

【公報種別】特許法第17条の2の規定による補正の掲載

【部門区分】第3部門第2区分

【発行日】平成20年12月18日(2008.12.18)

【公表番号】特表2003-533465(P2003-533465A)

【公表日】平成15年11月11日(2003.11.11)

【出願番号】特願2001-583733(P2001-583733)

【国際特許分類】

A 6 1 K	47/10	(2006.01)
A 6 1 K	9/20	(2006.01)
A 6 1 K	47/26	(2006.01)
A 6 1 K	47/32	(2006.01)
A 6 1 K	47/36	(2006.01)
A 6 1 K	47/38	(2006.01)
A 6 1 K	47/42	(2006.01)
A 6 1 K	47/46	(2006.01)
A 6 1 K	31/192	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	47/10
A 6 1 K	9/20
A 6 1 K	47/26
A 6 1 K	47/32
A 6 1 K	47/36
A 6 1 K	47/38
A 6 1 K	47/42
A 6 1 K	47/46
A 6 1 K	31/192

【手続補正書】

【提出日】平成20年10月30日(2008.10.30)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の：

(a) 少なくとも1つの製薬上許容可能な水溶性または分散性賦形剤を含む固体投与形態マトリックス、および

(b) 固体投与形態マトリックス内の、以下の：

(i) 投薬形態中に含入前に約2000 nm未満の有効平均粒子サイズを有する難可溶性活性剤、および

(ii) 活性剤の表面に吸着される少なくとも1つの表面安定剤

を含む経口固体投与形態迅速崩壊ナノ粒子処方物であって、ナノ粒子活性剤および少なくとも1つの表面安定剤を取り囲む固体投与形態マトリックスが唾液との接触時に約3分未満で実質的に完全に崩壊または溶解する処方物。

【請求項2】

活性剤粒子の有効平均粒子サイズが約1500 nm未満、約1000 nm未満、600 nm、約400 nm未満、約300 nm未満、約250 nm未満、約100 nm未満および約50 nm未満からなる群から選

択される請求項 1 記載の組成物。

【請求項 3】

約2分未満、約90秒未満、約60秒未満、約45秒未満、約30秒未満、約20秒未満、約15秒未満、約10秒未満および約5秒未満からなる群から選択される時間で唾液との接触時に固体投与形態マトリックスが実質的に完全に崩壊または溶解する請求項 1 記載の組成物。

【請求項 4】

活性剤の濃度が約0.1% ~ 約99.9% (w/w) である請求項 1 記載の組成物。

【請求項 5】

活性剤の濃度が約5% ~ 約70% (w/w) である請求項 4 記載の組成物。

【請求項 6】

活性剤の濃度が約15% ~ 約40% (w/w) である請求項 5 記載の組成物。

【請求項 7】

製薬上許容可能な水溶性または水分散性賦形剤の濃度が約99.9% ~ 約0.1% (w/w) である請求項 1 記載の組成物。

【請求項 8】

製薬上許容可能な水溶性または水分散性賦形剤の濃度が約95% ~ 約30% (w/w) である請求項 7 記載の組成物。

【請求項 9】

製薬上許容可能な水溶性または水分散性賦形剤の濃度が約85% ~ 約60% (w/w) である請求項 8 記載の組成物。

【請求項 10】

前記少なくとも1つの製薬上許容可能な水溶性または水分散性賦形剤が糖、糖アルコール、デンプン、天然ゴム、天然ポリマー、天然ポリマーの合成誘導体、合成ポリマーおよびそれらの混合物からなる群から選択される請求項 1 記載の組成物。

【請求項 11】

前記少なくとも1つの製薬上許容可能な水溶性または水分散性賦形剤がラクトース、グルコース、マンノース、マンニトール、ソルビトール、キシリトール、エリトリトール、ラクチトール、マルチトール、コーンスターク、ジャガイモデンプン、トウモロコシデンプン、ゼラチン、カラジーナン、アラビアゴム、キサンタンゴム、アルジネット、デキストラン、マルトデキストラン、ポリエチレングリコール、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、ポリオキシエチレンコポリマー、ポリオキシプロピレンコポリマー、ポリエチレンオキシドおよびそれらの混合物からなる群から選択される請求項 10 記載の組成物。

