

【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23年1月27日(2011.1.27)

【公表番号】特表2009-513530(P2009-513530A)
 【公表日】平成21年4月2日(2009.4.2)
 【年通号数】公開・登録公報2009-013
 【出願番号】特願2006-518170(P2006-518170)
 【国際特許分類】

A 6 1 K 31/198 (2006.01)
 A 6 1 P 5/14 (2006.01)
 A 6 1 K 47/38 (2006.01)
 A 6 1 K 47/36 (2006.01)
 A 6 1 K 47/04 (2006.01)
 A 6 1 K 47/12 (2006.01)
 A 6 1 K 9/20 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/198
 A 6 1 P 5/14
 A 6 1 K 47/38
 A 6 1 K 47/36
 A 6 1 K 47/04
 A 6 1 K 47/12
 A 6 1 K 9/20

【誤訳訂正書】

【提出日】平成22年11月30日(2010.11.30)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

(a)有効量のレボチロキシナトリウム、(b)125 μ m未満の平均粒度を有し、
 処方_の総重量に基づいて60~85%w/wの量で存在する微結晶セルロースおよび(c)
)処方_の総重量に基づいて5~30%w/wの量で存在する__化でんぷんを含む、医薬処
 方。

【請求項2】

微結晶セルロースが100 μ m以下の平均粒度を有する、請求項1記載の医薬処方。

【請求項3】

微結晶セルロース：__化でんぷんの比が2:1~15:1の範囲である、請求項1また
 は請求項2記載の医薬処方。

【請求項4】

微結晶セルロースおよび__化でんぷんが、処方_の総重量に基づいて3~6%w/wの水
 を含む、前記請求項1~3いずれか1項記載の医薬処方。

【請求項5】

レボチロキシナトリウムが水和している、前記請求項1~4いずれか1項記載の医薬
 処方。

【請求項6】

レボチロキシナトリウムが五水和物である、請求項 5 記載の医薬処方。

【請求項 7】

さらに、1 種以上の流動促進剤 / 滑沢剤を含む、前記請求項 1 ~ 6 いずれか 1 項記載の医薬処方。

【請求項 8】

流動促進剤 / 滑沢剤が、コロイド状無水シリカ、タルクおよび / またはステアリン酸マグネシウムから選択される、請求項 7 記載の医薬処方。

【請求項 9】

医薬処方を 2.5 および相対湿度 60% で 12 ヶ月貯蔵した場合、効力の減少が 5% 未満である程度に安定な、請求項 1 ~ 8 いずれか 1 項記載の医薬処方。

【請求項 10】

単位剤形である、請求項 1 ~ 9 いずれか 1 項記載の医薬処方。

【請求項 11】

単位剤形が錠剤である、請求項 10 記載の医薬処方。

【請求項 12】

医薬治療で用いるための、請求項 1 ~ 11 いずれか 1 項記載の医薬処方。

【請求項 13】

哺乳動物における甲状腺ホルモン障害の治療において用いるための、請求項 1 ~ 11 いずれか 1 項記載の医薬処方。

【請求項 14】

哺乳動物における甲状腺ホルモン障害の治療用の医薬の製造における、請求項 1 ~ 11 いずれか 1 項記載の医薬処方の使用。

【請求項 15】

(a) レボチロキシナトリウムの粉末を調製し、(b) 粉末を医薬処方の残りの成分と混合し、(c) 圧搾することを含む、請求項 1 ~ 11 いずれか 1 項記載の医薬処方の製造方法。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0003

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0003】

本発明者らは、レボチロキシナトリウム、125 μm 未満の平均粒度を有する微結晶セルロースおよび__化でんぷんを含む医薬処方が、美的に許容され、患者に気に入られる、改善された安定性および崩壊特性を有する、固体剤形を与えることを見出した。したがって、本発明は、(a) 有効量のレボチロキシナトリウム、(b) 125 μm 未満の平均粒度を有し、処方の総重量に基づいて 60 ~ 85% w/w の量で存在する微結晶セルロースおよび(c) 処方の総重量に基づいて 5 ~ 30% w/w の量で存在する__化でんぷん、を含む医薬処方を提供する。本発明の医薬処方は、5 および相対湿度 60% で 12 ヶ月貯蔵した場合に、効力の減少が、5% 未満、好ましくは 4% 未満、より好ましくは 3% 未満である程度に安定であるように改善された安定性を有する。本発明の医薬処方は、下記する実施例の項に記載された崩壊試験で試験した場合に、6 分未満、好ましくは 5 分未満、より好ましくは 4 分未満の崩壊時間を有するように改善された崩壊特性を有する。

