

【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2月3日(2005.2.3)

【公表番号】特表2004-501184(P2004-501184A)

【公表日】平成16年1月15日(2004.1.15)

【年通号数】公開・登録公報2004-002

【出願番号】特願2002-504983(P2002-504983)

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 9/14
A 6 1 K 31/215
A 6 1 K 31/337
A 6 1 K 31/427
A 6 1 K 45/00
A 6 1 K 47/10
A 6 1 K 47/12
A 6 1 K 47/14
A 6 1 K 47/18
A 6 1 K 47/20
A 6 1 K 47/22
A 6 1 K 47/24
A 6 1 K 47/26
A 6 1 K 47/28
A 6 1 K 47/32
A 6 1 K 47/34
A 6 1 K 47/36
A 6 1 K 47/38
A 6 1 K 47/40
A 6 1 K 47/42
A 6 1 P 31/16
A 6 1 P 43/00

【F I】

A 6 1 K 9/14
A 6 1 K 31/215
A 6 1 K 31/337
A 6 1 K 31/427
A 6 1 K 45/00
A 6 1 K 47/10
A 6 1 K 47/12
A 6 1 K 47/14
A 6 1 K 47/18
A 6 1 K 47/20
A 6 1 K 47/22
A 6 1 K 47/24
A 6 1 K 47/26
A 6 1 K 47/28
A 6 1 K 47/32
A 6 1 K 47/34
A 6 1 K 47/36
A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/40
A 6 1 K 47/42
A 6 1 P 31/16
A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成15年1月29日(2003.1.29)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

(a) 液体と、1種以上の薬学的に活性な化合物、1種以上の薬学的に適合する賦形剤およびそれらの混合物からなる群から選択される化合物との、溶液または均質分散体を調製する工程と、それに続く、

(b) 沸騰させずに前記溶液または均質分散体を膨張させる工程を含む医薬組成物の調製方法。

【請求項2】

前記組成物の乾燥および/または冷却が後続する、請求項1に記載の方法。

【請求項3】

前記溶液または均質分散体が、減圧により膨張する、請求項1または2に記載の方法。

【請求項4】

前記圧力が、30～150 Torrである、請求項3に記載の方法。

【請求項5】

工程(a)の化合物が、薬学的に活性な化合物である、請求項1～4のいずれか1項に記載の方法。

【請求項6】

前記薬学的に活性な化合物が、リパーゼインヒビターである、請求項1～5のいずれか1項に記載の方法。

【請求項7】

前記リパーゼインヒビターが、オルリスタットである、請求項6に記載の方法。

【請求項8】

前記薬学的に活性な化合物が、オセルタミビルまたは5-[7-[2-(5-メチル-2-フェニル-オキサゾール-4-イル)-エトキシ]-ベンゾチオフェン-4-メチル]-2,4-チアゾリジンジオンもしくはそのナトリウム塩である、請求項5に記載の方法。

【請求項9】

前記溶液または分散体が、埋込み材料またはガラスマトリックス形成材料を含む、請求項1～8のいずれか1項に記載の方法。

【請求項10】

前記埋込み材料またはガラスマトリックス形成材料が、薬学的に適合する賦形剤である、請求項9に記載の方法。

【請求項11】

前記埋込み材料またはガラスマトリックス形成材料が、ポリオール、ガム、ポリマーまたはそれらの薬学的に許容され得る塩である、請求項10に記載の方法。

【請求項12】

前記ポリオールが、炭水化物である、請求項11に記載の方法。

【請求項13】

前記炭水化物が、マルトデキストリン、トレハロース、セロビオース、グルコース、フルクトース、マルツロース、イソマルツロース、ラクツロース、マルトース、ゲントビオース、ラクトース、イソマルトース、マルチトール、ラクチトール、エリトリトール、パラチニトール、キシリトール、マンニトール、ソルビトール、ズルシトールおよびリビトール、トレハロース、スクロース、ラフィノース、ゲンチアノース、プランテオース、ベルバスコース、スタチオース、メレジトース、デキストランならびにイノシトールからなる群より選択される、請求項 12 に記載の方法。

【請求項 14】

前記炭水化物が、マルトデキストリンである、請求項 12 に記載の方法。

【請求項 15】

前記炭水化物が、マルチトールである、請求項 12 に記載の方法。

【請求項 16】

前記炭水化物が、トレハロースである、請求項 12 に記載の方法。

【請求項 17】

前記ガム、ポリマーまたはそれらの薬学的に許容され得る塩が、ポリエチレングリコール；修飾または置換されたデンプン；修飾または置換されたセルロース；ポビドン；ポリビニルアルコール；アカシアガム；カルボマー；アルギン酸；シクロデキストリン；ゼラチン；グアールガム；ウェランガム；ゲランガム；タラガム；ローカストビーンガム；繊維；カラギーナンガム；グルコマンナン；ポリメタクリレート；アルギン酸プロピレングリコール；セラック；アルギン酸ナトリウム；トラガカント；キトサン；およびキサンタンガムからなる群より選択される、請求項 11 に記載の方法。

