

【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18年1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2005-508971(P2005-508971A)

【公表日】平成17年4月7日(2005.4.7)

【年通号数】公開・登録公報2005-014

【出願番号】特願2003-537610(P2003-537610)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/138 (2006.01)

A 6 1 K 9/16 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/30 (2006.01)

A 6 1 K 9/36 (2006.01)

A 6 1 K 31/4196 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/24 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 P 5/32 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 249/08 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/138

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/30

A 6 1 K 9/36

A 6 1 K 31/4196

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/24

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/38

A 6 1 P 5/32

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 249/08 5 3 0

【手続補正書】

【提出日】平成17年6月9日(2005.6.9)

【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】

> 15% のタモキシフェンを含んでなり、
さらに：

- a) 有効量の希釈剤；
- b) 有効量の崩壊剤；
- c) 有効量の結合剤；および
- d) 有効量の滑沢剤；

を含んでなる医薬製剤であって、

2% (w/w) 以下の水分含量を有し、約 30,000 ~ 約 55,000 cm² / 100 g タモキシフェンの顆粒表面積を有する顆粒を含む、前記製剤。

【請求項 2】

有効量のアナストロゾールをさらに含んでなる、請求項 1 に記載の医薬製剤。

【請求項 3】

前記製剤が錠剤である、請求項 1 又は 2 に記載の医薬製剤。

【請求項 4】

有効量の皮膜形成要素；
有効量の可塑剤；および
有効量の乳白剤

を含んでなるコーティング剤をさらに含んでなる、請求項 3 に記載の医薬製剤。

【請求項 5】

- a) 約 2.75 mg のヒドロキシプロピルメチルセルロース；
- b) 約 0.54 mg のポリエチレングリコール 300；および
- c) 約 0.90 mg の二酸化チタン

を含んでなるコーティング剤をさらに含んでなる、請求項 3 に記載の医薬製剤。

【請求項 6】

約 > 15% ~ 約 20% (w/w) までのクエン酸タモキシフェン；
約 0.5% ~ 約 0.67% (w/w) までのアナストロゾール；
約 1% ~ 約 4% (w/w) までの結合剤；
約 2 ~ 5% (w/w) の崩壊剤；および
約 (0.5 ~ 2% の) 滑沢剤

を含んでなる、医薬錠剤。

【請求項 7】

前記錠剤が第一の希釈剤を約 60% ~ 約 80% (w/w) までの量でさらに含む、請求項 6 に記載の錠剤。

【請求項 8】

前記錠剤が第二の希釈剤を約 5 ~ 20% (w/w) の量でさらに含み、両方の希釈剤の全量は、錠剤の全重量の約 60 ~ 80% (w/w) である、請求項 7 に記載の錠剤。

【請求項 9】

本質的に、下記の a) ~ g) からなる錠剤：

- a) 約 30.4 mg のクエン酸タモキシフェン；
- b) 約 1.0 mg のアナストロゾール；
- c) 約 118.0 mg の乳糖一水和物；
- d) 約 18.0 mg の微結晶性セルロース；
- e) 約 7.2 mg のクロスカルメロースナトリウム；
- f) 約 3.6 mg のポビドン；および
- g) 約 1.8 mg のステアリン酸マグネシウム。

【請求項 10】

下記の a) ~ g) を含む、クエン酸タモキシフェンの医薬製剤を調製する方法：

- a) クエン酸タモキシフェン、アナストロゾール、乳糖一水和物、微結晶性セルロース

、クロスカルメロースナトリウム、及びポビドンを乾式混合して乾性混合物を形成すること；

b) 乾性混合物を水と混合して湿性造粒物を形成すること；

c) 大きな凝集物を砕くこと；

d) 2% (w/w) 以下の水分含量まで顆粒を乾燥させて乾性顆粒を形成すること；

e) 乾性顆粒を粉碎して粉碎乾性顆粒を形成すること；

f) 粉碎乾性顆粒へ滑沢剤を加えること；および

g) 滑沢剤を含有する乾性顆粒を混和すること。

【請求項 11】

下記の a) ~ h) を含む、医薬製剤を作製する方法：

a) クエン酸タモキシフェン、アナストロゾール、少なくとも 1 つの希釈剤、崩壊剤、および結合剤を含む成分を混合機へ充填すること；

b) 上記成分を混合して均一な分布を有する成分の混合物を形成すること；

c) 成分の混合物へ水を加えて湿性塊を形成すること；

d) 湿性塊を篩いに通して顆粒を形成すること；

e) 顆粒を乾燥させて 2% (w/w) 以下の水分含量を有する乾燥顆粒を形成すること；

f) 乾燥顆粒へ滑沢剤を加えて滑沢剤：乾燥顆粒混合物を形成すること；

g) 滑沢剤：乾燥顆粒混合物を破碎すること；および

h) 破碎混合物を混和して混和顆粒を形成すること。

【請求項 12】

顆粒を錠剤に圧縮することをさらに含んでなる、請求項 10 又は 11 に記載の方法。

【請求項 13】

前記錠剤へフィルムコートを施すことをさらに含んでなる、請求項 12 に記載の方法。