

【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30年3月8日 (2018.3.8)

【公開番号】特開2018-12711(P2018-12711A)

【公開日】平成30年1月25日 (2018.1.25)

【年通号数】公開・登録公報2018-003

【出願番号】特願2017-159995(P2017-159995)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/24 (2006.01)

A 6 1 K 47/42 (2017.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 45/08 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/00 1 0 1

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/24

A 6 1 K 47/42

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 45/08

【手続補正書】

【提出日】平成29年12月8日 (2017.12.8)

【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】

複数の粒子を含む即時放出固体経口剤形であって、

それぞれの粒子は、

( i ) 不活性添加剤および活性薬剤を含むコア ; および

( i i ) 前記コア上に層状化された酸性 p H に感受性である物質

を含み、

前記不活性添加剤が前記活性薬剤で層状化されており、

前記複数の粒子が、ゲル化剤を含有するマトリックスに分散され、

前記剤形は、500mlの0.1N HCl中37で50rpmでのUSP装置2（パドル）中インビトロ溶解によって測定して、前記活性薬剤の少なくとも70%を45分以内に放出する、即時放出固体経口剤形。

【請求項2】

前記マトリックスが、崩壊剤または充填剤の少なくとも一つを含む、請求項1に記載の即時放出固体経口剤形。

【請求項3】

酸性pHに感受性な前記物質が、ポリマーを含有する、請求項1に記載の即時放出固体経口剤形。

【請求項4】

前記ポリマーが、1～5のpHで可溶性である、請求項1に記載の即時放出固体経口剤形。

【請求項5】

前記ポリマーが、6～8.5のpHで不溶性である、または

前記ポリマーが、1～5のpH範囲よりも6～8.5のpH範囲で可溶性が低い、請求項3または4に記載の即時放出固体経口剤形。

【請求項6】

前記ポリマーが、ポリアクリレート、多糖、イオン交換樹脂、またはそれらの混合物を含有する、請求項3に記載の即時放出固体経口剤形。

【請求項7】

前記ポリマーが、メチルメタクリレートおよびジエチルアミノエチルメタクリレートを含むコポリマー、および、メチルメタクリレート、ブチルメタクリレートおよびジメチルアミノエチルメタクリレートを含むコポリマーからなる群より選択されるポリアクリレートを含む、請求項6に記載の即時放出固体経口剤形。

【請求項8】

前記ポリマーが、キトサンを含む多糖を含有する、請求項6に記載の即時放出固体経口剤形。

【請求項9】

前記ポリマーが、ポラクリレックス樹脂、ポラクリン塩、ポリスチレンスルホン酸ナトリウム、コレステラミン樹脂、およびそれらの混合物からなる群よりされるイオン交換樹脂を含有する、請求項6に記載の即時放出固体経口剤形。

【請求項10】

前記ゲル化剤が、糖、糖由来アルコール、デンプン、デンプン誘導体、セルロース誘導体、アタパルサイト、ベントナイト、デキストリン、アルギン酸塩、カラギーナン、ガム、ベクチン、ゼラチン、カオリン、レシチン、ケイ酸アルミニウムマグネシウム、カルボマー、カルボポール、ポリビニルピロリドン、ポリエチレングリコール、ポリエチレンオキシド、ポリビニルアルコール、二酸化ケイ素、カードラン、ファーセララン、卵白粉末、ラクトアルブミン、大豆タンパク質、キトサン、界面活性剤、乳化剤、およびそれらの混合物からなる群から選択される、または

前記ゲル化剤が、アルファ化デンプン、ヒドロキシエチルセルロース、グアーガム、キサンタンガム、アルギン酸塩、カラギーナン、およびそれらの混合物からなる群から選択される、請求項1に記載の即時放出固体経口剤形。

【請求項11】

0.5～10mlの蒸留水と混合された前記剤形の粘度が、非経口もしくは経鼻経路で投与される場合、前記活性薬剤が全身的に吸収されるのを妨げるか、または前記活性薬剤が全身的に吸収される能力を低減させる、または 破碎し、0.5～10mlの蒸留水と混合後の前記固体経口剤形の粘度が、非経口もしくは経鼻経路で投与される場合、前記活

性薬剤が全身的に吸収されるのを妨げるか、または前記活性薬剤が全身的に吸収される能力を低減させる、または

0.5 ~ 10 ml の蒸留水と混合後の粘度が、10 cP ~ 100 cP である、または 25 cP ~ 75 cP である、請求項 1 に記載の即時放出固体経口剤形。

【請求項 12】

前記崩壊剤が、架橋カルボキシメチルセルロースナトリウム、デンプン、デンプングリコール酸ナトリウム、架橋ポリビニルピロリドン、およびそれらの混合物からなる群から選択される、または

前記充填剤が、スクロース、デキストロース、ラクトース、フルクトース、マンニトール、セルロース誘導体、およびそれらの混合物からなる群から選択される糖類である、または

前記充填剤が、ラクトースまたは微結晶セルロースである、請求項 2 に記載の即時放出固体経口剤形。

【請求項 13】

ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリビニルアルコール、ポビドン、およびそれらの混合物からなる群から選択されるパリヤ層を含む、請求項 1 に記載の即時放出固体経口剤形。

