

【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29年3月16日 (2017.3.16)

【公表番号】特表2016-508516(P2016-508516A)

【公表日】平成28年3月22日 (2016.3.22)

【年通号数】公開・登録公報2016-017

【出願番号】特願2015-558108(P2015-558108)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/06 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 31/43 (2006.01)

A 6 1 K 31/438 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2017.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/04 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 K 9/16 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 K 9/28 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 45/06

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 31/43

A 6 1 K 31/438

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/04

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 9/14

A 6 1 P 31/04

A 6 1 K 9/28

【手続補正書】

【提出日】平成29年2月8日(2017.2.8)

【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】

(1) 少なくとも1種類の抗生物質を含む、圧縮ミニタブレットの形態の即時放出性の第1投与組成物、ならびに

(2) プロトンポンプ阻害薬およびコーティングを含む、圧縮ミニタブレットの形態の遅延放出性の第2投与組成物
を含むカプセル剤であって、前記遅延放出性第2投与組成物が、バスケット装置中で試験した場合にバスケット装置中での二段階溶出試験プロファイル：

(a) 100毎分回転数で120分間の、0.1N HCL 900mLを含む酸段階において、10重量%
以下のプロトンポンプ阻害薬の放出、および

(b) 前記酸段階に続いて、100毎分回転数で45分間の、pH6.8のリン酸緩衝液900mL中
で75%重量以上のプロトンポンプ阻害薬の放出
を満たすことを特徴とするカプセル剤。

【請求項 2】

前記第2投与組成物のコーティングが、経口投与の後、前記プロトンポンプ阻害薬の放出を120分から少なくとも240分遅延させることを特徴とする請求項1記載のカプセル剤。

【請求項 3】

前記第1投与組成物における前記抗生物質が、アモキシシリンもしくはその誘導体、またはその薬学上許容される塩もしくは溶媒和物、または該塩の溶媒和物であることを特徴とする請求項1または2記載のカプセル剤。

【請求項 4】

前記第1投与組成物における前記抗生物質が、リファブチンもしくはその誘導体、またはその薬学上許容される塩もしくは溶媒和物、または該塩の溶媒和物であることを特徴とする請求項1または2記載のカプセル剤。

【請求項 5】

前記第2投与組成物における前記プロトンポンプ阻害薬が、オメプラゾール、パントプラゾール、ランソプラゾール、イラプラゾール、デクスランソプラゾール、エソメプラゾールおよびラベプラゾール、それらの薬学上許容される塩および溶媒和物、ならびに該塩の溶媒和物のうちの1つ、またはそれらの組み合わせであることを特徴とする請求項1～4いずれか1項記載のカプセル剤。

【請求項 6】

前記第2投与組成物が、さらに、アルギン酸ナトリウム、モノステアリン酸グリセリル、ジステアリン酸グリセリル、アクリル酸およびセルロース、ならびにそれらの組み合わせからなる群から選択される時間遅延剤を含むことを特徴とする請求項1～5いずれか1項記載のカプセル剤。

【請求項 7】

前記第1投与組成物および第2投与組成物が、さらに、ラクトース、セルロース、デンプン、リン酸カルシウム、炭酸カルシウムおよび糖、ならびにそれらの組み合わせからなる群から選択される充填剤を含むことを特徴とする請求項1～6いずれか1項記載のカプセル剤。

【請求項 8】

前記第1投与組成物および第2投与組成物が、さらに、クロスカルメロースナトリウム

、カルボキシメチルセルロース、デンプングリコール酸ナトリウムおよびクロスボドン、ならびにそれらの組み合わせからなる群から選択される崩壊剤を含むことを特徴とする請求項 1 ~ 7 いずれか 1 項記載のカプセル剤。

【請求項 9】

前記第 1 投与組成物および第 2 投与組成物が、さらに、デンプン、セルロース、ポリビニルピロリドン、キサンタンガム、アルギン酸および寒天、ならびにそれらの組み合わせからなる群から選択される結合剤を含むことを特徴とする請求項 1 ~ 8 いずれか 1 項記載のカプセル剤。

【請求項 10】

前記第 1 投与組成物および第 2 投与組成物が、さらに、ラウリル硫酸ナトリウム、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレングリコール、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、ポリビニルカプロラクタム - ポリビニルアセテート - ポリエチレングリコールおよびヒドロキシステアリン酸マクロゴールグリセロール、ならびにそれらの組み合わせからなる群から選択される界面活性剤を含むことを特徴とする請求項 1 ~ 9 いずれか 1 項記載のカプセル剤。

