

【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18年3月9日(2006.3.9)

【公表番号】特表2005-521655(P2005-521655A)

【公表日】平成17年7月21日(2005.7.21)

【年通号数】公開・登録公報2005-028

【出願番号】特願2003-561577(P2003-561577)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/5513	(2006.01)
A 6 1 K	9/08	(2006.01)
A 6 1 K	9/20	(2006.01)
A 6 1 K	9/48	(2006.01)
A 6 1 K	31/4468	(2006.01)
A 6 1 K	31/485	(2006.01)
A 6 1 K	47/10	(2006.01)
A 6 1 K	47/14	(2006.01)
A 6 1 K	47/18	(2006.01)
A 6 1 K	47/20	(2006.01)
A 6 1 K	47/36	(2006.01)
A 6 1 P	25/04	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
C 0 7 D	403/12	(2006.01)
C 0 7 D	489/02	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/5513	
A 6 1 K	9/08	
A 6 1 K	9/20	
A 6 1 K	9/48	
A 6 1 K	31/4468	
A 6 1 K	31/485	
A 6 1 K	47/10	
A 6 1 K	47/14	
A 6 1 K	47/18	
A 6 1 K	47/20	
A 6 1 K	47/36	
A 6 1 P	25/04	
A 6 1 P	43/00	1 2 1
C 0 7 D	403/12	
C 0 7 D	489/02	

【手続補正書】

【提出日】平成18年1月23日(2006.1.23)

【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】

治療有効量のオピオイド鎮痛薬と、デバゼピドと、薬学的に許容可能な界面活性剤との個別投与、同時投与または逐次投与を含み、デバゼピドの一日の投与量が最高で $0.7\text{ mg/kg/day}$ であり、前記界面活性剤が、治療的に有効な緩下剤および／または便軟化剤であることを特徴とする、鎮痛を必要とする患者の処置方法。

【請求項 2】

治療有効量のデバゼピドと、薬学的に許容可能な界面活性剤とを含む医薬組成物の投与を含み、前記デバゼピドの一日の投与量が最高で $0.7\text{ mg/kg/day}$ であり、前記界面活性剤が、治療的に有効な緩下剤および／または便軟化剤であることを特徴とする、オピオイド鎮痛薬治療を受けている患者の処置方法。

【請求項 3】

前記デバゼピドと界面活性剤とが、単相形態の医薬組成物として提供されることを特徴とする、請求項 1 または 2 に記載の処置方法。

【請求項 4】

前記デバゼピドの一日の投与量が、 $25\text{ }\mu\text{g/kg/day} \sim 0.7\text{ mg/kg/day}$ であることを特徴とする、請求項 1 または 2 に記載の方法。

【請求項 5】

前記デバゼピドの一日の投与量が、 $50\text{ }\mu\text{g/kg/day} \sim 0.5\text{ mg/kg/day}$ であることを特徴とする、請求項 4 に記載の方法。

【請求項 6】

前記組成物が液剤であることを特徴とする、請求項 3 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 7】

前記デバゼピドと界面活性剤とが、固体剤形であることを特徴とする、請求項 3 に記載の処置方法。

【請求項 8】

前記デバゼピドと界面活性剤とが、錠剤の形態であることを特徴とする、請求項 7 に記載の処置方法。

【請求項 9】

前記デバゼピドと界面活性剤とが、カプセルに入った流動性粉末の形態であることを特徴とする、請求項 7 に記載の処置方法。

【請求項 10】

前記デバゼピドおよび／または前記オピオイドの送達方法が、静脈内投与、動脈内投与、経口投与、くも膜下腔内投与、鼻腔内投与、直腸内投与、筋内／皮下投与、吸入による投与および経皮パッチによる投与からなる群から選択されることを特徴とする、請求項 1 または 2 に記載の方法。

