

【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】令和4年1月6日(2022.1.6)

【公表番号】特表2021-506752(P2021-506752A)

【公表日】令和3年2月22日(2021.2.22)

【年通号数】公開・登録公報2021-009

【出願番号】特願2020-529210(P2020-529210)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/19 (2006.01)

A 6 1 K 9/50 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/44 (2017.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/04 (2006.01)

A 6 1 K 47/22 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/46 (2006.01)

A 6 1 P 25/26 (2006.01)

A 6 1 K 9/58 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/19

A 6 1 K 9/50

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/44

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/04

A 6 1 K 47/22

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/46

A 6 1 P 25/26

A 6 1 K 9/58

【手続補正書】

【提出日】令和3年11月29日(2021.11.29)

【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】

パッケージ内に医薬組成物を含むパッケージされた医薬組成物であって、医薬組成物は：

- a. ガンマ-ヒドロキシブチラートまたはその薬学的に許容される塩を含む即時放出成分；および
- b. ガンマ-ヒドロキシブチラートまたはその薬学的に許容される塩を含む修飾放出成分

；

を含み、

パッケージは、29%～54%相対湿度を有する内部容積を有し、および医薬組成物は、経時的に安定な溶解プロフィールを有する、医薬組成物。

【請求項 2】

パッケージの相対湿度は、40℃および75%の相対湿度にて貯蔵されたときに少なくとも2月の期間の間29%～54%である、請求項1のパッケージされた医薬組成物。

【請求項 3】

パッケージの相対湿度は、40℃および75%の相対湿度にて貯蔵されたときに1週にて29%を上回り、および2月にて54%未満である、請求項1または2のパッケージされた医薬組成物。

【請求項 4】

パッケージの相対湿度は、40℃および75%の相対湿度にて貯蔵されたときに1週にて29%を上回り且つ44%未満、および2月にて54%未満である、請求項1または2のパッケージされた医薬組成物。

【請求項 5】

パッケージの相対湿度は、40℃および75%の相対湿度にて貯蔵されたときに1週後に35%～39%および2月後に39%～48%である、請求項1または2のパッケージされた医薬組成物。

【請求項 6】

40℃および75%の相対湿度にて2月貯蔵されたときに、医薬組成物における0.4%を上回るガンマ-ヒドロキシブチラートがガンマ-ブチロラクトン（GBL）に変換されない、請求項1～5のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物。

【請求項 7】

パッケージは、USP 38 <671>にしたがって測定したときに7mg/日/リットル未満の水蒸気透過速度を有する、請求項1～6のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物。

【請求項 8】

2月の40℃/75%の相対湿度貯蔵期間後に、医薬組成物は、貯蔵期間の開始時の遅延時間とは70分未満異なる遅延時間を示し、遅延時間は、37℃の温度および75rpmのパドル速度にて900mLの0.1N塩酸においてUSP 38 <711>にしたがって溶解装置2における試験から決定される、請求項1～7のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物

【請求項 9】

2月の40℃/75%の相対湿度貯蔵期間後に、医薬組成物は、37℃の温度および75rpmのパドル速度にて900mLの0.1N塩酸においてUSP 38 <711>にしたがって溶解装置2において少なくとも4回の連続した1時間ごとの時点にて試験したときに、貯蔵期間前のガンマ-ヒドロキシブチラートの溶解とは10%未満まで異なるガンマ-ヒドロキシブチラートの溶解を有する、請求項1～8のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物。

【請求項 10】

修飾放出成分は、ガンマ-ヒドロキシブチラートまたはその薬学的に許容される塩を含むコア、並びに疎水性化合物およびメタクリル酸共重合体の混合物を含むコーティングを含む、請求項1～9のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物。

【請求項 11】

疎水性化合物は、トリスチアリン酸グリセリンまたは水素付加した植物油であり、およびメタクリル酸共重合体の混合物は、メタアクリル酸およびアクリル酸エチル共重合体NFおよびメタアクリル酸およびメタクリル酸メチル共重合体（1：2）NFを含む。請求項10のパッケージされた医薬組成物。

【請求項 12】

コーティングは、40～70重量部の疎水性化合物および30～60重量部のメタクリル酸共重合体の混合物を含む、請求項10または11のパッケージされた医薬組成物。

【請求項 13】

コーティングは、修飾放出成分の重量の10%～50%である、請求項10～12のいずれか1項

のパッケージされた医薬組成物。

【請求項 14】

疎水性化合物は、40℃以上の融点を有し、およびメタクリル酸共重合体の混合物は、5.6を上回るpHトリガーを有する、請求項10～13のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物。

