

【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23年6月30日(2011.6.30)

【公開番号】特開2011-63627(P2011-63627A)

【公開日】平成23年3月31日(2011.3.31)

【年通号数】公開・登録公報2011-013

【出願番号】特願2010-293163(P2010-293163)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/335 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 9/16 (2006.01)

A 6 1 K 31/137 (2006.01)

A 6 1 K 31/357 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/335

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 31/137

A 6 1 K 31/357

A 6 1 K 9/20

【手続補正書】

【提出日】平成23年5月17日(2011.5.17)

【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)苦味を呈する薬物を含有するコア粒子および(b)該コア粒子を被覆するマスキング皮膜を含んでなる薬物含有顆粒であって、

該マスキング皮膜が、該皮膜の20～70重量%のメタクリル酸コポリマーS、メタクリル酸コポリマーL、メタクリル酸アクリル酸エチルコポリマー、アクリル酸エチルメタクリル酸メチルコポリマーおよびアクリル酸エチルメタクリル酸メチルメタクリル酸塩化トリメチルアンモニウムエチルコポリマーから選ばれた1つ以上のポリマー、ならびに

該ポリマーに対して40～250重量%のD-マンニトール、乳糖、トレハロース、キシリトール、マルチトールおよびエリスリトールから選ばれた1つ以上の賦形剤を含有するマスキング皮膜であることを特徴とする、薬物含有顆粒。

【請求項2】

(a)苦味を呈する薬物として、シナカルセト、トピラマートもしくはオロパタジンまたはその薬学的に許容される塩を含有するコア粒子および(b)該コア粒子を被覆するマスキング皮膜を含んでなる薬物含有顆粒であって、

該マスキング皮膜が、メタクリル酸アクリル酸エチルコポリマー、ならびに

D-マンニトール、乳糖、トレハロース、キシリトール、マルチトールおよびエリスリトールから選ばれた1つ以上の賦形剤を含有するマスキング皮膜であることを特徴とする、薬物含有顆粒。

【請求項3】

該コア粒子が、D-マンニトール、乳糖、トレハロース、キシリトール、マルチトールおよびエリスリトールから選ばれた1つ以上の賦形剤ならびにメタクリル酸コポリマーS、メタクリル酸コポリマーL、メタクリル酸アクリル酸エチルコポリマー、アクリル酸エチルメタクリル酸メチルコポリマーおよびアクリル酸エチルメタクリル酸メチルメタクリル酸塩化トリメチルアンモニウムエチルコポリマーから選ばれた1つ以上のポリマーを含有するコア粒子である、請求項1または2記載の薬物含有顆粒。

【請求項4】

重量平均粒子径が100～300 μmである、請求項1～3のいずれかに記載の薬物含有顆粒。

【請求項5】

請求項1～4のいずれかに記載の薬物含有顆粒と、該苦味を呈する薬物を含有しない口腔内崩壊錠用粉末とを含有してなる口腔内崩壊錠。

【請求項6】

(a) 苦味を呈する薬物を含有するコア粒子および(b) 該コア粒子を被覆するマスキング皮膜を含んでなる薬物含有顆粒の製造方法であって、

該コア粒子を製造する工程、および

得られたコア粒子に、得られるマスキング皮膜の20～70重量%のメタクリル酸コポリマーS、メタクリル酸コポリマーL、メタクリル酸アクリル酸エチルコポリマー、アクリル酸エチルメタクリル酸メチルコポリマーおよびアクリル酸エチルメタクリル酸メチルメタクリル酸塩化トリメチルアンモニウムエチルコポリマーから選ばれた1つ以上のポリマー、ならびに

該ポリマーに対して40～250重量%のD-マンニトール、乳糖、トレハロース、キシリトール、マルチトールおよびエリスリトールから選ばれた1つ以上の賦形剤を含有するコーティング液を、コーティングしてマスキング皮膜を施す工程を含むことを特徴とする、薬物含有顆粒の製造方法。

【請求項7】

苦味を呈する薬物を含有するコア粒子を製造する工程が、苦味を呈する薬物ならびにD-マンニトール、乳糖、トレハロース、キシリトール、マルチトールおよびエリスリトールから選ばれた1つ以上の賦形剤を、

メタクリル酸コポリマーS、メタクリル酸コポリマーL、メタクリル酸アクリル酸エチルコポリマー、アクリル酸エチルメタクリル酸メチルコポリマーおよびアクリル酸エチルメタクリル酸メチルメタクリル酸塩化トリメチルアンモニウムエチルコポリマーから選ばれた1つ以上のポリマーを含有する結合液で造粒する工程である、請求項6記載の薬物含有顆粒の製造方法。

【請求項8】

(a) 苦味を呈する薬物として、シナカルセト、トピラマートもしくはオロパタジンまたはその薬学的に許容される塩を含有するコア粒子および(b) 該コア粒子を被覆するマスキング皮膜を含んでなる薬物含有顆粒の製造方法であって、

該コア粒子を製造する工程、および

得られたコア粒子に、メタクリル酸アクリル酸エチルコポリマー、ならびにD-マンニトール、乳糖、トレハロース、キシリトール、マルチトールおよびエリスリトールから選ばれた1つ以上の賦形剤を含有するコーティング液を、コーティングしてマスキング皮膜を施す工程を含むことを特徴とする、薬物含有顆粒の製造方法。

【請求項9】

コア粒子を製造する工程が、シナカルセト、トピラマートもしくはオロパタジンまたはその薬学的に許容される塩、ならびにD-マンニトール、乳糖、トレハロース、キシリトール、マルチトールおよびエリスリトールから選ばれた1つ以上の賦形剤を、

メタクリル酸コポリマーS、メタクリル酸コポリマーL、メタクリル酸アクリル酸エチルコポリマー、アクリル酸エチルメタクリル酸メチルコポリマーおよびアクリル酸エチルメタクリル酸メチルメタクリル酸塩化トリメチルアンモニウムエチルコポリマーから選ばれた1つ以上のポリマーを含有する結合液で造粒する工程である、請求項8記載の薬物含有顆粒の製造方法。

【請求項 10】

コア粒子の重量平均粒子径を75～150 μm とする、請求項6～9のいずれかに記載の薬物含有顆粒の製造方法。

【請求項 11】

請求項6～10のいずれかに記載の製造方法によって得られた薬物含有顆粒と、該苦味を呈する薬物を含有しない口腔内崩壊錠用粉末とを混合する工程、および得られた混合粉体を圧縮形成する工程を含むことを特徴とする口腔内崩壊錠の製造方法。