

【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29年4月20日(2017.4.20)

【公表番号】特表2016-527237(P2016-527237A)  
 【公表日】平成28年9月8日(2016.9.8)  
 【年通号数】公開・登録公報2016-054  
 【出願番号】特願2016-528268(P2016-528268)  
 【国際特許分類】

A 6 1 K 31/675 (2006.01)  
 A 6 1 P 1/08 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4402 (2006.01)  
 A 6 1 P 15/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)  
 A 6 1 K 9/20 (2006.01)  
 A 6 1 K 9/48 (2006.01)  
 A 6 1 K 9/08 (2006.01)  
 A 6 1 K 9/14 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4415 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/7084 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/525 (2006.01)

【F I】

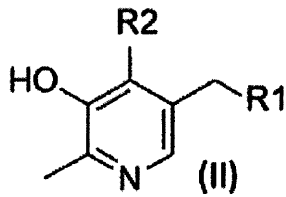
A 6 1 K 31/675  
 A 6 1 P 1/08  
 A 6 1 K 31/4402  
 A 6 1 P 15/00  
 A 6 1 P 43/00 1 2 1  
 A 6 1 K 9/20  
 A 6 1 K 9/48  
 A 6 1 K 9/08  
 A 6 1 K 9/14  
 A 6 1 K 31/4415  
 A 6 1 K 31/7084  
 A 6 1 K 31/525

【手続補正書】  
 【提出日】平成29年3月13日(2017.3.13)  
 【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】

経口用の医薬組成物であって、以下の活性成分：

- ( a ) ( i ) ドキシラミン及び ( i i ) その医薬的に許容される塩の1つまたは複数を  
 約5～約40mgと、  
 ( b ) ( i ) 式I Iのピリドキシシン化合物

## 【化 1】



(式中、

R 1 は、ヒドロキシル基またはホスフェート基であり、

R 2 は、 $\text{CH}_2\text{OH}$ 、 $\text{CHO}$ または $\text{CH}_2\text{NH}_2$ である)

( i i ) ( i ) の医薬的に許容されるエステル及び ( i i i ) ( i ) ~ ( i i ) のいずれかの医薬的に許容される塩の 1 つまたは複数を約 5 ~ 約 80 mg と、

( c ) ( I ) リボフラビン、( I I ) リボフラビン - 5 - リン酸、( I I I ) フラビンアデニンジヌクレオチド及び ( I V ) ( I ) ~ ( I I I ) のいずれかの医薬的に許容される塩の 1 つまたは複数を約 20 ~ 約 100 mg とを含む、組成物。

【請求項 2】

リボフラビンまたはその医薬的に許容される塩を含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

リボフラビン - 5 - リン酸またはその医薬的に許容される塩を含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 4】

ドキシラミン及び / またはその医薬的に許容される塩を約 5 ~ 約 30 mg 含む、請求項 1 ~ 3 のいずれ一項に記載の組成物。

【請求項 5】

ドキシラミン及び / またはその医薬的に許容される塩を約 20 mg 含む、請求項 4 に記載の組成物。

【請求項 6】

コハク酸ドキシラミンを含む、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 7】

前記 ( i ) ピリドキシン化合物、( i i ) その医薬的に許容されるエステル、及び / または ( i i i ) ( i ) ~ ( i i ) のいずれかの医薬的に許容される塩を約 5 ~ 約 30 mg 含む、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 8】

前記 ( i ) ピリドキシン化合物、( i i ) その医薬的に許容されるエステル、及び / または ( i i i ) ( i ) ~ ( i i ) のいずれかの医薬的に許容される塩を約 20 mg 含む、請求項 7 に記載の組成物。

【請求項 9】

塩酸ピリドキシンを含む、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 10】

( I ) リボフラビン、( I I ) リボフラビン - 5 - リン酸、( I I I ) フラビンアデニンジヌクレオチド及び / または ( I V ) ( I ) ~ ( I I I ) のいずれかの医薬的に許容される塩を約 20 ~ 約 60 mg 含む、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 11】

