

【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3月29日(2022.3.29)

【公開番号】特開2021-185139(P2021-185139A)

【公開日】令和3年12月9日(2021.12.9)

【年通号数】公開・登録公報2021-059

【出願番号】特願2021-123899(P2021-123899)

【国際特許分類】

A 61K 31/426(2006.01)

10

A 61P 13/02(2006.01)

A 61P 43/00(2006.01)

A 61K 9/20(2006.01)

A 61K 47/02(2006.01)

A 61K 47/10(2006.01)

【F I】

A 61K 31/426

A 61P 13/02

A 61P 43/00 1 1 1

A 61K 9/20

20

A 61K 47/02

A 61K 47/10

【手続補正書】

【提出日】令和4年3月18日(2022.3.18)

【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】

30

【特許請求の範囲】

【請求項1】

活性成分としてミラベグロンまたはその薬剤学的に許容可能な塩を含み、徐放性基剤としてポリエチレンオキシド(PEO)を含み、親水性基剤としてポリエチレングリコール(PEG)を含まないことを特徴とし、ポリエチレンオキシド(PEO)は、PEO 30万およびPEO 100万を1:0.1~1:5の重量比で含む、放出調節用薬剤学的組成物。

【請求項2】

PEO 30万およびPEO 100万を1:0.6~1:5の重量比で含むことを特徴とする、請求項1に記載の薬剤学的組成物。

40

【請求項3】

PEO 30万およびPEO 100万を1:0.6~1:1.7の重量比で含むことを特徴とする、請求項1に記載の薬剤学的組成物。

【請求項4】

ポリエチレンオキシド(PEO)の平均分子量が100万以下であることを特徴とする、請求項1から3のいずれか1項に記載の薬剤学的組成物。

【請求項5】

親水性基剤を5%未満にさらに含むことを特徴とする、請求項1から3のいずれか1項に記載の薬剤学的組成物。

【請求項6】

50

着色剤としてアルミニウムレーキをさらに含むことを特徴とする、請求項 1 から 3 のいずれか 1 項に記載の薬剤学的組成物。

【請求項 7】

請求項 1 から 3 のいずれか 1 項に記載の薬剤学的組成物が製剤化される放出調節用製剤。

【請求項 8】

前記製剤が経口投与用錠剤であることを特徴とする、請求項 7 に記載の放出調節用製剤。

【請求項 9】

前記製剤はプラスチック容器で包装される、請求項 7 に記載の放出調節用製剤。

【請求項 10】

前記容器がアルミ箔 (alu-alu) であることを特徴とする、請求項 7 に記載の放出調節用製剤。 10

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0009

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0009】

[試験例 1]

溶出試験

実施例 1 ~ 5 および比較例で製造された錠剤を pH 6.8 (900 mL, 50 rpm) で 20 溶出試験を行い、その液体クロマトグラフの測定方法は以下のとおりである。

- 検出機：紫外外部吸光光度計（測定波長：250 nm）

- カラム：C18 (4.6 mm × 150 mm, 5 μm)

- 移動相：移動相 A と B を 7 : 3 の比率で混和して用いる。

移動相 A：水 900 mL に 8.7 mL の過塩素酸 (70%) と 3.0 g の水酸化ナトリウムを添加した後、0.1 N 水酸化ナトリウム水溶液で pH 2.0 に調整した後に 1000 mL に合わせる。

移動相 B：アセトニトリル

- 流速：4 分にミラベグロンが検出されるように流速を調節

- カラム温度：40

その結果を図 1 および表 2 に示し、溶出率を確認した。すなわち、PEO 100 万を単独で用いるよりは、PEO 100 万と PEO 30 万を混合して用いる場合にさらに優れた溶出率を示した。 30

【表 2】

| 時間(hour) | 2 | 6 | 8 | 10 | 12 |
|----------|------|------|------|------|------|
| 比較例 | 22.6 | 66.6 | 84.0 | 92.5 | 95.2 |
| 実施例1 | 11.6 | 47.0 | 62.6 | 74.5 | 82.7 |
| 実施例2 | 14.3 | 54.6 | 73.8 | 87.8 | 94.4 |
| 実施例3 | 14.3 | 54.9 | 74.6 | 87.8 | 94.9 |
| 実施例4 | 18.8 | 67.4 | 85.3 | 95.7 | 99.3 |
| 実施例5 | 14.7 | 61.0 | 80.7 | 93.4 | 96.0 |

本発明のまた別の態様は、以下のとおりであってもよい。

[1] 活性成分としてミラベグロンまたはその薬剤学的に許容可能な塩を含み、徐放性基剤としてポリエチレンオキシド (PEO) を含む放出調節用薬剤学的組成物。

[2] ポリエチレンオキシド (PEO) は、PEO 100 万および PEO 30 万を含むことを特徴とする、前記 [1] に記載の薬剤学的組成物。

[3] PEO 30 万および PEO 100 万を 1 : 0.1 ~ 1 : 5 の重量比で含むことを特徴とする、前記 [2] に記載の薬剤学的組成物。

40

50

[4] ポリエチレンオキシド(PEO)の平均分子量が100万以下であることを特徴とする、前記[1]に記載の薬剤学的組成物。

[5] 親水性基剤を5%未満にさらに含むことを特徴とする、前記[1]に記載の薬剤学的組成物。

[6] 着色剤としてアルミニウムレーキをさらに含むことを特徴とする、前記[1]に記載の薬剤学的組成物。

[7] 前記[1]に記載の組成物が製剤化される放出調節用製剤。

[8] 前記製剤が経口投与用錠剤であることを特徴とする、前記[7]に記載の放出調節用製剤。

[9] 前記製剤はプラスチック容器で包装される、前記[7]に記載の放出調節用製剤。 10

[10] 前記プラスチック容器がアルミ箔(alu-alu)であることを特徴とする、前記[9]に記載の放出調節用製剤。

10

20

30

40

50