

【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9日(2006.3.9)

【公表番号】特表2005-523293(P2005-523293A)

【公表日】平成17年8月4日(2005.8.4)

【年通号数】公開・登録公報2005-030

【出願番号】特願2003-570883(P2003-570883)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/5377	(2006.01)
A 6 1 K	9/16	(2006.01)
A 6 1 K	9/20	(2006.01)
A 6 1 K	47/20	(2006.01)
A 6 1 K	47/32	(2006.01)
A 6 1 K	47/36	(2006.01)
A 6 1 K	47/38	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 K	9/16	
A 6 1 K	9/20	
A 6 1 K	47/20	
A 6 1 K	47/32	
A 6 1 K	47/36	
A 6 1 K	47/38	
A 6 1 P	43/00	
A 6 1 P	43/00	1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成18年1月18日(2006.1.18)

【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】

4-(3'-クロロ-4'-フルオロアニリノ)-7-メトキシ-6-(3-モルホリノプロポキシ)キナゾリンまたはその医薬的に許容な塩(以下、「薬剤」と称す)、および水溶性セルロースエーテルまたは水溶性セルロースエーテルのエステルを含む医薬組成物。

【請求項2】

「薬剤」および水溶性セルロースエーテルを含み、ここで水溶性セルロースエーテルが、ヒドロキシエチルセルロース、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およびカルボキシメチルセルロースの水溶性塩から選択される、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項3】

「薬剤」および水溶性セルロースエーテルのエステルを含み、ここで水溶性セルロースエーテルのエステルが、アセテート、サクシネート、フタレート、イソフタレート、テレフタレートおよびトリメリテートから選択される1以上のエステル基を有する、ヒドロキ

シプロピルメチルセルロースまたはヒドロキシプロピルセルロースのエステルである、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項4】

水溶性セルロースエーテルまたは水溶性セルロースエーテルのエステルが、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、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およびヒドロキシプロピルメチルセルロースアセテートサクシネットから選択される請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項5】

「薬剤」およびヒドロキシプロピルメチルセルロースを含む請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項6】

水溶性セルロースエーテルがヒドロキシプロピルメチルセルロースではない、請求項1または2のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項7】

水溶性セルロースエーテルおよび水溶性セルロースエーテルのエステルに対する「薬剤」の重量比が40:1~2.5:1である、請求項1~6のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項8】

さらに湿潤剤を含む、請求項1~7のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項9】

湿潤剤が医薬的に許容なカチオン性またはアニオン性界面活性剤から選択される、請求項8に記載の医薬組成物。

【請求項10】

湿潤剤がアルカリ金属(8~20°C)アルキルスルフェートである、請求項8に記載の医薬組成物。

【請求項11】

「薬剤」、水溶性セルロースエーテルおよび/または水溶性セルロースエーテルのエステル、湿潤剤、および1以上の充填剤、結合剤、崩壊剤または滑沢剤を含む、請求項1~10のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項12】

(a) 10~80部の、4-(3'-クロロ-4'-フルオロアニリノ)-7-メトキシ-6-(3-モルホリノプロポキシ)キナゾリンまたはその医薬的に許容な塩(以下、「薬剤」と称す);

(b) 0.05~5部の、アニオン性界面活性剤から選択される湿潤剤;

(c) 10~60部の、ラクトース、マンニトールおよび微結晶セルロースから選択される1以上の充填剤;

(d) 1~10部の、カルボキシメチルセルロースナトリウム、カルボキシメチルセルロースカルシウム、クロスカルメロースナトリウム、クロスポビドンおよびスターチグリコレートナトリウムから選択される1以上の崩壊剤;

(e) 1~20部の、ポリビニルピロリドンおよびヒドロキシプロピルメチルセルロースから選択される結合剤;および

(f) 0~3部の滑沢剤;

を含み、ここですべての部は重量部であり、(a)~(f)の各部の合計が100であり、(d)または(e)から選択される少なくとも1つの成分は、ヒドロキシプロピルメチルセルロースおよびカルボキシメチルセルロースナトリウムから選択される水溶性セルロースエーテルを含む、医薬組成物。

【請求項13】

経口投与に適合する固形医薬組成物である、請求項1~12のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項14】

(i) 4 - (3 ' - クロロ - 4 ' - フルオロアニリノ) - 7 - メトキシ - 6 - (3 - モルホリノプロポキシ) キナゾリンまたはその医薬的に許容な塩（「薬剤」）を含む核；および

(ii) 水溶性セルロースエーテルのエステルまたは水溶性セルロースエーテルを含むコーティングを含有する固体医薬組成物。

【請求項 15】

経口投与に適合した錠剤、ペレットまたは顆粒である請求項14に記載の固体医薬組成物であり、フィルムコーティングにより被覆された核を含み、核が：

44～55%の「薬剤」；

25～40%のラクトース；

5～15%の微結晶セルロース；

2～6%の崩壊剤；

1～5%のポビドン；

0.05～1%のドデシル硫酸ナトリウム；および

0.1～4%の滑沢剤；

を含み、フィルムコーティングが：

0.5～3%の水溶性セルロースエーテル；

0～0.5%の可塑剤；

0～0.5%の分散助剤；

0～0.5%の乳白剤；および

0～0.5%の着色料；

を含み、ここで、すべての%は組成物の総重量に基づく重量%である、前記組成物。

【請求項 16】

「薬剤」が4-(3'-クロロ-4'-フルオロアニリノ)-7-メトキシ-6-(3-モルホリノプロポキシ)キナゾリンである、請求項1～15のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

4-(3'-クロロ-4'-フルオロアニリノ)-7-メトキシ-6-(3-モルホリノプロポキシ)キナゾリンまたはその医薬的に許容な塩を、水溶性セルロースエーテルおよび/または水溶性セルロースエーテルのエステルと混合することを含む、医薬組成物の製造方法。

【請求項 18】

「薬剤」（ここで「薬剤」は請求項1に定義されたとおりである）の水溶液からの析出を抑制するための水溶性セルロースエーテルまたは水溶性セルロースエーテルのエステルの使用。