

【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20年6月26日(2008.6.26)

【公表番号】特表2007-537169(P2007-537169A)

【公表日】平成19年12月20日(2007.12.20)

【年通号数】公開・登録公報2007-049

【出願番号】特願2007-511867(P2007-511867)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/42 (2006.01)

A 6 1 K 9/06 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/16 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 K 47/22 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

A 6 1 K 9/16 (2006.01)

A 6 1 K 9/50 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/42

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/16

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/18

A 6 1 K 47/22

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 9/50

【手続補正書】

【提出日】平成20年5月8日(2008.5.8)

【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】

媒体が、

i) そのポリマー中、グルコース - ラムノース - グルコース - グルクロン酸単位の 2 回の繰返しごとに、4 までの度合いでアシル化されたジェランガムまたはジェランガム混合物、および

ii) ジェランガムの膨張を改善する、電解質、有機酸および浸透圧剤、およびそれらの混合物からなる群より選択される親水性剤

を含む、一以上の活性物質の経口投与用媒体であって、

該媒体が、#4 LVスピンドルを有するブルックフィールド粘度計により、6rpmおよび20~25 で測定したときに、少なくとも約10,000 cpsの粘度（ここで、粘度計スピンドルは、試験サンプル容器の中心に置かれ、シャフトの狭い部分の midpoint まで、適当に浸され、試験方法は、ビーカー500 ml中に、試験物質22~88 gを正確に秤量し、水道水500 mlを加えて、物質全てが分散 / 溶解するまで混合し、約5分後に、粘度と温度を測定する）を有する、経口投与用媒体。

## 【請求項 2】

粘度が約10,000 ~ 約99,000 cpsの範囲にある、請求項 1 に記載の媒体。

## 【請求項 3】

アルギン酸、アルギン酸ナトリウム、アルギン酸カリウム、アルギン酸アンモニウム、アルギン酸カルシウム、プロパン-1,2-ジオール アルギネート、寒天、カラギーナン、加工ユーケマ藻類、ローカストビーンガム、グァーガム、トラガカント、アカシアゴム、キサントガム、カラヤガム、タラガム、コンニャク、ペクチン、メチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、エチルメチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、カルボキシメチルセルロースナトリウム、架橋されたカルボキシメチルセルロースナトリウム、酵素的に加水分解されたカルボキシメチルセルロースのようなセルロース誘導體、ゼラチン、またはそれらの混合物のような、親水コロイドおよびヒドロゲル化剤から選択される膨張および / またはゲル化剤をさらに含む、請求項 1 または 2 に記載の媒体。

## 【請求項 4】

ジェランガムが25メッシュ ~ 300メッシュの平均粒径を有する、請求項 1 ~ 3 のいずれか一つに記載の媒体。

## 【請求項 5】

ジェランガムが、1回の繰返しにつき一つのグリセレートおよび2回の繰返しごとに一つのアセテートのアシル化の度合を有する、請求項 1 に記載の媒体。

## 【請求項 6】

前記の親水性剤が、親水性のビニルおよびアクリルポリマー、ポリサッカライド、PEO、PEG、PPG、ポリ(2-ヒドロキシエチルメタクリレート)、ポリ(アクリル)酸、ポリ(メタクリル)酸、PVP、PVA、PVA/PVPコポリマー、HEC、HPC、HPMC、CMC、CEC、アルギン酸ナトリウム、ポリカルボフィル、ゼラチンおよび澱粉グリコール酸ナトリウム、ならびにそれらの混合物からなる群より選択される浸透圧剤である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一つに記載の媒体。

## 【請求項 7】

前記の親水性剤が、PEO、PEG、PVP、HPMCおよびポリアクリル酸、ならびにそれらの混合物からなる群より選択される浸透圧剤である、請求項 1 ~ 6 のいずれか一つに記載の媒体。

## 【請求項 8】

前記の親水性剤が、硫酸マグネシウム、塩化マグネシウム、塩化カルシウム、塩化ナトリウム、塩化リチウム、硫酸カリウム、炭酸ナトリウム、亜硫酸ナトリウム、硫酸リチウム、塩化カリウム、硫酸ナトリウム、マンニトール、キシリトール、尿素、ソルビトール、イノシトール、ラフィノース、ショ糖、グルコース、果糖、乳糖、イヌリン、インスタ

