

【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24年8月30日(2012.8.30)

【公表番号】特表2011-528666(P2011-528666A)

【公表日】平成23年11月24日(2011.11.24)

【年通号数】公開・登録公報2011-047

【出願番号】特願2011-518947(P2011-518947)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/27 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/04 (2006.01)

A 6 1 P 21/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 K 9/32 (2006.01)

A 6 1 K 9/36 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/27

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/04

A 6 1 P 21/02

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 25/08

A 6 1 K 9/32

A 6 1 K 9/36

【手続補正書】

【提出日】平成24年7月13日(2012.7.13)

【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】

30～70%のN-(2-アミノ-4-(フルオロベンジルアミノ)-フェニル)カルバミン酸エチルエステル(レチガビン)又は医薬として許容し得るその塩、溶媒和物、若しくは水和物；  
5～30%のヒドロキシプロピルメチルセルロース(HPMC)を含む薬物送達マトリックス；  
1.0～10%のアニオン性界面活性剤及び

腸溶性ポリマーを含む放出調節医薬製剤であって、

被験者への投与後に、前記レチガビンの80%のインビトロ放出に要する時間より4～20時間長く、前記レチガビンの持続した血漿濃度を生み出す、前記放出調節医薬製剤。

【請求項2】

前記アニオン性界面活性剤がドデシル硫酸ナトリウム又はラウリル硫酸ナトリウムである、請求項 1 記載の製剤。

【請求項 3】

前記腸溶性ポリマーが、ポリビニルアセタートフタレート、ヒドロキシプロピルメチルセルロースアセタートスクシナート (HPMC-AS)、及びメチルメタクリレートと、メタクリル酸と、メチルアクリレートとの2種以上のコポリマーから選択される、請求項 1 記載の製剤。

【請求項 4】

5～40%の結合剤をさらに含む、請求項 1 記載の製剤。

【請求項 5】

前記結合剤が微結晶性セルロースを含む、請求項 4 記載の製剤。

【請求項 6】

前記結合剤がヒドロキシプロピルメチルセルロースをさらに含む、請求項 5 記載の製剤。

【請求項 7】

前記結合剤がコポリドンをさらに含む、請求項 5 記載の製剤。

【請求項 8】

0.5～10%の崩壊剤をさらに含む、請求項 1 記載の製剤。

【請求項 9】

前記崩壊剤がクロスポリドンを含む、請求項 8 記載の製剤。

【請求項 10】

前記崩壊剤がクロスカルメロースナトリウムをさらに含む、請求項 9 記載の製剤。

【請求項 11】

滑沢剤をさらに含む、請求項 1 記載の製剤。

【請求項 12】

前記滑沢剤がステアリン酸マグネシウムを含む、請求項 11 記載の製剤。

【請求項 13】

流動促進剤をさらに含む、請求項 1 記載の製剤。

【請求項 14】

前記流動促進剤が二酸化ケイ素を含む、請求項 13 記載の製剤。

【請求項 15】

レチガビンが、5mgから500mgの範囲の服用量で投与される、請求項 1 記載の製剤。

【請求項 16】

レチガビンが、100mgから500mgの範囲の服用量で投与される、請求項 15 記載の製剤。

【請求項 17】

30～70%のN-(2-アミノ-4-(フルオロベンジルアミノ)-フェニル)カルバミン酸エチルエステル(レチガビン)又は医薬として許容し得るその塩、溶媒和物、若しくは水和物；5～30%の薬物送達マトリックス、及び胃環境中での放出を妨げるための薬剤を含む製剤であって、血漿濃度対時間のプロファイルが、4時間から36時間継続する長期間にわたり実質的に平坦であり、かつ、前記送達マトリックスが、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ポリエチレンオキシド、及びポリビニルアセタートとポリビニルピロリドンとのコポリマーから選択される、前記製剤。

【請求項 18】

200mg服用量に対し、絶食条件下で、100ng/mLから300ng/mLの $C_{max}$ 、又はその90%信頼区間の生成をさらに含む、請求項 17 記載の製剤。

【請求項 19】

400mg服用量に対し、4000から10,000ng\*hr/Lである濃度-時間曲線下の面積( $AUC_{0-inf}$ )、又はその90%信頼区間の生成をさらに含む、請求項 17 記載の製剤。

【請求項 20】

胃環境中での放出を妨げる薬剤が腸溶性コーティングを含む、請求項 17 記載の製剤。

**【請求項 2 1】**

神経系の過興奮により特徴づけられる疾患を治療するための、請求項 1 又は 1 7 に記載の医薬製剤。

**【請求項 2 2】**

神経系の過興奮により特徴づけられる前記疾患が発作性疾患を含む、請求項 2 1 記載の医薬製剤。

**【請求項 2 3】**

前記医薬製剤が抗発作作用、筋弛緩作用、解熱作用、末梢鎮痛作用、又は抗痙攣作用を生み出す、請求項 2 1 記載の医薬製剤。

**【請求項 2 4】**

神経系の過興奮により特徴づけられる前記疾患が、電位開口型カリウムチャネルの活性化により特徴づけられる疾患をさらに含む、請求項 2 1 記載の医薬製剤。

**【請求項 2 5】**

前記医薬製剤が、KCNQ2/3チャネルのチャネル開口確率の増大又はニューロンM電流の増加をもたらす、請求項 2 1 記載の医薬製剤。