

【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 19 年 12 月 13 日 (2007.12.13)

【公表番号】特表 2007-509891 (P2007-509891A)

【公表日】平成 19 年 4 月 19 日 (2007.4.19)

【年通号数】公開・登録公報 2007-015

【出願番号】特願 2006-537197 (P2006-537197)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/04 (2006.01)

A 6 1 K 9/58 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/138 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 9/32

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/04

A 6 1 K 9/58

A 6 1 P 9/12

A 6 1 K 31/138

【手続補正書】

【提出日】平成 19 年 10 月 26 日 (2007.10.26)

【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】

単一層で被覆された経口投与のための薬学的活性成分含有製剤であって、前記単一層は 1 種以上のフィルム形成ポリマー、および

少なくとも 2 種の分離剤を含み、

前記分離剤のうち、少なくとも一つは脂肪酸塩であり、少なくとも一つは層状シリケートである、製剤。

【請求項 2】

前記単一層が界面活性剤または消泡剤を安定剤として含まない、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 3】

前記フィルム形成ポリマーが、水ベース分散液の形で提供されうることの特徴とする、請求項 1 または 2 に記載の製剤。

【請求項 4】

前記フィルム形成ポリマーが複数のフィルム形成ポリマーの混合物である、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 5】

ポリアクリレートフィルム形成ポリマーとして有する、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項

に記載の製剤。

【請求項 6】

前記ポリアクリレートがアクリル酸、メタクリル酸、アクリル酸エステルおよび／またはメタクリル酸エステルに基づくポリマーである、請求項 5 に記載の製剤。

【請求項 7】

前記脂肪酸塩が、脂肪酸のアルカリ金属塩および／またはアルカリ土類金属塩および／またはアルミニウム塩である、請求項 1 ～ 6 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 8】

ベヘン酸ナトリウム、カリウム、マグネシウムおよび／またはカルシウムを脂肪酸のアルカリ金属塩またはアルカリ土類金属塩として含む、請求項 7 に記載の製剤。

【請求項 9】

ステアリン酸ナトリウム、カリウム、マグネシウム、カルシウムおよび／またはアルミニウムを脂肪酸のアルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩またはアルミニウム塩として含む、請求項 7 に記載の製剤。

【請求項 10】

カプリル酸、カプリン酸、ラウリン酸および／またはパルミチン酸のマグネシウム塩を脂肪酸のアルカリ土類金属塩として含む、請求項 7 に記載の製剤。

【請求項 11】

脂肪酸塩の含有率が、フィルム形成ポリマーの乾燥重量に基づいて、5 ～ 40 重量％である、請求項 1 ～ 10 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 12】

タルカム、カオリナイト、パイロフィライト、アタパルジャイト、セピオライト、白雲母、モンモリロン石、ベントナイトおよび／またはパーミキュル石を層状シリケートとして含む、請求項 1 ～ 11 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 13】

層状シリケートの含有率が、フィルム形成ポリマーの乾燥重量に基づいて、20 ～ 60 重量％である、請求項 1 ～ 12 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 14】

単一層で被覆された活性成分含有コアの形が、カプセル、錠剤、ペレット、顆粒、ミニタブレットまたはマイクロペレットである、請求項 1 ～ 13 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 15】

単一層で被覆された活性成分含有コアの形が、活性成分結晶である、請求項 1 ～ 13 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 16】

ペレットまたはマイクロペレットの形の活性成分含有コアが不活性コアを含み、活性成分含有コアが特に活性成分含有コーティングを有する不活性コアで構成されている、請求項 14 に記載の製剤。