トシュガー、クエン酸、コハク酸、酒石酸、およびそれらの混合物よりなる群から選択される浸透圧剤である、請求項 1 ~ 7 のいずれか一つに記載の媒体。

【請求項 9】

前記の親水性剤が、グルコース、乳糖、ショ糖、マンニトール、キシリトールおよび塩化ナトリウム、ならびにそれらの混合物よりなる群から選択される浸透圧剤である、請求項 1 ~ 8 のいずれか一つに記載の媒体。

【請求項 10】

前記の親水性剤が、一価、二価または多価のイオン化可能な塩よりなる群から選択されるイオン化可能な物質または電解質である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一つに記載の媒体。

【請求項 11】

前記の塩が、種々のアルカリ金属および/またはアルカリ土類金属の硫酸塩、塩化物、ホウ酸塩、臭化物などを含む無機塩、およびクエン酸塩、酢酸塩、乳酸塩などのようなイオン化可能なアルカリ土類有機塩から選択される、請求項 10 に記載の媒体。

【請求項 12】

前記の塩が、硫酸カルシウム、塩化ナトリウム、硫酸カリウム、炭酸ナトリウム、塩化リチウム、リン酸三カリウム、ホウ酸ナトリウム、臭化カリウム、フッ化カリウム、重炭酸ナトリウム、塩化カルシウム、塩化マグネシウム、クエン酸ナトリウム、酢酸ナトリウム、乳酸カルシウム、硫酸マグネシウム、アルカリ金属塩化物、フッ化ナトリウム、クエン酸、コハク酸、フマル酸、リンゴ酸、マレイン酸、グルタル酸、乳酸などのような有機酸；硫酸ナトリウムのような硫酸アルカリ金属塩；二水素リン酸ナトリウム、一水素リン酸ナトリウム、リン酸水素二ナトリウム塩、およびそれらの混合物、ならびに多価金属カチオンから選択される、請求項 11 に記載の媒体。

【請求項 13】

前記の塩が、硫酸カルシウムまたは塩化ナトリウムである、請求項 12 に記載の媒体。

【請求項 14】

前記の親水性剤が、安息香酸、コハク酸、クエン酸およびアジピン酸ならびにその他の医薬的に認められた有機酸よりなる群から選択される有機酸である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一つに記載の媒体。

【請求項 15】

界面活性剤、着色剤、甘味剤、味マスキング剤、抗酸化剤、ポリサッカライド、糖、湿潤剤、UV吸収剤、懸濁化剤、安定化剤、可溶化剤、保存剤、加工助剤、pH調整剤、可塑剤、臭気マスキング剤、栄養剤、芳香剤、香気マスキング剤、乳化剤、増粘剤、分散剤、結晶成長抑制剤、結晶化促進剤、キレート化剤、緩衝剤、塩基および抗菌剤、ならびにそれらの混合物から選択される一以上の添加剤をさらに含む、請求項 1 ~ 14 のいずれか一つに記載の媒体。

【請求項 16】

グリセロールをさらに含む、請求項 1 ~ 15 のいずれか一つに記載の媒体。

【請求項 17】

例えば重炭酸ナトリウム、リン酸ナトリウム、水酸化ナトリウム、水酸化アンモニウム、スズ酸ナトリウム、トリエタノールアミン、クエン酸、塩酸、クエン酸ナトリウム、およびそれらの組合せのような水性ゲルのpHを調整するのに適したいずれかの物質からなる群から選択されるpH調整剤を含む、請求項 1 ~ 16 のいずれか一つに記載の媒体。

【請求項 18】

pH調整剤が、水性溶剤の添加により形成されるゲルのpHを約4.5 ~ 約11、好ましくは約5 ~ 約9、そしてより好ましくは約5 ~ 約8に調整するような量で存在する、請求項 17 に記載の媒体。

【請求項 19】

pH調整剤が、例えば、約0.05重量% ~ 約5重量%のような、約0.01重量% ~ 約15重量%で存在する、請求項 17 に記載の媒体。

【請求項 20】

医薬的に許容されるアニオン性界面活性剤、カチオン性界面活性剤、両性（両親媒性／両性親和性）界面活性剤、およびポロキサマー、PEGおよびPEOを含む非イオン性界面活性剤；メチル硫酸ナトリウム、ラウリル硫酸ナトリウムなどのようなアルキル基が1～14の炭素原子であるアルカン硫酸金属塩、ならびにジオクチルナトリウムスルホスクシネートからなる群から選択される湿潤剤を含む、請求項1～19のいずれか一つに記載の媒体。

