

【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4月7日(2005.4.7)

【公表番号】特表2000-514051(P2000-514051A)

【公表日】平成12年10月24日(2000.10.24)

【出願番号】特願平10-503836

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 P 1/04

C 0 7 D 401/12

【F I】

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 P 1/04

C 0 7 D 401/12

【手続補正書】

【提出日】平成16年6月23日(2004.6.23)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】補正の内容のとおり

【補正方法】変更

【補正の内容】

手 続 補 正 書

平成16年 6 月 23 日

特許庁長官 今 井 康 夫 殿

1. 事件の表示

平成10年特許願第503836号

2. 補正をする者

住 所 スウェーデン国エス-151 85 セーデルティエ (番地なし)

名 称 アストラゼネカ・アクチエボラーグ

3. 代 理 人

住 所 東京都千代田区麹町一丁目10番地(麹町広洋ビル)

電 話 (3261)2022

氏 名 (9173) 高 木 千 嘉



(外1名)

4. 補正命令の日付 (自発)

5. 補正対象書類名

請 求 の 範 囲

6. 補正対象項目名

請 求 の 範 囲

7. 補正の内容

請求の範囲を別紙のとおり補正します。



審 査



請求の範囲

1. (a)慣用の薬剤アジュバントと共に、オメプラゾール、ランソプラゾールおよびパントプラゾールから選択される活性成分を含有するコア、
(b)そのコアに塗布された中間層、および
(c)胃液に抵抗性な外層
からなり、
部分的にアルカリで中和され、かつ陽イオン交換能を有する胃液抵抗性ポリマー層材料の反応性中間層が(b)に存在することを特徴とする
経口投与用の安定な薬剤。
2. アルカリが水酸化ナトリウムおよび水酸化カリウムから選択されることを特徴とする請求項1に記載の薬剤。
3. 薬剤アジュバントが、マンニットおよびヒドロキシプロピルセルロースから選択されることを特徴とする請求項1または2に記載の薬剤。
4. コアがさらに界面活性剤からなることを特徴とする請求項1～3のいずれか一項に記載の薬剤。
5. 界面活性剤がラウリル硫酸ナトリウム、ソルビタン脂肪酸エステルおよびポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステルから選択されることを特徴とする請求項4に記載の薬剤。
6. コアがペレットコア、錠剤、マイクロタブレットの形または顆粒として存在することを特徴とする請求項1～5のいずれか一項に記載の薬剤。
7. 反応性中間層中の胃液抵抗性ポリマー層材料が、部分的に5.5～7.0のpH範囲に中和されることを特徴とする請求項1～6のいずれか一項に記載の薬剤。
8. 部分的に中和された胃液抵抗性ポリマー層材料が、部分的に中和されたメタクリル酸とアクリル酸エチルのコポリマー、メタクリル酸とメタクリル酸メチルのコポリマー、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフ

- タレート (HPMCP) およびセルロースアセテートフタレート (CAP) から選択されることを特徴とする請求項 7 に記載の薬剤。
9. 反応性中間層が、さらに皮膚軟化剤からなることを特徴とする請求項 1～8 のいずれか一項に記載の薬剤。
10. 皮膚軟化剤が、クエン酸トリエチルエステル、クエン酸アセチルトリエチルエステル、アセチル化されたモノグリセリド、プロピレングリコールおよびポリエチレングリコールから選択されることを特徴とする請求項 9 に記載の薬剤。
11. 反応性中間層が、外層を通してプロトンを浸透させるゲル状の層を形成することを特徴とする請求項 1～10 のいずれか一項に記載の薬剤。
12. 反応性中間層が 5～30 μm の厚さを有することを特徴とする請求項 1～11 のいずれか一項に記載の薬剤。
13. (c)中の胃液抵抗性外層が、メタクリル酸とアクリル酸エチルのコポリマー、メタクリル酸とメタクリル酸メチルのコポリマー、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレート (HPMCP) および／またはセルロースアセテートフタレート (CAP) を含有することを特徴とする請求項 1～12 のいずれか一項に記載の薬剤。
14. 胃液抵抗性外層が、薬剤的に許容な粘着防止剤、分散剤、顔料および／または着色剤を含有することを特徴とする請求項 13 に記載の薬剤。
15. 粘着防止剤がタルクであることを特徴とする請求項 14 に記載の薬剤。
16. 胃液抵抗性外層が、20～60 μm の層の厚さを有することを特徴とする請求項 1～15 のいずれか一項に記載の薬剤。
17. (a)アルカリ添加剤なしに、アジュバントとしてマンニットおよびヒドロキシプロピルセルロースと共に、オメプラゾール、ランソプラゾールおよびパントプラゾールから選択される活性成分を含有するコア、
(b)部分的に水酸化ナトリウムで 5.5～7.0 の pH 範囲に中和されたメ

タクリル酸とアクリル酸エチルのコポリマーの $5 \sim 30 \mu\text{m}$ の厚さを有する、そのコアに塗布された反応性中間層、および

(c)メタクリル酸とアクリル酸エチルのコポリマーの $30 \sim 60 \mu\text{m}$ の厚さを有する胃液に抵抗性な外層

からなる請求項 1～16 のいずれか一項に記載の薬剤。

18. 反応性中間層が多数の単層として形成されることを特徴とする請求項 1～17 のいずれか一項に記載の薬剤。

19. 胃液抵抗性外層が多数の単層として形成されることを特徴とする請求項 1～18 のいずれか一項に記載の薬剤。

20. 胃液抵抗性外層から反応性中間層への境界における pH 変化が、勾配として形成されることを特徴とする請求項 1～19 のいずれか一項に記載の薬剤。

21. (a)成形品が、慣用の薬剤アジュバントと共に、オメプラゾール、ランソプラゾールおよびパントプラゾールから選択された活性成分を含有するコアとして形成され、

(b)中間層が成形品に塗布され、かつ

(c)このように被覆された成形品が胃液抵抗性層で積層され、

部分的にアルカリで中和され、かつ陽イオン交換能を有する胃液抵抗性ポリマー層材料の反応性中間層が(b)で塗布されることを特徴とする請求項 1～20 のいずれか一項に記載の薬剤からなる経口投与用の安定な薬剤の製造方法。

22. 胃液抵抗性ポリマー層材料が、噴霧前にアルカリで $5.5 \sim 7.0$ の pH 範囲に部分的に中和されていることを特徴とする請求項 21 に記載の方法。

23. 水酸化ナトリウムまたは水酸化カリウムがアルカリとして使用されることを特徴とする請求項 21 に記載の方法。

24. イソプロパノールが工程(a)の溶媒として使用されることを特徴と

する請求項 21 に記載の方法。

25. 請求項 1～20 のいずれか一項に記載の安定な薬剤に加えて、さらに活性成分としてジクロフェナクを含有する薬剤的組成物。

26. ジクロフェナクが、

(a)慣用のアジュバントと共にジクロフェナクを含有するコア、

(b)部分的にアルカリで中和された胃液抵抗性ポリマー層材料の反応性中間層、および

(c)胃液抵抗性外層

からなる剤型として存在することを特徴とする請求項 25 に記載の薬剤的組成物。

27. ジクロフェナクが胃液抵抗性被覆されたペレットおよび遅延透過性ペレットの混合物からなるペレット剤型として存在することを特徴とする請求項 25 に記載の薬剤的組成物。

28. 請求項 1～20 のいずれか一項に記載の安定性薬剤またはペレットとして請求項 25～27 のいずれか一項に記載の組成物からなることを特徴とする薬剤的カプセル剤型。