【請求項 11】

前記デバゼピドおよび／または前記オピオイドが、静脈内に投与されることを特徴とする、請求項 10 に記載の方法。

【請求項 12】

前記静脈内投与が、静脈内ボーラス注入または連続静脈内注入によることを特徴とする、請求項 11 に記載の方法。

【請求項 13】

前記デバゼピドおよび／または前記オピオイドが、皮下投与されることを特徴とする、請求項 10 に記載の方法。

【請求項 14】

前記皮下投与が、皮下注入であることを特徴とする、請求項 13 に記載の方法。

【請求項 15】

前記デバゼピドおよび／または前記オピオイドが、経口投与されることを特徴とする、請求項 10 に記載の方法。

【請求項 16】

前記デバゼピドが、経口投与されることを特徴とする、請求項 10 に記載の方法。

**【請求項 17】**

前記オピオイドが静脈内投与され、かつ前記デバゼピドが静脈内投与されることを特徴とする、請求項11に記載の方法。

**【請求項 18】**

前記オピオイドが経口投与され、かつ前記デバゼピドが経口投与されることを特徴とする、請求項15に記載の方法。

**【請求項 19】**

前記オピオイドが、静脈内投与または経口投与により投与されることを特徴とする、請求項10に記載の方法。

**【請求項 20】**

前記オピオイドが、経皮パッチにより投与されることを特徴とする、請求項10に記載の方法。

**【請求項 21】**

経口投与の場合、前記デバゼピドの一日の投与量が0.07～0.7mg/kg/日であることを特徴とする、請求項16に記載の方法。

**【請求項 22】**

経口投与の場合、前記デバゼピドの一日の投与量が、0.07～0.29mg/kg/日であることを特徴とする、請求項21に記載の方法。

**【請求項 23】**

静脈内投与の場合、前記デバゼピドの投与量が、50μg/kg/日～0.5mg/kg/日であることを特徴とする、請求項11に記載の方法。

**【請求項 24】**

前記オピオイドが、モルヒネもしくはその塩、たとえば硫酸塩、塩化物または塩酸塩、または他の1,4-ヒドロキシモルフィナンオピオイド鎮痛薬、たとえばナロキソン、メペリジン、ブトルファノールまたはペントゾシン、またはモルフィン-6-グルクロニド、コデイン、ジヒドロコデイン、ダイアモルフィン、デキストロプロポキシフェン、ペチジン、フェンタニル、アルフェンタニル、アルファプロジン、ブレノルフィン、デキストロモラミド、ジフェノキシレート、ジピバノン、ヘロイン(ジアセチルモルフィン)、ヒドロコドン(ジヒドロコデイノン)、ヒドロモルフォン(ジヒドロモルヒノン)、レボルファノール、メタタジノール、メサドン、メトポン(メチルジヒドロモルヒノン)、ナルブフィン、オキシコドン(ジヒドロヒドロキシコデイノン)、オキシモルフォン(ジヒドロヒドロキシモルヒノン)、フェナドキソン、フェナゾシン、レミフェンタニル、トラマドール、またはこれらのいずれかの塩または前述の化合物の任意の組合せからなる群から選択されることを特徴とする、請求項1または2に記載の方法。

**【請求項 25】**

前記オピオイドが、ヒドロモルフォン、オキシコドン、モルヒネ、およびフェンタニル、およびそれらの塩類からなる群から選択されることを特徴とする、請求項24に記載の方法。

