

【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 6 月 9 日 (2005.6.9)

【公表番号】特表 2004-534739(P2004-534739A)
【公表日】平成 16 年 11 月 18 日 (2004.11.18)
【年通号数】公開・登録公報 2004-045
【出願番号】特願 2002-574948(P2002-574948)
【国際特許分類第 7 版】

A 6 1 K 31/553
A 6 1 K 9/08
A 6 1 K 9/14
A 6 1 K 9/20
A 6 1 K 9/48
A 6 1 K 47/18
A 6 1 K 47/20
A 6 1 K 47/28
A 6 1 K 47/30
A 6 1 K 47/32
A 6 1 K 47/34

【F I】

A 6 1 K 31/553
A 6 1 K 9/08
A 6 1 K 9/14
A 6 1 K 9/20
A 6 1 K 9/48
A 6 1 K 47/18
A 6 1 K 47/20
A 6 1 K 47/28
A 6 1 K 47/30
A 6 1 K 47/32
A 6 1 K 47/34

【手続補正書】
【提出日】平成 15 年 9 月 30 日 (2003.9.30)
【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】

固形の組成物であって、(a) 水溶性塩基性ポリマーと組み合わせたアニオン性界面活性剤、または (b) 水溶性酸性ポリマーと組み合わせたカチオン性界面活性剤、および (c) 少なくとも 1 種類の低水溶性医薬活性成分を含み、該活性成分が 20 の 1 リットルの水に対して、10 mg 未満の割合で可溶である、組成物。

【請求項 2】

アニオン性界面活性剤が有機酸およびその生理学的に許容される塩から選択される請求項 1 に記載の組成物であって、疎水性置換基を有し、そして該カチオン性界面活性剤が長鎖炭化水素基を有する生理学的に許容されるオニウム塩から選択される、組成物。

【請求項 3】

水溶性塩基性ポリマーが繰り返し単位中にアミド基またはアミン基を含んでなる、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 4】

ポリマーが、ポリリジン、ポリビニルピロリドン、所望により部分的にまたは全体としてメチル化または $C_1 \sim C_6$ アシル化されていてもよいポリビニルアミン、ポリアクリルアミド、ポリメタアクリルアミド、ポリ - N - メチル - もしくはポリ - N - ジメチルアクリル - もしくはメタアクリルアミド、およびポリ (2 - エチル - 2 - オキサゾリン) からなる群より選択される、請求項 3 に記載の組成物。

【請求項 5】

水溶性塩基性ポリマーがポリビニルピロリドンである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 6】

アニオン性界面活性剤が硫酸 $C_6 \sim C_{18}$ - モノアルキルまたはその Na^+ もしくは K^+ 塩であり、そして水溶性塩基性ポリマーがポリビニルピロリドンである、請求項 1 に記載の組成物。

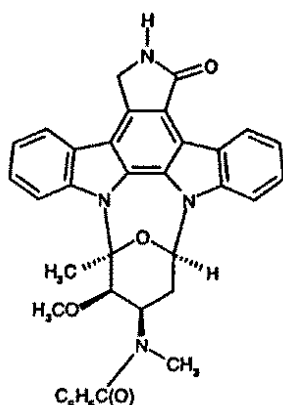
【請求項 7】

低水溶性医薬活性成分がスタウロスポリンある、請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 8】

低水溶性医薬活性成分が、式：

【化 1】



で示されるスタウロスポリンである、請求項 7 に記載の組成物。

【請求項 9】

水溶性ポリマーとアニオン性またはカチオン性界面活性剤との比が 10 : 1 ないし 1 : 1 である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 10】

低水溶性活性成分の量が、アニオン性またはカチオン性界面活性剤および水溶性ポリマーに基づき、0.01 ないし 30 重量%である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 11】

粉末、微細拡散顆粒、またはフィルムの形状で存在する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 12】

請求項 1 に記載の固形組成物の製造方法であって、

- a) 各成分、(a) アニオン性界面活性剤と水溶性塩基性ポリマー、または (b) アニオン性界面活性剤と水溶性酸性ポリマー、および (c) 少なくとも 1 種類の低水溶性活性成分を水中で混合、溶解させる工程；
- b) 固形組成物が得られるまで水分を除去する工程；または
- c) 各成分、(a) アニオン性界面活性剤と水溶性塩基性ポリマー、または (b) アニオン性界面活性剤と水溶性酸性ポリマー、および (c) 少なくとも 1 種類の低水溶性活性成分を有機溶媒中に混合、溶解させ、次いで、固形組成物が得られるまで溶媒を除去する工程；

を含んでなる、製造方法。

【請求項 1 3】

(a) 水溶性塩基性ポリマーと組み合せたアニオン性界面活性剤、または (b) 水溶性酸性ポリマーと組み合せたカチオン性界面活性剤、および (c) 少なくとも 1 種類の低水溶性医薬活性成分を水中または有機溶媒中に含み、該活性成分が 2 0 の 1 リットルの水に対して、1 0 m g 未満の割合で可溶である、溶液。

【請求項 1 4】

眼投与、経鼻投与または非経口投与用である、請求項 1 3 に記載の水溶液。

【請求項 1 5】

医薬担体に基づく固形剤形であって、(a) 水溶性塩基性ポリマーと組み合せたアニオン性界面活性剤、または (b) 水溶性酸性ポリマーと組み合せたカチオン性界面活性剤、および治療有効量の低水溶性医薬活性成分からなる固形混合物を含有し、該活性成分が 2 0 の 1 リットルの水に対して、1 0 m g 未満の割合で可溶である、固形剤形。