

【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3月30日(2006.3.30)

【公表番号】特表2005-526095(P2005-526095A)

【公表日】平成17年9月2日(2005.9.2)

【年通号数】公開・登録公報2005-034

【出願番号】特願2003-577853(P2003-577853)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/30 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/30

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/36

【手続補正書】

【提出日】平成18年2月7日(2006.2.7)

【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】

向かい合った主面表面を有し、

(a) 少なくとも1種の有効薬剤と；

(b) 少なくとも1種の薬学的に許容される水崩壊性または水溶性賦形剤とを含む急速崩壊固体投与剤型であって、

該投与剤型が、(i) 水性媒質と接触して約3分以内に実質的に崩壊または溶解し；(ii) 約2%以下の脆砕性を有し；かつ(iii) 主面表面の各々が二重凸形状を形成する、上記投与剤型。

【請求項2】

前記投与剤型が、水性媒質と接触して、約2分以内、約1分以内、約45秒以内、約30秒以内、約20秒以内、約15秒以内、約10秒以内、並びに約5秒以内からなる群より選択される時間内に実質的に崩壊または溶解する、請求項1に記載の投与剤型。

【請求項3】

脆砕性が約1%以下である、請求項1または2に記載の投与剤型。

【請求項4】

前記二重凸形状表面が、投与剤型直径の約100～約400%の長軸カップ半径と、投与剤型直径の約5～約50%の短軸カップ半径を有する、請求項1～3のいずれか1項に記載の投与剤型。

【請求項5】

前記長軸カップ半径が、投与剤型直径の約240～約290%であり、短軸カップ半径が、投与剤型直径の約16～約28%である、請求項4に記載の投与剤型。

【請求項 6】

(a)前記少なくとも 1 種の有効薬剤の濃度が、約 0.1% ~ 約 99.9% (w/w)、約 5% ~ 約 70% (w/w)、並びに約 20% ~ 約 50% (w/w) からなる群より選択される；および/または、

(b)前記少なくとも 1 種の薬学的に許容される水崩壊性または水溶性賦形剤の濃度が、約 99.9% ~ 約 0.1% (w/w)、約 95% ~ 約 30% (w/w)、並びに約 85% ~ 約 60% (w/w) からなる群より選択される、

請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の投与剤型。

【請求項 7】

前記少なくとも 1 種の薬学的に許容される水崩壊性または水溶性賦形剤が、糖、糖アルコール、デンプン、天然ゴム、天然ポリマー、天然ポリマーの合成誘導体、合成ポリマー、及びこれらの混合物からなる群より選択される、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の投与剤型。

【請求項 8】

前記少なくとも 1 種の薬学的に許容される水崩壊性または水溶性賦形剤が、ラクトース、グルコース、マンノース、マンニトール、ソルビトール、キシリトール、エリトリトール、ラクチトール、マルチトール、コーンデンプン、ジャガイモデンプン、トウモロコシデンプン、ゼラチン、カラギーナン、アルギン酸塩、デキストラン、マルトデキストラン、アラビアゴム、キサンタンゴム、ポリエチレングリコール、ポリビニルピロリドン、ポリビニルアルコール、ポリオキシエチレンコポリマー、ポリオキシプロピレンコポリマー、ポリエチレンオキシド、及びこれらの混合物からなる群より選択される、請求項 7 に記載の投与剤型。

【請求項 9】

結合剤、滑沢剤、懸濁剤、泡起性薬剤、希釈剤、及び滑剤からなる群より選択される少なくとも 1 種の薬学的に許容される賦形剤をさらに含む、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の投与剤型。

【請求項 10】

前記少なくとも 1 種の有効薬剤が、結晶質粒子、半結晶質粒子、非晶質粒子、半非晶質粒子、もしくはこれらの混合物の形態である、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の投与剤型。

