

【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25年3月7日 (2013.3.7)

【公開番号】特開2012-97088(P2012-97088A)

【公開日】平成24年5月24日 (2012.5.24)

【年通号数】公開・登録公報2012-020

【出願番号】特願2011-262441(P2011-262441)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/04 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/24 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/04

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/24

A 6 1 K 9/48

【手続補正書】

【提出日】平成24年12月26日 (2012.12.26)

【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】

外面と対向内面とを有し、その内面が少なくとも部分的に薬剤物質を保持するための限定空間を規定し、外面が胃腸環境に曝露される、

(i) 約 10 ～ 約 80 重量 / 重量 % の量で存在するアンモニオメタクリレートコポリマータイプ A またはアンモニオメタクリレートコポリマータイプ B ;

(i i) 約 20 ～ 約 65 重量 / 重量 % の量で存在する膨潤性固体から選択される少なくとも 1 種の溶解性修飾賦形剤 (ここで、前記膨潤性固体は、異なる分子量を有するヒドロキ

シプロピルセルロースのブレンドであり、前記ブレンドは、約 80,000 の分子量を有する低分子量ヒドロキシプロピルセルロースならびに約 140,000 の分子量を有するヒドロキシプロピルセルロースおよび約 370,000 の分子量を有するヒドロキシプロピルセルロースから選択される高分子量ヒドロキシプロピルセルロースを含む）、所望により

a) 約 10 ~ 40 重量 / 重量 % の量で存在する崩壊剤、

b) 約 5 ~ 70 重量 / 重量 % の範囲で存在する水溶性フィラー、

c) 約 2.5 ~ 約 70 重量 / 重量 % の範囲で存在する低分子量溶質、および

d) 約 2.5 ~ 約 15 重量 / 重量 % の範囲で存在する非還元糖

からなる群より選択される第 2 の溶解性修飾賦形剤を組み合わせてもよく；

(i i i) 約 5 ~ 約 25 重量 / 重量 % の量で存在する滑沢剤を含み、そして

(i v) 所望により 0 ~ 約 10 % の量で存在する界面活性剤、0 ~ 約 10 重量 / 重量 % の量で存在する可塑剤および / または 0 ~ 約 10 重量 / 重量 % の量で存在する加工処理剤を含んでいてもよい押出および射出成形される組成物からなるシェルを有するカプセルを含む剤形。

【請求項 2】

前記コポリマーが、アンモニオメタクリレートコポリマータイプ A である、請求項 1 に記載の剤形。

【請求項 3】

前記コポリマーが、約 15 ~ 約 50 重量 / 重量 % の量で存在する、請求項 2 に記載の剤形。

【請求項 4】

前記コポリマーが、約 20 ~ 約 40 重量 / 重量 % の量で存在する、請求項 2 に記載の剤形。

【請求項 5】

前記滑沢剤が、約 10 ~ 約 15 重量 / 重量 % の量で存在するステアリルアルコールである、請求項 2 に記載の剤形。

【請求項 6】

前記界面活性剤が、2 重量 / 重量 % 未満の量で存在する、請求項 1 に記載の剤形。

【請求項 7】

前記界面活性剤が、ドデシル硫酸ナトリウムであるかまたはエチレンオキシドとプロピレンオキシドのブロックコポリマーである、請求項 6 に記載の剤形。

【請求項 8】

前記滑沢剤が、ステアリルアルコール、モノステアリン酸グリセロール (G M S)、タルク、ステアリン酸マグネシウム、二酸化ケイ素、非晶質ケイ酸、またはヒュームドシリカ、またはそれらの組合せもしくは混合物である、請求項 1 に記載の剤形。

【請求項 9】

前記滑沢剤が、ステアリルアルコールである、請求項 8 に記載の剤形。

【請求項 10】

前記ステアリルアルコールが、約 10 ~ 約 15 重量 / 重量 % の量で存在する、請求項 9 に記載の剤形。

【請求項 11】

前記滑沢剤が、約 10 ~ 約 15 重量 / 重量 % の量で存在するステアリルアルコールである、請求項 1 に記載の剤形。

【請求項 12】

前記膨潤性固体が、約 30 ~ 約 80 重量 / 重量 % の合計量で存在する、それぞれ異なる分子量を有するヒドロキシプロピルセルロースポリマーのブレンドからなる、請求項 1 に記載の剤形。

【請求項 13】

前記第 2 の溶解性修飾賦形剤が、非還元糖、低分子量溶質または水溶性フィラーである

、請求項 1 に記載の剤形。

【請求項 1 4】

前記第 2 の溶解性修飾賦形剤が、キシリトール、マンニトール、ラクトース、デンプン、塩化ナトリウム、およびそれらの組合せまたは混合物からなる群より選択される、請求項 1 3 に記載の剤形。

