

【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 10 月 4 日 (2007.10.4)

【公表番号】特表 2007-502296 (P2007-502296A)

【公表日】平成 19 年 2 月 8 日 (2007.2.8)

【年通号数】公開・登録公報 2007-005

【出願番号】特願 2006-523385 (P2006-523385)

【国際特許分類】

**A 6 1 K 9/16 (2006.01)**  
**A 6 1 K 9/28 (2006.01)**  
**A 6 1 K 9/20 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/43 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/545 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/65 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/546 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/7048 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/496 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/635 (2006.01)**  
**A 6 1 K 47/12 (2006.01)**  
**A 6 1 K 47/14 (2006.01)**  
**A 6 1 K 47/22 (2006.01)**  
**A 6 1 P 31/04 (2006.01)**

【F I】

A 6 1 K 9/16  
 A 6 1 K 9/28  
 A 6 1 K 9/20  
 A 6 1 K 31/43  
 A 6 1 K 31/545  
 A 6 1 K 31/65  
 A 6 1 K 31/546  
 A 6 1 K 31/7048  
 A 6 1 K 31/496  
 A 6 1 K 31/635  
 A 6 1 K 47/12  
 A 6 1 K 47/14  
 A 6 1 K 47/22  
 A 6 1 P 31/04

【手続補正書】

【提出日】平成 19 年 8 月 13 日 (2007.8.13)

【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】

下流加工応力に耐え得るロバストペレットであって、前記ロバストペレットは、少なくとも 1 個の活性成分薬剤、少なくとも 1 個の薬理許容吸収性強化剤、および少なくとも 1

個の薬理許容可溶性強化剤を含み、前記少なくとも1個の活性成分薬剤は前記ロバストペレットの重量/重量で少なくとも50%を占め、前記少なくとも1個の薬理許容吸収性強化剤は界面活性剤であり、また前記少なくとも1個の薬理許容可溶性強化剤は前記少なくとも1個の活性成分薬剤の溶媒であることを特徴とするロバストペレット。

【請求項2】

下流加工応力に耐え得るロバストペレットの製造法であって、前記製造法は、少なくとも1個の活性成分薬剤を少なくとも1個の薬理許容吸収性強化剤および少なくとも1個の薬理許容可溶性強化剤と組合せ、かくして前記少なくとも1個の活性成分薬剤は前記ロバストペレットの重量/重量で少なくとも50%を占め、前記少なくとも1個の薬理許容吸収性強化剤は界面活性剤であり、また前記少なくとも1個の薬理許容可溶性強化剤は前記少なくとも1個の活性成分薬剤の溶媒であることを特徴とするロバストペレットの製造法。

【請求項3】

請求項2記載の方法で製造されることを特徴とするロバストペレット。

【請求項4】

前記下流加工応力が、押出し、球状化、ローラー圧縮、コーティング、圧縮、流動床乾燥、湿式造粒および錠剤化より成るグループから選択されることを特徴とする請求項1または3記載のロバストペレット。

【請求項5】

前記活性成分薬剤が、ベータラクタムペニシリン、セファロsporin、マクロライド、テトラサイクリン、フルオロキノロン、およびスルホンアミドより成るグループから選択されることを特徴とする請求項1、3または4のいずれか1項記載のロバストペレット。

【請求項6】

前記少なくとも1個の薬理許容吸収性強化剤が、非イオン界面活性剤、親水性界面活性剤、疎水性界面活性剤、短鎖脂肪酸、長鎖脂肪酸、短鎖トリグリセリド、および長鎖トリグリセリドより成るグループから選択されることを特徴とする請求項1、3、4または5のいずれか1項記載のロバストペレット。

【請求項7】

前記少なくとも1個の薬理許容可溶性強化剤が、メチル-2ピロリドン（ファーマソルブ）、ジエチレングリコールモノエチルエーテル（トランスキュートールP）、薬理許容アルコール、薬理許容炭化水素、およびそのいずれかの誘導体より成るグループから選択されることを特徴とする請求項1、3、4、5または6のいずれか1項記載のロバストペレット。

