

(19) 日本国特許庁(JP)

(12) 公表特許公報(A)

(11) 特許出願公表番号

特表2007-523664

(P2007-523664A)

(43) 公表日 平成19年8月23日(2007.8.23)

(51) Int. Cl.		F I			テーマコード (参考)
A 6 1 J	1/03	(2006.01)	A 6 1 J	1/00	3 7 0 B
A 6 1 J	1/00	(2006.01)	A 6 1 J	1/00	B
					4 C 0 4 7

審査請求 有 予備審査請求 未請求 (全 9 頁)

(21) 出願番号	特願2006-505232 (P2006-505232)	(71) 出願人	500297535
(86) (22) 出願日	平成16年4月22日 (2004. 4. 22)		フェリング ベスローテン フェンノート
(85) 翻訳文提出日	平成17年12月5日 (2005. 12. 5)		シャップ
(86) 国際出願番号	PCT/EP2004/004280		オランダ エヌエルー 2 1 3 2 ジェイエ
(87) 国際公開番号	W02004/093883		ックス ホーフドルプ ポラリス アベニ
(87) 国際公開日	平成16年11月4日 (2004. 11. 4)		ュー 1 4 4
(31) 優先権主張番号	PA200300612	(74) 代理人	100062007
(32) 優先日	平成15年4月23日 (2003. 4. 23)		弁理士 川口 義雄
(33) 優先権主張国	デンマーク (DK)	(74) 代理人	100114188
(31) 優先権主張番号	03388023.8		弁理士 小野 誠
(32) 優先日	平成15年4月23日 (2003. 4. 23)	(74) 代理人	100119253
(33) 優先権主張国	欧州特許庁 (EP)		弁理士 金山 賢敦
(31) 優先権主張番号	60/464, 649	(74) 代理人	100103920
(32) 優先日	平成15年4月23日 (2003. 4. 23)		弁理士 大崎 勝真
(33) 優先権主張国	米国 (US)		

最終頁に続く

(54) 【発明の名称】 医薬組成物用サシェ

(57) 【要約】

本発明は、紙；接着層；バリアー層；およびシール層の複数層を含む医薬組成物用サシェに関する。

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

i) 紙；
i i) 接着層；
i i i) バリヤー層；および
i v) シール層
の複数層を含む医薬組成物用サシェ。

【請求項 2】

前記バリヤー層が、アルミニウムホイルであり、前記接着層が、好ましくはポリエチレンであり、かつ前記シール層が、好ましくは低密度ポリエチレンである請求項 1 に記載のサシェ。 10

【請求項 3】

前記紙 i) が、単位面積当たり $10 \sim 100 \text{ g/m}^2$ の重量を有する請求項 1 または 2 に記載のサシェ。

【請求項 4】

前記紙 i) が、単位面積当たり $30 \sim 70 \text{ g/m}^2$ の重量を有する請求項 3 に記載のサシェ。

【請求項 5】

前記紙 i) が、単位面積当たり $40 \sim 60 \text{ g/m}^2$ の重量を有する請求項 4 に記載のサシェ。 20

【請求項 6】

前記接着層 i i) が、単位面積当たり $6 \sim 20 \text{ g/m}^2$ の重量を有する前記請求項のいずれかに記載のサシェ。

【請求項 7】

前記接着層 i i) が、単位面積当たり $9 \sim 18 \text{ g/m}^2$ の重量を有する請求項 6 に記載のサシェ。

【請求項 8】

前記接着層 i i) が、単位面積当たり $12 \sim 15 \text{ g/m}^2$ の重量を有する請求項 7 に記載のサシェ。

【請求項 9】

前記シール層 i v) が、 $15 \sim 50 \mu\text{m}$ の厚さを有する前記請求項のいずれかに記載のサシェ。 30

【請求項 10】

前記シール層 i v) が、単位面積当たり $10 \sim 100 \text{ g/m}^2$ 、より好ましくは $15 \sim 75 \text{ g/m}^2$ 、好ましくは $20 \sim 50 \text{ g/m}^2$ 、より好ましくは $30 \sim 40 \text{ g/m}^2$ 、最も好ましくは 35 g/m^2 の重量を有する前記請求項のいずれかに記載のサシェ。

【請求項 11】

前記バリヤー層 i i i) が、 $6 \sim 30 \mu\text{m}$ 、より好ましくは $7 \sim 25 \mu\text{m}$ 、好ましくは $9 \sim 25 \mu\text{m}$ 、より好ましくは $8 \sim 20 \mu\text{m}$ 、好ましくは $9 \sim 15 \mu\text{m}$ 、より好ましくは $12 \mu\text{m}$ の厚さを有する前記請求項のいずれかに記載のサシェ。 40