【請求項 15】

修飾放出成分は、コアとコーティングとの間にバリアコートがない、請求項10～15のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物。

【請求項 16】

修飾放出成分は、200～800マイクロメートルの平均直径を有する粒子を含む、請求項1～15のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物。

【請求項 17】

医薬組成物は、酸性化剤および懸濁剤または増粘剤をさらに含む、請求項1～16のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物。

【請求項 18】

酸性化剤は、リンゴ酸、クエン酸、酒石酸、アジピン酸、ホウ酸、マレイン酸、リン酸、アスコルビン酸、オレイン酸、カプリン酸、カプリル酸、安息香酸またはその混合物から選択され；および懸濁剤または増粘剤は、キサンタンガム、中間粘性カルボキシメチルセルロースナトリウム、微結晶性セルロースおよびカルボキシメチルセルロースナトリウムの混合物、微結晶性セルロースおよびグアーガムの混合物、中間粘性ヒドロキシエチルセルロース、寒天、アルギン酸ナトリウム、アルギン酸ナトリウムおよびアルギン酸カルシウムの混合物、ゲランゴム、カラギナンガム等級イオタ、カップまたはラムダ、中間粘性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から選択される、請求項17のパッケージされた医薬組成物。

【請求項 19】

酸性化剤は、リンゴ酸または酒石酸であり、および1.2%～15重量%の量で存在し；および懸濁剤または増粘剤は、キサンタンガム、カラギナンガムおよびヒドロキシエチルセルロースの混合物またはキサンタンガムおよびカラギナンガムの混合物であり、および1%～15重量%の量で存在する。請求項17または18のパッケージされた医薬組成物

【請求項 20】

ガンマ-ヒドロキシブチラートは、即時放出および修飾放出成分において10/90～65/35の重量比で存在する、請求項1～19のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物。

【請求項 21】

パッケージは、0.5グラム～12.0グラムのガンマ-ヒドロキシブチラートのナトリウム塩を含む、請求項1～20のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物。

【請求項 22】

パッケージは、少なくとも6マイクロメートルのアルミ箔厚を有するアルミ箔ポーチまたはサッシュである、請求項1～21のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物。

【請求項 23】

ナルコレプシー1型または2型を治療する方法において使用するための、請求項1～22のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物であって、前記方法はパッケージを開けること、医薬組成物を液体と混合して混合物を形成すること、およびその必要がある個体に混合物を経口投与することを含むものである、パッケージされた医薬組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0208

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0208】

本出願の全体にわたって、種々の刊行物が参照される。これらの刊行物の開示は、より完全に本発明が属する技術水準を記述するために、これらの全体において、この出願により、参照により本明細書に援用される。種々の修飾およびバリエーションが本発明の範囲または精神を逸脱しない範囲で本発明に行うことができることは、当業者に明らかであろう。本発明のその他の態様が、明細書の考慮および本明細書に開示した本発明の実施により当業者には明らかであろう。明細書および実施例は、例示のみとみなされることが意図され、本発明の真の範囲および趣旨は、以下の特許請求の範囲によって示される。

本発明は、例えば以下の項目を提供する。

(項目1)

パッケージ内に医薬組成物を含むパッケージされた医薬組成物であって、医薬組成物は：

a. ガンマ-ヒドロキシブチラートまたはその薬学的に許容される塩を含む即時放出成分
；および

b. ガンマ-ヒドロキシブチラートまたはその薬学的に許容される塩を含む修飾放出成分
；
を含み、

パッケージは、29%～54%相対湿度を有する内部容積を有し、および医薬組成物は、経時的に安定な溶解プロファイルを有する、医薬組成物。

(項目2)

パッケージの相対湿度は、40℃および75%の相対湿度にて貯蔵されたときに少なくとも2月の期間の間29%～54%である、項目1のパッケージされた医薬組成物。

(項目3)

パッケージの相対湿度は、40℃および75%の相対湿度にて貯蔵されたときに1週にて29%を上回り、および2月にて54%未満である、項目1または2のパッケージされた医薬組成物。

(項目4)

パッケージの相対湿度は、40℃および75%の相対湿度にて貯蔵されたときに1週にて29%を上回り且つ44%未満、および2月にて54%未満である、項目1または2のパッケージされた医薬組成物。

(項目5)

パッケージの相対湿度は、40℃および75%の相対湿度にて貯蔵されたときに1週後に35%～39%および2月後に39%～48%である、項目1または2のパッケージされた医薬組成物。

(項目6)

40℃および75%の相対湿度にて2月貯蔵されたときに、医薬組成物における0.4%を上回るガンマ-ヒドロキシブチラートがガンマ-ブチロラクトン (GBL) に変換されない、項目1～5のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物。

