

【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17年12月22日(2005.12.22)

【公表番号】特表2005-520796(P2005-520796A)

【公表日】平成17年7月14日(2005.7.14)

【年通号数】公開・登録公報2005-027

【出願番号】特願2003-552271(P2003-552271)

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 47/04

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/38

// A 6 1 K 31/473

【F I】

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 47/04

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 31/473

【手続補正書】

【提出日】平成16年8月16日(2004.8.16)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

同時噴霧乾燥したマンニトールおよびソルビトール、ならびに崩壊剤を含む組成物であって、高度圧縮性であり、かつ口腔内で60秒以内に溶解する、速溶性組成物。

【請求項2】

さらに流動促進剤を含む、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

崩壊剤が、クロスポビドン、クロスカルメロース、デンブングリコール酸ナトリウム、およびその組合せよりなる群から選択される、請求項1に記載の組成物。

【請求項4】

流動促進剤が、コロイドシリカ、シリカゲル、沈降シリカ、およびその組合せよりなる群から選択される、請求項2に記載の組成物。

【請求項5】

マンニトールが60～99.5%の範囲で存在し、ソルビトールが0.5～40%の範囲で存在する、請求項1に記載の組成物。

【請求項6】

さらに有効成分を含む、請求項1に記載の組成物。

【請求項7】

有効成分がコーティングされている、請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 8】

有効成分がコーティングされていない、請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 9】

組成物が直接圧縮適性である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 10】

請求項 1 に記載の組成物を含む錠剤。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 5 6

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 5 6】

本発明の精神または範囲から逸脱することなく本発明の方法および組成物に種々の改変および変更をなしうることは、当業者に明らかであろう。したがって本発明は、本発明の改変および変更が特許請求の範囲およびその均等物の範囲に含まれる限り、それらの改変および変更を包含するものとする。

なお、本発明の態様は、以下の通りである。

- 1 . 直接圧縮適性かつ高度圧縮性組成物の調製方法であつて、
  - a ) マンニトール粉末およびソルビトール粉末を溶解して溶液にし；
  - b ) 該溶液を空気流中で乾燥させ、そして
  - c ) 該溶液から非フィラメント性ミクロ構造を有する粒子を形成することを含む方法。
- 2 . 組成物の含水率が約 8 % 未満である、上記 1 に記載の方法。
- 3 . 組成物の含水率が約 5 % 未満である、上記 1 に記載の方法。
- 4 . 組成物の含水率が約 2 % 未満である、上記 1 に記載の方法。
- 5 . さらに、崩壊剤を組成物に添加することを含む、上記 1 に記載の方法。
- 6 . 崩壊剤が、クロスポビドン、クロスカルメロース、デンプングリコール酸ナトリウム、およびその組合せよりなる群から選択される、上記 5 に記載の方法。
- 7 . さらに、流動促進剤を組成物に添加することを含む、上記 5 に記載の方法。
- 8 . 流動促進剤が、コロイドシリカ、シリカゲル、沈降シリカ、およびその組合せよりなる群から選択される、上記 7 に記載の方法。
- 9 . さらに、有効成分を添加することを含む、上記 1 に記載の方法。
- 10 . マンニトールが 6 0 ~ 9 9 . 5 % の範囲で存在し、ソルビトールが 0 . 5 ~ 4 0 % の範囲で存在する、上記 1 に記載の方法。
- 11 . マンニトールが 7 0 ~ 9 5 % の範囲で存在し、ソルビトールが 5 ~ 3 0 % の範囲で存在する、上記 10 に記載の方法。
- 12 . マンニトールが 8 0 ~ 9 0 % の範囲で存在し、ソルビトールが 1 0 ~ 2 0 % の範囲で存在する、上記 11 に記載の方法。
- 13 . 工程 ( b ) においてさらに、乾燥マンニトール粉末および乾燥ソルビトール粉末のブレンドを噴霧乾燥チャンバー内へ乾式供給することを含む、上記 1 に記載の方法。
- 14 . さらに、得られた組成物をマンニトールおよび崩壊剤の乾燥混合物で希釈することを含む、上記 1 に記載の方法。
- 15 . 混合物が約 9 0 % のマンニトールおよび約 1 0 % のクロスポビドンを含む、上記 14 に記載の方法。
- 16 . さらに、錠剤を成形することを含む、上記 1 に記載の方法。
- 17 . 同時噴霧乾燥したマンニトールおよびソルビトール、ならびに崩壊剤を含む組成物であつて、高度圧縮性であり、かつ口腔内で 6 0 秒以内に溶解する、速溶性組成物。
- 18 . さらに流動促進剤を含む、上記 17 に記載の組成物。
- 19 . 崩壊剤が、クロスポビドン、クロスカルメロース、デンプングリコール酸ナトリ

