【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21年8月13日(2009.8.13)

【公表番号】特表2009-506067(P2009-506067A)
【公表日】平成21年2月12日(2009.2.12)
【年通号数】公開・登録公報2009-006
【出願番号】特願2008-528199(P2008-528199)
【国際特許分類】
Ａ６１Ｋ　31/655　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　 1/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　31/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　35/00　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　 9/48　(2006.01)
【ＦＩ】
Ａ６１Ｋ　31/655
Ａ６１Ｐ　 1/04
Ａ６１Ｐ　31/04
Ａ６１Ｐ　35/00
Ａ６１Ｋ　 9/48

【手続補正書】
【提出日】平成21年6月29日(2009.6.29)
【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】
約６グラム／日のバルサラジドまたはその医薬として許容され得るプロドラッグ、塩、溶媒和物、もしくは包接化合物の１日２回の投薬量を含む、胃腸疾患を治療するための医薬製剤。
【請求項２】
約６．６グラム／日のバルサラジドまたはその医薬として許容され得るプロドラッグ、塩、溶媒和物、もしくは包接化合物の１日２回の投薬量を含む、胃腸疾患を治療するための医薬製剤。
【請求項３】
１日２回の投薬量が、それぞれ約３グラム～約３．３グラムを含む、請求項１または２に記載の医薬製剤。
【請求項４】
前記胃腸疾患が、胃腸細菌感染もしくは細菌過剰増殖、直腸炎、または結腸癌のうちの１以上である、請求項１または２に記載の医薬製剤。
【請求項５】
注入可能な流体、エアゾール、クリーム、ゲル、錠剤、カプセル、シロップまたは経皮パッチの形態である、請求項１または２に記載の医薬製剤。
【請求項６】
担体、滑沢剤または着色剤のうちの１以上をさらに含む、請求項１に記載の医薬製剤。
【請求項７】
前記担体が、ヒプロメロース、炭酸カルシウム、リン酸カルシウム、第二リン酸カルシウ

ム、第三硫酸カルシウム、カルボキシメチルセルロースカルシウム、セルロース、セルロース、デキストレート、デキストリン、デキストロース、フルクトース、ラクチトール、ラクトース、炭酸マグネシウム、酸化マグネシウム、マチトール、マルトデキストリン、マルトース、ポリデキストロース、ソルビトール、スターチ、スクロース、糖、およびキシリトールである、請求項６に記載の医薬製剤。
【請求項８】
前記滑沢剤が、ステアリン酸マグネシウム、寒天、ステアリン酸カルシウム、オレイン酸エチル、ラウリン酸エチル、グリセリン、パルミトステアリン酸グリセリル、水素化植物油、マクロゴール、酸化マグネシウム、マンニトール、ポロキサマー、グリコール、安息香酸ナトリウム、ラウリル硫酸ナトリウム、ナトリウムステアリル、ソルビトール、ステアリン酸、タルク、トリアセチン、ステアリン酸亜鉛のうちの１以上である、請求項６に記載の医薬製剤。
【請求項９】
前記着色剤が、オパドリーＩＩイエロー、Ｄ＆Ｃイエロー＃１０アルミニウムレーキ、またはＦＤ＆Ｃイエロー＃６アルミニウムレーキのうちの１以上である、請求項６に記載の医薬製剤。
【請求項１０】
前記ヒプロメロースが、前記製剤の全重量の約１％～約５％である、請求項６に記載の医薬製剤。
【請求項１１】
前記ステアリン酸マグネシウムが、前記製剤の全重量の約０．５％～約２．５％である、請求項６に記載の医薬製剤。
【請求項１２】
二酸化チタン、ポリデキストロース、トリアセチン、マクロゴール、Ｄ＆Ｃイエロー＃１０アルミニウムレーキ、またはＦＤ＆Ｃイエロー＃６アルミニウムレーキのうちの１以上をさらに含む、請求項１に記載の医薬製剤。
【請求項１３】
被覆溶液をさらに含む、請求項１に記載の医薬製剤。
【請求項１４】
前記被覆溶液が、ヒプロメロースおよびヒドロキシプロピルセルロースを含む、請求項１３に記載の医薬製剤。
【請求項１５】
約６グラム／日に相当するバルサラジドの１日２回の投薬量を含む、胃腸疾患を治療するための医薬製剤を含むパッケージ。
【請求項１６】
それぞれ約３．３グラムのバルサラジドの１日２回の投薬量を含む、胃腸疾患を治療するための医薬製剤を含むパッケージ。
【請求項１７】
胃腸疾患のうちの１以上を治療するための使用説明書をさらに含む、請求項１６に記載のパッケージ。
【請求項１８】
前記投薬量が、注入可能な流体、エアゾール、クリーム、ゲル、錠剤、カプセル、シロップまたは経皮パッチの形態である、請求項１６に記載のパッケージ。
【請求項１９】
胃腸疾患を治療するための組成物であって、該組成物は、１日２回の投薬量において約６グラム／日～約６．７グラム／日のバルサラジドを含み、該組成物は、治療を必要とする被験体に投与するために処方されている、組成物。
【請求項２０】
前記１日２回の投薬量が、それぞれ約３．３グラムである、請求項１９に記載の組成物。
【請求項２１】

