

【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 5 月 30 日 (2013.5.30)

【公開番号】特開 2012-1473 (P2012-1473A)

【公開日】平成 24 年 1 月 5 日 (2012.1.5)

【年通号数】公開・登録公報 2012-001

【出願番号】特願 2010-137155 (P2010-137155)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 36/00 (2006.01)

A 6 1 K 36/18 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 35/78 W

A 6 1 K 35/78 C

【手続補正書】

【提出日】平成 25 年 4 月 10 日 (2013.4.10)

【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】

a) 生薬エキス末または漢方エキス末、b) 糖類、c) 結晶セルロース、d) 崩壊剤を含み、a) が 50 ~ 90 質量部、b) と c) を合わせて 5 ~ 50 質量部、d) が 0.1 ~ 1.5 質量部であり、b) : c) の質量比が 4 : 6 ~ 9 : 1 であることを特徴とする固形製剤。

【請求項 2】

a) 生薬エキス末または漢方エキス末が、「セオラス PH - 101」(旭化成ケミカルズ製)、「AVICEL、PH - 101」(FMC 社製)、「EMCOCEL、50M」(JRS 社製)、「VIVAPOR、101P」(JRS 社製)、「COMPRECEL、101QD」(明台社製)から選ばれる結晶セルロースとの等量混合物を圧縮して得られる錠剤硬度 80 N の錠剤の崩壊時間が 5 ~ 60 分の生薬エキス末または漢方エキス末であることを特徴とする請求項 1 に記載の固形製剤。

【請求項 3】

糖類がトレハロースであることを特徴とする請求項 1 又は 2 に記載の固形製剤。

【請求項 4】

崩壊剤がクロスカルメロースナトリウム、クロスボビドン、アルファ化澱粉、部分アルファ化澱粉のいずれか 1 種以上であることを特徴とする請求項 1 ~ 3 のいずれかに記

載の固形製剤。

【請求項 5】

崩壊剤がクロスカルメロースナトリウムと部分アルファー化澱粉であり、クロスカルメロースナトリウムと部分アルファー化澱粉の質量比が $1/3 \sim 3/1$ であることを特徴とする請求項 4 記載の固形製剤。

【請求項 6】

a) 生薬エキス末又は漢方エキス末が、防風通聖散である請求項 1 ～ 5 のいずれかに記載の固形製剤。

【請求項 7】

固形製剤に対して、a) を $50 \sim 90$ 質量部含むことを特徴とする請求項 1 ～ 6 のいずれかに記載の固形製剤。

【請求項 8】

c) 結晶セルロースが、平均重合度が $130 \sim 450$ 、 $75 \mu\text{m}$ 以下の粒子の平均 L/D が $1.2 \sim 4.5$ 、平均粒子径が $20 \sim 250 \mu\text{m}$ 、見掛け比容積が $2 \sim 7 \text{ cm}^3/\text{g}$ 、見掛けタッピング比容積が $2.4 \sim 4.5 \text{ cm}^3/\text{g}$ 、安息角が 55° 以下の結晶セルロースであることを特徴とする請求項 1 ～ 7 のいずれかに記載の固形製剤。

【請求項 9】

c) 結晶セルロースが、セルロース一次粒子が凝集してなる二次凝集構造を有し、粒子内細孔容積が $0.265 \text{ cm}^3/\text{g} \sim 2.625 \text{ cm}^3/\text{g}$ であり、I 型結晶を含有し、平均粒子径が $30 \mu\text{m}$ を超え $250 \mu\text{m}$ 以下、比表面積が $0.1 \text{ m}^2/\text{g}$ 以上 $20 \text{ m}^2/\text{g}$ 未満、安息角が 25° 以上 44° 未満の結晶セルロースであることを特徴とする請求項 1 ～ 8 のいずれかに記載の固形製剤。

【請求項 10】

a) 「セオラス PH - 101」(旭化成ケミカルズ製)、「AVICEL、PH - 101」(FMC 社製)、「EMCOCEL、50M」(JRS 社製)、「VIVAPOR、101P」(JRS 社製)、「COMPRECEL、101QD」(明台社製)から選ばれる結晶セルロースとの等量混合物を圧縮して得られる錠剤硬度 80 N の錠剤の崩壊時間が $5 \sim 60$ 分である生薬エキス末または漢方エキス末と、

b) 糖類と、

c) 平均重合度が $130 \sim 450$ 、 $75 \mu\text{m}$ 以下の粒子の平均 L/D が $1.2 \sim 4.5$ 、平均粒子径が $20 \sim 250 \mu\text{m}$ 、見掛け比容積が $2 \sim 7 \text{ cm}^3/\text{g}$ 、見掛けタッピング比容積が $2.4 \sim 4.5 \text{ cm}^3/\text{g}$ 、安息角が 55° 以下である結晶セルロースと、

d) 崩壊剤と、

を混合し、直接打錠によって圧縮成形することを特徴とする固形製剤の製造方法。

【請求項 11】

c) 結晶セルロースが、セルロース一次粒子が凝集してなる二次凝集構造を有し、粒子内細孔容積が $0.265 \text{ cm}^3/\text{g} \sim 2.625 \text{ cm}^3/\text{g}$ であり、I 型結晶を含有し、平均粒子径が $30 \mu\text{m}$ を超え $250 \mu\text{m}$ 以下、比表面積が $0.1 \text{ m}^2/\text{g}$ 以上 $20 \text{ m}^2/\text{g}$ 未満、安息角が 25° 以上 44° 未満であることを特徴とする請求項 10 記載の製造方法。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0015