【請求項 18】

前記修飾または置換されたデンプンが、予めゼラチン化されたデンプン、ヒドロキシエチルデンプンまたはオクテニルコハク酸デンプンナトリウムである、請求項 17 に記載の方法。

【請求項 19】

前記修飾または置換されたセルロースが、メチルセルロース、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、フタル酸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または酢酸フタル酸セルロースである、請求項 17 に記載の方法。

【請求項 20】

前記溶液または分散体が、界面活性剤を含む、請求項 1 ～ 19 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 21】

前記界面活性剤が、陰イオン性界面活性剤、共乳化剤、陽イオン性界面活性剤、非イオン性界面活性剤および両性界面活性剤からなる群より選択される、請求項 20 に記載の方法。

【請求項 22】

前記界面活性剤が、ラウリル硫酸ナトリウム、ドコサン酸ナトリウム、カゼイン酸ナトリウム、脂肪酸塩、第四級アミン、塩化セチルピリジニウム、ポリオキシエチレン脂肪酸エステル、スクロース脂肪酸エステル、セチルアルコール脂肪酸エステル、セトステアリルアルコール、コレステロール、ソルビタン脂肪酸エステル、ポリソルベート、ポロキサマー、コハク酸トコフェリルポリエチレングリコールおよびリン脂質からなる群より選択される、請求項 20 または 21 に記載の方法。

【請求項 23】

前記溶液または分散体が、水または水/エタノール混合物 5 ～ 95 重量%、オルリスタット 1 ～ 91 重量%、マルトデキストリン 3.9 ～ 93.9 重量%、および 1 種以上の薬学的に許容され得る賦形剤 0.1 ～ 90.1 重量% から生成される、請求項 1 ～ 22 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 24】

前記溶液または分散体が、水または水／エタノール混合物 5 ～ 95 重量％、オルリスタット 1 ～ 91 重量％、マルトデキストリン 3.9 ～ 93.9 重量％およびポリオキシエチレン脂肪酸エステル 0.1 ～ 90.1 重量％から生成される、請求項 1 ～ 22 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 25】

前記溶液または分散体が、水または水／エタノール混合物 5 ～ 95 重量％、オルリスタット 1 ～ 91 重量％、トリミリスチン 1 ～ 91 重量％、マルトデキストリン 2.9 ～ 92.9 重量％およびポリオキシエチレン脂肪酸エステル 0.1 ～ 90.1 重量％から生成される、請求項 1 ～ 22 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 26】

前記溶液または分散体が、イソプロピルアルコール 3 ～ 99.98 重量％、オセルタミビル 0.01 ～ 96.99 重量％およびポリメタクリラート 0.01 ～ 96.99 重量％から生成される、請求項 1 ～ 22 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 27】

前記医薬組成物が、0.1 ～ 10 重量％の残留溶媒レベルを有する、請求項 1 ～ 26 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 28】

前記医薬組成物が、 $0.1 \sim 0.9 \text{ g / cm}^3$ のかさ密度（流し込み密度）を有する、請求項 1 ～ 26 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 29】

前記医薬組成物が、50 ～ 600 μm の粒度分布を有する、請求項 1 ～ 26 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 30】

前記組成物が、最終的な投与剤型に直接調製される、請求項 1 ～ 29 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 31】

前記組成物が、その包装内で直接調製される、請求項 1 ～ 30 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 32】

請求項 1 ～ 31 のいずれか 1 項に記載の方法により得られる組成物。

【請求項 33】

残留水または水／エタノール混合物 0.2 ～ 10 重量％、オルリスタット 1 ～ 96 重量％、マルトデキストリン 3.7 ～ 98.7 重量％および 1 種以上の薬学的に許容され得る賦形剤 0.1 ～ 95.1 重量％を含む組成物。

【請求項 34】

ポリエチレン脂肪酸エステルを含む、請求項 30 に記載の組成物。

【請求項 35】

残留イソプロピルアルコール 0.2 ～ 10 重量％、オセルタミビル 1 ～ 98.8 重量％およびポリメタクリラート 1 ～ 98.8 重量％を含む組成物。

【請求項 36】

$0.1 \sim 0.9 \text{ g / cm}^3$ のかさ密度（流し込み密度）を有する、請求項 32 ～ 35 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 37】

50 ～ 600 μm の粒度分布を有する、請求項 32 ～ 35 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 38】

0.1 ～ 10 % の残留溶媒レベルを有する、請求項 32 ～ 35 のいずれか 1 項に記載の組成物。