【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2005-506365(P2005-506365A)
【公表日】平成17年3月3日(2005.3.3)
【年通号数】公開・登録公報2005-009
【出願番号】特願2003-537604(P2003-537604)
【国際特許分類第７版】
　Ａ６１Ｋ　31/495
　Ａ６１Ｋ　 9/14
　Ａ６１Ｋ　 9/20
　Ａ６１Ｋ　47/04
　Ａ６１Ｋ　47/10
　Ａ６１Ｋ　47/12
　Ａ６１Ｋ　47/20
　Ａ６１Ｋ　47/32
　Ａ６１Ｋ　47/34
　Ａ６１Ｋ　47/36
　Ａ６１Ｋ　47/38
　Ａ６１Ｐ　17/00
　Ａ６１Ｐ　17/06
　Ａ６１Ｐ　19/02
　Ａ６１Ｐ　25/00
　Ａ６１Ｐ　29/00
　Ａ６１Ｐ　37/08
【ＦＩ】
　Ａ６１Ｋ　31/495
　Ａ６１Ｋ　 9/14
　Ａ６１Ｋ　 9/20
　Ａ６１Ｋ　47/04
　Ａ６１Ｋ　47/10
　Ａ６１Ｋ　47/12
　Ａ６１Ｋ　47/20
　Ａ６１Ｋ　47/32
　Ａ６１Ｋ　47/34
　Ａ６１Ｋ　47/36
　Ａ６１Ｋ　47/38
　Ａ６１Ｐ　17/00
　Ａ６１Ｐ　17/06
　Ａ６１Ｐ　19/02
　Ａ６１Ｐ　25/00
　Ａ６１Ｐ　29/00
　Ａ６１Ｐ　29/00　　１０１
　Ａ６１Ｐ　37/08

【手続補正書】
【提出日】平成16年7月7日(2004.7.7)
【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】
(2R)－１－（（４－クロロ－２－（ウレイド）フェノキシ）メチル）カルボニル－２－メチル－４－（４－フルオロベンジル）ピペラジン又はその塩を含む固形医薬剤配合物であって、さらに、ポリマーマトリックス、有機酸、滑剤及び１又は複数のアジュバントを含み、そして粉末混合物の粒子サイズが、0.1～750μｍの範囲で90％までであることを特徴とする配合物。
【請求項２】
前記ポリマーマトリックスが、セルロース誘導体、アクリル誘導体、ビニルポリマー、ポリアンヒドリド、ポリエステルポリオルトエステル、ポリウレタン、ポリカーボネート、ポリホスファゼン、ポリアセタール、ポリサッカリド、糖エステル、ジエチレングリコール－モノエチルエーテル、ジエチレングリコールモノパルミトステアレート、エチレングリコール－モノパルミトステアレート、グリセロールベヘネート及びグリセロールジベヘネート、グリセロールジステアレート及びグリセロールパルミトステアレート、グリセロール－モノオレエート40、グリセロール－モノステアレート40－55、マクロゴールグリセロール－ラウレート、マクロゴールグリセロール－ステアレート、プロピレングリコール－モノパルミトステアレート、キトサン、ガラクトマンナン、ペクチン、シェラック及びアルギネートから成る群から選択された請求項１記載の固形医薬剤配合物。
【請求項３】
前記ポリマーマトリックスが、水溶性ポリビニルピロリドン及び水不溶性ポリビニルアセテートの混合物から成る請求項１又は２記載の固形医薬剤配合物。
【請求項４】
前記ポリマーマトリックスが、次の組成、すなわちポリビニルアセテート80％、ポリビニルピロリド19％、ラウリル硫酸ナトリウム0.8％及び二酸化珪素0.2％を有する請求項１～３のいずれか１項記載の固形医薬剤配合物。
【請求項５】
前記有機酸が、フマル酸、クエン酸、クエン酸三ナトリウム、クエン酸水素ナトリウム、アスコルビン酸、マレイン酸、無水マレイン酸、酒石酸、アジピン酸、リン酸水素ナトリウム、琥珀酸、グルタル酸、グルタル酸無水物、ソルビン酸カリウム及びソルビン酸から成る群から選択される請求項１～４のいずれか１項記載の固形医薬剤配合物。
【請求項６】
さらに、滑剤が添加される請求項１～５のいずれか１項記載の固形医薬剤配合物。
【請求項７】
前記アジュバントが、ラクトース、二リン酸カルシウム、マンニトール又は澱粉である請求項１～６のいずれか１項記載の固形医薬剤配合物。
【請求項８】
追加のアジュバントとして微晶性セルロースを含む請求項１～７のいずれか１項記載の固形医薬剤配合物。
【請求項９】
さらに、流れ－調節剤を含む請求項１～８のいずれか１項記載の固形医薬剤配合物。
【請求項１０】
前記粉末混合物の粒子サイズが、20～400μｍの範囲で90％までである請求項１～９のいずれか１項記載の固形医薬剤配合物。
【請求項１１】
(2R)－１－（（４－クロロ－２－（ウレイド）フェノキシ）メチル）カルボニル－２－メチル－４－（４－フルオロベンジル）ピペラジン又はその塩が、前記マトリックスに均質に分散される請求項１～10のいずれか１項記載の固形医薬剤配合物。