【請求項8】

前記少なくとも1個の活性成分薬剤が、前記ロバストペレットの重量/重量で70-90%の量で存在するアモキシシリンであり、前記少なくとも1個の薬理許容吸収性強化剤が、前記ロバストペレットの重量/重量で2-10%の量で存在するラブラソールであり、また前記少なくとも1個の薬理許容可溶性強化剤が、前記ロバストペレットの重量/重量で2-10%の量で存在するN-メチルピロリジンであることを特徴とする請求項1、3、4、5、6または7のいずれか1項記載のロバストペレット。

【請求項9】

第一、第二、および第三剤形を含み、各剤形それぞれが請求項1記載のロバストペレットを含む1日1回投与薬剤製品であって、前記第一剤形は即時放出剤形であり、前記第二および第三剤形は遅延放出剤形であり、前記第一、第二および第三剤形は異なる時点に放出を開始し、前記1日1回投与薬剤製品から放出される全活性成分薬剤のCmaxは投与から約12時間以下で達成され、また前記1日1回投与薬剤製品は24時間にわたり活性成分薬剤の全用量を含むことを特徴とする1日1回投与薬剤製品。

【請求項10】

仕上り薬剤製品のための生産プロトコルの製品収量を改善する方法であって、前記生産プロトコルは、押出し、球状化、ローラー圧縮、コーティング、圧縮、流動床乾燥、湿式

造粒、および錠剤化より成るグループから選択される下流加工を含み、前記方法が

- (a) 請求項 3 記載の複数のロバストペレットを作り、
  - (b) 前記複数のロバストペレットに前記下流加工を受けさせ、
  - (c) 前記複数のロバストペレットから前記仕上げ薬剤製品を調製する、
- ステップを含むことを特徴とする方法。

【請求項 1 1】

仕上げ薬剤製品のための生産プロトコルの下流加工要素の効率を改善する方法であって、前記下流加工要素は、押出し、球状化、ローラー圧縮、コーティング、圧縮、流動床乾燥、湿式造粒、および錠剤化より成るグループから選択され、前記方法が、

- (a) 請求項 3 記載の複数のロバストペレットを作り、かつ
  - (b) 前記複数のロバストペレットに前記生産プロトコルの前記下流加工要素を受けさせる、
- ステップを含むことを特徴とする方法。

【請求項 1 2】

前記活性成分薬剤がアモキシシリンであることを特徴とする請求項 1 記載のロバストペレット。

【請求項 1 3】

前記ペーテラクタムペニシリンが、アモキシシリン、ペニシリン、およびジクロキサシンより成るグループから選択されることを特徴とする請求項 5 記載のロバストペレット。

【請求項 1 4】

前記セファロスポリンが、セフィキシムおよびセフポドキシムプロキシティルから成るグループから選択されることを特徴とする請求項 5 記載のロバストペレット。

【請求項 1 5】

前記マクロライドが、クラリスロマイシンおよびエリスロマイシンより成るグループから選択されることを特徴とする請求項 5 記載のロバストペレット。

【請求項 1 6】

前記テトラサイクリンが、ドキシサイクリン、クロルテトラサイクリン、およびミノサイクリンより成るグループから選択されることを特徴とする請求項 5 記載のロバストペレット。

【請求項 1 7】

前記フルオロキノロンが、シプロフロキサシンおよびノルフロキサシンより成るグループから選択されることを特徴とする請求項 5 記載のロバストペレット。

【請求項 1 8】

前記スルホンアミドが、スルファジアジンおよびスルフィソキサゾールより成るグループから選択されることを特徴とする請求項 5 記載のロバストペレット。

【請求項 1 9】

下流加工応力に耐え得るロバストペレットの使用法であって、前記ロバストペレットは、少なくとも 1 個の活性成分薬剤、少なくとも 1 個の薬理許容吸収性強化剤、および少なくとも 1 個の薬理許容可溶性強化剤を含み、前記少なくとも 1 個の活性成分薬剤は前記ロバストペレットの重量 / 重量で少なくとも 50 % を占め、前記少なくとも 1 個の薬理許容吸収性強化剤は界面活性剤であり、また前記少なくとも 1 個の薬理許容可溶性強化剤は前記少なくとも 1 個の活性成分薬剤の溶媒であり、前記使用法は前記活性成分薬剤の高用量を必要とする患者を処置する薬剤製品の製造のためのものであることを特徴とするロバストペレットの使用法。

