

【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 17 年 9 月 15 日 (2005.9.15)

【公表番号】特表 2002-538098 (P2002-538098A)

【公表日】平成 14 年 11 月 12 日 (2002.11.12)

【出願番号】特願 2000-602039 (P2000-602039)

【国際特許分類第 7 版】

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 47/08

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/44

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 17/10

A 6 1 P 35/00

【F I】

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 47/08

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/44

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 17/10

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成 15 年 12 月 25 日 (2003.12.25)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

水溶性の低い活性剤の経口デリバリーのためのカプセルシステムであって、

水溶性の低いレチノイド活性剤；

活性剤を最初に溶解するための賦形剤手段；

胃腸管内における活性剤および賦形剤手段の自己乳化を促進するための乳化剤手段；および

活性剤、賦形剤手段および乳化剤手段を未乳化均質混合物として封入するためのカプセルシェル手段であって、摂取後に胃腸管に対し開放して該混合物を放出し、活性剤を溶解している賦形剤手段の、胃腸管内における自己乳化を可能にするように調製したカプセルシェル手段

を含有するカプセルシステム。

【請求項 2】

賦形剤手段は、レチノイド活性剤を充分溶解する中程度の鎖長の液体トリグリセリドを含有する請求項 1 に記載のカプセルシステム。

【請求項 3】

中程度の鎖長の液体トリグリセリドは、カプリル / カプリントリグリセリドを含有する請求項 2 に記載のカプセルシステム。

【請求項 4】

賦形剤手段は、エチルオレエート、イソプロピルミリステート、セテアリルオクタノエート、トウモロコシ油、綿実油、ベニバナ油、オリーブ油、ピーナツ油、大豆油およびゴマ油から成る群から選択する請求項 2 に記載のカプセルシステム。

【請求項 5】

乳化剤手段は共同乳化剤を含有する請求項 3 に記載のカプセルシステム。

【請求項 6】

共同乳化剤は、ソルビタンモノオレエートおよびポリソルベート 80 を含有する請求項 5 に記載のカプセルシステム。

【請求項 7】

共同乳化剤は、ソルビタンモノオレエート、ソルビタンモノラウレート、ソルビタンモノパルミテート、ソルビタンモノステアレート、ポリソルベート 20、ポリソルベート 40、ポリソルベート 60 およびポリソルベート 80 から成る群から選択する請求項 5 に記載のカプセルシステム。

【請求項 8】

共同乳化剤は、カプリル / カプリントリグリセリドの親水性 / 親油性バランスに適合するように選択する請求項 7 に記載のカプセルシステム。

【請求項 9】

レチノイド活性剤はタザロテンである請求項 1 に記載のカプセルシステム。

【請求項 10】

賦形剤手段中に抗酸化剤をも含有する請求項 9 に記載のカプセルシステム。

【請求項 11】

カプセルシェル手段は不透明色素をも含有する請求項 10 に記載のカプセルシステム。

【請求項 12】

タザロテンは 1 カプセル当たり約 34 mg までの量で存在し、抗酸化剤は約 0.05 % w / w の量のブチル化ヒドロキシアニソールから成り、ソルビタンモノオレエートは約 5.0 % w / w の量で存在し、ポリソルベート 80 は約 0.25 % w / w の量で存在し、カプリル / カプリントリグリセリドは約 94 % w / w の量で存在する請求項 11 に記載のカプセルシステム。

【請求項 13】

水溶性の低い活性剤の経口デリバリーのためのカプセルシステムであって、

水溶性の低いレチノイド活性剤；

活性剤を充分溶解する液体トリグリセリド；

胃腸管内における液体トリグリセリドおよび溶解した活性剤の自己乳化を促進するための乳化剤手段；および

液体トリグリセリドと溶解した活性剤および乳化剤手段を未乳化均質混合物として封入するためのカプセルシェル手段であって、摂取後に胃腸管に対し開放して該混合物を放出し、液体トリグリセリドおよび溶解した活性剤の、胃腸管内における自己乳化を可能にするように調製したカプセルシェル手段を含有するカプセルシステム。

【請求項 14】

液体トリグリセリドは、カプリル / カプリントリグリセリドを含有する請求項 13 に記載のカプセルシステム。

【請求項 15】

乳化剤手段は共同乳化剤を含有する請求項 14 に記載のカプセルシステム。

【請求項 16】

共同乳化剤は、ソルビタンモノオレエートおよびポリソルベート80を含有する請求項15に記載のカプセルシステム。

【請求項 17】

共同乳化剤は、カプリル/カプリントリグリセリドの親水性/親油性バランスに適合するように選択する請求項15に記載のカプセルシステム。

【請求項 18】

請求項13に記載の活性剤、液体トリグリセリドおよび乳化剤手段を含有する組成物。

【請求項 19】

レチノイド活性剤はタザロテンである請求項13に記載のカプセルシステム。

【請求項 20】

賦形剤手段中に抗酸化剤をも含有する請求項19に記載のカプセルシステム。

【請求項 21】

カプセルシェル手段は不透明色素をも含有する請求項20に記載のカプセルシステム。

【請求項 22】

タザロテンは1カプセル当たり約0.1~34mgの量で存在し、抗酸化剤は約0.05%w/wの量のブチル化ヒドロキシアニソールから成り、ソルビタンモノオレエートは約5.0%w/wカプセルの量で存在し、ポリソルベート80は約0.25%w/wの量で存在し、カプリル/カプリントリグリセリドは約94%w/wの量で存在する請求項21に記載のカプセルシステム。

【請求項 23】

請求項22に記載のタザロテン、ブチル化ヒドロキシアニソール、ソルビタンモノオレエート、ポリソルベート80、およびカプリル/カプリントリグリセリドを含有する組成物。

【請求項 24】

水溶性の低い活性剤のデリバリーを可能にする方法であって、
水溶性の低いレチノイド活性剤を提供し；
胃腸管内における初めての活性剤の溶解を排除するために、活性剤を賦形剤に溶解し；
胃腸管内における活性剤および賦形剤の自己乳化を促進するために、乳化剤を賦形剤に組み合わせ；および
摂取後に胃腸管に対し開放するよう調製したカプセルシェルに、活性剤、賦形剤および乳化剤を封入する
過程を含んで成る方法。

【請求項 25】

レチノイド活性剤を提供する過程は、タザロテンの提供を含んで成る請求項24に記載の方法。

【請求項 26】

賦形剤中に抗酸化剤を組み合わせる過程を更に含んで成る請求項25に記載の方法。

【請求項 27】

カプセルシェルに不透明色素を組み合わせる過程を更に含んで成る請求項26に記載の方法。