【請求項 17】

マイクロペレットが多数単位投与形として、特に錠剤またはカプセルの形で提供される、請求項 14 または 16 に記載の製剤。

【請求項 18】

ペレット、顆粒またはミニタブレットが多数単位投与形として、特にカプセルの形で提供される、請求項 14 または 16 に記載の製剤。

【請求項 19】

多数単位投与形が請求項 1 ～ 13 のいずれか一項に記載の単一層で被覆される、請求項 17 または 18 に記載の製剤。

【請求項 20】

多数単位投与形がカプセル、特にソフトゼラチンカプセルである、請求項 17 ～ 19 のいずれか一項に記載の製剤。

## 【請求項 2 1】

活性成分が薬学的に許容される助剤、特に通例の助剤との混合物の形で提供される、請求項 1 ~ 2 0 のいずれか一項に記載の製剤。

## 【請求項 2 2】

活性成分が界面活性剤、特に非イオンまたはイオン界面活性物質との混合物の形、あるいは界面活性剤を含まない形で提供される、請求項 1 ~ 2 1 のいずれか一項に記載の製剤。

## 【請求項 2 3】

3 0 0 g / L 水溶液を越える溶解度を有する易水溶性活性成分を含む、請求項 1 ~ 2 2 のいずれか一項に記載の製剤。

## 【請求項 2 4】

活性成分としてメトプロロールまたはその塩、特にコハク酸メトプロロールを含む、請求項 1 ~ 2 3 のいずれか一項に記載の製剤。

## 【請求項 2 5】

分散液がフィルム形成ポリマーおよび少なくとも 2 種の分離剤を含み、安定剤を含まない、請求項 1 ~ 2 4 のいずれか一項に記載の経口投与用薬学的活性成分含有製剤用の単一層を製造するための水性分散液であって、ポリマーの乾燥重量に基づいて、

少なくとも 1 種の脂肪酸塩が 5 ~ 4 0 重量 % の量で分離剤として存在し、および層状シリケートが 2 0 ~ 6 0 重量 % の量で存在する、  
水性分散液。

## 【請求項 2 6】

分散液が界面活性剤または消泡剤を安定剤として含まず、  
特に非イオン界面活性剤、とりわけポリソルベート、モノイソステアリン酸ソルビタン、モノラウリン酸ソルビタン、モノパルミチン酸ソルビタン、モノステアリン酸ソルビタン、モノオレイン酸ソルビタン、セスキオレイン酸ソルビタン、トリオレイン酸ソルビタン、モノステアリン酸グリセリル、モノオレイン酸グリセリルおよび / またはポリビニルアルコール、  
特に陰イオン界面活性剤、とりわけドキュセートナトリウムおよび / またはラウリル硫酸ナトリウム、  
特に陽イオン界面活性剤、とりわけ塩化ベンザルコニウム、塩化ベンゼトニウムおよび / またはセトリミド、  
特にシリコン系消泡剤および / または  
特に消泡剤としてのグリセロール、ソルビトールおよび / または P E G 誘導体  
を含まない請求項 2 5 に記載の水性分散液。

## 【請求項 2 7】

下記の工程を含む、請求項 2 5 または 2 6 に記載の水性分散液を製造するための方法。  
少なくとも 1 種の脂肪酸塩と、少なくとも 1 種の層状シリケートとを混合し、分離剤混合物を調製する工程、および  
該分離剤混合物を、フィルム形成ポリマーの水性懸濁液に添加する工程。

## 【請求項 2 8】

活性成分含有コアに、請求項 2 5 ~ 2 7 のいずれか一項に記載の水性分散液を噴霧することを特徴とする請求項 1 ~ 2 4 のいずれか一項に記載の薬学的活性成分含有製剤を製造するための方法。

## 【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 2 9

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 2 9】

本発明の問題は、単一層（以下、コーティングまたは単一コーティングということもあ

る ) で被覆された経口投与のための薬学的活性成分含有製剤による態様によって解消され、その単一層は 1 種以上のフィルム形成ポリマーおよび少なくとも 2 種の分離剤を含み、前記分離剤のうち、少なくとも一つは脂肪酸塩であり、少なくとも一つは層状シリケートである。