

【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3区分

【発行日】平成21年1月29日(2009.1.29)

【公表番号】特表2005-522542(P2005-522542A)

【公表日】平成17年7月28日(2005.7.28)

【年通号数】公開・登録公報2005-029

【出願番号】特願2003-584135(P2003-584135)

【国際特許分類】

C 08 F 220/00 (2006.01)

C 08 F 2/24 (2006.01)

【F I】

C 08 F 220/00

C 08 F 2/24 A

【誤訳訂正書】

【提出日】平成20年12月3日(2008.12.3)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

乳化剤の存在下、水中で、下記のモノマー：

40から80重量%の範囲のアクリル酸もしくはそのエステル；

20から60重量%の範囲のメタクリル酸もしくはそのエステル；および

0.01から5重量%の範囲の重合可能な界面活性剤；

を重合することによって得られる水性ポリマー分散液であって、包含される残留乳化剤が、重合反応後に部分的にもしくは完全に除去されポリマー量の0.67%(w/w)未満である、水性ポリマー分散液。

【請求項2】

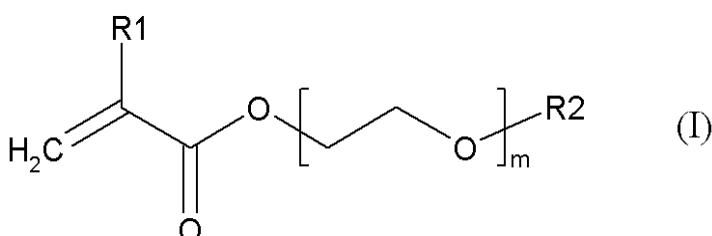
乳化剤の存在下、水中で、下記のモノマー：

40から80重量%の範囲のアクリル酸エチル；

20から60重量%の範囲のメタクリル酸メチル；および

0.01から9重量%の範囲の式I：

【化1】



[式中、mは、2～55の整数であり；

R1は、水素またはメチルであり；そして

R2は、水素、または1から20個の炭素原子を有する炭素鎖である]によって特徴付けられるモノマー；

を重合することによって得られる水性ポリマー分散液であって、包含される残留乳化剤が、重合反応後に部分的にもしくは完全に除去されポリマー量の0.67%(w/w)未満である