【請求項 2 0】

前記下流加工応力が、押出し、球状化、ローラー圧縮、コーティング、圧縮、流動床乾燥、湿式造粒および錠剤化より成るグループから選択されることを特徴とする請求項 1 9 記載の使用法。

【請求項 2 1】

前記活性成分薬剤が、ベータラクタムペニシリン、セファロスポリン、マクロライド、テトラサイクリン、フルオロキノロン、およびスルホンアミドより成るグループから選択されることを特徴とする請求項 19 または 20 記載の使用法。

【請求項 22】

前記少なくとも 1 個の薬理許容吸収性強化剤が、非イオン界面活性剤、親水性界面活性剤、疎水性界面活性剤、短鎖脂肪酸、長鎖脂肪酸、短鎖トリグリセリド、および長鎖トリグリセリドより成るグループから選択されることを特徴とする請求項 19 乃至 21 のいずれか 1 項記載の使用法。

【請求項 23】

前記少なくとも 1 個の薬理許容可溶性強化剤が、メチル - 2 ピロリドン（ファーマソルブ）、ジエチレングリコールモノエチルエーテル（トランスキュートール P）、薬理許容アルコール、薬理許容炭化水素、およびそのいずれかの誘導体より成るグループから選択されることを特徴とする請求項 19 乃至 22 のいずれか 1 項記載の使用法。

【請求項 24】

前記少なくとも 1 個の活性成分薬剤が、前記ロバストペレットの重量 / 重量で 70 - 90 % の量で存在するアモキシシリンであり、前記少なくとも 1 個の薬理許容吸収性強化剤が、前記ロバストペレットの重量 / 重量で 2 - 10 % の量で存在するラブラソールであり、また前記少なくとも 1 個の薬理許容可溶性強化剤が、前記ロバストペレットの重量 / 重量で 2 - 10 % の量で存在する N - メチルピロリジンであることを特徴とする請求項 19 乃至 23 のいずれか 1 項記載の使用法。

【請求項 25】

前記活性成分薬剤がアモキシシリンであることを特徴とする請求項 19 乃至 23 のいずれか 1 項記載の使用法。

【請求項 26】

前記ベータラクタムペニシリンが、アモキシシリン、ペニシリン、およびジクロキサシンより成るグループから選択されることを特徴とする請求項 21 記載の使用法。

【請求項 27】

前記セファロスポリンが、セフィキシムおよびセフポドキシムプロキシティルから成るグループから選択されることを特徴とする請求項 21 記載の使用法。

【請求項 28】

前記マクロライドが、クラリスロマイシンおよびエリスロマイシンより成るグループから選択されることを特徴とする請求項 21 記載の使用法。

【請求項 29】

前記テトラサイクリンが、ドキシサイクリン、クロルテトラサイクリン、およびミノサイクリンより成るグループから選択されることを特徴とする請求項 21 記載の使用法。

【請求項 30】

前記フルオロキノロンが、シプロフロキサシンおよびノルフロキサシンより成るグループから選択されることを特徴とする請求項 21 記載の使用法。

【請求項 31】

前記スルホンアミドが、スルファジアジンおよびスルフィソキサゾールより成るグループから選択されることを特徴とする請求項 21 記載の使用法。

【請求項 32】

第一、第二、および第三剤形の使用方法であって、各剤形それぞれが請求項 1、3、4、5、6、7、8、12、13、14、15、16、17 または 18 のいずれか 1 項記載のロバストペレットを含み、前記第一剤形は即時放出剤形であり、前記第二および第三剤形は遅延放出剤形であり、前記第一、第二および第三剤形は異なる時点に放出を開始し、前記第一、第二および第三剤形から放出される全活性成分薬剤の Cmax は投与から約 12 時間以下で達成され、また前記第一、第二および第三剤形は 24 時間にわたり活性成分薬剤の全用量を含み、前記使用法は前記活性成分薬剤の高用量を必要とする患者を処置する 1 日 1 回投与薬剤製品の製造のためのものであることを特徴とする使用法。