**【請求項 26】**

前記オピオイドが、モルヒネまたは硫酸モルヒネであることを特徴とする、請求項25に記載の方法。

**【請求項 27】**

前記オピオイドが、フェンタニル、またはその塩であることを特徴とする、請求項25に記載の方法。

**【請求項 28】**

前記界面活性剤の一日の投与量が、最高で0.056mg/kg/日であることを特徴とする、請求項1または2に記載の方法。

**【請求項 29】**

前記界面活性剤の一日の投与量が、0.4～1.6mg/日であることを特徴とする、請求項1または2に記載の方法。

**【請求項 3 0】**

前記オピオイドの投与量が、1日に5～2000mgであることを特徴とする、請求項1または2に記載の方法。

**【請求項 3 1】**

前記オピオイドの投与量が、1日に10～240mgであることを特徴とする、請求項3 0に記載の方法。

**【請求項 3 2】**

前記オピオイドの一日の投与量が、1日に5～100mgであることを特徴とする、請求項3 1に記載の方法。

**【請求項 3 3】**

本発明の方法で使用される前記デバゼピドが、実質的にSエナンチオマーであることを特徴とする、請求項1または2に記載の方法。

**【請求項 3 4】**

不純物として存在する可能性がある、Rエナンチオマーのレベルが、1.5%w/w以下であることを特徴とする、請求項3 3に記載の方法。

**【請求項 3 5】**

前記界面活性剤が、親油性界面活性剤、親水性界面活性剤またはグリセリド、またはそれらの組合せであることを特徴とする、請求項1または2に記載の方法。

**【請求項 3 6】**

前記界面活性剤が親水性界面活性剤であることを特徴とする、請求項3 5に記載の方法。

**【請求項 3 7】**

前記親水性界面活性剤が、イオン性または非イオン性の界面活性剤であることを特徴とする、請求項3 6に記載の方法。

**【請求項 3 8】**

前記親水性界面活性剤が、アルキルグルコシド類；アルキルマルトシド類；アルキルチオグルコシド類；ラウリルマクロゴルグリセリド類；ポリオキシエチレンアルキルエーテル類；ポリオキシエチレンアルキルフェノール類；ポリエチレングリコール脂肪酸エステル類；ポリエチレングリコールグリセロール脂肪酸エステル類；ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類；ポリオキシエチレン-ポリオキシプロピレンブロックコポリマー；ポリグリセロール脂肪酸エステル類；ポリオキシエチレングリセリド類；ポリオキシエチレンステロール類、それらの誘導体および類似体；ポリオキシエチレン植物油；ポリオキシエチレン硬化植物油；ポリオール類と、脂肪酸、グリセリド類、植物油、硬化植物油およびステロール類からなる群の少なくとも1つのメンバーとの反応混合物；トコフェロールポリエチレングリコールコハク酸塩；糖エステル類；糖エーテル類；スクログリセリド類；およびそれらの混合物；からなる群から選択される非イオン性界面活性剤であることを特徴とする、請求項3 7に記載の方法。

**【請求項 3 9】**

前記親水性界面活性剤が、アルキルアンモニウム塩類；胆汁酸類ならびにそれらの塩類、類似体、および誘導体；アミノ酸、カルニチン類、オリゴペプチド類およびポリペプチド類の脂肪酸誘導体；アミノ酸、オリゴペプチド類、およびポリペプチド類のグリセリド誘導体；アシルラクチレート類；モノグリセリド類、ジグリセリド類のモノアセチル化酒石酸エステル類、ジアセチル化酒石酸エステル類；サクシノイル化モノグリセリド類；モノグリセリド類、ジグリセリド類のクエン酸エステル類；アルギン酸塩類；プロピレングリコールアルギネット；レシチン類および水素化レシチン類；リゾレシチンおよび水素化リゾレシチン類；リゾリン脂質およびそれらの誘導体；リン脂質およびそれらの誘導体；硫酸アルキルの塩類；脂肪酸の塩類；ドキュセートナトリウム；およびそれらの混合物；からなる群から選択されるイオン性界面活性剤であることを特徴とする、請求項3 7に記載の方法。

**【請求項 4 0】**

前記界面活性剤が親油性界面活性剤であることを特徴とする、請求項35に記載の方法。

【請求項41】

前記親油性界面活性剤が、アルコール類；ポリオキシエチレンアルキルエーテル類；脂肪酸；胆汁酸；グリセロール脂肪酸エステル類；アセチル化グリセロール脂肪酸エステル類；低級アルコール脂肪酸エステル類；ポリエチレングリコール脂肪酸エステル類；ポリエチレングリコールグリセロール脂肪酸エステル類；ポリプロピレングリコール脂肪酸エステル類；ポリオキシエチレングリセリド類；モノノジグリセリド類の乳酸誘導体；プロピレングリコールジグリセリド類；ソルビタン脂肪酸エステル類；ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類；ポリオキシエチレン-ポリオキシプロピレンブロックポリマー；トランスエステル化植物油；ステロール類；ステロール誘導体；糖エステル類；糖エーテル類；スクログリセリド類；ポリオキシエチレン植物油；ポリオキシエチレン硬化植物油；ポリオール類と、脂肪酸、グリセリド類、植物油、硬化植物油、およびステロール類からなる群の少なくとも1つのメンバーとの反応混合物；およびそれらの混合物からなる群から選択されることを特徴とする、請求項40に記載の方法。

