

【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22年5月20日(2010.5.20)

【公表番号】特表2010-501538(P2010-501538A)

【公表日】平成22年1月21日(2010.1.21)

【年通号数】公開・登録公報2010-003

【出願番号】特願2009-525110(P2009-525110)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/663	(2006.01)
A 6 1 K	9/36	(2006.01)
A 6 1 K	47/26	(2006.01)
A 6 1 K	31/675	(2006.01)
A 6 1 K	47/38	(2006.01)
A 6 1 K	47/32	(2006.01)
A 6 1 K	47/36	(2006.01)
A 6 1 K	47/02	(2006.01)
A 6 1 P	19/10	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/663
A 6 1 K	9/36
A 6 1 K	47/26
A 6 1 K	31/675
A 6 1 K	47/38
A 6 1 K	47/32
A 6 1 K	47/36
A 6 1 K	47/02
A 6 1 P	19/10

【手続補正書】

【提出日】平成22年3月25日(2010.3.25)

【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】

固体剤型を製剤化する方法であって、該方法が、

(i) ビスホスホネートまたは薬学的に許容可能なその類似体または誘導体の粒子を、コーティングおよび溶媒から本質的になるコーティング溶液または懸濁液と組み合わせる工程であって、該コーティングが薬学的に許容可能な水溶性の糖を含み、そして該コーティングの量が非コーティング粒子の10質量%から70質量%までである、工程；

(ii) 該溶液または懸濁液を乾燥して、ビスホスホネートのコーティングされた粒子を形成する工程；

(iii) 該(iii)のコーティングされた粒子と1以上の賦形剤とを混合する工程；および

(iv) 該コーティングされた粒子および1以上の賦形剤を固体剤型に形成する工程、を含む、方法。

【請求項2】

前記ビスホスホネートが、リセドロネート、イバンドロネート、パミドロネート、クロドロネート、ゾレドロネート、エチドロネート、チルドロネートおよびアレンドロネートから選択される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

前記薬学的に許容可能な糖が、ソルビトール、マンニトール、キシリトールまたはマルチトールから選択される、請求項 1 または 2 に記載の方法。

【請求項 4】

前記工程 (i) のコーティングの量が、非コーティング粒子の 20 質量 % から 50 質量 % までである、前記いずれかの請求項に記載の方法。

【請求項 5】

前記工程 (i) のコーティングの量が、非コーティング粒子の 30 質量 % である、請求項 4 に記載の方法。

【請求項 6】

前記方法から得られる剤型が、コーティングされた粒子を 7 5 質量 % まで含む、請求項 1 から 5 のいずれかに記載の方法。

【請求項 7】

前記粒子が、前記ビスホスホネートの吸収に実質的に影響しないコーティングでコーティングされる、請求項 1 から 6 のいずれかに記載の方法。

【請求項 8】

前記 1 以上の賦形剤が、崩壊剤を含む、請求項 1 から 7 のいずれかに記載の方法。

【請求項 9】

前記方法から得られる剤型が、8 5 質量 % まで、崩壊剤を含む、請求項 8 に記載の方法。

【請求項 10】

前記崩壊剤が、クロスカルメロースセルロース、クロスポビドン、微結晶性セルロース、クロスカルメロースナトリウムおよびデンブングリコール酸ナトリウムから選択される、請求項 8 または 9 に記載の方法。

【請求項 11】

工程 (i v) が、前記コーティングされた粒子および 1 以上の賦形剤を錠剤に圧縮する工程を含む、請求項 1 から 10 のいずれかに記載の方法。

【請求項 12】

前記ビスホスホネートまたは薬学的に許容可能なその類似体または誘導体の粒子を、前記コーティング溶液または懸濁液と混合してスラリーを形成する、請求項 1 から 11 のいずれかに記載の方法。