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0015】

(1) a) 生薬エキス末または漢方エキス末、b) 糖類、c) 結晶セルロース、d) 崩壊剤を含み、

a) が $50 \sim 90$ 質量部、b) と c) を合わせて $5 \sim 50$ 質量部、d) が $0.1 \sim 15$ 質量部であり、

b) : c) の質量比が $4 : 6 \sim 9 : 1$ であることを特徴とする固形製剤。

(2) a) 生薬エキス末または漢方エキス末が、「セオラスPH-101」(旭化成ケミカルズ製)、「AVICEL、PH-101」(FMC社製)、「EMCOCEL、50M」(JRS社製)、「VIVAPOR、101P」(JRS社製)、「COMPRECEL、101QD」(明台社製)から選ばれる結晶セルロースとの等量混合物を圧縮して得られる錠剤硬度80Nの錠剤の崩壊時間が5~60分の生薬エキス末または漢方エキス末であることを特徴とする上記(1)に記載の固形製剤。

(3) 糖類がトレハロースであることを特徴とする上記(1)又は(2)記載の固形製剤。

(4) 崩壊剤がクロスカルメロースナトリウム、クロスボidon、アルファ化澱粉、部分アルファ化澱粉のいずれか1種以上であることを特徴とする上記(1)~(3)のいずれかに記載の固形製剤。

(5) 崩壊剤がクロスカルメロースナトリウムと部分アルファ化澱粉であり、クロスカルメロースナトリウムと部分アルファ化澱粉の質量比が1/3~3/1であることを特徴とする上記(4)記載の固形製剤。

(6) a) 生薬エキス末又は漢方エキス末が、防風通聖散である上記(1)~(5)のいずれかに記載の固形製剤。

(7) 固形製剤に対して、a)を50~90質量部含むことを特徴とする上記(1)~(6)のいずれかに記載の固形製剤。

(8) c) 結晶セルロースが、平均重合度が130~450、75 μ m以下の粒子の平均L/Dが1.2~4.5、平均粒子径が20~250 μ m、見掛け比容積が2~7cm³/g、見掛けタッピング比容積が2.4~4.5cm³/g、安息角が55°以下の結晶セルロースであることを特徴とする上記(1)~(7)のいずれかに記載の固形製剤。

(9) c) 結晶セルロースが、セルロース一次粒子が凝集してなる二次凝集構造を有し、粒子内細孔容積が0.265cm³/g~2.625cm³/gであり、I型結晶を含有し、平均粒子径が30 μ mを超え250 μ m以下、比表面積が0.1m²/g以上20m²/g未満、安息角が25°以上44°未満の結晶セルロースであることを特徴とする上記(1)~(8)のいずれかに記載の固形製剤。

(10) a) 「セオラスPH-101」(旭化成ケミカルズ製)、「AVICEL、PH-101」(FMC社製)、「EMCOCEL、50M」(JRS社製)、「VIVAPOR、101P」(JRS社製)、「COMPRECEL、101QD」(明台社製)から選ばれる結晶セルロースとの等量混合物を圧縮して得られる錠剤硬度80Nの錠剤の崩壊時間が5~60分である生薬エキス末または漢方エキス末と、b) 糖類と、c) 平均重合度が130~450、75 μ m以下の粒子の平均L/Dが1.2~4.5、平均粒子径が20~250 μ m、見掛け比容積が2~7cm³/g、見掛けタッピング比容積が2.4~4.5cm³/g、安息角が55°以下である結晶セルロースと、d) 崩壊剤と、を混合し、直接打錠することで、固形製剤を製造する方法。

(11) c) 結晶セルロースが、セルロース一次粒子が凝集してなる二次凝集構造を有し、粒子内細孔容積が0.265cm³/g~2.625cm³/gであり、I型結晶を含有し、平均粒子径が30 μ mを超え250 μ m以下、比表面積が0.1m²/g以上20m²/g未満、安息角が25°以上44°未満であることを特徴とする上記(10)記載の固形製剤を製造する方法。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0038

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0038】

また、固形製剤に対して、a) 生薬エキス末又は漢方エキス末を50~90質量部含むことが好ましい。より好ましくは、55質量部~85質量部、さらに好ましくは、60質量部~80質量部である。