【請求項42】

前記界面活性剤が、グリセリドであることを特徴とする、請求項41に記載の方法。

【請求項43】

前記トリグリセリドが、植物油、魚油、動物性油脂、硬化植物油、部分的に硬化した植物油、合成トリグリセリド類、修飾トリグリセリド類、分留トリグリセリド類、およびそれらの混合物からなる群から選択されることを特徴とする、請求項42に記載の方法。

【請求項44】

前記界面活性剤が、アルキルスルホコハク酸塩、アルキル硫酸塩またはアルキルアンモニウム塩からなる群から選択されることを特徴とする、請求項1または2に記載の方法。

【請求項45】

前記界面活性剤が、ドキュセートナトリウム（ジオクチルスルホコハク酸ナトリウム）、ドデシル硫酸ナトリウムおよびテトラデシルトリメチルアンモニウムプロミドからなる群から選択されることを特徴とする、請求項44に記載の方法。

【請求項46】

前記界面活性剤が、抗菌特性および/または消毒特性も有することを特徴とする、請求項1または2に記載の方法。

【請求項47】

前記界面活性剤が、セトリミドであることを特徴とする、請求項46に記載の方法。

【請求項48】

前記界面活性剤が、ドキュセートナトリウムであることを特徴とする、請求項45に記載の方法。

【請求項49】

前記組成物が、一種以上の充填剤を含むことを特徴とする、請求項1または2に記載の方法。

【請求項50】

前記充填剤粒子を、界面活性剤で被覆し、次いで被覆された充填剤とデバゼピドとを完全混和物にすることを特徴とする、請求項49に記載の方法。

【請求項51】

前記充填剤が、乳糖、マンニトール、タルク、ステアリン酸マグネシウム、塩化ナトリウム、塩化カリウム、クエン酸、噴霧乾燥乳糖、加水分解デンプン、デンプン、微結晶性セルロース、セルロース誘導体、ソルビトール、スクロース、スクロース系材料、イコデキストリン、硫酸カルシウム、第二リン酸カルシムおよびデキストロースおよびそれらの混合物からなる群から選択されることを特徴とする、請求項49に記載の方法。

【請求項52】

前記充填剤が、デンプンであることを特徴とする、請求項51に記載の方法。

**【請求項 5 3】**

前記デンブンが、コーンスタークであることを特徴とする、請求項 5 2 に記載の方法。

**【請求項 5 4】**

前記デバゼピド粒子と前記充填剤粒子とのサイズが、実質的に異なることを特徴とする、請求項 4 9 に記載の方法。

**【請求項 5 5】**

デバゼピド：界面活性剤の比率が、5 : 1 ~ 25 : 1 w / w であることを特徴とする、請求項 1 または 2 に記載の方法。

**【請求項 5 6】**

前記組成物が、デバゼピドと界面活性剤とを含み、前記組成物の残りが、充填剤で構成されていることを特徴とする、請求項 4 8 に記載の方法。

**【請求項 5 7】**

前記組成物が、デバゼピド 1.25 mg と、界面活性剤 0.1 mg と、充填剤 148.65 mg とを含むことを特徴とする、請求項 5 5 に記載の方法。

**【請求項 5 8】**

前記組成物が、デバゼピド 1.25 mg と、ドキュセートナトリウム 0.1 mg と、コーンスターク 148.65 mg とを含むことを特徴とする、請求項 5 6 に記載の方法。

