

【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 12 月 22 日 (2005.12.22)

【公表番号】特表 2005-510539(P2005-510539A)

【公表日】平成 17 年 4 月 21 日 (2005.4.21)

【年通号数】公開・登録公報 2005-016

【出願番号】特願 2003-546859(P2003-546859)

【国際特許分類第 7 版】

A 6 1 K 9/32

A 6 1 K 9/36

A 6 1 K 31/606

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 47/32

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 1/04

【F I】

A 6 1 K 9/32

A 6 1 K 9/36

A 6 1 K 31/606

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 47/32

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 1/04

【手続補正書】

【提出日】平成 16 年 11 月 2 日 (2004.11.2)

【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】

ヒトまたは下等動物の経口投与用固体単位剤形の医薬組成物であって、前記医薬組成物は：

a．安全且つ有効量の治療用活性物質；

b．ポリ（メタクリル酸、メチルメタクリレート）1：2、ポリ（メタクリル酸、メチルメタクリレート）1：1、及びこれらの混合物から成る群より選択される内部コーティング層；並びに

c．前記内部コーティング層に直接的に適用され、約 7 未満の P H で水性媒質に溶解し始める腸溶性ポリマーまたはフィルムコーティング素材を含む外部コーティング層；

を含み、

内部コーティング層が、外部コーティング層と同じではなく；

内部コーティング層が、ポリ（メタクリル酸、メチルメタクリレート）1：1 であるとき、外部コーティング層はポリ（メタクリル酸、メチルメタクリレート）1：2、またはポリ（メタクリル酸、メチルメタクリレート）1：1 とポリ（メタクリル酸、メチルメタクリレート）1：2 との混合物ではなく；かつ、

内部コーティング層と外部コーティング層とが治療用活性物質を含まない医薬組成物。

【請求項 2】

前記内部コーティング層が、ポリ（メタクリル酸、メチルメタクリレート）１：２である、請求項１に記載の組成物。

【請求項３】

ヒトまたは下等動物の経口投与用固体単位剤形の医薬組成物であって、前記医薬組成物は、

a．安全且つ有効量の治療用活性物質；

b．ポリ（メタクリル酸、メチルメタクリレート）１：２を含む内部コーティング層；及び

c．前記内部コーティング層に直接的に適用され、約７未満のＰＨで水性媒質に溶解し始める腸溶性ポリマーまたはフィルムコーティング素材を含む外部コーティング層；

を含み、

内部コーティング層が、外部コーティング層と同じではない医薬組成物。

【請求項４】

前記外部コーティング層は、ポリメタクリレート、陰イオン性ポリメタクリレート、ポリ（メタクリル酸、メチルメタクリレート）１：１、ポリ（メタクリル酸、メチルメタクリレート）１：２とポリ（メタクリル酸、メチルメタクリレート）１：１との混合物、ポリビニルアセテートフタレート、ポリ（メタクリル酸、エチルアクリレート）１：１、およびこれらの適合性のある混合物から成る群より選択される腸溶性ポリマーであり；好ましくは、ポリ（メタクリル酸、メチルメタクリレート）１：２とポリ（メタクリル酸、メチルメタクリレート）１：１との混合物である、請求項１または３のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項５】

前記外部コーティング層は、セルロースエーテル、メチルセルロース、エチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、カルボキシメチルエチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、低粘度ヒドロキシプロピルセルロース、低粘度ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ろう、カルナウバろう、脂肪族アルコール、硬化植物油、ゼイン、セラック、スクロース、アラビアゴム、ポリエチレングリコール、ポリビニルピロリドン、ゼラチン、アルギン酸ナトリウム、デキストリン、オオバコ殻粉末、セルロースアセテートフタレート、セルロースアセテートトリメリテート、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレート（ＨＰＭＣＰ）、セルロースプロピオネートフタレート、セルロースアセテートマレアート、ポリビニルアルコールフタレート、ヒドロキシプロピルメチルセルロースアセテートスクシネート（ＨＰＭＣＡＳ）、ヒドロキシプロピルメチルセルロースヘキサヒドロフタレート、及びこれらの適合性のある混合物から成る群から選択されるフィルムコーティング素材である、請求項１または３のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項６】

前記治療用活性物質が、緩下剤、止瀉剤、非ステロイド系抗炎症剤、５－アミノサリチル酸、糖質コルチコイド、抗菌剤、免疫抑制剤、化学療法剤または抗癌剤、ペプチド、タンパク質、心血管作動薬、向精神薬、Ｈ２遮断薬、抗喘息薬、及び抗ヒスタミン剤から成る群より選択され、好ましくは治療用活性物質が非ステロイド系抗炎症剤である、請求項１～５のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項７】

前記治療用活性物質が５－アミノサリチル酸である、請求項６に記載の組成物。

【請求項８】

前記５－アミノサリチル酸が、固体単位剤形当たり約７００ｍｇ～約９００ｍｇの量で存在する、請求項７に記載の組成物。

【請求項９】

前記内部コーティング層と前記外部コーティング層とを合わせた全コーティング厚が、５ｍｇ／ｃｍ^２～４０ｍｇ／ｃｍ^２、好ましくは１０ｍｇ／ｃｍ^２～１５ｍｇ／ｃｍ^２である、請求項１～８のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 10】

前記外部コーティング層は、 $10\mu\text{m} \sim 200\mu\text{m}$ 、好ましくは $10\mu\text{m} \sim 50\mu\text{m}$ 、より好ましくは $20\mu\text{m} \sim 40\mu\text{m}$ の最小厚を有する、請求項1～9のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 11】

前記固体単位剤形の全重量が $600\text{mg} \sim 1200\text{mg}$ である、請求項1～10のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 12】

前記固体剤形が圧縮錠剤である、請求項1～11のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 13】

前記固体剤形は連続スプレー法によりコーティングされ、内部コーティング層の後ではあるが内部コーティング層が乾燥または硬化される前に、外部コーティング層が適用される、請求項1～12のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 14】

請求項1～13のいずれか一項に記載の組成物を経口投与することによって、所望の送達部位に治療用活性物質を安定して確実に送達および放出する方法。