【請求項 12】

医薬品製剤を含有する前記請求項のいずれかに記載のサシェ。

【請求項 13】

前記医薬品製剤が、メサラジンまたは製薬的に許容できるその塩を含む請求項 12 に記載のサシェ。

【請求項 14】

55 重量%を超えるメサラジンまたは製薬的に許容できるその塩を含む顆粒形態の経口用医薬品製剤を含有する請求項 12 または 13 に記載のサシェ。

【請求項 15】

医薬組成物用の前記請求項のいずれかに記載のサシェの使用。 50

【請求項 16】

医用目的の請求項 1 から 14 のいずれかに記載のサシェの使用。

【発明の詳細な説明】

【技術分野】

【0001】

本発明は、医薬組成物用サシェに関する。

【0002】

本願 (w r i t) は、デンマーク特許出願 P A 2003 00612、欧州特許出願 E P 03388023、および米国仮特許出願第 60/464649 号からの優先権を主張する。

10

【背景技術】

【0003】

錠剤または顆粒剤のいずれかであるメサラジンを含む経口用医薬品製剤が知られている。顆粒剤は、サシェに詰めることができる。本発明の目的に関して、「サシェ」とは、顆粒剤用の包みまたはバッグを言い、また、「顆粒剤」とは、粒子、顆粒または球状化粒子を言う。

【0004】

知られたサシェは、製造方法の複雑さ、または製造コストの高さという欠点をこうむる傾向がある。消費者によって受け入れられるために、サシェは、好ましくは、鋏を使用しないで容易に開封できなければならない。サシェから顆粒剤を移す際に、できるだけ物質の損失が少ないことが好ましい。一定の顆粒剤タイプとサシェの間には静電気が発生し得る。これは、顆粒のタイプならびにサシェのタイプに左右される。静電気が存在する場合、サシェから顆粒剤を移すことが困難になりがちである。最後に、サシェ中の顆粒剤は、光、湿気および／または空気による分解に鋭敏であり得る。これもまた、サシェのタイプならびに顆粒のタイプに左右される。

20

【発明の開示】

【発明が解決しようとする課題】

【0005】

本発明の態様は、これらの問題、および下記のその他の問題に取り組む。

【課題を解決するための手段】

30

【0006】

本発明の目的のために、用語の「メサラジン」はまた、W O 97/23199 15 ページ、17 行目～6 ページ、12 行目に記載されたものなど、製薬的に許容できるその塩類およびエステル類、ならびにバルサラジドなどのプロドラッグを包含する。

【0007】

本発明によるサシェに保存される製剤は、粒子状物、例えば、顆粒、球状物、ペレット、粒子の形態が好ましく、顆粒の形態が好ましい。

【0008】

当該サシェは、任意の医薬品製剤に使用され得るが、メサラジンなどの感受性の高い化合物を含む医薬品を保存するために特に好適である。

40

【発明を実施するための最良の形態】

【0009】

一態様によれば、本発明は、

i) 紙；

i i) 接着層、好ましくはポリエチレンなどの接着剤；

i i i) バリヤー層、好ましくはアルミニウムホイル；および

i v) シール層、好ましくは低密度ポリエチレン

の複数層を含むサシェに関する。

【0010】

メサラジンは、湿気、大気および／または光に感受性が高い。したがって、メサラジン

50

を含有する製品のためのサシェは、湿気、大気および光に対するバリエーを提供することが好ましいと云える。前記サシェはまた、患者にとって開封が容易である必要があり、鋏などのさらなる道具を使用することがないのが好ましい。人の指によりサシェを引き裂いて開封できることを犠牲にすることなく、必要なバリエー性を有するサシェを提供することが課題となっていた。さらに、既存のサシェは、静電気の発生をこうむりがちである。サシェは、好ましくは、製造が容易で、充填が容易で、空にすることが容易であるべきで、また患者のコンプライアンスを改善するために魅力ある外見を有するべきである。

【0011】

本態様は、例えば、有効医薬成分が、メサラジンであるサシェに含まれた医薬組成物に関して長期保存安定性を供与するサシェを提供する。さらに、前記サシェは、引き裂くことが容易であり、静電気が除去されて、その内容物を完全に空にし得るサシェを提供する。本発明によるサシェと経口用製剤との組合せは、殆ど静電気を発生させない。

【0012】

外側の紙 i) は、好ましい実施形態において、単位面積当たり $10 \sim 100 \text{ g/m}^2$ 、好ましくは $30 \sim 70 \text{ g/m}^2$ 、より好ましくは $40 \sim 60 \text{ g/m}^2$ 、最も好ましくは 50 g/m^2 の重量を有する。