**【請求項 5 9】**

前記組成物が、デバゼピド 2.5 mg と、界面活性剤 0.2 mg と、充填剤 297.3 mg とを含むことを特徴とする、請求項 5 5 に記載の方法。

**【請求項 6 0】**

前記組成物が、デバゼピド 2.5 mg と、ドキュセートナトリウム 0.2 mg と、コーンスターク 297.3 mg とを含むことを特徴とする、請求項 5 8 に記載の方法。

**【請求項 6 1】**

前記組成物が、カプセル内に充填されることを特徴とする、請求項 1、2 または 4 8 に記載の方法。

**【請求項 6 2】**

前記カプセルが、ゼラチンカプセルであることを特徴とする、請求項 6 1 に記載の方法。

**【請求項 6 3】**

治療有効量のデバゼピドと、薬学的に許容可能な界面活性剤とを含み、該デバゼピドの一日の投与量が最高で 0.7 mg / kg / 日であり、前記界面活性剤が、アルキルスルホコハク酸塩類、アルキル硫酸塩類またはアルキルアンモニウム塩類からなる群から選択されることを特徴とする、単相性医薬組成物の製造におけるデバゼピドの使用。

**【請求項 6 4】**

前記医薬組成物が固体剤形であることを特徴とする、請求項 6 3 に記載の使用。

**【請求項 6 5】**

治療有効量のデバゼピドと、薬学的に許容可能な界面活性剤とを含み、前記デバゼピドの一日の投与量が最高で 0.7 mg / kg / 日であり、前記界面活性剤が、アルキルスルホコハク酸塩類、アルキル硫酸塩類またはアルキルアンモニウム塩類からなる群から選択されることを特徴とする、単相性医薬組成物。

**【請求項 6 6】**

前記デバゼピドの一日の投与量が、25 μg / kg / 日 ~ 0.7 mg / kg / 日であることを特徴とする、請求項 6 5 に記載の単相性医薬組成物。

**【請求項 6 7】**

前記デバゼピドの一日の投与量が、50 μg / kg / 日 ~ 0.5 mg / kg / 日であることを特徴とする、請求項 6 6 に記載の単相性医薬組成物。

**【請求項 6 8】**

前記組成物が、液剤であることを特徴とする、請求項 6 5 に記載の単相性医薬組成物。

**【請求項 6 9】**

前記組成物が固体剤形であることを特徴とする、請求項 6 5 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 7 0】

前記組成物が、錠剤の形態であることを特徴とする、請求項 6 9 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 7 1】

前記組成物が、カプセルに入った流動性粉末の形態であることを特徴とする、請求項 6 9 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 7 2】

前記組成物を、治療有効量のオピオイド鎮痛薬を含む個別投与、同時投与または逐次投与用に適合させることを特徴とする、請求項 6 5 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 7 3】

前記組成物が、静脈内投与、動脈内投与、経口投与、くも膜下腔内投与、鼻腔内投与、直腸内投与、筋内 / 皮下投与、吸入による投与および経皮パッチによる投与に適合させることを特徴とする、請求項 6 5 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 7 4】

前記デバゼピドおよび / または前記オピオイドを、静脈内投与に適合させることを特徴とする、請求項 7 3 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 7 5】

静脈内投与が、静脈内ボーラス注入または連続静脈内注入による特徴とする、請求項 7 4 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 7 6】

前記デバゼピドおよび / または前記オピオイドを、皮下投与に適合させることを特徴とする、請求項 7 3 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 7 7】

前記皮下投与が、皮下注入であることを特徴とする、請求項 7 6 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 7 8】

前記デバゼピドおよび / または前記オピオイドを、経口投与に適合させることを特徴とする、請求項 7 3 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 7 9】

前記デバゼピドを、経口投与することを特徴とする、請求項 7 3 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 8 0】

前記オピオイドを静脈内に投与し、かつ前記デバゼピドを静脈内に投与することを特徴とする、請求項 7 4 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 8 1】

前記オピオイドを経口投与し、かつ前記デバゼピドを経口投与することを特徴とする、請求項 7 8 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 8 2】