ウム、およびその組合せよりなる群から選択される、上記17に記載の組成物。

20. 流動促進剤が、コロイドシリカ、シリカゲル、沈降シリカ、およびその組合せよりなる群から選択される、上記18に記載の組成物。

21. マンニトールが60～99.5%の範囲で存在し、ソルビトールが0.5～40%の範囲で存在する、上記17に記載の組成物。

22. マンニトールが70～95%の範囲で存在し、ソルビトールが5～30%の範囲で存在する、上記21に記載の組成物。

23. マンニトールが80～90%の範囲で存在し、ソルビトールが10～20%の範囲で存在する、上記22に記載の組成物。

24. さらに有効成分を含む、上記17に記載の組成物。

25. 有効成分がコーティングされている、上記24に記載の組成物。

26. 有効成分がコーティングされていない、上記24に記載の組成物。

27. 組成物が直接圧縮適性である、上記17に記載の組成物。

28. 上記17に記載の組成物を含む錠剤。

29. 同時噴霧乾燥したマンニトールおよびソルビトールを含有する粒子を含む組成物であって、粒子が非フィラメント性ミクロ構造を有し、組成物が高度圧縮性である組成物。

30. さらに崩壊剤を含む、上記29に記載の組成物。

31. さらに流動促進剤を含む、上記29に記載の組成物。

32. 崩壊剤が、クロスボビドン、クロスカルメロース、デンプングリコール酸ナトリウム、およびその組合せよりなる群から選択される、上記30に記載の組成物。

33. 流動促進剤が、コロイドシリカ、シリカゲル、沈降シリカ、およびその組合せよりなる群から選択される、上記31に記載の組成物。

34. マンニトールが60～99.5%の範囲で存在し、ソルビトールが0.5～40%の範囲で存在する、上記29に記載の組成物。

35. マンニトールが70～95%の範囲で存在し、ソルビトールが5～30%の範囲で存在する、上記34に記載の組成物。

36. マンニトールが80～90%の範囲で存在し、ソルビトールが10～20%の範囲で存在する、上記35に記載の組成物。

37. さらに有効成分を含む、上記29に記載の組成物。

38. 有効成分がコーティングされている、上記37に記載の組成物。

39. 有効成分がコーティングされていない、上記37に記載の組成物。

40. 組成物が直接圧縮適性である、上記29に記載の組成物。

41. 上記29に記載の組成物を含む錠剤。

42. 直接圧縮適性である速溶性組成物の調製方法であって、

a) マンニトール粉末およびソルビトール粉末を溶解して溶液にし；

b) 該溶液を空気流中で乾燥させ、そして

c) 崩壊剤を添加する

ことにより、直接圧縮適性である速溶性組成物を調製することを含む方法。

43. さらに流動促進剤を含む、上記42に記載の組成物。

44. 崩壊剤が、クロスボビドン、クロスカルメロース、デンプングリコール酸ナトリウム、およびその組合せよりなる群から選択される、上記42に記載の組成物。

45. 流動促進剤が、コロイドシリカ、シリカゲル、沈降シリカ、およびその組合せよりなる群から選択される、上記43に記載の組成物。

46. マンニトールが60～99.5%の範囲で存在し、ソルビトールが0.5～40%の範囲で存在する、上記42に記載の組成物。

47. マンニトールが70～95%の範囲で存在し、ソルビトールが5～30%の範囲で存在する、上記46に記載の組成物。

48. マンニトールが80～90%の範囲で存在し、ソルビトールが10～20%の範囲で存在する、上記47に記載の組成物。

- 4 9 . さらに有効成分を含む、上記 4 2 に記載の組成物。
- 5 0 . 有効成分がコーティングされている、上記 4 9 に記載の組成物。
- 5 1 . 有効成分がコーティングされていない、上記 4 9 に記載の組成物。
- 5 2 . 組成物が直接圧縮適性である、上記 4 2 に記載の組成物。
- 5 3 . 上記 4 2 に記載の組成物を含む錠剤。
- 5 4 . ( a ) 同時噴霧乾燥したマンニトールおよびソルビトールを含有する粒子であつて、非フィラメント性ミクロ構造を有する粒子；  
( b ) クロスポビドン、クロスカルメロース、デンプングリコール酸ナトリウム、およびその組合せよりなる群から選択される崩壊剤；  
( c ) シリカゲル、コロイドシリカ、沈降シリカ、およびその組合せよりなる群から選択される流動促進剤；ならびに  
( d ) 有効成分  
を含む組成物。
- 5 5 . ( a ) 同時噴霧乾燥したマンニトールおよびソルビトールを含有する粒子；  
( b ) クロスポビドン、クロスカルメロース、デンプングリコール酸ナトリウム、およびその組合せよりなる群から選択される崩壊剤；  
( c ) シリカゲル、およびコロイドシリカ、沈降シリカ、およびその組合せよりなる群から選択される流動促進剤；ならびに  
( d ) 有効成分  
を含む、速溶性組成物。