【請求項 1 5】

前記第 2 の溶解性修飾賦形剤が、崩壊剤である、請求項 1 に記載の剤形。

【請求項 1 6】

前記崩壊剤が、デンプングリコール酸ナトリウム、クロスカルメロースナトリウム、クロスポビドン（架橋ポリビニルピロリドン）、コポビドン、ポリビニルピロリドン、およびそれらの組合せまたは混合物からなる群より選択される、請求項 1 5 に記載の剤形。

【請求項 1 7】

前記可塑剤が、クエン酸トリエチル（TEC）、クエン酸トリブチル、アセチルクエン酸トリエチル（ATEC）、アセチルクエン酸トリブチル（ATBC）、フタル酸ジブチル、セバチン酸ジブチル（DBS）、フタル酸ジエチル、ビニルピロリドングリコールトリアセテート、ポリエチレングリコール、ポリオキシエチレンソルビタンモノラウレート、プロピレングリコール、ヒマシ油、またはそれらの組合せもしくは混合物である、請求項 1 に記載の剤形。

【請求項 1 8】

前記加工処理剤が、タルクである、請求項 1 に記載の剤形。

【請求項 1 9】

前記加工処理剤が、約 1 ～ 約 5 重量 / 重量 % の量で存在する、請求項 1 8 に記載の剤形。

【請求項 2 0】

吸収促進剤をさらに含む、請求項 1 に記載の剤形。

【請求項 2 1】

前記吸収促進剤が、キトサン、レシチン、レクチン、スクロース脂肪酸エステル、ビタミン E - TPGS、またはそれらの組合せもしくは混合物である、請求項 2 0 に記載の剤形。

【請求項 2 2】

前記アンモニオメタクリレートコポリマータイプ A が、約 1 5 ～ 5 0 重量 / 重量 % の量で存在し、前記崩壊剤が、ステアリルアルコールであり、前記少なくとも 1 種の溶解性修飾賦形剤が、異なる分子量を有するヒドロキシプロピルセルロースのブレンドである、請求項 1 に記載の剤形。

【請求項 2 3】

前記ヒドロキシプロピルセルロースポリマーのブレンドが、約 8 0 , 0 0 0 の分子量を有するヒドロキシプロピルセルロースおよび約 3 7 0 , 0 0 0 の分子量を有するヒドロキシプロピルセルロースを含む、請求項 2 2 に記載の剤形。

【請求項 2 4】

前記ヒドロキシプロピルセルロースのブレンドが、約 8 0 , 0 0 0 の分子量を有するヒドロキシプロピルセルロースおよび約 3 7 0 , 0 0 0 の分子量を有するヒドロキシプロピルセルロースである、請求項 1 2 に記載の剤形。

【請求項 2 5】

前記ヒドロキシプロピルセルロースのブレンドが、等しい重量 / 重量 % からなるものである、請求項 2 2 に記載の剤形。

【請求項 2 6】

前記ヒドロキシプロピルセルロースのブレンドが、約 3 2 重量 / 重量 % である、請求項 2 2 に記載の剤形。

【請求項 2 7】

前記ヒドロキシプロピルセルロースが、約 5 0 重量 / 重量 % の量で存在する、請求項 2

2 に記載の剤形。

【請求項 2 8】

ウィッキング剤である第 2 の溶解性修飾賦形剤を含む、請求項 2 2 に記載の剤形。

【請求項 2 9】

前記ウィッキング剤が、ラクトースである、請求項 2 8 に記載の 剤形。

【請求項 3 0】

前記ラクトースが、約 1 3 重量 / 重量 % の量で存在する、請求項 2 9 に記載の 剤形。

【請求項 3 1】

【表 1】

#	配合	重量 / 重量 %
<u>1.</u>	オイドラギット R L 1 0 0	2 5 . 0 0
	クルーセル E F	3 1 . 5 0
	クルーセル J F	3 1 . 5 0
	ステアリルアルコール	1 2 . 0 0
<u>2.</u>	オイドラギット R L 1 0 0	2 1 . 6 0
	オイドラギット R S 1 0 0	2 . 4 0
	クルーセル E F	3 2 . 0 0
	クルーセル J F	3 2 . 0 0
	ステアリルアルコール	1 2 . 0 0
<u>3.</u>	オイドラギット R L 1 0 0	2 . 4 0
	オイドラギット R S 1 0 0	2 1 . 6 0
	クルーセル E F	3 2 . 0 0
	クルーセル J F	3 2 . 0 0
	ステアリルアルコール	1 2 . 0 0

および

からなる群より選択される医薬組成物を含む押出材から製造された壁部分を有する少なくとも 1 つのサブコンポーネントを含む剤形。

【請求項 3 2】

カプセルシェルが、約 0 . 1 ~ 0 . 8 mm の範囲の厚さの壁を有する、請求項 1 に記載の剤形。