

【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0.5～15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 E u d r a g i t ^(R) E P O 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 ~ 6 k p 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 2 3】

顆粒化工程が湿式顆粒化を含む請求項 2 2 記載の方法。

【請求項 2 4】

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 2 3 記載の方法。

【請求項 2 5】

乾燥工程がオープン中におけるトレー乾燥を含む請求項 2 4 記載の方法。

【請求項 2 6】

乾燥工程が流動床乾燥を含む請求項 2 4 記載の方法。

【請求項 2 7】

湿式顆粒化工程が高剪断湿式顆粒化を含む請求項 2 3 記載の方法。

【請求項 2 8】

湿式顆粒化工程が流動床顆粒化を含む請求項 2 3 記載の方法。

【請求項 2 9】

顆粒化工程が乾式顆粒化を含む請求項 2 2 記載の方法。

【請求項 3 0】

乾式顆粒化工程がローラー圧縮を含む請求項 2 9 記載の方法。

【請求項 3 1】

薬剤が、その吸収が溶解速度制限性の薬剤である請求項 2 2 記載の方法。

【請求項 3 2】

請求項 2 2 の方法に従って調製された口内速溶性組成物。