【請求項 11】

前記結晶質粒子、半結晶質粒子、非晶質粒子、半非晶質粒子、もしくはこれらの混合物がコーティング剤でコーティングされている、請求項 10 に記載の投与剤型。

【請求項 12】

前記コーティング剤が約 5 ~ 約 60% (w/w) の量で存在する、請求項 11 に記載の投与剤型。

【請求項 13】

前記少なくとも 1 種の有効薬剤が、

(a) 難溶性であり；

(b) 約 2,000 nm 以下の有効平均粒径を有し、

(c) 有効薬剤の表面と結合する少なくとも 1 種の表面安定剤を有する、

請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の投与剤型。

【請求項 14】

前記組成物が、約 1,900nm 以下、約 1,800nm 以下、約 1,700nm 以下、約 1,600nm 以下、約 1,500nm 以下、約 1,400nm 以下、約 1,300nm 以下、約 1,200nm 以下、約 1,100nm 以下、約 1,000nm 以下、約 900nm 以下、約 800nm 以下、約 700nm 以下、約 600nm 以下、約 500nm 以下、約 400nm 以下、約 300nm 以下、約 250nm 以下、約 200nm 以下、約 100nm 以下、約 75nm 以下、及び約 50nm 以下からなる群より選択される有効平均粒径を有する、請求項 13 に記載の投与剤型。

