

【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 11 月 10 日 (2005.11.10)

【公表番号】特表 2001-514651(P2001-514651A)

【公表日】平成 13 年 9 月 11 日 (2001.9.11)

【出願番号】特願 平 10-539357

【国際特許分類第 7 版】

A 6 1 K 9/22

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 9/70

A 6 1 K 31/135

【F I】

A 6 1 K 9/22

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 9/70 4 0 1

A 6 1 K 31/135

【手続補正書】

【提出日】平成 17 年 3 月 8 日 (2005.3.8)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】補正の内容のとおり

【補正方法】変更

【補正の内容】

## 手続補正書

平成17年 3月 8日

特許庁長官殿

## 1. 事件の表示

平成10年特許願第539357号



## 2. 補正をする者

氏名(名称) アラキス・リミテッド

## 3. 代理人

住所

〒540-0001

大阪府大阪市中央区城見1丁目3番7号 IMPビル  
青山特許事務所

電話 06-6949-1261

FAX 06-6949-0361

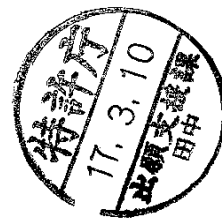
氏名

弁理士 (6214) 青山 葆



## 4. 補正対象書類名 請求の範囲

## 5. 補正対象項目名 請求の範囲

6. 補正の内容  
別紙のとおり。

(別紙)

請 求 の 範 囲

1. 一部分にベラパミル以外のキラルな薬物の、実質上単一の(+) -エナンチオマーを含有し、他の別の部分に該薬物の実質上単一の(−) -エナンチオマーを含有し、使用時に異なるエナンチオマーが製剤から異なる速度で放出される、医薬製剤。
2. キラルな薬物が、その異なるエナンチオマーが異なる速度で体に吸収され、代謝され、分散され、または分泌される薬物のいずれかである、請求項1記載の製剤。
3. キラルな薬物が、異なるエナンチオマーが異なる効力または異なる作用態様を有する薬物のいずれかである、請求項1または請求項2記載の製剤。
4. キラルな薬物が、その2つのエナンチオマーのうち的一方において有害な副作用を有する薬物のいずれかである、請求項1または請求項2記載の製剤。
5. 標的組織において、少なくとも1日に8時間、異なるエナンチオマーの比が実質上一定となるよう異なるエナンチオマーの放出速度が選択される、請求項1から4のいずれかに記載の製剤。
6. 標的組織でのエナンチオマー比が約50:50である、請求項5記載の製剤。
7. 標的組織でのエナンチオマー比が、(−) -エナンチオマーに比べて(+) -エナンチオマーが過剰である非ラセミ体比である、請求項5記載の製剤。
8. 標的組織でのエナンチオマー比が、(+) -エナンチオマーに比べて(−) -エナンチオマーが過剰である非ラセミ体比である、請求項5記載の製剤。
9. 少なくともエナンチオマーの一方の放出速度が時間と共に変化する、請求項1記載の製剤。
10. (+) -エナンチオマーの放出速度が時間と共に増加または減少する、請求項9記載の製剤。
11. (−) -エナンチオマーの放出速度が時間と共に増加または減少する、請求項9記載の製剤。
12. 一方のエナンチオマーが他方のエナンチオマーよりも速い速度で放出され

る、請求項 1 記載の製剤。

13. (+)-エナンチオマーが(−)-エナンチオマーよりも速く放出される、請求項 1 2 記載の製剤。

14. (−)-エナンチオマーが(+)-エナンチオマーよりも速く放出される、請求項 1 2 記載の製剤。

15. (+)-エナンチオマーを含有する多くの第 1 粒子と(−)-エナンチオマーを含有する多くの第 2 粒子を含むカプセルを含み、第 1 および第 2 粒子がそのそれぞれのエナンチオマーに関して異なる放出速度を有する、請求項 1 から 14 のいずれかに記載の製剤。

16. (+)-エナンチオマーを含有する第 1 の錠剤と(−)-エナンチオマーを含有する第 2 の錠剤を含み、第 1 と第 2 の錠剤がそのそれぞれのエナンチオマーに関して異なる放出速度を有する、請求項 1 から 14 のいずれかに記載の製剤。

17. 第 1 と第 2 の錠剤が一つのカプセル内に充填される、請求項 1 6 記載の製剤。

18. (+)-エナンチオマーを含有する第 1 部分と(−)-エナンチオマーを含有する第 2 部分を有し、第 1 と第 2 の部分がそのそれぞれのエナンチオマーに関して異なるポンピング速度を有するオスモティックポンプ錠剤を含む、請求項 1 から 14 のいずれかに記載の製剤。

