

【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；

( i i ) 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；

( i i i ) 該 ( 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 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 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 75 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、85 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プ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；

( 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 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 23 から 30 のいずれかに記載の方法。

【請求項 32】

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 23 から 31 のいずれかに記載の方法。

【請求項 33】

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 23 から 31 のいずれかに記載の方法。

【請求項 34】

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 33 に記載の方法。

【請求項 35】

前記スラリーを乾燥する、請求項 34 に記載の方法。

【請求項 36】

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 23 から 35 のいずれかに記載の方法。

【請求項 37】

請求項 23 から 36 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 ) の組み合わせを粉砕する工程；

( 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 38】

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 37 に記載の方法。

【請求項 39】

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 37 または 38 に記載の方法。

【請求項 40】

前記 ( i i ) の賦形剤が、微結晶性セルロースである、請求項 39 に記載の方法。

【請求項 41】

請求項 23 から 40 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 42】

骨粗鬆症を治療するための、請求項 41 に記載の固形剤型。

【請求項 43】

骨粗鬆症を予防するための、請求項 41 に記載の固形剤型。

【請求項 44】

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 45】

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 4 4 に記載の固形剤型。

【請求項 4 6】

前記コーティングの量が、非コーティング粒子の質量の 2 0 % から 5 0 % までである、請求項 4 4 または 4 5 に記載の固形剤型。

【請求項 4 7】

コーティングされた粒子を 7 5 質量 % まで含む、請求項 4 4 から 4 6 のいずれかに記載の固形剤型。

【請求項 4 8】

請求項 4 4 から 4 7 のいずれかに記載の、非コーティングの固形剤型。

【請求項 4 9】

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 4 4 から 4 8 のいずれかに記載の固形剤型。

【請求項 5 0】

崩壊剤をさらに含む、請求項 4 4 から 4 9 のいずれかに記載の固形剤型。

【請求項 5 1】

8 5 質量 % まで、崩壊剤を含む、請求項 5 0 に記載の固形剤型。

【請求項 5 2】

前記崩壊剤が、クロスカルメローズセルローズ、クロスボビドン、微結晶性セルローズ、クロスカルメローズ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 5 0 または 5 1 に記載の固形剤型。

【請求項 5 3】

錠剤として製剤化された、請求項 4 4 から 5 2 のいずれかに記載の固形剤型。

【請求項 5 4】

薬学的キャリアをさらに含む、請求項 4 4 から 5 3 のいずれかに記載の固形剤型。