【請求項 15】

前記表面安定剤が、非イオン性表面安定剤、アニオン表面安定剤、カチオン表面安定剤、イオン性表面安定剤、および双性イオン表面安定剤からなる群より選択される、請求項

13または14に記載の投与剤型。

【請求項16】

前記少なくとも1種の表面安定剤が、セチルピリジニウムクロリド、ゼラチン、カゼイン、ホスファチド、デキストラン、グリセロール、アラビアゴム、コレステロール、トラガカント、ステアリン酸、塩化ベンザルコニウム、ステアリン酸カルシウム、モノステアリン酸グリセロール、セトステアリルアルコール、セトマクロゴール乳化ワックス、ソルビタンエステル、ポリオキシエチレンアルキルエーテル、ポリオキシエチレンヒマシ油誘導体、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、ポリエチレングリコール、ドデシルトリメチルアンモニウムブロミド、ポリオキシエチレンステアレート、コロイド状二酸化ケイ素、リン酸塩、ドデシル硫酸ナトリウム、カルボキシメチルセルロースカルシウム、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、カルボキシメチルセルロースナトリウム、メチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレート、非晶質セルロース、ケイ酸マグネシウムアルミニウム、トリエタノールアミン、ポリビニルアルコール、ポリビニルピロリドン、エチレンオキシドおよびホルムアルデヒドとの4-(1,1,3,3-テトラメチルブチル)-フェノールポリマー、ポロキサマー；ポロキサミン、荷電性リン脂質、ジオクチルスルホスクシネート、ナトリウムスルホコハク酸のジアルキルエステル、ラウリル硫酸ナトリウム、アルキルアリアルポリエーテルスルホネート、ステアリン酸ショ糖とジステアリン酸ショ糖の混合物、p-イソノニルフェノキシポリ-(グリシドール)、デカノイル-N-メチルグルカミド、n-デシル-D-グルコピラノシド、n-デシル-D-マルトピラノシド、n-ドデシル-D-グルコピラノシド、n-ドデシル-D-マルトシド、ヘプタノイル-N-メチルグルカミド、n-ヘプチル-D-グルコピラノシド、n-ヘプチル-D-チオグルコシド、n-ヘキシル-D-グルコピラノシド、ノナノイル-N-メチルグルカミド、n-ノイル-D-グルコピラノシド、オクタノイル-N-メチルグルカミド、n-オクチル-D-グルコピラノシド、オクチル-D-チオグルコピラノシド、酢酸ビニルとビニルピロリドンのランダムコポリマー、リゾチーム、カチオン脂質、ポリメチルメタクリレートトリメチルアンモニウムブロミド、スルホニウム化合物、ポリビニルピロリドン-2-ジメチルアミノエチルメタクリレートジメチルスルフェート、ヘキサデシルトリメチルアンモニウムブロミド、ホスホニウム化合物、四級化アンモニウム化合物、ベンジル-ジ(2-クロロエチル)エチルアンモニウムブロミド、ココナツトリメチルアンモニウムクロリド、ココナツトリメチルアンモニウムブロミド、ココナツメチルジヒドロキシエチルアンモニウムクロリド、ココナツメチルジヒドロキシエチルアンモニウムブロミド、デシルトリエチルアンモニウムクロリド、デシルジメチルヒドロキシエチルアンモニウムクロリド、デシルジメチルヒドロキシエチルアンモニウムクロリドブロミド、 C_{12-15} ジメチルヒドロキシエチルアンモニウムクロリド、 C_{12-15} ジメチルヒドロキシエチルアンモニウムクロリドブロミド、ココナツジメチルヒドロキシエチルアンモニウムクロリド、ココナツジメチルヒドロキシエチルアンモニウムブロミド、ミリスチルトリメチルアンモニウムメチルスルフェート、ラウリルジメチルベンジルアンモニウムクロリド、ラウリルジメチルベンジルアンモニウムブロミド、ラウリルジメチル(エテノキシ)₄アンモニウムクロリド、ラウリルジメチル(エテノキシ)₄アンモニウムブロミド、N-アルキル(C_{12-18})ジメチルベンジルアンモニウムクロリド、N-アルキル(C_{14-18})ジメチルベンジルアンモニウムクロリド、N-テトラデシルジメチルベンジルアンモニウムクロリド-水和物、ジメチルジデシルアンモニウムクロリド、N-アルキルおよび(C_{12-14})ジメチル1-ナフチルメチルアンモニウムクロリド、ハロゲン化トリメチルアンモニウム、アルキル-トリメチルアンモニウム塩、ジアルキル-ジメチルアンモニウム塩、ラウリルトリメチルアンモニウムクロリド、エトキシ化アルキアミドアルキルジアルキルアンモニウム塩、エトキシ化トリアルキルアンモニウム塩、ジアルキルベンゼンジアルキルアンモニウムクロリド、N-ジデシルジメチルアンモニウムクロリド、N-テトラデシルジメチルベンジルアンモニウムクロリド-水和物、N-アルキル(C_{12-14})ジメチル1-ナフチルメチルアンモニウムクロリド、ドデシルジメチルベンジルアンモニウムクロリド、ジアルキルベンゼンアルキルアンモニウムクロリド、ラウリルトリメチルアンモニウ

ムクロリド、アルキルベンジルメチルアンモニウムクロリド、アルキルベンジルジメチルアンモニウムブロミド、 C_{12} トリメチルアンモニウムブロミド、 C_{15} トリメチルアンモニウムブロミド、 C_{17} トリメチルアンモニウムブロミド、ドデシルベンジルトリエチルアンモニウムクロリド、ポリジアリルジメチルアンモニウムクロリド (DADMAC)、ジメチルアンモニウムクロリド、ハロゲン化アルキルジメチルアンモニウム、トリセチルメチルアンモニウムクロリド、デシルトリメチルアンモニウムブロミド、ドデシルトリエチルアンモニウムブロミド、テトラデシルトリメチルアンモニウムブロミド、メチルトリオクチルアンモニウムクロリド、POLYQUAT 10 (登録商標)、テトラブチルアンモニウムブロミド、ベンジルトリメチルアンモニウムブロミド、コリンエステル、塩化ベンザルコニウム、塩化ステアラルコニウム化合物、セチルピリジニウムブロミド、セチルピリジニウムクロリド、第四級ポリオキシエチルアルキルアミンのハロゲン化物塩、MIRAPOL (登録商標)、ALK AQUAT (登録商標)、アルキルピリジニウム塩、アミン、アミン塩、アミノキシド、イミドアゾリニウム塩、プロトン化第四級アクリルアミド、メチル化第四級ポリマー、並びにカチオン性グアーからなる群より選択される、請求項 13 ~ 15 のいずれか 1 項に記載の投与剤型。

