

【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22年5月20日(2010.5.20)

【公表番号】特表2009-532388(P2009-532388A)

【公表日】平成21年9月10日(2009.9.10)

【年通号数】公開・登録公報2009-036

【出願番号】特願2009-503378(P2009-503378)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 K 9/30 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/42 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/04 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/44 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 9/30

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/42

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/04

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/44

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/14

【手続補正書】

【提出日】平成22年4月5日(2010.4.5)

【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】

押出球状体を含み、前記球状体が、少なくとも 1 つの活性医薬成分、少なくとも 1 つの押出球状化助剤、少なくとも 1 つの超崩壊剤、ならびに、少なくとも 1 つの流動促進剤、少なくとも 1 つの潤滑剤および／または少なくとも 1 つの油を含む、薬物送達組成物。

【請求項 2】

前記球状体が、2種以上の球状体を含み、該2種以上の球状体が、エチルセルロース分散液、カラゲナン、微結晶性セルロースおよびセバシン酸ジブチルを異なる配合でコーティングされている請求項1に記載の薬物送達組成物。

【請求項3】

前記活性医薬成分が、メチルフェニデート、ベンラファキシンおよびカルベジロールからなる群より選択される請求項1または2に記載の薬物送達組成物。

【請求項4】

前記少なくとも1つの活性医薬成分が、0.1質量%から80質量%、5質量%から70質量%、10質量%から70質量%、20質量%から60質量%、30質量%から60質量%、または40質量%から60質量%である、請求項1ないし3のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項5】

前記少なくとも1つの押出球状化助剤が、10質量%から70質量%、20質量%から70質量%、30質量%から70質量%、40質量%から70質量%、50質量%から70質量%、または55質量%から70質量%である、請求項1から4のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項6】

前記少なくとも1つの超崩壊剤が、2質量%から70質量%、20質量%から70質量%、30質量%から70質量%、40質量%から70質量%、50質量%から70質量%、または55質量%から70質量%である、請求項1から5のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項7】

前記少なくとも1つの流動促進剤が、1質量%から20質量%、1質量%から15質量%、2質量%から15質量%、5質量%から15質量%、または5質量%から10質量%である、請求項1から6のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項8】

前記少なくとも1つの潤滑剤が、0.5質量%から5質量%、0.5質量%から4質量%、0.5質量%から3質量%、0.5質量%から2質量%、または1質量%から2質量%である、請求項1から7のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項9】

前記少なくとも1つの油が、0.5質量%から5質量%、0.5質量%から4質量%、0.5質量%から3質量%、0.5質量%から2質量%、または1質量%から2質量%である、請求項1から8のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項10】

少なくとも1つのカルボマー、少なくとも1つの緩衝剤、少なくとも1つの電解質、ゼイン、および／または水をさらに含む、請求項1から9のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項11】

少なくとも1つのコーティングをさらに含む、請求項1から10のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項12】

前記少なくとも1つのコーティングが、少なくとも1層のポリマーフィルムコート、少なくとも1つの腸溶材料および少なくとも1つの超崩壊剤を含む少なくとも1層の腸溶コート、少なくとも1つの非腸溶材料および少なくとも1つの超崩壊剤を含む少なくとも1層の非腸溶コート、ならびに／または、少なくとも1つの半透膜材料および少なくとも1つの超崩壊剤を含む少なくとも1層の半透膜コートを含む、請求項10に記載の薬物送達組成物。

【請求項13】

前記少なくとも1つの超崩壊剤が、0.5質量%から55質量%、0.5質量%から40質量%、0.5質量%から30質量%、1質量%から20質量%、または10質量%か

ら 20 質量%である、請求項 12に記載の薬物送達組成物。

【請求項 14】

それぞれの層が、少なくとも 1つのウィッキング剤 (wicking agent)、カラゲナン、および、少なくとも 1つの可塑剤をさらに含む、請求項 12 または 13に記載の薬物送達組成物。

【請求項 15】

カラゲナンが、0.5 質量%から 55 質量%、0.5 質量%から 50 質量%、0.5 質量%から 40 質量%、5 質量%から 40 質量%、または 20 質量%から 40 質量%である、請求項 14に記載の薬物送達組成物。

【請求項 16】

前記可塑剤が、0.5 質量%から 25 質量%、1 質量%から 20 質量%、5 質量%から 20 質量%、5 質量%から 15 質量%、または 1 質量%から 5 質量%である、請求項 14に記載の薬物送達組成物。

【請求項 17】

前記少なくとも 1つのコーティングが、その球状体とコーティングの総質量に基づいて 0.5 質量%から 50 質量%、1 質量%から 20 質量%、1 質量%から 10 質量%、1 質量%から 7 質量%、3.5 質量%から 7 質量%、3.5 質量%から 6 質量%、または 4 質量%から 5 質量%である 請求項 11 から 16 のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項 18】

