

【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19年11月22日(2007.11.22)

【公表番号】特表2007-509155(P2007-509155A)
 【公表日】平成19年4月12日(2007.4.12)
 【年通号数】公開・登録公報2007-014
 【出願番号】特願2006-536758(P2006-536758)
 【国際特許分類】

A 6 1 K 31/554 (2006.01)
A 6 1 K 9/36 (2006.01)
A 6 1 K 9/16 (2006.01)
A 6 1 P 25/30 (2006.01)
A 6 1 P 25/18 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
A 6 1 K 47/44 (2006.01)
A 6 1 K 47/14 (2006.01)
A 6 1 K 47/32 (2006.01)
A 6 1 K 47/04 (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 47/12 (2006.01)
A 6 1 K 47/34 (2006.01)
A 6 1 K 47/10 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/554
 A 6 1 K 9/36
 A 6 1 K 9/16
 A 6 1 P 25/30
 A 6 1 P 25/18
 A 6 1 P 43/00 1 1 4
 A 6 1 K 47/44
 A 6 1 K 47/14
 A 6 1 K 47/32
 A 6 1 K 47/04
 A 6 1 K 47/38
 A 6 1 K 47/36
 A 6 1 K 47/26
 A 6 1 K 47/12
 A 6 1 K 47/34
 A 6 1 K 47/10

【手続補正書】
 【提出日】平成19年10月3日(2007.10.3)
 【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】**

マトリックスを含む固形投薬形態であって、
前記マトリックスは、
治療有効量のクエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩と、
ロウ物質と、
を含むことを特徴とする固形投薬形態。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の固形投薬形態であって、
前記マトリックスは、治療有効量のヘミフマル酸クエチアピンを含むことを特徴とする固形投薬形態。

【請求項 3】

請求項 1 に記載の固形投薬形態であって、
前記ロウ物質は、カルナバウロウ、ベヘン酸グリセリル、カスターワックス、またはそれらの任意の組合せを含むことを特徴とする固形投薬形態。

【請求項 4】

請求項 1 に記載の固形投薬形態であって、
前記投薬は、持続放出投薬製剤として製剤されることを特徴とする固形投薬形態。

【請求項 5】

請求項 1 に記載の固形投薬形態であって、
前記マトリックスは、コーティング組成物でコーティングされることを特徴とする固形投薬形態。

【請求項 6】

請求項 1 に記載の固形投薬形態であって、
前記マトリックスは、さらに、加工助剤を含むことを特徴とする固形投薬形態。

【請求項 7】

プレスコート投薬形態であって、
クエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩である活性薬剤、ロウ物質を含むコア組成物と、
親水性ポリマーを含み、前記コア組成物上にプレスコーティングされる、コーティング組成物と、
を含むことを特徴とするプレスコート投薬形態。

【請求項 8】

請求項 7 に記載のプレスコート投薬形態であって、
前記活性薬剤は、ヘミフマル酸クエチアピンであることを特徴とするプレスコート投薬形態。

【請求項 9】

請求項 7 に記載のプレスコート投薬形態であって、
前記コア組成物中のクエチアピンと前記コーティング組成物中のクエチアピンの比は、約 5 : 3 よりも大きいことを特徴とするプレスコート投薬形態。

【請求項 10】

薬剤として有効な量のクエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩および少なくとも 1 種の賦形剤を含む制御放出投薬形態であって、
前記投薬形態を溶解媒体と組み合わせてから 4 時間後に前記クエチアピンまたは前記薬剤として許容されるその塩の 50 から 95 % が放出されるような溶解度プロフィールを示すことを特徴とする制御放出投薬形態。

【請求項 11】

請求項 10 に記載の制御放出投薬形態であって、
前記投薬形態を溶解媒体と組み合わせてから 1 時間後に前記クエチアピンまたは前記薬剤として許容されるその塩の 30 から 80 % が放出され、

前記投薬形態を溶解媒体と組み合わせてから2時間後に前記クエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩の40から85%が放出され、

前記投薬形態を溶解媒体と組み合わせてから3時間後に前記クエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩の45から90%が放出され、

