

【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8日(2005.12.8)

【公表番号】特表2005-506987(P2005-506987A)

【公表日】平成17年3月10日(2005.3.10)

【年通号数】公開・登録公報2005-010

【出願番号】特願2003-530331(P2003-530331)

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 31/421

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/32

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 29/02

【F I】

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 31/421

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/32

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 29/02

【手続補正書】

【提出日】平成16年5月17日(2004.5.17)

【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】

下記成分：

(a) 治療有効量の低水溶性の感覚的に許容されない薬剤、

(b) 薬学的に許容される溶解遅延剤少なくとも1種、および、

(c) 急速口内溶解を示す薬学的に許容される賦形剤少なくとも1種、

を含有し、組成物は感覚的に許容される口内速溶性組成物。

【請求項2】

薬学的に許容される溶解遅延剤少なくとも1種が重合体である請求項1記載の組成物。

【請求項3】

重合体が0.5～1.5重量%の総量で存在する請求項2記載の組成物。

【請求項4】

重合体が1.0～5重量%の総量で存在する請求項2記載の組成物。

【請求項5】

薬学的に許容される溶解遅延剤少なくとも1種がエチルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリビニルピロリドン、Eudragit^(R) EPOおよび同等の

ポリメタクリレート製品、ヒドロキシプロピルエチルセルロースおよびヒドロキシプロピルセルロースよりなる群から選択される請求項1記載の組成物。

【請求項6】

薬学的に許容される溶解遅延剤少なくとも1種がEudragit^(R) EPOまたは同等のポリメタクリレート製品である請求項1記載の組成物。

【請求項7】

急速口内溶解を示す薬学的に許容される賦形剤少なくとも1種が炭水化物である請求項1記載の組成物。

【請求項8】

急速口内溶解を示す薬学的に許容される賦形剤少なくとも1種が糖類である請求項1記載の組成物。

【請求項9】

急速口内溶解を示す薬学的に許容される賦形剤少なくとも1種がマルトース、マルチトール、ソルビトール、乳糖およびマンニトールよりなる群から選択される請求項1記載の組成物。

【請求項10】

急速口内溶解を示す薬学的に許容される賦形剤少なくとも1種が高成形性の糖類および低成形性の糖類を含有する請求項1記載の組成物。

【請求項11】

高成形性の糖類の低成形性の糖類に対する重量比が低成形性の糖類100部に対して高成形性の糖類2~20部である請求項10記載の組成物。

【請求項12】

高成形性の糖類の低成形性の糖類に対する重量比が低成形性の糖類100部に対して高成形性の糖類5~7.5部である請求項10記載の組成物。

【請求項13】

急速口内溶解を示す薬学的に許容される賦形剤少なくとも1種が10~90重量%の総量で存在する請求項1記載の組成物。

【請求項14】

急速口内溶解を示す薬学的に許容される賦形剤少なくとも1種が10~75重量%の総量で存在する請求項1記載の組成物。

【請求項15】

薬剤が、その吸収が溶解速度制限性の薬剤である請求項1記載の組成物。

【請求項16】

1~6kpの硬度を有する請求項1記載の組成物。

【請求項17】

米国薬局方24インビトロ崩壊試験701番に付した場合に300秒未満の崩壊時間を示す請求項1記載の組成物。

【請求項18】

米国薬局方24インビトロ崩壊試験701番に付した場合に100秒未満の崩壊時間を示す請求項1記載の組成物。

【請求項19】

ヒト患者の口腔内に入れて60秒以内に崩壊する請求項1記載の組成物。

【請求項20】

ヒト患者の口腔内に入れて15秒以内に崩壊する請求項1記載の組成物。

【請求項21】

薬剤が組成物の1~75重量%の量で存在する請求項1記載の組成物。

【請求項22】

下記工程：

粒子状形態の低水溶性の感覚的に許容されない薬剤を準備する工程；

薬学的に許容される溶解遅延剤少なくとも1種を薬剤に添加して薬剤複合物を形成する

工程；

薬剤複合物を急速口内溶解を示す薬学的に許容される賦形剤少なくとも1種と混合し、該混合工程により錠剤化用ブレンド物を形成する工程；

薬剤、薬剤複合物または錠剤化用ブレンド物を顆粒化する工程；および、

錠剤化用ブレンド物を圧縮して速溶性組成物を形成する工程；

を包含し、該顆粒化工程は溶解遅延剤の添加工程の前、同時、および／または後に行う口腔内崩壊速溶性錠剤組成物の調製方法。

【請求項23】

顆粒化工程が湿式顆粒化を含む請求項22記載の方法。

【請求項24】

湿式顆粒化工程の間および／または後に薬剤複合物を乾燥またはブレンド物を錠剤化する工程を更に含む請求項23記載の方法。

【請求項25】

乾燥工程がオーブン中におけるトレー乾燥を含む請求項24記載の方法。

【請求項26】

乾燥工程が流動床乾燥を含む請求項24記載の方法。

【請求項27】

湿式顆粒化工程が高剪断湿式顆粒化を含む請求項23記載の方法。

【請求項28】

湿式顆粒化工程が流動床顆粒化を含む請求項23記載の方法。

【請求項29】

顆粒化工程が乾式顆粒化を含む請求項22記載の方法。

【請求項30】

乾式顆粒化工程がローラー圧縮を含む請求項29記載の方法。

【請求項31】

薬剤が、その吸収が溶解速度制限性の薬剤である請求項22記載の方法。

【請求項32】

請求項22の方法に従って調製された口内速溶性組成物。