

【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 2004-522798 (P2004-522798A)
【公表日】平成 16 年 7 月 29 日 (2004.7.29)
【年通号数】公開・登録公報 2004-029
【出願番号】特願 2002-571033 (P2002-571033)
【国際特許分類第 7 版】

A 6 1 K 9/62
A 6 1 K 31/138
A 6 1 P 9/00

【F I】

A 6 1 K 9/62
A 6 1 K 31/138
A 6 1 P 9/00

【手続補正書】

【提出日】平成 17 年 3 月 4 日 (2005.3.4)

【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】

メトプロロールの固形分を含む造粒液体媒質を準備すること；
この造粒液体媒質を流動床中に噴霧すること；および
250 μ m 未満の粒度分布を有する微粒子を選別して、それによって少なくとも 80 重量 % のメトプロロールを有する乾燥した均一な微粒子を得ること
を含む、メトプロロールの均一な微粒子を製造する方法。

【請求項 2】

造粒液体媒質がさらにポリマーおよび / または分散剤を含む、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

造粒液体媒質がさらに、
固形分を基にして少なくとも 5 重量 % である、水溶性または水不溶性ポリマーから成る群から選択されるポリマー；および
このポリマーがそれに可溶性である液体
を含む、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 4】

ポリマーがそれに可溶性である液体が水、第三級ブチルアルコール、シクロヘキサン、塩化メチレン、メタノール、エタノールおよびその混合物類から成る群から選択される、請求項 2 に記載の方法。

【請求項 5】

メトプロロールのパーセント重量が 90 ~ 100 % の範囲内である、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 6】

微粒子の所望の粒度分布が 50 μ m ないし 100 μ m である、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 7】

微粒子の所望の粒度分布が100ないし200 μm である、請求項1～6のいずれか1項に記載の方法。

【請求項8】

造粒液体媒質の固形分が15ないし60重量%である、請求項1～7のいずれか1項に記載の方法。

【請求項9】

造粒液体媒質の固形分が20ないし50重量%である、請求項1～8のいずれか1項に記載の方法。

【請求項10】

造粒液体媒質が懸濁液である、請求項1～9のいずれか1項に記載の方法。

【請求項11】

造粒液体媒質が溶液である、請求項1～10のいずれか1項に記載の方法。

【請求項12】

造粒液体媒質がエマルジョンである、請求項1～11のいずれか1項に記載の方法。

【請求項13】

メトプロロールが塩形態であり、そしてメトプロロールコハク酸塩およびメトプロロールフマル酸塩から成る群から選択される、請求項1～12のいずれか1項に記載の方法。

【請求項14】

方法がさらに、選択された微粒子を制御放出剤皮でコーティングすることを含む、請求項1～13のいずれか1項に記載の方法。

【請求項15】

請求項1～14のいずれか1項に記載の方法に従って製造される微粒子。

【請求項16】

微粒子の乾燥重量を基にして少なくとも80重量%のメトプロロール、その塩、その単一エナンチオマーの1つ、またはその塩を含み、そして50ないし200 μm の粒度分布からなるメトプロロールを含む均一な微粒子。

【請求項17】

85～100重量%のメトプロロールを含む、請求項16に記載の均一な微粒子。

【請求項18】

50ないし100 μm の範囲内の粒度分布を含む、請求項16に記載の微粒子。

【請求項19】

100ないし200 μm の範囲内の粒度分布を含む、請求項16に記載の微粒子。

【請求項20】

さらに制御放出剤皮を含む、請求項16に記載の微粒子。

【請求項21】

メトプロロールが塩形態であり、そしてメトプロロールコハク酸塩およびメトプロロールフマル酸塩から成る群から選択される、請求項16に記載の微粒子。

【請求項22】

請求項16に記載の微粒子を含む医薬組成物。

【請求項23】

心臓血管障害の予防または治療用薬剤の製造のための請求項16に記載の微粒子の使用

。