【請求項 13】

前記スラリーを乾燥する、請求項 12 に記載の方法。

【請求項 14】

前記固形剤型をコーティングする工程を含まない、請求項 1 から 13 のいずれかに記載の方法。

【請求項 15】

コーティングされた粒子を 20 質量 % から 40 質量 % まで、および崩壊剤を 30 質量 % から 80 質量 % まで含む非コーティングの錠剤を作製するための、請求項 14 に記載の方法。

【請求項 16】

請求項 1 から 15 のいずれかに記載の方法であって、

(i) ビスホスホネートまたは薬学的に許容可能なその類似体または誘導体の粒子をコーティングする工程；

(ii) 該コーティングされた粒子に薬学的に許容可能な賦形剤を添加し、賦形剤とコーティングされた粒子との組み合わせを得る工程；

(iii) 該 (ii) の組み合わせを粉碎する工程；

(i v) 該組み合わせと1以上の賦形剤とを混合する工程；および
(v) 該コーティングされた粒子および1以上の賦形剤を固形剤型に形成する工程、
を含む、方法。

【請求項17】

前記(i i)の賦形剤が、前記(i v)の1以上の賦形剤のうちの1つと同じである、
請求項16に記載の方法。

【請求項18】

前記(i i)の賦形剤が、セルロース、ラクトース、デンプンおよびリン酸カルシウム
から選択される、請求項16または17に記載の方法。

【請求項19】

前記(i i)の賦形剤が、微結晶性セルロースである、請求項18に記載の方法。

【請求項20】

請求項1から19のいずれかに記載の方法によって製剤化された固形剤型。

【請求項21】

骨粗鬆症を治療するための、請求項20に記載の固形剤型。

【請求項22】

骨粗鬆症を予防するための、請求項20に記載の固形剤型。

【請求項23】

固形剤型を製剤化する方法であって、該方法が、

(i) ビスホスホネートまたは薬学的に許容可能なその類似体または誘導体の粒子をコ
ーティングする工程；

(i i) (i)のコーティングされた粒子と1以上の賦形剤とを混合する工程；および
(i i i) 該コーティングされた粒子および1以上の賦形剤を固形剤型に形成する工程
、

を含み、

該粒子がコロイド状二酸化ケイ素でコーティングされ、そしてコーティングの量が非コ
ーティング粒子の10質量%から70質量%までである、方法。

【請求項24】

前記ビスホスホネートが、リセドロネート、イバンドロネート、パミドロネート、クロ
ドロネート、ゾレドロネート、エチドロネート、チルドロネートおよびアレンドロネート
から選択される、請求項23に記載の方法。

【請求項25】

前記粒子が、前記コーティングによってそれらの非コーティング質量の20%でコ
ーティングされる、請求項23または24に記載の方法。

【請求項26】

前記方法から得られる剤型が、コーティングされた粒子を75質量%まで含む、請求項
23から25のいずれかに記載の方法。

【請求項27】

前記粒子が、前記ビスホスホネートの吸収に実質的に影響しないコーティングでコ
ーティングされる、請求項23から26のいずれかに記載の方法。

【請求項28】

前記1以上の賦形剤が、崩壊剤を含む、請求項23から27のいずれかに記載の方法。

【請求項29】

前記方法から得られる剤型が、85質量%まで、崩壊剤を含む、請求項28に記載の
方法。

【請求項30】

前記崩壊剤が、クロスカルメロースセルロース、クロスポビドン、微結晶性セルロース
、クロスカルメロースナトリウムおよびデンプングリコール酸ナトリウムから選択される
、請求項28または29に記載の方法。

【請求項31】

工程 (i i i) が、前記コーティングされた粒子および 1 以上の賦形剤を錠剤に圧縮する工程を含む、請求項 2 3 から 3 0 のいずれかに記載の方法。

【請求項 3 2】

前記ビスホスホネートまたは薬学的に許容可能なその類似体または誘導体の粒子を、それらの上にコーティングを噴霧することによってコーティングする、請求項 2 3 から 3 1 のいずれかに記載の方法。

