

【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 4 月 21 日 (2011.4.21)

【公表番号】特表 2010-520174 (P2010-520174A)

【公表日】平成 22 年 6 月 10 日 (2010.6.10)

【年通号数】公開・登録公報 2010-023

【出願番号】特願 2009-551216 (P2009-551216)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/28 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/22 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/55

A 6 1 P 25/00

A 6 1 K 9/28

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/22

A 6 1 K 47/10

【手続補正書】

【提出日】平成 23 年 2 月 25 日 (2011.2.25)

【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】

a) 1 - { 6 - [(3 - シクロブチル - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズアゼピン - 7 - イル) オキシ] - 3 - ピリジニル } - 2 - ピロリジノンまたはその医薬上許容される塩 ;

b) 安定化剤を含まない剤形と比べた場合に剤形中の 1 - { 6 - [(3 - シクロブチル - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズアゼピン - 7 - イル) オキシ] - 3 - ピリジニル } - 2 - ピロリジノンの崩壊を減少させる、安定化剤 ; および

c) 医薬上許容される賦形剤

を含む剤形。

【請求項 2】

a) 1 - { 6 - [(3 - シクロブチル - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズアゼピン - 7 - イル) オキシ] - 3 - ピリジニル } - 2 - ピロリジノンまたはその医薬上許容される塩、および

b) 安定化剤を含まない剤形と比べた場合に剤形中の 1 - { 6 - [(3 - シクロブチル - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズアゼピン - 7 - イル) オキシ] - 3 - ピリジニル } - 2 - ピロリジノンの崩壊を減少させる安定化剤

を含むフィルムによって少なくとも部分的に被覆されている、キャリアー錠剤を含む、請求項 1 記載の剤形。

【請求項 3】

フィルムがフィルム形成剤を付加的に含有する、請求項 2 記載の剤形。

【請求項 4】

フィルム形成剤がヒドロキシプロピルセルロースである、請求項 3 記載の剤形。

【請求項 5】

キャリアー錠剤が少なくとも 1 つの凹部を有する、請求項 2、3 または 4 記載の剤形。

【請求項 6】

フィルムがキャリアー錠剤上の凹部に存在する、請求項 5 記載の剤形。

【請求項 7】

キャリアー錠剤による 1 - { 6 - [(3 - シクロブチル - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズアゼピン - 7 - イル) オキシ] - 3 - ピリジニル } - 2 - ピロリジノンまたはその医薬上許容される塩の吸収が実質的に存在しない、請求項 2 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の剤形。

【請求項 8】

該キャリアー錠剤がコーティングされている、請求項 7 記載の剤形。

【請求項 9】

存在する遊離塩基の量として換算した場合に、1 μ g ~ 1 mg の 1 - { 6 - [(3 - シクロブチル - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズアゼピン - 7 - イル) オキシ] - 3 - ピリジニル } - 2 - ピロリジノンを含む、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の剤形。

【請求項 10】

遊離塩基として 1 - { 6 - [(3 - シクロブチル - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズアゼピン - 7 - イル) オキシ] - 3 - ピリジニル } - 2 - ピロリジノンを含む、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の剤形。

【請求項 11】

安定化剤が、クエン酸、リンゴ酸、アスコルビン酸およびその塩、重炭酸ナトリウム、ブチル化ヒドロキシアニソールならびにブチル化ヒドロキシトルエンからなる群より選択される、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の剤形。

【請求項 12】

安定化剤がクエン酸であり、遊離塩基 1 - { 6 - [(3 - シクロブチル - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズアゼピン - 7 - イル) オキシ] - 3 - ピリジニル } - 2 - ピロリジノンのクエン酸に対するモル比が 1 : 5 ~ 1 : 500 の範囲内にある、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の剤形。

【請求項 13】

剤形および / またはフィルムが、存在する遊離塩基の量として換算した場合に、2 μ g ~ 100 μ g の 1 - { 6 - [(3 - シクロブチル - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズアゼピン - 7 - イル) オキシ] - 3 - ピリジニル } - 2 - ピロリジノンを含む、請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の剤形。

【請求項 14】

剤形がさらにコーティングされている、請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の剤形。

【請求項 15】

実質的に実施例に記載される剤形。

【請求項 16】

実施例 1 - 11 に記載される剤形。

【請求項 17】

請求項 2 記載の剤形の製造方法であって、キャリアー錠剤上に 1 - { 6 - [(3 - シクロブチル - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズアゼピン - 7 - イル) オキシ] - 3 - ピリジニル } - 2 - ピロリジノンまたはその医薬上許容される塩および安定化剤の溶液または懸濁液を分散させることを含む方法。

【請求項 18】

1 - { 6 - [(3 - シクロブチル - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズ

アゼピン - 7 - イル) オキシ] - 3 - ピリジニル} - 2 - ピロリジノンまたはその医薬上許容される塩および安定化剤の溶液または懸濁液が、メタノール、エタノール、アセトン、酢酸または塩化メチレンである有機溶媒を用いて調製される、請求項 17 記載の方法。

【請求項 19】

安定化剤がクエン酸であり、2 ~ 3 % w / v の量で溶液または懸濁液中に存在する、請求項 17 または 18 記載の方法。

【請求項 20】

剤形では、キャリアー錠剤が請求項 2 記載のフィルムによって少なくとも部分的に被覆され、フィルムがヒドロキシプロピルセルロースであるフィルム形成剤を付加的に含有し、方法では、ヒドロキシプロピルセルロースが 4 ~ 6 % w / v の量で溶液または懸濁液中に存在する、請求項 17、18 または 19 記載の方法。

【請求項 21】

キャリアー錠剤および分散溶液 / 懸濁液が、過剰な液体を蒸発させ、キャリアー錠剤の少なくとも一部の表面上でフィルムを形成させるために加熱される、請求項 17、18、19 または 20 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 22】

方法に用いられるキャリアー錠剤が、分散させた後に得られる 1 - { 6 - [(3 - シクロブチル - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズアゼピン - 7 - イル) オキシ] - 3 - ピリジニル} - 2 - ピロリジノンまたはその医薬上許容される塩および安定化剤の溶液または懸濁液のベイスンを得る凹部またはくぼみを有する、請求項 17 ~ 21 のいずれか 1 項に記載の方法。

【請求項 23】

錠剤の 2 つの表面に凹部を有する両凹錠剤が用いられる、請求項 22 記載の方法。

【請求項 24】

神経疾患の治療のための請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の剤形の製造における 1 - { 6 - [(3 - シクロブチル - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズアゼピン - 7 - イル) オキシ] - 3 - ピリジニル} - 2 - ピロリジノンまたはその医薬上許容される塩の使用。

【請求項 25】

神経疾患の治療に用いる、請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の剤形。

【請求項 26】

1 - { 6 - [(3 - シクロブチル - 2 , 3 , 4 , 5 - テトラヒドロ - 1 H - 3 - ベンズアゼピン - 7 - イル) オキシ] - 3 - ピリジニル} - 2 - ピロリジノンまたはその医薬上許容される塩および安定化剤の溶媒系中溶液または懸濁液。

【請求項 27】

1 種または複数のフィルム形成剤をさらに含む、請求項 26 記載の溶液または懸濁液。

【請求項 28】

溶媒系がメタノールである有機溶媒である、請求項 26 記載の溶液または懸濁液。