

【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21年1月15日(2009.1.15)

【公表番号】特表2008-520696(P2008-520696A)

【公表日】平成20年6月19日(2008.6.19)

【年通号数】公開・登録公報2008-024

【出願番号】特願2007-543252(P2007-543252)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/427 (2006.01)

A 6 1 K 47/42 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (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 9/52 (2006.01)

A 6 1 K 9/28 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/02 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/427

A 6 1 K 47/42

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 9/52

A 6 1 K 9/28

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 29/02

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成20年11月14日(2008.11.14)

【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

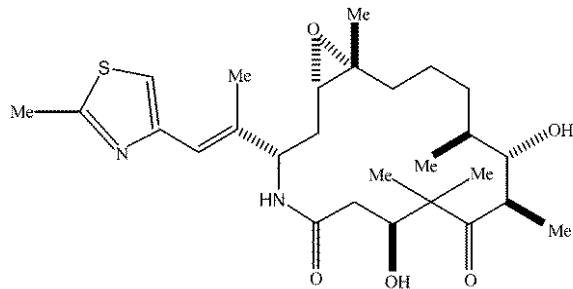
【補正方法】変更

【補正の内容】

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項 1】

- a) i) 基剤粒子；および  
 ii) 前記基剤粒子上に配置された有効成分層（ここに、該有効成分層は、1）式：  
 【化 1】



を有する化合物またはその薬学的に許容可能な溶媒和物もしくは水和物；および2）少なくとも1つの結合剤を含む）

を含む被覆粒子；および

b) 前記被覆粒子を封入する腸溶性コーティング  
 を含む腸溶性被覆ビーズ。

## 【請求項 2】

前記腸溶性被覆ビーズの重量を基準として、

- a) 約 10 ～ 約 80 重量 % の前記基剤粒子；  
 b) 約 0.1 ～ 約 50 重量 % の前記有効成分層；および  
 c) 約 5 ～ 約 55 重量 % の前記腸溶性コーティング  
 を含む、請求項 1 に記載の腸溶性被覆ビーズ。

## 【請求項 3】

腸溶性被覆ビーズのヒト患者への経口投与において、腸溶性コーティングが前記被覆粒子に塗布されて有効成分層の胃酸への曝露を最小限にするかまたは防止する、請求項 1 または 2 のいずれかが記載の腸溶性被覆ビーズ。

## 【請求項 4】

有効成分層が基剤粒子表面の下に部分的に分布している、請求項 1、2 または 3 のいずれかが記載の腸溶性被覆ビーズ。

## 【請求項 5】

結合剤がデンプン、ゼラチン、スクロース、グルコース、デキストロース、糖蜜、変性デキストリン、ラクトース、アカシア、アルギン酸ナトリウム、アルギン酸カリウム、メチルセルロース、ヒドロキシメチルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、グアーガム、キサンタンガム、ポリビニルピロリドン、ポリ（ビニルピロリドン - 酢酸ビニル）コポリマーまたはその混合物である、請求項 1、2、3 または 4 のいずれかが記載の腸溶性被覆ビーズ。

## 【請求項 6】

約 0.5 ミリメートルから約 7 ミリメートルまでの範囲の直径を有する、請求項 1、2、3、4 または 5 のいずれかが記載の腸溶性被覆ビーズ。

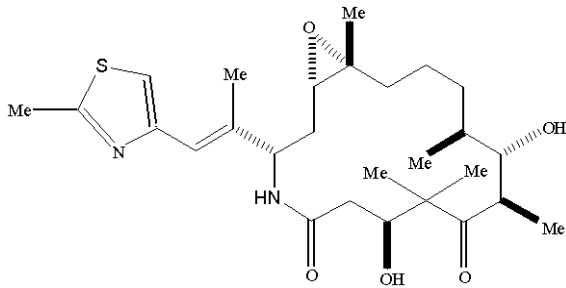
## 【請求項 7】

有効成分層が 500 ミクロン未満、より好ましくは 250 ミクロン未満の直径を有する化合物粒子で調製される、請求項 1、2、3、4、5 または 6 のいずれかが記載の腸溶性被覆ビーズ。

## 【請求項 8】

i) 式：

## 【化 2】



で示される化合物の粒子およびii) 水、溶媒または溶媒 / 水混合物を含む、有効成分混合物を調製すること；

結合剤の存在下、基剤粒子を該有効成分混合物と接触させて被覆粒子を提供すること；

基剤粒子および有効成分混合物を含む該被覆粒子を乾燥すること；および

該被覆粒子を腸溶性コーティングで封入し、腸溶性被覆ビーズを提供することを含む、ヒト患者への経口投与用医薬組成物の製造における使用のための腸溶性被覆ビーズを製造する方法。

## 【請求項 9】

粒子が500ミクロン未満、より好ましくは250ミクロン未満の直径を有する、請求項 8 に記載の方法。

## 【請求項 10】

有効成分混合物が6～9の範囲、より好ましくは6.5～8の範囲のpHにて維持される、請求項 8 または 9 のいずれか記載の方法。

## 【請求項 11】

基剤粒子への塗布前に有効成分混合物の一部として結合剤を用い、予め混合する、請求項 8、9 または 10 のいずれか記載の方法。

## 【請求項 12】

有効成分混合物を流体床スプレー装置でスプレーすることにより基剤粒子に塗布する、請求項 8、9、10 または 11 のいずれか記載の方法。

## 【請求項 13】

請求項 8、9、10、11 または 12 のいずれか記載の方法により製造される、イキサベピロンの腸溶性被覆ビーズ。

## 【請求項 14】

請求項 1、2、3、4、5、6、7 または 13 のいずれか記載の多数の腸溶性被覆ビーズを含むカプセル。

## 【請求項 15】

ヒト患者への経口投与用医薬の製造におけるイキサベピロンの使用であって、医薬がイキサベピロンの腸溶性被覆ビーズを含み、腸溶性被覆ビーズが被覆粒子および腸溶性コーティングを含み、被覆粒子が基剤粒子中または基剤粒子上に完全にまたは部分的に分布しているイキサベピロンを少なくとも一つの結合剤とともに含み、腸溶性コーティングがヒト患者への腸溶性被覆ビーズの経口投与において、被覆ビーズの胃酸への曝露を最小限にするかまたは防止する、使用。