、水性ポリマー分散液。

【請求項3】

乳化剤が15kD未満の分子量を有する乳化剤である、請求項1に記載の水性ポリマー分散液。

【請求項4】

乳化剤が15kD未満の分子量を有する乳化剤である、請求項2に記載の水性ポリマー分散液。

【請求項5】

乳化剤が、重合の際は乳化剤として作用する重合可能な界面活性剤である、請求項1に記載の水性ポリマー分散液。

【請求項6】

乳化剤が、重合の際は乳化剤として作用する式Iのモノマーである、請求項2に記載の水性ポリマー分散液。

【請求項7】

請求項1から6の何れか1項に記載の水性分散液から水を除去することによって得られる医薬製剤をコートするのに使用するためのフィルム。

【請求項8】

残留乳化剤の総量が全ポリマー量の、0.67%(w/w)未満である、請求項7に記載のフィルム。

【請求項9】

a)薬理学的に活性な成分を含む薬剤コア；および

b)請求項7または8に記載のフィルムを含むフィルム・コーティング；
を含む医薬製剤。

【請求項10】

複数のビーズ中に提供される薬理学的に活性な成分を含む医薬製剤であって、それぞれのビーズが請求項7または8に記載のフィルムでコートされている医薬製剤。

【請求項11】

製剤が制御放出製剤である請求項9もしくは10の何れか1項に記載の製剤。

【請求項12】

薬理学的に活性な成分が心血管疾患もしくは胃腸疾患の処置に活性を有する、請求項9～11の何れか1項に記載の製剤。

【請求項13】

薬理学的に活性な成分が-遮断アドレナリン作動薬である、請求項9～11の何れか1項に記載の製剤。

【請求項14】

薬理学的に活性な成分がメトプロロールまたはその薬学的に許容される塩である、請求項13に記載の製剤。

【請求項15】

メトプロロール塩が、酒石酸塩、コハク酸塩、フマル酸塩、または安息香酸塩である、請求項14に記載の製剤。

【請求項16】

式Iのモノマーが、mが4であり、R1が水素であり、かつR2が13個の炭素原子を有すると定義される、請求項2、4または6に記載の水性ポリマー分散液。

【請求項17】

式Iのモノマーが、mが10であり、R1が水素であり、かつR2が11個の炭素原子を有すると定義される、請求項2、4または6に記載の水性ポリマー分散液。

【請求項18】

式Iのモノマーが、mが25であり、R1が水素であり、かつR2が18個の炭素原子を有すると定義される、請求項2、4または6に記載の水性ポリマー分散液。

【請求項19】

式Iのモノマーが、mが1であり、R1がメチルであり、かつR2が水素であると定義される、請求項2、4または6に記載の水性ポリマー分散液。

【請求項20】

式Iのモノマーが、mが9であり、R1がメチルであり、かつR2が水素であると定義される、請求項2、4または6に記載の水性ポリマー分散液。

【請求項21】

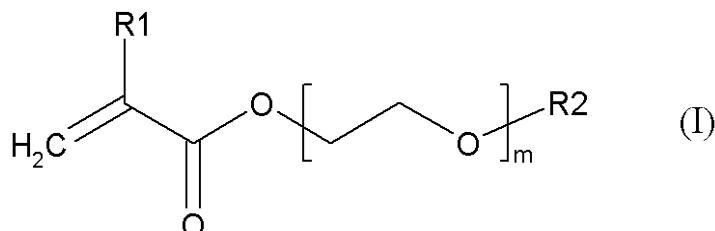
乳化剤の存在下、水中で、下記のモノマー：

40から80重量%の範囲のアクリル酸エチル；

20から60重量%の範囲のメタクリル酸メチル；および

0.01から9重量%の範囲の、式I：

【化2】



[式中、mが2～55の整数であり；

R1が水素またはメチルであり；そして

R2が、水素、または1から20個の炭素原子を有する炭素鎖である]によって特徴付けられるモノマー；

を重合し、重合反応後に残留乳化剤を部分的にもしくは完全に除去して、ポリマー量の0.67% (w/w)未満である残留乳化剤の総量を提供することを含む、水性ポリマー分散液の製造方法。

【請求項22】

該製造方法を1から100の範囲の温度で行う、請求項21に記載の方法。

【請求項23】

乳化剤が式Iのポリマーであり、それが重合の際に乳化剤として作用する、請求項21に記載の方法。

【請求項24】

薬剤コアまたはビーズを請求項1から6の何れか1項に定義した通りのフィルム・コーティング分散液でコートすることを含む、請求項9から15の何れか1項に記載の製剤を製造する方法。

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0012

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0012】

JP 01-113322 は、アクリル酸エチル(EA) - メタクリル酸メチル(MMA) - 2-ヒドロキシエチルメタクリレート(HEMA)を含む、徐放性を得るために薬物をコーティングするのに適切なエマルジョンを開示している。コポリマー中の共重合したモノマーの比は、EA : MMAが、3 : 1から1 : 3であり、HEMAの(EAおよびMMAに対する)比が、1 : 2から1 : 10である。これらの製剤のさらに詳細な事項は、以下の3つの論文で示されている。

・アクリル酸エチル(EA) - メタクリル酸メチル(MMA) - 2-ヒドロキシエチルメタクリレート(HEMA)の水性分散液の乳化重合によって製造されたコポリマーでフィルム・コートされた遅放性ラクトース・マイクロカプセルフィルムが、Chem. Pharm. Bull.

36 (8) 3070-3078 (1988) で開示されている。用いられたEA、MMA、およびHEMA

Aのモル比は、12:6:X、9:9:X、および6:12:Xであり、Xは、4、6、または8であった。用いられた乳化剤は、ドデシル硫酸ナトリウム(SDS)であった。

・該フィルム・コートの性質は、さらに、Chem. Pharm. Bull. 41(6) 1342-1136 (1993)で報告された。この論文の結論は、以下のものを全て示すコ-ポリ(EA-MMA-HEMA)のモノマー組成はないことが見出されたということである：低い凝集度(*low degree of agglomeration*)、低い透過性、および高収率のポリマー。

・Chem. Pharm. Bull. 42(6) 1308-1314 (1994)は、混合コポリマー・ラテックス、または混合コア壁ラテックスの使用が、求められる性質、例えば凝集、低い膜透過性、および高いコーティング効率の組み合わせを得るために必要であること、ラクトースをうまく完全にマイクロカプセルに入れられる、EA、MMA、およびHEMAを含むフィルムを製造することが求められることを開示している。用いられたEA、MMA、およびHEMAのモル比は、EA:MMA:HEMAが、6:12:8および12:6:4であった。