

【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6年3月21日(2024.3.21)

【国際公開番号】WO2021/188773

【公表番号】特表2023-518245(P2023-518245A)

【公表日】令和5年4月28日(2023.4.28)

【年通号数】公開公報(特許)2023-080

【出願番号】特願2022-555945(P2022-555945)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/42(2017.01)

A 6 1 K 47/10(2017.01)

A 6 1 K 47/32(2006.01)

A 6 1 K 47/36(2006.01)

A 6 1 K 47/12(2006.01)

A 6 1 K 47/26(2006.01)

A 6 1 P 5/14(2006.01)

A 6 1 K 31/198(2006.01)

A 6 1 K 9/48(2006.01)

【F I】

A 6 1 K 47/42

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/26

A 6 1 P 5/14

A 6 1 K 31/198

A 6 1 K 9/48

【手続補正書】

【提出日】令和6年3月11日(2024.3.11)

【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) 充填材料；および

(b) シェル組成物

を含む、ソフトゲルカプセルであって、

前記充填材料が、水、ポリオール、グリコール、アルコールまたはそれらの組合せから選択される液体媒体を少なくとも10%含み、

前記シェル組成物が、ゼラチン、および約6.0未満のpHにおいて可溶化するpH依存ポリマーを含む、ソフトゲルカプセル。

【請求項2】

前記充填材料が、前記液体媒体に溶解または懸濁した活性剤をさらに含み、前記充填材料が、約4超のpHを含む、請求項1に記載のソフトゲルカプセル。

【請求項3】

10

20

30

40

50

前記 pH 依存ポリマーが、約 5.5 未満、約 5.0 未満、約 4.5 未満または約 4.0 未満の pH において可溶化する、及び/又は、

前記 pH 依存ポリマーが、アクリルポリマーまたはセルロースポリマーである、及び/又は、

付随的に、前記アクリルポリマーが、アミノメタクリレートコポリマーである、請求項 1 または 2 に記載のソフトゲルカプセル。

【請求項 4】

前記シェル組成物が、前記 pH 依存ポリマーを約 1% ~ 約 60%、約 5% ~ 約 50%、約 10% ~ 約 40% または約 15% ~ 約 35% の量 (w/w) で含む、及び/又は、

前記シェル組成物が、前記ゼラチンを約 5% ~ 約 75%、約 10% ~ 約 60%、約 15% ~ 約 50% または約 20% ~ 約 40% の量 (w/w) で含む、請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載のソフトゲルカプセル。

10

【請求項 5】

前記シェル組成物が、可溶化剤をさらに含む、及び/又は、

付随的に、前記可溶化剤が有機酸である、及び/又は、

付随的に、前記有機酸が、シュウ酸、マロン酸、コハク酸、グルタル酸、アジピン酸、フマル酸、マレイン酸、フタル酸、イソフタル酸、テレフタル酸、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、酪酸、吉草酸、桂皮酸、乳酸、安息香酸、サリチル酸、没食子酸またはトルイル酸から選択される、及び/又は、

付随的に、前記シェル組成物が、前記可溶化剤を約 0.0001% ~ 約 1%、約 0.001% ~ 約 0.5% または約 0.005% または約 0.1% の量 (w/w) で含む、請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載のソフトゲルカプセル。

20

【請求項 6】

前記シェル組成物が、可塑剤をさらに含む、及び/又は、

付随的に、前記シェル組成物が、前記可塑剤を、約 5 wt% ~ 約 50 wt%、約 10% ~ 約 40% または約 15% ~ 約 35% の量 (w/w) で含む、及び/又は、

付随的に、前記可塑剤が、グリセロール、グリセリン、ソルビトールまたはそれらの組合せから選択される、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載のソフトゲルカプセル。

【請求項 7】

前記ゼラチンが、タイプ A ゼラチン、タイプ B ゼラチンまたはそれらの混合物から選択される、及び/又は、

前記ゼラチンが、魚ゼラチン、獣皮ゼラチン、骨ゼラチンまたはそれらの混合物からなる群から選択される、請求項 1 ~ 6 のいずれかに記載のソフトゲルカプセル。

30

【請求項 8】

前記液体媒体が水である、及び/又は、

前記ポリオールがグリセロールである、及び/又は、

前記グリコールが、ポリエチレングリコールである、及び/又は、

前記アルコールがエタノールである、請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載のソフトゲルカプセル。

【請求項 9】

前記充填組成物が、前記液体媒体を少なくとも 20%、少なくとも 30%、少なくとも 40%、少なくとも 50%、少なくとも 60%、少なくとも 70%、少なくとも 80%、少なくとも 90%、少なくとも 95% または少なくとも 99% の量で含む、又は、

前記充填組成物が、前記液体媒体を 5% ~ 50%、約 10% ~ 約 40% または約 15% ~ 約 30% の量で含む、請求項 1 ~ 8 のいずれかに記載のソフトゲルカプセル。

40

【請求項 10】

前記カプセル剤が、pH 1.2 の緩衝液中、50 rpm の速度のパドルを用いる USP Apparatus II において行われる崩壊試験に基づいて、胃環境において、約 60 分未満に崩壊する、又は、

前記カプセル剤が、約 37 ± 2 において、1000 mL のビーカー中、バスケット

50

- ラックアセンブリ NT - 40 H モデルの装置で行う崩壊試験に基づいて、塩基性媒体中、少なくとも約 1 時間で崩壊する、請求項 1 ~ 9 のいずれかに記載のソフトゲルカプセル

【請求項 1 1】

水溶性活性剤を含む、請求項 1 ~ 1 0 のいずれかに記載のソフトゲルカプセル。

【請求項 1 2】

レボチロキシンまたは薬学的に許容されるその塩を含む、請求項 1 ~ 1 1 のいずれかに記載のソフトゲルカプセル。

【請求項 1 3】

前記充填材料が、約 4 超の pH を含む、請求項 1 ~ 1 2 のいずれかに記載のソフトゲルカプセル。 10

【請求項 1 4】

請求項 1 2 に記載のソフトゲルカプセルを投与するステップを含む、甲状腺補充療法を提供する方法。

【請求項 1 5】

(a) 少なくとも 1 0 % の液体媒体を含む前記充填材料を調製するステップと ;
(b) ゼラチンおよび約 6 . 0 未満の pH において可溶化する pH 依存ポリマーを含むシェル組成物により前記充填材料を封入するステップと
を含む、請求項 1 ~ 1 3 のいずれかに記載のソフトゲルカプセルを調製する方法。 20

30

40

50