前記オピオイドを静脈内投与または経口投与することを特徴とする、請求項 7 3 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 8 3】

前記オピオイドが経皮パッチにより投与されることを特徴とする、請求項 7 3 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 8 4】

経口投与の場合、前記デバゼピドの一日の投与量が、0.07 ~ 0.7 mg / kg / 日であることを特徴とする、請求項 7 3 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 8 5】

経口投与の場合、前記デバゼピドの一日の投与量が、0.07 ~ 0.29 mg / kg /

日であることを特徴とする、請求項 8 4 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 8 6】

静脈内投与の場合、前記デバゼピドの投与量が  $50 \mu\text{g} / \text{kg} / \text{日} \sim 0.5 \text{mg} / \text{kg} / \text{日}$  であることを特徴とする、請求項 8 5 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 8 7】

前記オピオイドが、モルヒネ、またはその塩、たとえば硫酸塩、塩化物または塩酸塩、あるいは他の 1, 4 - ヒドロキシモルフィナンオピオイド鎮痛薬、たとえばナロキソン、メペリジン、ブトルファノールもしくはペンタゾシン、またはモルフィン - 6 - グルクロニド、コデイン、ジヒドロコデイン、ダイアモルフィン、デキストロプロポキシフェン、ペチジン、フェンタニル、アルフェンタニル、アルファプロジン、ブプレノルフィン、デキストロモラミド、ジフェノキシレート、ジピバノン、ヘロイン(ジアセチルモルフィン)、ヒドロコドン(ジヒドロコデイノン)、ヒドロモルフォン(ジヒドロモルヒノン)、レボルファノール、メプタジノール、メサドン、メトポン(メチルジヒドロモルヒノン)、ナルブフィン、オキシコドン(ジヒドロヒドロキシコデイノン)、オキシモルフォン(ジヒドロヒドロキシモルヒノン)、フェナドキソン、フェナゾシン、レミフェンタニル、トラマドール、またはこれらのいずれかの塩、または前述の化合物の任意の組合せからなる群から選択されることを特徴とする、請求項 6 5 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 8 8】

前記オピオイドが、ヒドロモルフォン、オキシコドン、モルヒネおよびフェンタニル、またはそれらの塩からなる群から選択されることを特徴とする、請求項 8 7 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 8 9】

前記オピオイドが、モルヒネまたは硫酸モルヒネであることを特徴とする、請求項 8 8 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 9 0】

前記オピオイドが、フェンタニル、またはその塩であることを特徴とする、請求項 8 8 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 9 1】

前記界面活性剤の一日の投与量が、最高で  $0.056 \text{mg} / \text{kg} / \text{日}$  であることを特徴とする、請求項 6 5 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 9 2】

前記界面活性剤の一日の投与量が、1日に  $0.4 \text{mg} \sim 1.6 \text{mg}$  であることを特徴とする、請求項 6 5 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 9 3】

オピオイドの投与量が、1日に  $5 \sim 2000 \text{mg}$  であることを特徴とする、請求項 6 5 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 9 4】

前記オピオイドの投与量が、1日に  $10 \sim 240 \text{mg}$  であることを特徴とする、請求項 9 3 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 9 5】

前記オピオイドの一日の投与量が、1日に  $5 \sim 100 \text{mg}$  であることを特徴とする、請求項 9 4 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 9 6】

前記デバゼピドが、実質的に S エナンチオマーであることを特徴とする、請求項 6 5 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 9 7】

不純物として存在する可能性がある、R エナンチオマーのレベルが、 $1.5 \% \text{w/w}$  以下であることを特徴とする、請求項 9 6 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 9 8】

前記界面活性剤が、親油性界面活性剤、親水性またはグリセリド、あるいはそれらの組

合せであることを特徴とする、請求項 6 5 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 9 9】

前記界面活性剤が、親水性界面活性剤であることを特徴とする、請求項 9 8 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 1 0 0】