【請求項 3 3】

前記ビスホスホネートまたは薬学的に許容可能なその類似体または誘導体の粒子を、コーティング溶液または懸濁液と混合することによってコーティングする、請求項 2 3 から 3 1 のいずれかに記載の方法。

【請求項 3 4】

前記ビスホスホネートまたは薬学的に許容可能なその類似体または誘導体の粒子を、前記コーティング溶液または懸濁液と混合してスラリーを形成する、請求項 3 3 に記載の方法。

【請求項 3 5】

前記スラリーを乾燥する、請求項 3 4 に記載の方法。

【請求項 3 6】

前記固形剤型をコーティングする工程を含まない、請求項 2 3 から 3 5 のいずれかに記載の方法。

【請求項 3 7】

請求項 2 3 から 3 6 のいずれかに記載の方法であって、

(i) ビスホスホネートまたは薬学的に許容可能なその類似体または誘導体の粒子をコーティングする工程；

(i i) 該コーティングされた粒子に薬学的に許容可能な賦形剤を添加し、賦形剤とコーティングされた粒子との組み合わせを得る工程；

(i i i) 該 (i i) の組み合わせを粉碎する工程；

(i v) 該組み合わせと 1 以上の賦形剤とを混合する工程；および

(v) 該コーティングされた粒子および 1 以上の賦形剤を固形剤型に形成する工程、を含む、方法。

【請求項 3 8】

前記 (i i) の賦形剤が、前記 (i v) の 1 以上の賦形剤のうちの 1 つと同じである、請求項 3 7 に記載の方法。

【請求項 3 9】

前記 (i i) の賦形剤が、セルロース、ラクトース、デンプンおよびリン酸カルシウムから選択される、請求項 3 7 または 3 8 に記載の方法。

【請求項 4 0】

前記 (i i) の賦形剤が、微結晶性セルロースである、請求項 3 9 に記載の方法。

【請求項 4 1】

請求項 2 3 から 4 0 のいずれかに記載の方法によって製剤化された固形剤型。

【請求項 4 2】

骨粗鬆症を治療するための、請求項 4 1 に記載の固形剤型。

【請求項 4 3】

骨粗鬆症を予防するための、請求項 4 1 に記載の固形剤型。

【請求項 4 4】

ビスホスホネートまたは薬学的に許容可能なその類似体または誘導体のコーティングされた粒子を含む固形剤型であって、(i) 該粒子が、コロイド状二酸化ケイ素または薬学的に許容可能な糖でコーティングされ、そして (i i) 該コーティングの量が、非コーティング粒子の 10 質量 % から 70 質量 % までである、固形剤型。

【請求項 4 5】

前記ビスホスホネートが、リセドロネート、イバンドロネート、パミドロネート、クロ

ドロネット、ゾレドロネット、エチドロネット、チルドロネットおよびアレンドロネットから選択される、請求項44に記載の固体剤型。

【請求項46】

前記コーティングの量が、非コーティング粒子の質量の20%から50%までである、請求項44または45に記載の固体剤型。

【請求項47】

コーティングされた粒子を75質量%まで含む、請求項44から46のいずれかに記載の固体剤型。

【請求項48】

請求項44から47のいずれかに記載の、非コーティングの固体剤型。

【請求項49】

前記粒子が、前記ビスホスホネートの吸収に実質的に影響しないコーティングでコーティングされる、請求項44から48のいずれかに記載の固体剤型。

【請求項50】

崩壊剤をさらに含む、請求項44から49のいずれかに記載の固体剤型。

【請求項51】

85質量%まで、崩壊剤を含む、請求項50に記載の固体剤型。

【請求項52】

前記崩壊剤が、クロスカルメロースセルロース、クロスポビドン、微結晶性セルロース、クロスカルメロースナトリウムおよびデンブングリコール酸ナトリウムから選択される、請求項50または51に記載の固体剤型。

【請求項53】

錠剤として製剤化された、請求項44から52のいずれかに記載の固体剤型。

【請求項54】

薬学的キャリアをさらに含む、請求項44から53のいずれかに記載の固体剤型。