【0013】

単位面積当たり $10 \sim 100 \text{ g/m}^2$ の範囲外の重量を有する紙は、サシェの工業的製造においてほとんど好適とは言えない。単位面積当たり約 $30 \sim 40 \text{ g/cm}^2$ 以下の重量を有する紙は、サシェ用の製造装置内で破損しがちである。単位面積当たり約 $60 \sim 70 \text{ g/cm}^2$ 超の重量を有する紙については、材料をサシェへと形状化することが困難である。単位面積当たり約 50 g/cm^2 を超える重量により最適な結果が達成された。

【0014】

一態様によれば、接着層 ii) は、好ましくは単位面積当たり $6 \sim 20 \text{ g/m}^2$ 、好ましくは $9 \sim 18 \text{ g/m}^2$ 、より好ましくは $12 \sim 15 \text{ g/m}^2$ の重量を有する。極めて薄い層が用いられる場合、通常、適切な適用範囲を達成するために高価な特殊のポリマー類の使用が必要となる。厚い層が適用される場合、本質的により高価となり、また、層の不均一性を避けることが難しい。

【0015】

一態様によれば、バリエー層 iii) は、好ましくは $6 \sim 30 \mu\text{m}$ 、より好ましくは $7 \sim 25 \mu\text{m}$ 、好ましくは $9 \sim 25 \mu\text{m}$ 、より好ましくは $8 \sim 20 \mu\text{m}$ 、好ましくは $9 \sim 15 \mu\text{m}$ 、より好ましくは $12 \mu\text{m}$ の厚さを有する。

【0016】

前記請求項のいずれかに記載のサシェであって、前記シール層 iv) は、 $15 \sim 50 \mu\text{m}$ の厚さを有する。極めて薄い層が適用される場合、表面を完全には被覆しない傾向がある。極めて厚い層が適用される場合、完全に融着することが難しく、どんな加熱が適用されても、均一に温めることは難しい。

【0017】

一態様によれば、シール層 iv) は、好ましくは単位面積当たり $10 \sim 100 \text{ g/m}^2$ 、より好ましくは $15 \sim 75 \text{ g/m}^2$ 、好ましくは $20 \sim 50 \text{ g/m}^2$ 、より好ましくは $30 \sim 40 \text{ g/m}^2$ 、最も好ましくは 35 g/m^2 の重量を有する。

【0018】

一態様によれば、本発明は、本発明による医薬組成物用サシェの使用に関する。

【0019】

前記サシェは、本発明による医薬組成物を保存するのに好適であることが証明された。

【0020】

一態様によれば、本発明は、医用目的のサシェの使用に関する。

【0021】

本願のサシェは、メサラジンまたは製薬的に許容できるその塩を含む医薬品製剤に特に好適である。

【0022】

当該サシェは、静電気の発生が著しく低い傾向にある。これは以前に、特にメサラジン顆粒剤に伴った問題であった。このようなメサラジン製品の例として、特許出願PCT/DK01/00677により得られる顆粒剤を述べることができる。

【0023】

本発明の態様によれば、それは、本願サシェ中の顆粒剤における有効成分として、メサラジンの使用に限定されず、WO 00/44353、12～16ページに記載された成分など、他の有効成分にも関連する。

【0024】

本発明の態様によれば、さらに、充填剤、崩壊剤、pH調整剤、または界面活性剤などの添加剤を、本発明による組成物に含むことができる。このような添加剤は、文献でよく知られており、多数の好適な添加剤に関して、例えば、WO 00/44353、16～20ページを参照されたい。

【0025】

幾つかの添加剤は、吸湿性である。このような添加剤の例として、ポビドンを挙げることができる。有効成分が、吸湿性添加剤と共に製剤化される場合、好適なサシェの必要性が強調される。当該サシェは、少なくとも1種の吸湿性添加剤を含む医薬品に用いるのに好適である。

【実施例】

【0026】

サシェの材料は、以下の構成である：

クレーコート化紙	50 g/m ²
低密度ポリエチレン	12 g/m ²
アルミニウムホイル	12 μm
低密度ポリエチレン	35 g/m ²

本実施例に関して、12 g/m²のPEは、13 μmに相当し、35 g/m²のPEは、38 μmに相当する。この材料は、129 g/m²の秤量を有した。水蒸気に対する透過性は、24時間、25℃、75%RHで<0.05 g/m²であり、O₂に対する透過性は、24時間、1気圧、23℃、75%RHで<0.05 ml/m²であった。

【0027】

前記紙が、サシェの外側にあるように、充填／シールステーションの充填チューブをサシェで包み、次いで、シール層としての低密度ポリエチレンにより縦にシールする。サシェ底部に交差シールを形成後、サシェに顆粒剤を充填してから、上部で再度シールし、最後に切断する。

