

【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、デンプングリコール酸ナトリウム、およびその組み合わ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、およびその組み合わ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】0156

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0156】

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) 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、およびその組合わ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、およびその組合わ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 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 1 に記載の方法。
11. 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 10 に記載の方法。
12. 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 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 90 % のマンニトールおよび約 10 % 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。
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、およびその組合わ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、およびその組合わ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、およびその組合わ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、およびその組合わ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、およびその組合わ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、およびその組合わ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。

49. さらに有効成分を含む、上記42に記載の組成物。

50. 有効成分がコーティングされている、上記49に記載の組成物。

51. 有効成分がコーティングされていない、上記49に記載の組成物。

52. 組成物が直接圧縮適性である、上記42に記載の組成物。

53. 上記42に記載の組成物を含む錠剤。

54. (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って、非フィラメント性マイクロ構造を有する粒子；

(b) 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、およびその組合わ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、およびその組合わ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。

55. (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、およびその組合わ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、およびその組合わ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。