前記コーティングが、 0.1 mg/cm^2 から 20 mg/cm^2 の表面積を生ずるように球状体に塗布される、請求項 17に記載の薬物送達組成物。

【請求項 19】

カプセル封入される、または、錠剤および／もしくはキャプレットに圧縮される、請求項 1 から 18 のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項 20】

前記球状体が、カプセルおよび／またはサッシェ内にある、請求項 1 から 18 のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項 21】

前記少なくとも 1つの活性医薬成分が、インビボで治療、診断または予防効果をもたらす化学または生体分子を含む、請求項 1 から 20 のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項 22】

前記少なくとも 1つの押出球状化助剤が、微結晶性セルロース、ペクチンおよび／またはエチルセルロースを含む、請求項 1 から 21 のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項 23】

前記少なくとも 1つの超崩壊剤が、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、架橋 N-ビニル-2-ピロリドンのホモポリマー、およびアルギン酸、架橋セルロース、架橋ポリマー、架橋デンプン、イオン交換樹脂、および／またはクロスポビドンを含む、請求項 1 から 22 のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項 24】

前記少なくとも 1つの流動促進剤が、二酸化ケイ素、デンプン、ケイ酸カルシウム、タルク、Cabosil、Syloid、および二酸化ケイ素エーロゲルを含む、請求項 1 から 23 のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項 25】

前記少なくとも 1つの潤滑剤が、アルカリスチアリン酸塩、ポリエチレングリコール、アジピン酸、硬化植物油、塩化ナトリウム、ステロテックス、モノステアリン酸グリセロール、タルク、ポリエチレングリコール、安息香酸ナトリウム、ラウリル硫酸ナトリウム、ラウリル硫酸マグネシウム、ステアリルフマル酸ナトリウム、軽油、および／または、ワックス状脂肪酸エステルを含む、請求項 1 から 24 のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項 26】

前記少なくとも 1 つの油が、扁桃油、杏仁油、アボカド油、ブラックカラント油、14% GLA、ルリジサ油、20% GLA、カノーラ油、ニンジン油、ヒマシ油、クローブリーフ油、ヤシ油、トウモロコシ油、綿実油、オオマツヨイグサ油、9% GLA、亜麻仁油、55% ALA、ブドウ種子油、ヘーゼルナッツ油、麻油、ALA/GLA、硬化油、ホホバ油、ゴールデンホホバ油、無色透明ククイナッツ油、マカデミアナッツ油、オート麦油、オリーブ油、エクストラバージンオリーブ油ボマス/「B」グレード、オリーブ油、ピュア/NF、パーム油、パセリ種子油、桃仁油、落花生油、ペカン油、ピスタチオ油、カボチャ種子油、米ぬか油、バラの実種油、ローズマリー油、ベニバナ油、リノール酸ベニバナ油、高オレイン酸、ゴマ油 NF、焙煎ゴマ油、大豆油、ひまわり油、サラダひまわり油・高オレイン酸、ティーツリー油、食物性、グリセリン、USP、クルミ油、麦芽油、低温圧搾、および鉱油または他の類似の油から選択された 1 つ以上を含む、請求項 1 から 25 のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項 27】

不活性球状体および該不活性球状体のための少なくとも 1 つのコーティングを有する、コーティングされた球状体を含み、前記コーティングが、少なくとも 1 つの活性医薬成分および少なくとも 1 つの超崩壊剤を含む、薬物送達組成物。

【請求項 28】

前記不活性球状体が、糖球状体であり、前記不活性球状体がさらに、エチルセルロース分散液、カラゲナン、微結晶性セルロースおよびセバシン酸ジブチルのコーティングを含む請求項 27 に記載の薬物送達組成物。

【請求項 29】

前記活性医薬成分が、メチルフェニデート、ベンラファキシンおよびカルベジロールからなる群より選択される請求項 27 または 28 に記載の薬物送達組成物。

【請求項 30】

前記少なくとも 1 つの活性医薬成分が、0.1 質量% から 90 質量%、0.1 質量% から 80 質量%、10 質量% から 80 質量%、20 質量% から 80 質量%、30 質量% から 70 質量%、または、40 質量% から 70 質量% である請求項 27 から 29 のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項 31】

前記少なくとも 1 つの超崩壊剤が、0.1 質量% から 80 質量%、0.5 質量% から 55 質量%、0.5 質量% から 40 質量%、0.5 質量% から 30 質量%、1 質量% から 20 質量%、または、10 質量% から 20 質量% である請求項 27 から 30 のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項 32】