【請求項 12】

前記賦形剤が直接圧縮物質および非直接圧縮物質からなる群から選択される請求項 10 記載の組成物。

【請求項 13】

前記賦形剤が噴霧乾燥マンニトールおよび噴霧乾燥ラクトースからなる群から選択される請求項 12 記載の組成物。

【請求項 14】

固体投与形態処方物が流動床造粒により製造される請求項 1 記載の組成物。

【請求項 15】

少なくとも1つの泡起剤をさらに含む請求項 1 記載の組成物。

【請求項 16】

凍結乾燥された請求項 1 記載の組成物。

【請求項 17】

貧可溶性活性剤が結晶粒子、半結晶粒子、非晶質粒子またはそれらの混合物の形態である請求項 1 記載の組成物。

【請求項 18】

経口用量迅速崩壊ナノ粒子処方物の製造方法であって、以下の：

(a) (i) 貧可溶性活性剤およびその表面に吸着される少なくとも1つの表面安定剤のナノ粒子組成物であって、活性剤が約2000 nm未満の有効平均粒子サイズを有する組成物、および(ii) ナノ粒子組成物を取り囲む固体投与形態マトリックスを形成する少なくとも1つの製薬上許容可能な水分散性または水溶性賦形剤を含み、そして

(b) 固体投与形態処方物を生成する

ことを包含する方法であって、ナノ粒子活性剤および表面安定剤を取り囲む固体投与形態マトリックスが唾液との接触時に約3分未満で実質的に完全に崩壊または溶解する方法。

【請求項19】

活性剤粒子の有効平均粒子サイズが約1500 nm未満、約1000 nm未満、600 nm、約400 nm未満、約300 nm未満、約250 nm未満、約100 nm未満および約50 nm未満からなる群から選択される請求項18記載の方法。

【請求項20】

約2分未満、約90秒未満、約60秒未満、約45秒未満、約30秒未満、約20秒未満、約15秒未満、約10秒未満および約5秒未満からなる群から選択される時間で唾液との接触時に固体投与形態マトリックスが実質的に完全に崩壊または溶解する請求項18記載の方法。

【請求項21】

ナノ粒子組成物および少なくとも1つの水分散性または製薬上許容可能な水溶性賦形剤が、(i) ナノ粒子組成物および少なくとも1つの水溶性または水分散性賦形剤の粒子を形成するための流動床造粒、を用いて過程(a)で併合され、次にこれらが過程(b)で圧縮されて固体投与形態処方物を形成する請求項18記載の方法。

【請求項22】

固体投与形態処方物を生成するための過程(b)における粒子の圧縮前に過程(a)において(i)で形成される顆粒または粒子に1つまたはそれ以上の付加的製薬上許容可能な水溶性または水分散性賦形剤を付加することを包含する請求項21記載の方法。

【請求項23】

過程(b)が過程(a)で形成された組成物の圧縮を包含する請求項18記載の方法。

【請求項24】

過程(b)が過程(a)で形成された組成物の凍結乾燥を包含する請求項18記載の方法。

【請求項25】

過程(b)の前に組成物に少なくとも1つの泡起剤を付加することをさらに包含する請求項18記載の方法。

【請求項26】

活性剤の濃度が約0.1%～約99.9% (w/w) である請求項18記載の方法。

【請求項27】

活性剤の濃度が約5%～約70% (w/w) である請求項26記載の方法。

【請求項28】

活性剤の濃度が約15%～約40% (w/w) である請求項27記載の方法。

【請求項29】

製薬上許容可能な水溶性または水分散性賦形剤の濃度が約99.9%～約0.1% (w/w) である請求項18記載の方法。

【請求項30】

製薬上許容可能な水溶性または水分散性賦形剤の濃度が約95%～約30% (w/w) である請求項29記載の方法。

【請求項31】

製薬上許容可能な水溶性または水分散性賦形剤の濃度が約85%～約60% (w/w) である請求項30記載の方法。

【請求項32】

前記少なくとも1つの製薬上許容可能な水溶性または水分散性賦形剤が糖、糖アルコー

ル、デンプン、天然ゴム、天然ポリマー、天然ポリマーの合成誘導体、合成ポリマーおよびそれらの混合物から成る群から選択される請求項18記載の方法。

【請求項33】

前記少なくとも1つの製薬上許容可能な水溶性または分散性賦形剤がラクトース、グルコース、マンノース、マンニトール、ソルビトール、キシリトール、エリトリトール、ラクチトール、マルチトール、コーンスターク、ジャガイモデンプン、トウモロコシデンプン、ゼラチン、カラジーナン、アラビアゴム、キサンタンゴム、アルジネート、デキストラン、マルトデキストラン、ポリエチレングリコール、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、ポリオキシエチレンコポリマー、ポリオキシプロピレンコポリマー、ポリエチレンオキシドおよびそれらの混合物から成る群から選択される請求項32記載の方法。