(項目7)

パッケージは、USP 38 <671>にしたがって測定したときに7mg/日/リットル未満の水蒸気透過速度を有する、項目1～6のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物。

(項目8)

2月の40℃/75%の相対湿度貯蔵期間後に、医薬組成物は、貯蔵期間の開始時の遅延時間とは70分未満異なる遅延時間を示し、遅延時間は、37℃の温度および75rpmのパドル速度にて900mLの0.1N塩酸においてUSP 38 <711>にしたがって溶解装置2における試験から決定される、項目1～7のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物

(項目9)

2月の40℃/75%の相対湿度貯蔵期間後に、医薬組成物は、37℃の温度および75rpmのパドル速度にて900mLの0.1N塩酸においてUSP 38 <711>にしたがって溶解装置2において少なくとも4回の連続した1時間ごとの時点にて試験したときに、貯蔵期間前のガンマ-ヒドロキシブチラートの溶解とは10%未満まで異なるガンマ-ヒドロキシブチラートの溶解を有する、項目1～8のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物。

(項目10)

修飾放出成分は、ガンマ-ヒドロキシブチラートまたはその薬学的に許容される塩を含

むコア、並びに疎水性化合物およびメタクリル酸共重合体の混合物を含むコーティングを含む、項目1～9のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物。

(項目 1 1)

疎水性化合物は、トリステアリン酸グリセリンまたは水素付加した植物油であり、およびメタクリル酸共重合体の混合物は、メタアクリル酸およびアクリル酸エチル共重合体NFおよびメタアクリル酸およびメタクリル酸メチル共重合体 (1:2) NFを含む。項目10のパッケージされた医薬組成物。

(項目 1 2)

コーティングは、40～70重量部の疎水性化合物および30～60重量部のメタクリル酸共重合体の混合物を含む、項目10または11のパッケージされた医薬組成物。

(項目 1 3)

コーティングは、修飾放出成分の重量の10%～50%である、項目10～12のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物。

(項目 1 4)

疎水性化合物は、40℃以上の融点を有し、およびメタクリル酸共重合体の混合物は、5.6を上回るpHトリガーを有する、項目10～13のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物。

(項目 1 5)

修飾放出成分は、コアとコーティングとの間にバリアコートがない、項目10～15のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物。

(項目 1 6)

修飾放出成分は、200～800マイクロメートルの平均直径を有する粒子を含む、項目1～15のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物。

(項目 1 7)

医薬組成物は、酸性化剤および懸濁剤または増粘剤をさらに含む、項目1～16のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物。

(項目 1 8)

酸性化剤は、リンゴ酸、クエン酸、酒石酸、アジピン酸、ホウ酸、マレイン酸、リン酸、アスコルビン酸、オレイン酸、カプリン酸、カプリル酸、安息香酸またはその混合物から選択され；および懸濁剤または増粘剤は、キサンタンガム、中間粘性カルボキシメチルセルロースナトリウム、微結晶性セルロースおよびカルボキシメチルセルロースナトリウムの混合物、微結晶性セルロースおよびグアーガムの混合物、中間粘性ヒドロキシエチルセルロース、寒天、アルギン酸ナトリウム、アルギン酸ナトリウムおよびアルギン酸カルシウムの混合物、ゲランゴム、カラギナンガム等級イオタ、カップまたはラムダ、中間粘性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から選択される、項目17のパッケージされた医薬組成物。

(項目 1 9)

酸性化剤は、リンゴ酸または酒石酸であり、および1.2%～15重量%の量で存在し；および懸濁剤または増粘剤は、キサンタンガム、カラギナンガムおよびヒドロキシエチルセルロースの混合物またはキサンタンガムおよびカラギナンガムの混合物であり、および1%～15重量%の量で存在する。項目17または18のパッケージされた医薬組成物

(項目 2 0)

ガンマ-ヒドロキシブチラートは、即時放出および修飾放出成分において10/90～65/35の重量比で存在する、項目1～19のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物。

(項目 2 1)

パッケージは、0.5グラム～12.0グラムのガンマ-ヒドロキシブチラートのナトリウム塩を含む、項目1～20のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物。

(項目 2 2)

パッケージは、少なくとも6マイクロメートルのアルミ箔厚を有するアルミ箔ポーチまたはサッシェである、項目1～21のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物。

(項目 2 3)

ナルコレプシー1型または2型を治療するための、項目1～22のいずれか1項のパッケージされた医薬組成物の使用であって、使用はパッケージを開けること、医薬組成物を液体と混合して混合物を形成すること、およびその必要がある個体に混合物を経口投与することを含む、使用。