前記コーティングが、ウィックキング剤、カラゲナンおよび/または可塑剤のうちの少なくとも 1 つをさらに含む、請求項 27 から 31 のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項 33】

前記ウィックキング剤が、0.5 質量% から 90 質量%、0.5 質量% から 80 質量%、0.5 質量% から 70 質量%、5 質量% から 60 質量%、または、20 質量% から 60 質量% である、請求項 32 に記載の薬物送達組成物。

【請求項 34】

前記カラゲナンが、0.5 質量% から 90 質量%、0.5 質量% から 80 質量%、0.5 質量% から 70 質量%、5 質量% から 60 質量%、または 20 質量% から 60 質量% である、請求項 32 または 33 に記載の薬物送達組成物。

【請求項 35】

前記可塑剤が、0.5 質量% から 25 質量%、1 質量% から 20 質量%、5 質量% から 20 質量%、5 質量% から 15 質量%、または 1 質量% から 5 質量% である、請求項 32 または 33 に記載の薬物送達組成物。

【請求項 36】

前記少なくとも1つの活性医薬成分が、インビボで治療、診断または予防効果をもたらす化学または生体分子を含む、請求項27から35のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項37】

前記少なくとも1つの超崩壊剤が、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、架橋N-ビニル-2-ピロリドンのホモポリマー、および、アルギン酸、架橋セルロース、架橋ポリマー、架橋デンプン、イオン交換樹脂、および／または、クロスポビドンを含む、請求項27から36のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項38】

前記球状体が、前記少なくとも1つのコーティングを、その球状体とコーティングの総質量に基づいて0.5質量%から50質量%、1質量%から20質量%、1質量%から10質量%、1質量%から7質量%、3.5質量%から7質量%、3.5質量%から6質量%、または4質量%から5質量%含む、請求項27から37のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項39】

前記少なくとも1つのコーティングが、 0.1 mg/cm^2 から 20 mg/cm^2 の表面積を生ずるように球状体に塗布される、請求項38に記載の薬物送達組成物。

【請求項40】

カプセル封入される、または、錠剤および／もしくはキャブレットに圧縮される、請求項27から39のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項41】

前記球状体が、カプセルおよび／またはサッシェの中にある、請求項27から39のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項42】

前記不活性球状体が、糖球状体、デンプン球状体および／またはセルロース球状体である請求項27から41のいずれか一項に記載の薬物送達組成物。

【請求項43】

前記少なくとも1つの活性医薬成分の持効性、パルス、時間治療学的、持続または制御放出を哺乳動物にもたらすための医薬品であって、請求項1から42のいずれか一項に記載の薬物送達組成物を含む医薬品。

【請求項44】

前記薬物送達組成物中の少なくとも1つの活性医薬成分が効果を有する疾病を治療するための、請求項43に記載の医薬品。

【請求項45】

その組成物の乾燥材料を併せて、均質なブレンドを生じさせること、
それらの顆粒と前記少なくとも1つの流動促進剤、少なくとも1つの潤滑剤および／または少なくとも1つの油を併せて、押出球状化に適する湿潤塊を生じさせること、ならびに、

その湿潤塊を押し出して、球状体を形成すること
を含む、請求項1から30のいずれか一項に記載の薬物送達組成物の製造方法。

【請求項46】

前記湿潤塊が、可塑性を有する、請求項45に記載の方法。

【請求項47】

前記湿潤塊が、押出助剤を1として、前記少なくとも1つの流動促進剤、少なくとも1つの潤滑剤および／または少なくとも1つの油を0.7から2含む、請求項45または46に記載の方法。

【請求項48】

前記顆粒が、少なくとも1つの可塑剤とさらに併せられる、請求項45から47のいずれか一項に記載の方法。

【請求項49】

前記湿潤塊を押し出した後、それらの押出物を球状体形成機回転板に装填し、回転させて、球状体を生じさせる、請求項 4 5 から 4 8 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 5 0】

前記球状体を乾燥させて、10 質量%の含水量を有する球状体を生じさせる、請求項 4 5 から 4 9 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 5 1】

前記球状体をコーティングすることをさらに含む、請求項 4 5 から 5 0 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 5 2】

前記球状体が、前記コーティングの溶液、分散液または懸濁液を使用してコーティングされる、請求項 5 1 に記載の方法。

【請求項 5 3】

前記球状体をカプセル封入することをさらに含む、請求項 4 5 から 5 2 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 5 4】

前記球状体をカプセル、錠剤、キャプレットおよび／またはサッシェに兼備させることをさらに含む、請求項 4 5 から 5 2 のいずれか一項に記載の方法。