【請求項 11】

前記第 1 投与組成物および第 2 投与組成物が、さらに、メグルミン、炭酸カルシウム、硫酸ナトリウムおよび重炭酸ナトリウム、ならびにそれらの組み合わせからなる群から選択されるアルカリ化剤を含むことを特徴とする請求項 1 ~ 10 いずれか 1 項記載のカプセル剤。

【請求項 12】

前記第 1 投与組成物および第 2 投与組成物が、さらに、ステアリン酸マグネシウム、二酸化ケイ素、タルク、ステアリン酸、フマル酸ステアリルナトリウムおよびベヘン酸グリセリル、ならびにそれらの組み合わせからなる群から選択される潤滑剤を含むことを特徴とする請求項 1 ~ 11 いずれか 1 項記載のカプセル剤。

【請求項 13】

前記第 1 投与組成物が 2 種類の抗生物質を含むことを特徴とする請求項 1 ~ 12 いずれか 1 項記載のカプセル剤。

【請求項 14】

前記第 2 投与組成物が、さらに、外側保護層、腸溶コーティングおよび内側保護層を含むことを特徴とする請求項 1 ~ 13 いずれか 1 項記載のカプセル剤。

【請求項 15】

アモキシシリン、リファブチンおよびオメブラゾールを含むことを特徴とする請求項 1 ~ 14 いずれか 1 項記載のカプセル剤。

【請求項 16】

前記第 1 投与組成物がアモキシシリンもしくはその誘導体、またはその薬学上許容される塩もしくは溶媒和物、または該塩の溶媒和物 250mg、およびリファブチンもしくはその誘導体、またはその薬学上許容される塩もしくは溶媒和物、または該塩の溶媒和物 12.5mg を含み、前記第 2 投与組成物がオメブラゾールもしくはその誘導体、またはその薬学上許容される塩もしくは溶媒和物、または該塩の溶媒和物 10mg を含むことを特徴とする請求項 1 ~ 14 いずれか 1 項記載のカプセル剤。

【請求項 17】

宿主に、少なくとも 14 日間、一日 3 回投与するように用いられることを特徴とする、宿主におけるピロリ菌治療のための請求項 1 ~ 16 いずれか 1 項記載のカプセル剤。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0013

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0013】

いくつかの実施形態では、前記第 1 および第 2 投与組成物はさらに充填剤、崩壊剤、結合剤、界面活性剤、アルカリ化剤、潤滑剤またはその組み合わせを含むことができる。

前記充填剤は、ラクトース、セルロース、デンプン、リン酸カルシウム、炭酸カルシウム、糖、またはその組み合わせの 1 つであってもよい。前記崩壊剤は、クロスカルメロースナトリウム、カルボキシメチルセルロース、デンプングリコール酸ナトリウム、クロスボビドンまたはその組み合わせの 1 つであってもよい。結合剤は、デンプン、セルロース、ポリビニルピロリドン、キサンタンガム、アルギン酸、寒天またはその組み合わせの 1 つであってもよい。前記界面活性剤は、ラウリル硫酸ナトリウム、ポリオキシエチレンポリオキシプロピレングリコール、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、ポリビニルカプロラクタム - ポリビニルアセテート - ポリエチレングリコール、ヒドロキシステアリン酸マクロゴールグリセロールまたはその組み合わせの 1 つであってもよい。前記アルカリ化剤は、メグルミン、炭酸カルシウム、硫酸ナトリウム、重炭酸ナトリウムまたはその組み合わせの 1 つであってもよい。前記潤滑剤は、ステアリン酸マグネシウム、二酸化ケイ素、タルク、ステアリン酸、フマル酸ステアリルナトリウム、ベヘン酸グリセリルまたはその組み合わせの 1 つであってもよい。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0102

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0102】

いくつかの実施形態では、本医薬組成物は少なくとも 1 種類のプロトンポンプ阻害薬を含む。プロトンポンプ阻害薬 (PPI) は非常に有効な胃酸分泌抑制薬である。少なくとも 1 つのプロトンポンプ阻害薬は、オメプラゾール、パントプラゾール、ランソプラゾール、イラプラゾール、デクスランソプラゾール、エソメプラゾールおよびラベプラゾールを含む群から選ばれる一またはその任意の組み合わせ、その任意の薬学的許容される塩およびその溶媒和物であってもよい。いくつかの実施形態では、プロトンポンプ阻害薬は、マグネシウム、炭酸水素ナトリウムあるいはナトリウムのような化学物質を含むことができる。

。