【請求項１２】
(2R)－１－（（４－クロロ－２－（ウレイド）フェノキシ）メチル）カルボニル－２－メチル－４－（４－フルオロベンジル）ピペラジン又はその塩が、前記マトリックスにより取り囲まれている請求項１～11のいずれか１項記載の固形医薬剤配合物。
【請求項１３】
請求項１～12のいずれか１項記載の固形医薬剤配合物の生成方法であって、(2R)－１－（（４－クロロ－２－（ウレイド）フェノキシ）メチル）カルボニル－２－メチル－４－（４－フルオロベンジル）ピペラジン又はその塩が１又は複数のアジュバント、ポリマーマトリックス、有機酸及び滑剤と共に混合され、そして錠剤形入れられ、それにより、すべての物質は粉末形で存在し、そして混合の前に個々に、又は混合の後に一緒に分級される方法。
【請求項１４】
請求項１～12のいずれか１項記載の固形医薬剤配合物の生成方法であって、(2R)－１－（（４－クロロ－２－（ウレイド）フェノキシ）メチル）カルボニル－２－メチル－４－（４－フルオロベンジル）ピペラジン又はその塩が１又は複数のアジュバント、ポリマーマトリックス及び有機酸と共に混合され、そして次に、粒質化され、次に滑剤が添加され、そして次に、それを錠剤形に入れられる方法。
【請求項１５】
請求項１～12のいずれか１項記載の固形多粒質状医薬剤配合物の生成方法であって、(2R)－１－（（４－クロロ－２－（ウレイド）フェノキシ）メチル）カルボニル－２－メチル－４－（４－フルオロベンジル）ピペラジン又はその塩、ポリマーマトリックス、有機酸及びアジュバントが、押し出し及び続く球状化によりペレットに加工される方法。
【請求項１６】
請求項１～12のいずれか１項記載の固形多粒質状医薬剤配合物の生成方法であって、(2R)－１－（（４－クロロ－２－（ウレイド）フェノキシ）メチル）カルボニル－２－メチル－４－（４－フルオロベンジル）ピペラジン又はその塩、ポリマーマトリックス、有機酸及びアジュバントが、混合され、そして結合剤溶液又は溶融された添加剤によりペレットに加工される方法。
【請求項１７】
請求項１～12のいずれか１項記載の固形多粒質状医薬剤配合物の生成方法であって、(2R)－１－（（４－クロロ－２－（ウレイド）フェノキシ）メチル）カルボニル－２－メチル－４－（４－フルオロベンジル）ピペラジン又はその塩、ポリマーマトリックス、有機酸及びアジュバントが、噴霧乾燥又は噴霧凝固によりペレットに加工される方法。
【請求項１８】
請求項１～12のいずれか１項記載の固形多粒質状医薬剤配合物の生成方法であって、(2R)－１－（（４－クロロ－２－（ウレイド）フェノキシ）メチル）カルボニル－２－メチル－４－（４－フルオロベンジル）ピペラジン又はその塩、ポリマーマトリックス、有機酸及びアジュバントが、回転造粒機によりペレットに加工される方法。
【請求項１９】
請求項１～12のいずれか１項記載の固形医薬剤配合物の生成方法であって、ポリマーマトリックス、有機酸及びアジュバントが、(2R)－１－（（４－クロロ－２－（ウレイド）フェノキシ）メチル）カルボニル－２－メチル－４－（４－フルオロベンジル）ピペラジン又はその塩上への積層化適用によりペレットに加工される方法。
【請求項２０】
炎症性疾患を処理するための薬剤の生成のためへの請求項１～12のいずれか１項記載の固形医薬剤配合物の使用。
【請求項２１】
前記炎症性疾患が多発性硬化症である請求項20記載の使用。
【請求項２２】
前記炎症性疾患がリウマチ様関節炎である請求項20記載の使用。

【請求項２３】
前記疾患が乾癬である請求項20記載の使用。
【請求項２４】
前記疾患がアトピー性皮膚炎である請求項20記載の使用。
【請求項２５】
乾癬の治療のための医薬化成物の製造のための、(2R)－１－（（４－クロロ－２－（ウレイド）フェノキシ）メチル）カルボニル－２－メチル－４－（４－フルオロベンジル）ピペラジン又はその塩の使用。