【請求項34】

前記賦形剤が直接圧縮物質および非直接圧縮物質からなる群から選択される請求項32記載の方法。

【請求項35】

前記賦形剤が噴霧乾燥マンニトールおよび噴霧乾燥ラクトースから成る群から選択される請求項34記載の方法。

【請求項36】

貧可溶性活性剤が結晶粒子、半結晶粒子、非晶質粒子またはそれらの混合物の形態である請求項18記載の方法。

【請求項37】

有効量の固体投与形態迅速崩壊ナノ粒子処方物であって、以下の：

(a) 少なくとも1つの製薬上許容可能な水溶性または分散性賦形剤を含む固体投与形態マトリックス、および

(b) 固体投与形態マトリックス内の、以下の：

(i) 投薬形態中に含入前に約2000 nm未満の有効平均粒子サイズを有する貧可溶性活性剤、および

(ii) 活性剤の表面に吸着される少なくとも1つの表面安定剤

を含むナノ粒子処方物であって、ナノ粒子活性剤および表面安定剤を取り囲む固体投与形態マトリックスが約3分未満での唾液との接触時に実質的に完全に崩壊または溶解する処方物を哺乳類に投与することを包含する哺乳類の治療方法。

【請求項38】

活性剤粒子の有効平均粒子サイズが約1500 nm未満である、請求項37記載の方法。

【請求項39】

活性剤粒子の有効平均粒子サイズが約1000 nm未満である、請求項37記載の方法。

【請求項40】

活性剤粒子の有効平均粒子サイズが約600 nm未満である、請求項37記載の方法。

【請求項41】

活性剤粒子の有効平均粒子サイズが約400 nm未満である、請求項37記載の方法。

【請求項42】

活性剤粒子の有効平均粒子サイズが約300 nm未満である、請求項37記載の方法。

【請求項43】

活性剤粒子の有効平均粒子サイズが約250 nm未満である、請求項37記載の方法。

【請求項44】

活性剤粒子の有効平均粒子サイズが約100 nm未満である、請求項37記載の方法。

【請求項45】

活性剤粒子の有効平均粒子サイズが約50 nm未満である、請求項37記載の方法。

【請求項46】

活性剤の濃度が約0.1%～約99.9% (w/w) である請求項37記載の方法。

【請求項47】

活性剤の濃度が約5%～約70%（w/w）である請求項4～6記載の方法。

【請求項4～8】

活性剤の濃度が約15%～約40%（w/w）である請求項4～7記載の方法。

【請求項4～9】

製薬上許容可能な水溶性または水分散性賦形剤の濃度が約99.9%～約0.1%（w/w）である請求項3～7記載の方法。

【請求項5～0】

製薬上許容可能な水溶性または水分散性賦形剤の濃度が約95%～約30%（w/w）である請求項4～9記載の方法。

【請求項5～1】

製薬上許容可能な水溶性または水分散性賦形剤の濃度が約85%～約60%（w/w）である請求項5～0記載の方法。

【請求項5～2】

前記少なくとも1つの製薬上許容可能な水溶性または水分散性賦形剤が糖、糖アルコール、デンプン、天然ゴム、天然ポリマー、天然ポリマーの合成誘導体、合成ポリマーおよびそれらの混合物から成る群から選択される請求項3～7記載の方法。

【請求項5～3】

前記少なくとも1つの製薬上許容可能な水溶性または水分散性賦形剤がラクトース、グルコース、マンノース、マンニトール、ソルビトール、キシリトール、エリトリトール、ラクチトール、マルチトール、コーンスターク、ジャガイモデンプン、トウモロコシデンプン、ゼラチン、カラジーナン、アラビアゴム、キサンタンゴム、アルジネット、デキストラン、マルトデキストラン、ポリエチレングリコール、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、ポリオキシエチレンコポリマー、ポリオキシプロピレンコポリマー、ポリエチレンオキシドおよびそれらの混合物から成る群から選択される請求項5～2記載の方法。

【請求項5～4】

前記賦形剤が直接圧縮物質および非直接圧縮物質からなる群から選択される請求項5～2記載の方法。

【請求項5～5】

前記賦形剤が噴霧乾燥マンニトールおよび噴霧乾燥ラクトースから成る群から選択される請求項5～4記載の方法。

【請求項5～6】

貧可溶性活性剤が結晶粒子、半結晶粒子、非晶質粒子またはそれらの混合物の形態である請求項3～7記載の方法。