前記１日２回の投薬量が、それぞれ３錠を含む、請求項１９に記載の組成物。
【請求項２２】
前記３錠が、それぞれ約１１００ｍｇのバルサラジドを含む、請求項２１に記載の組成物。
【請求項２３】
前記投薬量が、注入可能な流体、エアゾール、クリーム、ゲル、丸薬、カプセル、シロップまたは経皮パッチの形態である、請求項１９に記載の組成物。
【請求項２４】
前記被験体が、胃腸疾患または直腸炎のうちの１以上の治療を必要とすると識別されている、請求項２３に記載の組成物。
【請求項２５】
前記被験体が動物である、請求項１９に記載の組成物。
【請求項２６】
前記被験体がヒトである、請求項１９に記載の組成物。
【請求項２７】
カプセルを製造する方法であって、
　前記バルサラジド二ナトリウムおよび１以上の賦形剤を顆粒状にして、顆粒を形成し；
　該顆粒をサイズによって分別し；
　該顆粒を約２０分間混和して、粉末混和物を形成し；
　該粉末混和物をカプセル化する
ことを含む製造方法。
【請求項２８】
前記１以上の賦形剤が、コロイド状二酸化ケイ素またはステアリン酸マグネシウムのうちの１以上を含む、請求項２７に記載の方法。
【請求項２９】
前記賦形剤が、顆粒のうちの約２重量％～約３重量％を構成する、請求項２７に記載の方法。
【請求項３０】
前記サイズによる分別が、１２メッシュスクリーンを用いてなされる、請求項２７に記載の方法。
【請求項３１】
前記混和が、ダブルコーンブレンダーを用いてなされる、請求項２７に記載の方法。
【請求項３２】
前記カプセル化した粉末混和物を研磨することをさらに含む、請求項２７に記載の方法。
【請求項３３】
約７００ｍｇ～約１２００ｍｇの粉末混和物がカプセル化される、請求項２７に記載の方法。
【請求項３４】
バルサラジドカプセルの溶解試験法であって、
　請求項１９に従って調製されたバルサラジドカプセルを溶解媒体中で撹拌し；
　該溶液を濾過して、濾液を形成し；
　該濾液をサンプリングし；
　該濾液を希釈する
ことを含む溶解試験法。
【請求項３５】
前記溶解媒体が、約ｐＨ６．８の５０ｍＭリン酸緩衝液を含む、請求項３４に記載の方法。
【請求項３６】
前記濾液を希釈することが、２ｍＬを約９８ｍＬの溶解媒体中に希釈することを含む、請求項３４に記載の方法。