【請求項 14】

前記複数の粒子が、治療有効量の前記活性薬剤を含む、請求項 1 に記載の即時放出固体経口剤形。

【請求項 15】

前記活性薬剤が、オピオイドアゴニスト、トランキライザ、CNS 抑制剤、CNS 刺激剤、催眠鎮静剤、およびそれらの混合物からなる群から選択される、請求項 1 に記載の即時放出固体経口剤形。

【請求項 16】

前記活性薬剤が、コデイン、モルヒネ、オキシコドン、オキシモルホン、ヒドロコドン、ヒドロモルホン、それらの薬学的に許容される塩、およびそれらの混合物からなる群から選択されるオピオイドアゴニストを含む、請求項 1 に記載の即時放出固体経口剤形。

【請求項 17】

吐剤、アンタゴニスト、苦味剤、刺激作用物質、およびそれらの混合物からなる群から選択される嫌忌剤を更に含む、請求項 1 から 16 のいずれかに記載の即時放出固体経口剤形。

【請求項 18】

前記嫌忌剤が、複数の粒子またはマトリックスの少なくとも一つの中に封じ込められている、請求項 17 に記載の即時放出固体経口剤形。

【請求項 19】

前記嫌忌剤が、トコン、メチルセフェリン、セフェリン、塩酸エメチン、サイコトリン、O-メチルサイコトリン、エメタミン、イペカミン、ヒドロイペカミン、インカクン酸、およびそれらの混合物からなる群から選択される吐剤を含有する、または

前記嫌忌剤が、ナルトレキソン、ナロキソン、ナルメフェン、シクラザシン、レバロルファン、それらの薬学的に許容される塩、およびそれらの混合物からなる群から選択されるアンタゴニストを含有する、または

前記嫌忌剤が、香味油、スペアミント油、ペパーミント油、ユーカリ油、ニクズク油、オールスパイス、メース、苦扁桃油、メントール、香味芳香剤、含油樹脂、植物抽出物、レモン抽出物、オレンジ抽出物、ライム抽出物、グレープフルーツ抽出物、葉抽出物、花抽出物、果実抽出物、スクロース誘導体、クロロスクロース誘導体、硫酸キニーネ、安息香酸デナトニウム、およびそれらの混合物からなる群から選択される苦味剤を含有する、または

前記嫌忌剤が安息香酸デナトニウムを含有する、または

前記嫌忌剤が、界面活性剤、ポロキサマー、ソルビタンモノエステル、モノオレイン酸

グリセリル、ラウリル硫酸ナトリウム、カプサイシン、カプサイシン類似体、レシニフェラトキシン、チニアトキシン、ヘプタノイルイソブチルアミド、ヘプタノイルグアイアシルアミド、アンイソブチルアミド、グアイアシルアミド、ジヒドロカプサイシン、ホモバニリルオクチルエステル、ノナノイルバニリルアミド、およびそれらの混合物からなる群から選択される刺激作用物質を含有する、請求項 17 または 18 に記載の即時放出固体経口剤形。

【請求項 20】

前記剤形が、500 ml の 0.1 N HCl 中 37 で 50 rpm での USP 装置 2 (パドル) 中インビトロ溶解によって測定して、前記活性薬剤の少なくとも 85 % を 45 分以内に放出する、または

前記剤形が、500 ml の 0.1 N HCl 中 37 で 50 rpm での USP 装置 2 (パドル) 中インビトロ溶解によって測定して、前記活性薬剤の少なくとも 90 % を 45 分以内に放出する、または

前記剤形が、500 ml の 0.1 N HCl 中 37 で 50 rpm での USP 装置 2 (パドル) 中インビトロ溶解によって測定して、前記活性薬剤の少なくとも 85 % を 60 分以内に放出する、または

前記剤形が、500 ml の 0.1 N HCl 中 37 で 50 rpm での USP 装置 2 (パドル) 中インビトロ溶解によって測定して、活性薬剤の少なくとも 90 % を 60 分以内に放出する、または

前記剤形が、500 ml の 0.1 N HCl 中 37 で 50 rpm での USP 装置 2 (パドル) 中インビトロ溶解によって測定して、前記活性薬剤の少なくとも 95 % を 60 分以内に放出する、請求項 1 に記載の即時放出固体経口剤形。

【請求項 21】

圧縮錠剤の形態の、または薬学的に許容されるカプセル中に封じ込められた、請求項 1 に記載の即時放出固体経口剤形。

【請求項 22】

(i) 複数の粒子を調製する工程であって、それぞれの粒子は、不活性添加剤および活性薬剤を含むコア、および前記コア上に層状化された酸性 pH に感受性である物質を含む工程；ならびに

(ii) 前記複数の粒子をゲル化剤を含むマトリックス中に分散させる工程を含む、請求項 1 から 21 のいずれかに記載の即時放出固体経口剤形を調製する方法であって、

前記不活性添加剤が前記活性薬剤で層状化されており、

前記剤形は、500 ml の 0.1 N HCl 中 37 で 50 rpm での USP 装置 2 (パドル) 中インビトロ溶解によって測定して、前記活性薬剤の少なくとも 70 % を 45 分以内に放出する、方法。