19. 一層が(+)-エナンチオマーを含有し、他の層が(−)-エナンチオマーを含有し、二層がそのそれぞれのエナンチオマーに関して異なる放出速度を有する二層性錠剤を含む、請求項 1 から 14 のいずれかに記載の製剤。

20. (+)-および(−)-エナンチオマーのうちの一つを含有する中心部と、その中心部を囲んで(+)-および(−)-エナンチオマーのもう一方を含有する外殻を有する圧縮されたコート錠剤を含む、請求項 1 から 14 のいずれかに記載の製剤。

21. (+)-エナンチオマーを含有する第 1 部分と(−)-エナンチオマーを含有する第 2 部分を含み、第 1 と第 2 の部分がそのそれぞれのエナンチオマーに関して異なる放出速度を有する、患者の皮膚に直接貼り付けるためのパッチを含む、請求項 1 から 14 のいずれかに記載の製剤。

22. 一方のパッチが(+)-エナンチオマーを含有し、他方のパッチが(−)-エナ

ンチオマーを含有し、2つのパッチが異なる放出速度を有する、患者の皮膚におのおの直接貼り付けるための2つのパッチを含む、請求項1から14のいずれかに記載の製剤。

23. (+)-エナンチオマーを含有する第1部分と(-)-エナンチオマーを含有する第2部分を有し、第1と第2の部分がそれぞれのエナンチオマーに関して異なる放出速度を有する重合体インプラントを含む、請求項1から14のいずれかに記載の製剤。

24. 一方のインプラントが(+)-エナンチオマーを含有し、他方のインプラントが(-)-エナンチオマーを含有し、2つのインプラントが異なる放出速度を有する2つの重合体インプラントを含む、請求項1から14のいずれかに記載の製剤。

25. 一方のセットが(+)-エナンチオマーを含有し、他方のセットが(-)-エナンチオマーを含有し、異なる放出速度を有する2セットの微小粒子を含有する1エアゾールを含む、請求項1から14のいずれかに記載の製剤。

26. 一方が(+)-エナンチオマーを含有する微小粒子を含有し、他方が(-)-エナンチオマーを含有する微小粒子を含有し、2つのエアゾール中の微小粒子がそれぞれのエナンチオマーに関して異なる放出速度を有する2つのエアゾールを含む、請求項1から14のいずれかに記載の製剤。

27. キラルな薬物がワルファリン、トラマドール、ミアンセリン、カルベジオール、シタロプラム、ドブタミンおよびアミノグルテチミドから選択される、前記請求項のいずれかに記載の製剤。

28. キラルな薬物がワルファリンである、請求項27記載の製剤。

29. キラルな薬物がトラマドールである、請求項27記載の製剤。

30. (-)-トラマドールが即時放出型であり、(+)-トラマドールが徐放性放出型である、請求項29記載の製剤。

31. (-)-トラマドールを含む外層と(+)-トラマドールを含む中心部を有する二層性錠剤である、請求項29または30記載の製剤。

32. キラルな薬物がアルフゾシン、セリプロロール、シサプリド、ジソピラミド、フェノドパム、フレカイニド、ヒドロキシクロロキン、イホスファミド、ラベトロール、メキシレチン、プロパフェノン、テガフル、テラゾシン、チオク

ト酸、チオペンタル、およびザコプリドから選択される、請求項 1 から 26 のいずれかに記載の製剤。

33. キラルな薬物が、異なるエナンチオマーが異なる選択性を有する薬物のいずれかである、請求項 1 から 26 のいずれかに記載の製剤。

34. キラルな薬物が、異なるエナンチオマーが異なる毒性を有する薬物のいずれかである、請求項 1 から 26 のいずれかに記載の製剤。

35. 一方のエナンチオマーが即時放出型であり、他方のエナンチオマーが叙放性放出型である、請求項 1 から 28 および 32 から 34 のいずれかに記載の製剤。

36. 別々の部分にキラルな薬物の(+) -エナンチオマーと(−) -エナンチオマーを含む単位製剤である、請求項 1 から 14 のいずれかに記載の製剤。

37. 薬物が通常ラセミ体で投与され、有害な副作用を受けやすいか、又は副作用にさらされることにより危険にさらされるであろう患者に薬物が投与される疾患を治療するための、請求項 1 から 36 のいずれかに定義される製剤の製造におけるキラルな薬物の実質上単一のエナンチオマーの使用。