【0028】

全ての引用文献は、参照としてそれら全体を援用する。

10

20

30

【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No
PCT/EP2004/004280A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER
IPC 7 B65D31/02 A61K9/00 A61K31/60

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)
IPC 7 A61K B65D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the International search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, EMBASE, PAJ

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	US 6 537 680 B1 (FREDLUND MATS ET AL) 25 March 2003 (2003-03-25)	1-16
Y	the whole document	1-16
X	US 6 150 004 A (FUKUSHIMA YOUICHI ET AL) 21 November 2000 (2000-11-21) abstract the whole document	1-16
X	US 4 360 550 A (ASAKURA HIROSHI ET AL) 23 November 1982 (1982-11-23) the whole document	1-16
X	US 4 867 977 A (BURGUIENE MARTINE ET AL) 19 September 1989 (1989-09-19) abstract column 4, line 55 - column 4, line 65	1-16
	----- -/--	

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.☒ Patent family members are listed in annex.

* Special categories of cited documents:

- *A* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- *E* earlier document but published on or after the international filing date
- *L* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- *O* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- *P* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

T later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

X document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

Y document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

Z document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

26 October 2004

Date of mailing of the international search report

04/11/2004

Name and mailing address of the ISA
European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2
NL-2280 HV Rijswijk
Tel. (+31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Felder, C

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No.
PCT/EP2004/004280

C.(Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT		
Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
Y	VARIA: "Pentasa Sachet: Prolonged Release Granules 1 g" DANISH SPECIALITY, 19 January 2001 (2001-01-19), XP002261788 the whole document	1-16

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

 International Application No
 PCT/EP2004/004280

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)	Publication date
US 6537680	B1	25-03-2003	SE 512776 C2 15-05-2000
			AU 5893899 A 27-03-2000
			BR 9913134 A 08-05-2001
			CA 2342227 A1 16-03-2000
			CN 1136361 B 28-01-2004
			EP 1117869 A1 25-07-2001
			JP 2002524315 T 06-08-2002
			NZ 510171 A 29-04-2003
			PL 346425 A1 11-02-2002
			RU 2202021 C2 10-04-2003
			SE 9802967 A 04-03-2000
			WO 0014333 A1 16-03-2000
US 6150004	A	21-11-2000	JP 8080597 A 26-03-1996
			AU 694163 B2 16-07-1998
			AU 1481195 A 25-01-1996
US 4360550	A	23-11-1982	JP 56040547 A 16-04-1981
			JP 57041341 B 02-09-1982
			JP 1311008 C 11-04-1986
			JP 56053068 A 12-05-1981
			JP 60036938 B 23-08-1985
			DE 3034563 A1 19-03-1981
			FR 2464895 A1 20-03-1981
US 4867977	A	19-09-1989	FR 2600893 A1 08-01-1988
			AT 392588 B 25-04-1991
			AT 164187 A 15-10-1990
			AU 597992 B2 14-06-1990
			AU 7491387 A 07-01-1988
			BE 1007686 A4 03-10-1995
			CA 1305057 C 14-07-1992
			CH 674935 A5 15-08-1990
			CY 1684 A 10-10-1993
			DE 3720510 A1 07-01-1988
			DK 333487 A 02-01-1988
			ES 2006192 A6 16-04-1989
			FI 872871 A ,B, 02-01-1988
			GB 2192131 A ,B, 06-01-1988
			GR 871015 A1 02-11-1987
			HK 80393 A 13-08-1993
			HU 49481 A2 30-10-1989
			IE 60430 B1 13-07-1994
			IL 83032 A 12-05-1991
			IT 1216829 B 14-03-1990
			JP 63022522 A 30-01-1988
			KR 9514449 B1 28-11-1995
			LU 86932 A1 20-01-1988
			NL 8701440 A ,B, 01-02-1988
			NO 872712 A ,B, 04-01-1988
			NZ 220898 A 26-04-1991
			PH 25430 A 01-07-1991
			PT 85212 A ,B, 01-07-1987
			SE 502567 C2 13-11-1995
			SE 8702712 A 02-01-1988
			SG 123192 G 19-02-1993
			ZA 8704769 A 22-02-1989

フロントページの続き

(81)指定国 AP(BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), EA(AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), EP(AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU, IE, IT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR), OA(BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG), AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW

(74)代理人 100124855

弁理士 坪倉 道明

(72)発明者 ウィダーストロム, カリン

スウェーデン国、エスー 2 3 6 3 8、ヘルバイキン、ヘルバイクツランズバーゲン・ 7 7 ・ビー
Fターム(参考) 4C047 AA17 BB04 BB08 BB13 BB14 BB30 CC14 FF06 FF09 GG02
GG04 GG34 GG40