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0007

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0007】

「__化でんぷん」なる用語は、本明細書において用いられる場合、典型的には、約 5%

の遊離アミロース、15%の遊離アミロペクチンおよび80%の未修飾でんぷんを含有する、部分的に糊化したでんぷんを意味する。一部またはすべてのでんぷん粒を破壊するために、湿らせたでんぷんを機械的な圧力下に付すことにより製造される。得られた物質をすりつぶし、その含水量を、良好な流動特性および圧縮特性を有するように調節する。部分的に糊化したでんぷん、例えばStarch 1500 (Colorcon)の典型的な冷水溶解度は10~20%である。さらに、__化でんぷんは、European Pharmacopeia (2002)において定義されている(出典明示により本明細書に組み入れる)。好ましくは、__化でんぷんは、処方総重量に基づいて、5~30% w/w、より好ましくは10~30% w/w、最も好ましくは15~25% w/w存在する。

【誤訳訂正4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0008

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0008】

好ましくは、微結晶セルロース：__化でんぷんの比は、2：1~15：1であり、より好ましくは、2.5：1~8：1、最も好ましくは3：1~5：1である。

好ましくは、微結晶セルロースおよび__化でんぷんは水含有する。好ましくは、水は、処方総重量に基づいて3~6% w/w、より好ましくは約4.5% (例えば、4.5%~5.0%)を構成する。

【誤訳訂正5】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0016

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0016】

例えば、50 μgの錠剤は、0.0425~0.0575 mgのレボチロキシナトリウム、50~60 mgの微結晶セルロース、12~17 mgの__化でんぷん、2~3 mgのタルク、1~2 mgのコロイド状無水シリカおよび0.5~1 mgのステアリン酸マグネシウムを含みうる。100 μgの錠剤は、0.085~0.115 mgのレボチロキシナトリウム、100~120 mgの微結晶セルロース、24~34 mgの__化でんぷん、4~6 mgのタルク、2~4 mgのコロイド状無水シリカおよび1~2 mgのステアリン酸マグネシウムを含みうる。

【誤訳訂正6】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0025

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0025】

実施例

実施例1：レボチロキシナトリウム錠剤の調製

(a) 処方

【表 1】

| | [k g] |
|-----------------|-------|
| レボチロキシナトリウム五水和物 | 0.074 |
| 微結晶セルロース | 75.0 |
| α 化でんぷん | 20.0 |
| タルク | 3.0 |
| コロイド状二酸化ケイ素 | 2.0 |
| ステアリン酸マグネシウム | 1.0 |

【誤訳訂正 7】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0026

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0026】

製造方法

レボチロキシナトリウム錠剤を、下記工程を含む直接圧縮法により製造した：

- レボチロキシナトリウム粉末を、微結晶セルロースの一部と一緒に単純混合することにより調製すること；
- 残りの微結晶セルロースおよび__化でんぷんを、レボチロキシナトリウム粉末と混合し、活性基質の均一な内容物を得ること；
- タルク、二酸化ケイ素コロイド状およびステアリン酸マグネシウムを添加し、ついで、混合して、粉末混合物を調製すること；
- 少なくとも3 K pの破砕強度および3.5 ~ 10 K pの結果として生じた強度でレボチロキシナトリウム錠剤を圧縮すること。

【誤訳訂正 8】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0027

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0027】

(b) 処方

【表 2】

| | [kg] |
|-----------------|-------|
| レボチロキシナトリウム五水和物 | 0.074 |
| 微結晶セルロース | 75.0 |
| α 化でんぷん | 20.0 |
| タルク | 3.0 |
| コロイド状二酸化ケイ素 | 2.0 |
| ステアリン酸マグネシウム | 1.0 |

【誤訳訂正 9】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0028

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0028】

製造方法

実施例 1 (b) の製造方法は、残りの微結晶セルロースおよびコロイド状二酸化ケイ素の予め形成した混合物を、レボチロキシナトリウム粉末および__化でんぷんとブレンド

する前に形成しておく点で実施例 1 (a) とは異なる。