

【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7月21日(2011.7.21)

【公表番号】特表2010-529142(P2010-529142A)

【公表日】平成22年8月26日(2010.8.26)

【年通号数】公開・登録公報2010-034

【出願番号】特願2010-511351(P2010-511351)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/4168 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/4168

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/20

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成23年6月6日(2011.6.6)

【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】

経口製剤であって、

(a) 前記経口製剤の 0 , 0 0 1 重量% ~ 0 . 5 重量%の量の  $\beta_2$  - アドレナリン受容体アゴニストと、

(b) 医薬的に許容される親水性マトリックスと

を含み、前記親水性マトリックスが、

(i) 前記経口製剤の 2 0 重量% ~ 8 0 重量%の量の少なくとも一種のヒドロキシプロピルメチルセルロースエーテルと、

(i i) 前記経口製剤の 2 0 重量% ~ 8 0 重量%の量の少なくとも一種のデンプン、ラクトースまたはデキストロースと、

(i i i) アルキル硫酸金属塩と

を含み、前記経口製剤を、前記  $\beta_2$  - アドレナリン受容体アゴニストの血漿中濃度が定常状態にある被験者に、約 1 2 又は 2 4 時間毎に一回だけ投与した後、前記アゴニストの

血漿中濃度のピーク対トラフ比が約 1 . 9 以下に留まる経口製剤。

【請求項 2】

前記経口製剤を、前記  $\beta_2$  - アドレナリン受容体アゴニストの血漿中濃度が定常状態にある被験者に、約 2 4 時間毎に一回だけ投与した後、前記アゴニストの血漿中濃度のピーク対トラフ比が約 1 . 9 以下に留まる請求項 1 に記載の経口製剤。

【請求項 3】

さらに、ステアリン酸金属塩および / またはコロイダルシリカを含む請求項 1 または 2 に記載の経口製剤。

【請求項 4】

前記  $\beta_2$  - アドレナリン受容体アゴニストがクロニジンまたはその医薬的に許容される塩である請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の経口製剤。

【請求項 5】

前記  $\beta_2$  - アドレナリン受容体アゴニストが塩酸クロニジンである請求項 4 に記載の経口製剤。

【請求項 6】

前記クロニジンの量が、前記製剤の約 0 . 0 2 5 重量 % ~ 約 0 . 4 0 重量 % の量である請求項 4 に記載の経口製剤。

【請求項 7】

前記アルキル硫酸金属塩の量が、前記製剤の約 1 重量 % ~ 約 7 重量 % の量である請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の経口製剤。

【請求項 8】

前記アルキル硫酸金属塩の量が、前記製剤の約 2 重量 % ~ 約 6 重量 % の量である請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の経口製剤。

【請求項 9】

前記アルキル硫酸金属塩の量が約 2 % である請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の経口製剤。

【請求項 10】

前記アルキル硫酸金属塩がラウリル硫酸ナトリウムである請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の経口製剤。

【請求項 11】

前記血漿中濃度のピーク対トラフ比が約 1 . 6 以下に留まる請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の経口製剤。

【請求項 12】

前記  $\beta_2$  - アドレナリン受容体アゴニストの量が、約 0 . 1 m g ~ 約 0 . 7 m g の量である請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の経口製剤。

【請求項 13】

請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の経口製剤であって、

( a ) 前記経口製剤の 0 . 0 5 重量 % ~ 0 . 2 重量 % の量の塩酸クロニジンと、

( b ) 医薬的に許容される親水性マトリックスと、

( c ) ステアリン酸金属塩および / またはコロイダルシリカと

を含み、前記親水性マトリックスが、

( i ) 前記経口製剤の 3 0 重量 % ~ 5 0 重量 % の量の少なくとも一種のヒドロキシプロピルメチルセルロースエーテルと、

( i i ) 前記経口製剤の 5 0 重量 % ~ 7 0 重量 % の量の少なくとも一種のデンプン、ラクトースまたはデキストロ - スと、

( i i i ) 前記経口製剤の約 2 重量 % の量のアルキル硫酸金属塩と

を含むものである経口製剤。

【請求項 14】

請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の経口製剤であって、

( a ) 前記経口製剤の 0 . 0 2 5 重量 % ~ 約 0 . 4 0 重量 % の量の塩酸クロニジンと、

(b) 医薬的に許容される親水性マトリックスと、

(c) ステアリン酸金属塩および / またはコロイダルシリカと

を含み、前記親水性マトリックスが、

(i) 前記経口製剤の 30 重量% ~ 50 重量% の量の少なくとも一種のヒドロキシプロピルメチルセルロースエーテルと、

(ii) 前記経口製剤の 50 重量% ~ 70 重量% の量の少なくとも一種のデンプン、ラクトースまたはデキストロ - スと、

(iii) 前記経口製剤の約 2 重量% ~ 約 6 重量% の量のアルキル硫酸金属塩とを含むものである経口製剤。

【請求項 15】

アドレナリン調節異常症の治療を必要とする被験者のアドレナリン調節異常症を治療する方法であって

請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の経口製剤を、前記  $\alpha_2$  - アドレナリン受容体アゴニストの血漿中濃度が定常状態である前記被験者に、約 12 又は 24 時間毎に一回だけ投与し、投与後の前記アゴニストの血漿中濃度のピーク対トラフ比が約 1.9 に留まるステップを含む

前記アドレナリン調節異常症が治療される方法。

【請求項 16】

前記アドレナリン調節異常症が、高血圧、心房細動、うっ血性心不全、起立性低血圧、術後疼痛、難治性癌性疼痛、頭痛、陣痛、反射性交感神経性ジストロフィ、アカシジア、末梢神経障害、神経障害性口顔疼痛、糖尿病性胃不全麻痺、本態性振戦、硬膜後悪寒戦慄、麻酔後悪寒振戦、レストレスレッグ症候群、緊張亢進状態、運動亢進障害、トゥーレット症候群、薬物離脱、急性神経性食欲不振症、注意欠陥 / 多動障害 (ADHD)、行為障害、双極性障害、攻撃性、発作睡眠、パニック障害、心的外傷後ストレス障害、睡眠障害、社交恐怖、統合失調症、潰瘍性大腸炎と直腸炎、嘔吐、シクロスポリン誘発性腎毒症、甲状腺機能亢進症、小児の成長遅延、多汗症、閉経後の潮紅と顔面潮紅からなる群から選択される症状で現れる請求項 15 に記載の方法。

【請求項 17】

前記アドレナリン調節異常症が、注意欠陥多動障害、高血圧または閉経後の潮紅もしくは顔面潮紅で現れる請求項 15 に記載の方法。

【請求項 18】

前記経口製剤を約 24 時間毎に一回だけ投与する請求項 15 ~ 17 のいずれか一項に記載の方法。