【請求項３７】
前記希釈した濾液を分析することをさらに含む、請求項３４に記載の方法。
【請求項３８】
前記撹拌が５０ｒｐｍにおいてである、請求項３４に記載の方法。
【請求項３９】
バルサラジド二ナトリウム供給粉末および１以上の賦形剤を顆粒状にして、顆粒を形成し；
該顆粒を約２０分間混和して、粉末混和物を形成し；
該粉末混和物をカプセル化する
ことを含む、バルサラジドの医薬製剤の製造方法であって、
ここで、約６グラム／日のバルサラジドまたはその医薬として許容され得るプロドラッグ、塩、溶媒和物、もしくは包接化合物の１日２回の投薬量が投与される、方法。
【請求項４０】
前記方法が、混和する前に前記顆粒をサイズによって分別することをさらに含む、請求項３９に記載の方法。
【請求項４１】
前記供給粉末が、約８～約３０μｍの平均粒子径を有する、請求項３９に記載の方法。
【請求項４２】
前記粉末混和物が、約３００～約６７５μｍの平均粒子径を有する、請求項３９に記載の方法。
【請求項４３】
前記粉末混和物が、約３５００～約８５００ｃｍ^2／ｍｌの比表面積を有する、請求項３９に記載の方法。
【請求項４４】
前記粉末混和物が、約８５～約９０（６０メッシュ）の硬度（保持力）を有する、請求項３９に記載の方法。
【請求項４５】
前記粉末混和物が、約０．６７～約０．６９ｇ／ｃｃのルーズ嵩密度（ＬＢＤ）を有する、請求項３９に記載の方法。
【請求項４６】
前記バルサラジド二ナトリウム供給粉末が、約１．２８～約１．４７ｇ／ｃｃの圧縮２０Ｋを有する、請求項３９に記載の方法。
【請求項４７】
前記バルサラジド二ナトリウム供給粉末が、約０．５７～約０．６３ｇ／ｃｃのタップ嵩密度（ＴＢＤ）を有する、請求項３９に記載の方法。
【請求項４８】
前記バルサラジド二ナトリウム供給粉末が、約０．１０％～約０．１５％の水分を有する、請求項３９に記載の方法。
【請求項４９】
バルサラジド二ナトリウムおよび１以上の賦形剤を顆粒状にして、顆粒を形成し；
該顆粒を約２０分間混和して、粉末混和物を形成し；
該粉末混和物をカプセル化する
ことを含む、バルサラジドの医薬製剤の製造方法であって、
ここで、該粉末混和物が、約３００～約６７５μｍの平均粒子径を有する、方法。
【請求項５０】
前記方法が、混和する前に前記顆粒をサイズによって分別することをさらに含む、請求項４９に記載の方法。
【請求項５１】
前記方法が、混和する前に前記顆粒をサイズによって分別することをさらに含む、請求項４９に記載の方法。

【請求項５２】
前記供給粉末が、約８～約３０μｍの平均粒子径を有する、請求項４９に記載の方法。
【請求項５３】
前記粉末混和物が、約３５００～約８５００ｃｍ^2／ｍｌの比表面積を有する、請求項４９に記載の方法。
【請求項５４】
前記粉末混和物が、約８５～約９０（６０メッシュ）の硬度（保持力）を有する、請求項４９に記載の方法。
【請求項５５】
前記粉末混和物が、約０．６７～約０．６９ｇ／ｃｃのルーズ嵩密度（ＬＢＤ）を有する、請求項４９に記載の方法。
【請求項５６】
前記バルサラジド二ナトリウム供給粉末が、約１．２８～約１．４７ｇ／ｃｃの圧縮２０Ｋを有する、請求項４９に記載の方法。
【請求項５７】
前記バルサラジド二ナトリウム供給粉末が、約０．５７～約０．６３ｇ／ｃｃのタップ嵩密度（ＴＢＤ）を有する、請求項４９に記載の方法。
【請求項５８】
前記バルサラジド二ナトリウム供給粉末が、約０．１０％～約０．１５％の水分を有する、請求項４９に記載の方法。