( I ) リボフラビン、( I I ) リボフラビン - 5 - リン酸、( I I I ) フラビンアデニンジヌクレオチド及び / または ( I V ) ( I ) ~ ( I I I ) のいずれかの医薬的に許容される塩を約 20 ~ 約 50 mg 含む、請求項 10 に記載の組成物。

## 【請求項 1 2】

( I )リボフラビン、( I I )リボフラビン - 5 - リン酸、( I I I )フラビンアデニンジヌクレオチド及び / または ( I V ) ( I ) ~ ( I I I ) のいずれかの医薬的に許容される塩を約 4 0 m g 含む、請求項 1 1 に記載の組成物。

## 【請求項 1 3】

( i ) 活性成分 ( a )、( b ) 及び ( c ) の少なくとも 1 つを含む遅放性組成物を含むコア；( i i ) コアを取り囲む腸溶性コーティング；並びに ( i i i ) 活性成分 ( a )、( b ) 及び ( c ) の少なくとも 1 つを含む即放性組成物を含む 1 つまたは複数のコートを含む二重放出製剤である、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか一項に記載の組成物。

## 【請求項 1 4】

前記即放性組成物が、活性成分 ( a ) と ( b ) を含む、請求項 1 3 に記載の組成物。

## 【請求項 1 5】

前記遅放性組成物が、( a )、( b ) 及び ( c ) を含む、請求項 1 3 または 1 4 に記載の組成物。

## 【請求項 1 6】

少なくとも 1 つの医薬的に許容される賦形剤をさらに含む、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか一項に記載の組成物。

## 【請求項 1 7】

錠剤または丸薬の形態である、請求項 1 ~ 1 6 のいずれか一項に記載の組成物。

## 【請求項 1 8】

請求項 1 ~ 1 7 のいずれか一項に記載の組成物を含む、ヒト被検体における悪心及び嘔吐の症状を軽減するための医薬。

## 【請求項 1 9】

請求項 1 ~ 1 7 のいずれか一項に記載の組成物を含む、ヒト妊娠時の悪心及び嘔吐 ( N V P ) の症状を軽減するための医薬。

## 【請求項 2 0】

( I )リボフラビン、( I I )リボフラビン - 5 - リン酸、( I I I )フラビンアデニンジヌクレオチド及び / または ( I V ) ( I ) ~ ( I I I ) のいずれかの医薬的に許容される塩から選択されるリボフラビン化合物を 2 0 m g ~ 1 0 0 m g の量で含む、ピリドキシンまたはその医薬的に許容される塩で処置された被検体の血漿中のピリドキサル 5 - リン酸 ( P L P ) のバイオアベイラビリティを向上するための医薬。

## 【請求項 2 1】

前記リボフラビン化合物が、3 0 m g ~ 5 0 m g の量で含まれる、請求項 2 0 に記載の医薬。

## 【請求項 2 2】

前記被検体が、塩酸ピリドキシンで処置されている、請求項 2 0 または 2 1 に記載の医薬。

## 【請求項 2 3】

前記ピリドキシンまたはその医薬的に許容される塩と、前記リボフラビン化合物またはその医薬的に許容される塩とが、同じ医薬中に存在する、請求項 2 0 ~ 2 2 のいずれか一項に記載の医薬。

## 【請求項 2 4】

更に、コハク酸ドキシラミンを含む、請求項 2 3 に記載の医薬。

## 【請求項 2 5】

前記コハク酸ドキシラミンが、医薬中に、1 0 m g ~ 3 0 m g の量で存在する、請求項 2 4 に記載の医薬。

## 【請求項 2 6】

錠剤または丸薬の形態である、請求項 2 3 ~ 2 5 のいずれか一項に記載の医薬。

## 【請求項 2 7】

前記被検体が、ヒト妊娠時の悪心及び嘔吐 ( N V P ) の症状を有する妊娠した女性であ

る、請求項 20 ~ 26 のいずれか一項に記載の医薬。