前記親水性界面活性剤が、イオン性界面活性剤または非イオン性界面活性剤であることを特徴とする、請求項 9 9 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 1 0 1】

前記親水性界面活性剤が、アルキルグルコシド類；アルキルマルトシド類；アルキルチオグルコシド類、ラウリルマクロゴルグリセリド類；ポリオキシエチレンアルキルエーテル類；ポリオキシエチレンアルキルフェノール類；ポリエチレングリコール脂肪酸エステル類；ポリエチレングリコールグリセロール脂肪酸エステル類；ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類；ポリオキシエチレン - ポリオキシプロピレンブロックコポリマー；ポリグリセロール脂肪酸エステル類；ポリオキシエチレングリセリド類；ポリオキシエチレンステロール類、それらの誘導体および類似体；ポリオキシエチレン植物油；ポリオキシエチレン硬化植物油；ポリオール類と、脂肪酸、グリセリド類、植物油、硬化植物油、およびステロール類からなる群の少なくとも 1 つのメンバーとの反応混合物；トコフェロールポリエチレングリコールコハク酸塩；糖エステル類；糖エーテル類；スクログリセリド類；およびそれらの混合物；からなる群から選択される非イオン性界面活性剤であることを特徴とする、請求項 1 0 0 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 1 0 2】

前記親水性界面活性剤が、アルキルアンモニウム塩類；胆汁酸類ならびにそれらの塩類、類似体、および誘導体；アミノ酸、カルニチン類、オリゴペプチド類およびポリペプチド類の脂肪酸誘導体；アミノ酸、オリゴペプチド類、およびポリペプチド類のグリセリド誘導体；アシルラクチレート類；モノグリセリド類、ジグリセリド類のモノアセチル化酒石酸エステル類、ジアセチル化酒石酸エステル類；サクシノイル化モノグリセリド類；モノグリセリド類、ジグリセリド類のクエン酸エステル類；アルギン酸塩類；プロピレングリコールアルギネート；レシチン類および水素化レシチン類；リゾレシチンおよび水素化リゾレシチン類；リゾリン脂質およびそれらの誘導体；リン脂質およびそれらの誘導体；硫酸アルキルの塩類；脂肪酸の塩類；ドキュセートナトリウム；およびそれらの混合物；からなる群から選択されるイオン性界面活性剤であることを特徴とする、請求項 1 0 0 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 1 0 3】

前記界面活性剤が、親油性界面活性剤であることを特徴とする、請求項 9 8 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 1 0 4】

前記親油性界面活性剤が、アルコール類；ポリオキシエチレンアルキルエーテル類；脂肪酸；胆汁酸；グリセロール脂肪酸エステル類；アセチル化グリセロール脂肪酸エステル類；低級アルコール脂肪酸エステル類；ポリエチレングリコール脂肪酸エステル類；ポリエチレングリコールグリセロール脂肪酸エステル類；ポリプロピレングリコール脂肪酸エステル類；ポリオキシエチレングリセリド類；モノ / ジグリセリド類の乳酸誘導体；プロピレングリコールジグリセリド類；ソルビタン脂肪酸エステル類；ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル類；ポリオキシエチレン - ポリオキシプロピレンブロックコポリマー；トランスエステル化植物油；ステロール類；ステロール誘導体；糖エステル類；糖エーテル類；スクログリセリド類；ポリオキシエチレン植物油；ポリオキシエチレン硬化植物油；ポリオール類と、脂肪酸、グリセリド類、植物油、硬化植物油、およびステロール類からなる群の少なくとも 1 つのメンバーとの反応混合物；およびそれらの混合物；からなる群から選択されることを特徴とする、請求項 1 0 3 に記載の単相性医薬組成物。

【請求項 1 0 5】

前記界面活性剤が、グリセリドであることを特徴とする、請求項 9 9 に記載の単相性医

薬組成物。

**【請求項 106】**

前記トリグリセリドが、植物油、魚油、動物性油脂、硬化植物油、部分的に硬化した植物油、合成トリグリセリド類、修飾トリグリセリド類、分留トリグリセリド類、およびそれらの混合物からなる群から選択されることを特徴とする、請求項105に記載の単相性医薬組成物。

