

【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3cps～約100000cpsの粘度(20で2%水溶液の粘度)を有するゲル化剤および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35～65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40～60cps、メトキシ含有量約28～30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3500～5600cps、メトキシ含有量約28～30質量%およびヒドロキシプロポキシ含有量約7～12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80～120cps、メトキシ含有量約19～24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3500～5600cps、メトキシ含有量約19～24質量%およびヒドロキシプロポキシ含有量約7～12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ド、

(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 13 までのいずれか 1 項記載の徐放性製剤の製造方法。