【請求項21】

粉末ブレンドの形態にある、請求項1～20のいずれか一つに記載の媒体。

【請求項22】

顆粒、ビーズ、オブラートまたはペレットの形態にある、請求項1～21のいずれか一つに記載の媒体。

【請求項23】

請求項6～21のいずれか一つで定義されている少なくとも一つの添加剤および／または膨張および／またはゲル化剤が、顆粒状物質に加えられた、請求項1～22のいずれか一つに記載の媒体。

【請求項24】

顆粒状の形態にある、請求項1～20のいずれか一つに記載の媒体。

【請求項25】

一以上の活性物質をさらに含む、請求項1～24のいずれか一つに記載の媒体。

【請求項26】

活性物質が媒体との混合物中に存在する、請求項25に記載の媒体。

【請求項27】

活性物質が顆粒中に存在する、請求項23または24に記載の媒体。

【請求項28】

活性物質が、コーティングおよび／またはマイクロカプセル化された形態で存在するか、またはマトリックス中に埋め込まれた、請求項25に記載の媒体。

【請求項29】

活性物質が、該活性物質の制御された放出を許容する形態で存在する、請求項25に記載の媒体。

【請求項30】

試験スプーン中に試験物質0.5 g～0.7 gを正確に秤量し、水道水3 ml～5 mlを加え、1/2分待って、スプーンを逆さにし、もし試験物質が2分以内に落下（剥離）しなければ、その物質は試験にパスしたとする落下試験をパスする、請求項1～29のいずれか一つに記載の媒体。

【請求項31】

請求項1～30のいずれか一つで定義されている媒体と一以上の活性物質とを含む経口投与用の医薬組成物。

【請求項32】

固形投与形態にある、請求項31に記載の医薬組成物。

【請求項33】

単位投与形態にある、請求項32に記載の医薬組成物。

【請求項34】

複数の粒子または複数のユニットの形態にある、請求項32に記載の医薬組成物。

【請求項35】

風味をマスキングするおよび／または制御された放出機能を有する成分を含む、請求項31または32に記載の医薬組成物。

【請求項36】

カプセル剤、サシェ剤、錠剤、テープまたはラミネートの形態にある、請求項31または32に記載の医薬組成物。

【請求項37】

請求項32～36のいずれか一つで定義されている医薬組成物と合体した調剤ユニットを

含む投薬キット。

【請求項 3 8】

調剤ユニットがスプーンである、請求項 3 7 に記載の投薬キット。

【請求項 3 9】

単位投与形態にある、請求項 3 1 ~ 3 6 のいずれか一つで定義されている医薬組成物を含む調剤ユニット。

【請求項 4 0】

医薬組成物が、調剤ユニットの表面に付着または接着された、請求項 3 9 に記載の調剤ユニット。

【請求項 4 1】

くぼんだ表面を有する、請求項 3 9 または 4 0 に記載の調剤ユニット。

【請求項 4 2】

スプーンの形態にある、請求項 3 9 ~ 4 1 のいずれか一つに記載の調剤ユニット。

【請求項 4 3】

医薬組成物が、スプーンのくぼんだ部分に付着または接着された、請求項 4 2 に記載の調剤ユニット。

【請求項 4 4】

接着剤が、糖アルコール、糖、ポリビニルピロリドン (PVP)、ガムよりなる群から選択される、液体の形態または溶液である一以上の成分を含む、請求項 4 0 ~ 4 3 のいずれか一つに記載の調剤ユニット。

【請求項 4 5】

接着剤がPVPとグリセロールとの混合物を含む、請求項 4 0 ~ 4 4 のいずれか一つに記載の調剤ユニット。

【請求項 4 6】

乾燥成分をブレンドし、該混合物を任意に結合剤と顆粒化することを含む、請求項 3 1 ~ 3 4 のいずれか一つに記載の医薬組成物の製造方法。

【請求項 4 7】

医薬組成物が、ジェランガムの溶解性より実質的に低い溶解性を有する、一以上の賦形剤および/または活性成分をさらに含む、請求項 4 6 に記載の方法。

【請求項 4 8】

i) ジェランガムを含むが、ジェランガムの溶解性より実質的に低い溶解性を有する一以上の賦形剤および/または活性成分を本質的に含まない第一のブレンドを顆粒化すること

、  
ii) 顆粒化された第一のブレンドに、ジェランガムの溶解性より実質的に低い溶解性を有する一以上の賦形剤および/または活性成分を添加すること  
を含む、請求項 4 7 に記載の方法。

【請求項 4 9】

ジェランガムの溶解性より実質的に低い溶解性を有する一以上の賦形剤および/または活性成分が、追加的な賦形剤とのブレンドまたは顆粒として、顆粒化された第一のブレンドに加えらる、請求項 4 8 に記載の方法。