**【請求項 107】**

前記界面活性剤が、治療的に有効な界面活性剤であることを特徴とする、請求項65に記載の単相性医薬組成物。

**【請求項 108】**

前記界面活性剤が、ドキュセートナトリウム（ジオクチルスルホカク酸ナトリウム）、ドデシル硫酸ナトリウムおよびテトラデシルトリメチルアンモニウムプロミドからなる群から選択されることを特徴とする、請求項65に記載の単相性医薬組成物。

**【請求項 109】**

前記界面活性剤が、抗菌薬特性および／または消毒特性も有することを特徴とする、請求項65に記載の単相性医薬組成物。

**【請求項 110】**

前記界面活性剤が、セトリミドであることを特徴とする、請求項109に記載の単相性医薬組成物。

**【請求項 111】**

前記界面活性剤が、ドキュセートナトリウムであることを特徴とする、請求項108に記載の単相性医薬組成物。

**【請求項 112】**

前記組成物が、一種以上の充填剤を含む、請求項65に記載の単相性医薬組成物。

**【請求項 113】**

前記充填剤粒子を、界面活性剤で被覆し、次いで被覆された充填剤とデバゼピドとを完全混和物にすることを特徴とする、請求項112に記載の単相性医薬組成物。

**【請求項 114】**

前記充填剤が、乳糖、マンニトール、タルク、ステアリン酸マグネシウム、塩化ナトリウム、塩化カリウム、クエン酸、噴霧乾燥乳糖、加水分解デンプン、デンプン、微結晶性セルロース、セルロース誘導体、ソルビトール、スクロース、スクロース系材料、イコデキストリン、硫酸カルシウム、第二リン酸カルシムおよびデキストロースおよびそれらの混合物からなる群から選択されることを特徴とする、請求項112に記載の単相性医薬組成物。

**【請求項 115】**

前記充填剤が、デンプンであることを特徴とする、請求項114に記載の単相性医薬組成物。

**【請求項 116】**

前記デンプンが、コーンスタークであることを特徴とする、請求項115に記載の単相性医薬組成物。

**【請求項 117】**

前記デバゼピド粒子のサイズと、前記充填剤粒子のサイズとが異なることを特徴とする、請求項112に記載の単相性医薬組成物。

**【請求項 118】**

デバゼピド：界面活性剤に比率が、5：1～25：1 w/w であることを特徴とする、請求項65に記載の単相性医薬組成物。

**【請求項 119】**

前記組成物が、デバゼピドと界面活性剤とを含み、前記組成物の残りが充填剤で構成されることを特徴とする、請求項112に記載の単相性医薬組成物。

**【請求項 120】**

前記組成物が、デバゼピド1.25mgと、界面活性剤0.1mgと、充填剤148.65mgとを含むことを特徴とする、請求項119に記載の単相性医薬組成物。

**【請求項121】**

前記組成物が、デバゼピド1.25mgと、ドキュセートナトリウム0.1mgと、コーンスター<sup>チ</sup>148.65mgとを含むことを特徴とする、請求項120に記載の単相性医薬組成物。

**【請求項122】**

前記組成物が、デバゼピド2.5mgと、界面活性剤0.2mgと、充填剤297.3mgとを含むことを特徴とする、請求項119に記載の単相性医薬組成物。

**【請求項123】**

前記組成物が、デバゼピド2.5mgと、ドキュセートナトリウム0.2mgと、コーンスター<sup>チ</sup>297.3mgとを含むことを特徴とする、請求項122に記載の単相性医薬組成物。

**【請求項124】**

前記組成物が、カプセル内に充填されることを特徴とする、請求項65に記載の単相性医薬組成物。

**【請求項125】**

前記カプセルが、ゼラチンカプセルであることを特徴とする、請求項124に記載の単相性医薬組成物。

**【請求項126】**

実質的に、添付の実施例に関連して記載されている通りの方法または組成物。