

【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26年10月23日 (2014.10.23)

【公開番号】特開2014-167026(P2014-167026A)

【公開日】平成26年9月11日 (2014.9.11)

【年通号数】公開・登録公報2014-049

【出願番号】特願2014-121055(P2014-121055)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/554 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/554

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/32

A 6 1 P 25/18

A 6 1 K 9/20

【手続補正書】

【提出日】平成26年8月5日 (2014.8.5)

【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】

約 3 c p s ~ 約 1 0 0 0 0 0 c p s の粘度 (2 0 で 2 % 水溶液の粘度) を有するゲル化剤および 1 1 - [4 - [2 - (2 - ヒドロキシエトキシ) エチル] - 1 - ビペラジニル] ジベンゾ - [b , f] [1 , 4] チアゼピンまたはその製剤上認容性の塩 3 5 ~ 6 5 質量 % を、1 種以上の製剤上認容性の賦形剤と共に含有する徐放性製剤。

【請求項 2】

ゲル化剤がヒドロキシプロピルメチルセルロースである、請求項 1 記載の徐放性製剤。

【請求項 3】

(a) 粘度約 4 0 ~ 6 0 c p s 、メトキシ含有量約 2 8 ~ 3 0 質量 % およびヒドロキシプロポキシ含有量約 7 ~ 9 質量 % 未満を有するヒドロキシプロピルメチルセルロース、(b) 粘度約 3 5 0 0 ~ 5 6 0 0 c p s 、メトキシ含有量約 2 8 ~ 3 0 質量 % およびヒドロキシプロポキシ含有量約 7 ~ 1 2 質量 % を有するヒドロキシプロピルメチルセルロース、(c) 粘度約 8 0 ~ 1 2 0 c p s 、メトキシ含有量約 1 9 ~ 2 4 質量 % およびヒドロキシプロポキシ含有量約 7 ~ 9 質量 % 未満を有するヒドロキシプロピルメチルセルロース、ならびに (d) 粘度約 3 5 0 0 ~ 5 6 0 0 c p s 、メトキシ含有量約 1 9 ~ 2 4 質量 % およびヒドロキシプロポキシ含有量約 7 ~ 1 2 質量 % を有するヒドロキシプロピルメチルセルロースからなる群から選択されるヒドロキシプロピルメチルセルロースまたはその混合物

約 5 ～ 50 質量 % を含有するが、但し、製剤が前記の (d) のヒドロキシプロピルメチルセルロースを含有する場合、製剤中に存在するヒドロキシプロピルメチルセルロースの総量は 25 . 8 質量 % 以上でなければならない、請求項 1 または 2 記載の徐放性製剤。

【請求項 4】

(a) ～ (d) からなる群から選択されるヒドロキシプロピルメチルセルロースまたはその混合物約 5 ～ 40 質量 % を含有する、請求項 3 記載の徐放性製剤。

【請求項 5】

(a) ～ (d) からなる群から選択されるヒドロキシプロピルメチルセルロースまたはその混合物約 8 ～ 35 質量 % を含有する、請求項 4 記載の徐放性製剤。

【請求項 6】

(a) ～ (d) からなる群から選択されるヒドロキシプロピルメチルセルロースまたはその混合物約 10 ～ 30 質量 % を含有する、請求項 5 記載の徐放性製剤。

【請求項 7】

(a) ～ (d) からなる群から選択されるヒドロキシプロピルメチルセルロースまたはその混合物約 15 ～ 30 質量 % を含有する、請求項 6 記載の徐放性製剤。

【請求項 8】

1 種以上の製剤上認容性の賦形剤を、微結晶性セルロース、ラクトース、ステアリン酸マグネシウム、クエン酸ナトリウムおよびポビドンからなる群から選択する、請求項 1 から 7 までのいずれか 1 項記載の製剤。

【請求項 9】

1 種以上の製剤上認容性の賦形剤を、(a) 微結晶性セルロース約 4 ～ 20 質量 %、(b) ラクトース約 5 ～ 20 質量 %、(c) ステアリン酸マグネシウム約 1 ～ 3 質量 %、(d) クエン酸ナトリウム約 10 ～ 30 質量 % および (e) ポビドン約 1 ～ 15 質量 % からなる群から選択する、請求項 8 記載の製剤。

【請求項 10】

11 - [4 - [2 - (2 - ヒドロキシエトキシ) エチル] - 1 - ピペラジニル] ジベンゾ - [b , f] [1 , 4] チアゼピンがヘミフマレート塩の形である、請求項 1 から 9 までのいずれか 1 項記載の製剤。

【請求項 11】

1 種以上の製剤学上認容性の賦形剤のうちの 1 種類が pH 調整剤である、請求項 1 から 7 までのいずれか 1 項記載の製剤。

【請求項 12】

pH 調整剤がクエン酸ナトリウムである、請求項 11 記載の製剤。

【請求項 13】

精神病状態または機能亢進の治療のために使用する請求項 1 から 12 までのいずれか 1 項記載の徐放性製剤。

【請求項 14】

徐放性製剤の製造方法において、11 - [4 - [2 - (2 - ヒドロキシエトキシ) エチル] - 1 - ピペラジニル] ジベンゾ - [b , f] [1 , 4] チアゼピンまたはその製剤上認容性の塩、ゲル化剤および他の賦形剤を混合することを特徴とする、請求項 1 から 13 までのいずれか 1 項記載の徐放性製剤の製造方法。

【請求項 15】

徐放性製剤の製造方法において、

(a) 11 - [4 - [2 - (2 - ヒドロキシエトキシ) エチル] - 1 - ピペラジニル] ジベンゾ - [b , f] [1 , 4] チアゼピンまたはその製剤上認容性の塩、ゲル化剤および他の賦形剤の混合、

(b) 混合した成分の湿式の顆粒化、

(c) 該混合物の乾燥、

(d) 乾燥させた混合物のミル、

(e) 該混合物と滑沢剤とのブレンダー、

(f) ブレンドした混合物の圧縮によるタブレットへの成形、を含むことを特徴とする、請求項 1 から 1 3 までのいずれか 1 項記載の徐放性製剤の製造方法。