【請求項 17】

前記少なくとも 1 種の有効薬剤が、タンパク質、ペプチド、栄養剤、カロチノイド、抗肥満薬、コルチコステロイド、エラスターゼ阻害剤、鎮痛薬、抗真菌薬、腫瘍治療薬、制吐薬、鎮痛薬、心臓血管薬、抗炎症薬、駆虫薬、抗不整脈薬、抗生物質、抗凝固薬、抗うつ薬、抗糖尿病薬、鎮痙薬、抗ヒスタミン薬、抗高血圧薬、抗ムスカリン薬、抗ミコバクテリウム薬、抗新生物薬、免疫抑制薬、抗甲状腺薬、抗ウイルス薬、抗不安鎮静薬、収れん薬、 α -アドレナリン受容体遮断剤、血液産物および置換物、強心薬、造影剤、咳抑制薬、診断薬、診断用撮像剤、利尿薬、ドーパミン作用薬、止血薬、免疫薬、脂質調節薬、筋弛緩薬、副交感神経刺激作用薬、上皮小体カルシトニンおよびビホスホネート、プロスタグランジン、放射性薬品、性ホルモン、抗アレルギー薬、興奮薬および食欲抑制薬、交感神経刺激作用薬、甲状腺薬、血管拡張薬、キサンチン、ニキビ治療薬、 α -ヒドロキシ製剤、嚢胞性繊維症治療薬、喘息治療薬、気腫治療薬、呼吸窮迫症候群治療薬、慢性気管支炎治療薬、慢性閉塞性肺疾患治療薬、器官移植拒絶治療薬、結核症およびその他の肺感染症の治療薬、並びに後天性免疫不全症候群に関連する呼吸疾患治療薬からなる群より選択される、請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の投与剤型。

【請求項 18】

医薬を製造するための請求項 1 ~ 17 のいずれか 1 項に記載の投与剤型の使用。

【請求項 19】

(a) 少なくとも 1 種の有効薬剤と少なくとも 1 種の薬学的に許容される水崩壊性または水溶性賦形剤とを含む組成物を調製し、

(b) 固体投与剤型を形成する

工程を含む、急速崩壊固体投与剤型を製造する方法であって、

該投与剤型が、(i) 水性媒質と接触して約 3 分以内に実質的に崩壊または溶解し；(ii) 約 2 % 以下の脆砕性を有し；かつ (iii) 上記投与剤型が、各々二重凸形状を形成する、向かい合った主面表面を備える、上記方法。

【請求項 20】

前記投与剤型が、水性媒質と接触して、約 2 分以内、約 1 分以内、約 45 秒以内、約 30 秒以内、約 20 秒以内、約 15 秒以内、約 10 秒以内、及び約 5 秒以内からなる群より選択される時間内に実質的に崩壊または溶解する、請求項 19 に記載の方法。

【請求項 21】

(a) 前記工程 (a) が、組成物のブレンドを含む、および/または

(b) 前記工程 (b) が、工程 (a) で調製された組成物の圧縮を含む、

請求項 19 または 20 に記載の方法。

【請求項 22】

脆砕性が約 1 % 以下である、請求項 19 ~ 21 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 23】

前記表面が、投与剤型直径の約100～約400%の長軸カップ半径と、投与剤型直径の約5～約50%の短軸カップ半径を有する、請求項19～22のいずれか1項に記載の方法。

【請求項 24】

前記長軸カップ半径が、投与剤型直径の約240～約290%であり、短軸カップ半径が、投与剤型直径の約16～約28%である請求項23に記載の方法。