

【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1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2004-538301(P2004-538301A)

【公表日】平成16年12月24日(2004.12.24)

【年通号数】公開・登録公報2004-050

【出願番号】特願2003-516487(P2003-516487)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/30 (2006.01)

A 6 1 K 31/195 (2006.01)

A 6 1 K 47/04 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 9/30

A 6 1 K 31/195

A 6 1 K 47/04

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/38

A 6 1 P 9/10

【手続補正書】

【提出日】平成17年7月4日(2005.7.4)

【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】

(a)薬物、高膨潤性ポリマーおよびガス発生剤を含む制御放出コア(該コアは、長期間、胃腸液中でその物理的完全性を維持しながら、迅速に膨潤し、浮遊を達成する能力がある);および

(b)コア内のものと同じ薬物および医薬的に許容しうる賦形剤を含む速放性コーティング組成物(ここで、コーティング組成物は、システムが胃腸液中で薬物の二相性放出を提供するようにコアを取り囲む);

を含む胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項2】

高膨潤性ポリマーが、超崩壊剤および親水性ポリマーである請求項1に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項3】

超崩壊剤が、架橋ポリビニルピロリドン、架橋カルボキシメチルナトリウムセルロースおよびデンプングリコール酸ナトリウムである請求項2に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 4】

デンプングリコール酸ナトリウムを、コアの約 10 重量% ~ 約 40 重量% の量で用いる請求項 3 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 5】

用いる親水性ポリマーが、2% w/v の水溶液において、約 500 mPas ~ 約 120,000 mPas の水溶液粘度を有する高粘度セルロース誘導体である請求項 2 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 6】

高粘度セルロース誘導体が、2% w/v の水溶液において、9000 mPas ~ 30,000 mPas の水溶液粘度を有するヒドロキシエチルセルロースである請求項 5 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 7】

ヒドロキシエチルセルロースを、コアの約 15 重量% ~ 約 30 重量% の量で用いる請求項 6 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 8】

超崩壊剤がデンプングリコール酸ナトリウムであり、デンプングリコール酸ナトリウム：ヒドロキシエチルセルロースの比率が 4:6 ~ 6:4 である請求項 5 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 9】

ガス発生剤が、炭酸塩、重炭酸塩、亜硫酸塩およびその混合物から選ばれる請求項 1 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 10】

ガス発生剤が、さらに、クエン酸、リンゴ酸、コハク酸、酒石酸、フマル酸、マレイン酸、アスコルビン酸、グルタミン酸またはそれらの塩、ならびにそれらの混合物から選ばれる酸源を含む請求項 9 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 11】

用いるガス発生剤が、重炭酸ナトリウムである請求項 9 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 12】

重炭酸ナトリウムを、コアの約 1 重量% ~ 約 15 重量% の量で用いる請求項 11 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 13】

制御放出コアが、さらに、浸透性作用剤を含む請求項 1 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 14】

浸透性作用剤を、コアの約 2 重量% ~ 約 40 重量% の量で用いる請求項 13 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 15】

バクロフェンまたはその医薬的に許容しうる塩を含む胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 16】

バクロフェンまたはその医薬的に許容しうる塩、高膨潤性ポリマーおよびガス発生剤を含み、長期間、胃腸液中でその物理的完全性を維持しながら、迅速に膨潤し、浮遊を達成する能力がある請求項 15 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 17】

さらに、バクロフェンまたはその医薬的に許容しうる塩および医薬的に許容しうる賦形剤を含む速放性コーティング組成物を含む請求項 16 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 18】

高膨潤性ポリマーが、超崩壊剤および親水性ポリマーである請求項 16 に記載の胃保持

制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 19】

超崩壊剤が、架橋ポリビニルピロリドン、架橋カルボキシメチルナトリウムセルロースおよびデンプングリコール酸ナトリウムである請求項 18 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 20】

デンプングリコール酸ナトリウムを、コアの約 10 重量% ~ 約 40 重量% の量で用いる請求項 19 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 21】

用いる親水性ポリマーが、2% w/v の水溶液において、約 500 mPas ~ 約 1,20,000 mPas の水溶液粘度を有する高粘度セルロース誘導体である請求項 16 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 22】

高粘度セルロース誘導体が、2% w/v の水溶液において、9000 mPas ~ 30,000 mPas の水溶液粘度を有するヒドロキシエチルセルロースである請求項 21 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 23】

ヒドロキシエチルセルロースを、コアの約 15 重量% ~ 約 30 重量% の量で用いる請求項 22 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 24】

超崩壊剤がデンプングリコール酸ナトリウムであり、デンプングリコール酸ナトリウム：ヒドロキシエチルセルロースの比率が 4:6 ~ 6:4 である請求項 21 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 25】

ガス発生剤が、炭酸塩、重炭酸塩、亜硫酸塩およびその混合物から選ばれる請求項 16 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 26】

ガス発生剤が、さらに、クエン酸、リンゴ酸、コハク酸、酒石酸、フマル酸、マレイン酸、アスコルビン酸、グルタミン酸またはそれらの塩、ならびにそれらの混合物から選ばれる酸源を含む請求項 25 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 27】

用いるガス発生剤が、重炭酸ナトリウムである請求項 25 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 28】

重炭酸ナトリウムを、コアの約 1 重量% ~ 約 15 重量% の量で用いる請求項 27 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 29】

制御放出ドラッグデリバリーシステムが、さらに、浸透性作用剤を含む請求項 16 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 30】

浸透性作用剤を、コアの約 2 重量% ~ 約 40 重量% の量で用いる請求項 29 に記載の胃保持制御ドラッグデリバリーシステム。

【請求項 31】

バクロフェンおよび放出速度制御賦形剤を含む 1 日 1 回療法用の制御ドラッグデリバリーシステムであって、該 1 日 1 回療法のためにバクロフェンの血漿レベルが 24 時間にわたって望ましい範囲内になるように、血漿レベルへの制御を提供するように制御された様式でバクロフェンを放出するように適合されたシステム。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0051

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0051】

好ましい具体例において、高膨潤性ポリマーは、超崩壊剤と1種またはそれ以上の結合剤の混合物であり、結合剤は、親水性ポリマー、好ましくは、高膨潤性ポリマーから選ばれる。好ましい具体例において、親水性ポリマーは、約500 mPas～約120,000 mPasの水溶液粘度を有する高粘度セルロース誘導体である。本発明の1つの好ましい具体例において、好ましい膨潤性ポリマーとして、デンプングリコール酸ナトリウムと高粘度グレードヒドロキシエチルセルロースの混合物を用いる。別の具体例において、使用した高膨潤性ポリマーは、デンプングリコール酸ナトリウム、高粘度グレードヒドロキシエチルセルロースおよびヒドロキシプロピルメチルセルロースの混合物である。