前記投薬形態を溶解媒体と組み合わせてから4時間後に前記クエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩の50から95%が放出されるような溶解度プロファイルを示すことを特徴とする制御放出投薬形態。

【請求項12】

薬剤として有効な量のクエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩および少なくとも1種の賦形剤を含む制御放出投薬形態であって、

前記投薬形態を溶解媒体と組み合わせてから1時間後に前記クエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩の5から15%が放出され、

前記投薬形態を溶解媒体と組み合わせてから2時間後に前記クエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩の10から25%が放出され、

前記投薬形態を溶解媒体と組み合わせてから4時間後に前記クエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩の15から35%が放出され、

前記投薬形態を溶解媒体と組み合わせてから8時間後に前記クエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩の25から50%が放出されるような溶解度プロファイルを示すことを特徴とする制御放出投薬形態。

【請求項13】

請求項12に記載の制御放出投薬形態であって、

薬剤として有効な量のクエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩および少なくとも1種の賦形剤を含み、

前記投薬形態を溶解媒体と組み合わせてから16時間後に前記クエチアピンまたは前記薬剤として許容されるその塩の90%未満が放出されるような溶解度プロファイルを示すことを特徴とする制御放出投薬形態。

【請求項14】

請求項10に記載の制御放出投薬形態であって、

薬剤として有効な量のヘミフマル酸クエチアピンを含むことを特徴とする制御放出投薬形態。

【請求項15】

請求項10に記載の制御放出投薬形態であって、

前記溶解媒体は、0.1NのHClであることを特徴とする制御放出投薬形態。

【請求項16】

溶解度プロファイルをもたらす方法であって、

制御放出投薬形態を溶解媒体と組み合わせてから4時間後にクエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩の50から95%が放出されるように前記クエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩の前記制御放出投薬形態を前記溶解媒体と組み合わせることを含むことを特徴とする方法。

【請求項17】

請求項16に記載の溶解度プロファイルをもたらす方法であって、

前記投薬形態を前記溶解媒体と組み合わせてから1時間後に前記クエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩の30から80%が放出され、

前記投薬形態を前記溶解媒体と組み合わせてから2時間後に前記クエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩の40から85%が放出され、

前記投薬形態を前記溶解媒体と組み合わせてから3時間後に前記クエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩の45から90%が放出され、

前記投薬形態を前記溶解媒体と組み合わせてから4時間後に前記クエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩の50から95%が放出されるような溶解度プロファイルをもたらすことを特徴とする方法。

【請求項 18】

溶解度プロフィールをもたらす方法であって、クエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩の制御放出投薬形態を溶解媒体と組み合わせることを含み、

前記投薬形態を前記溶解媒体と組み合わせてから 1 時間後に前記クエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩の 5 から 15 % が放出され、

前記投薬形態を前記溶解媒体と組み合わせてから 2 時間後に前記クエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩の 10 から 25 % が放出され、

前記投薬形態を前記溶解媒体と組み合わせてから 4 時間後に前記クエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩の 15 から 35 % が放出され、

前記投薬形態を前記溶解媒体と組み合わせてから 8 時間後に前記クエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩の 25 から 50 % が放出されるような溶解度プロフィールをもたらすことを特徴とする方法。

【請求項 19】

請求項 18 に記載の方法であって、

前記投薬形態を前記溶解媒体と組み合わせてから 16 時間後に前記クエチアピンまたは前記薬剤として許容されるその塩の 90 % 未満が放出されるような溶解度プロフィールをもたらすことを特徴とする方法。

【請求項 20】

請求項 16 に記載の方法であって、

前記溶解媒体は、0.1 N の HCl であることを特徴とする方法。

【請求項 21】

経口腔投薬形態であって、

最高クエチアピン血漿濃度 (C_{max}) および投与してから約 24 時間後のクエチアピン血漿濃度 (C_{24}) をもたらし、 C_{max} 対 C_{24} の比が約 4 : 1 未満である制御放出形態のクエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩を含むことを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項 22】

請求項 21 に記載の経口腔投薬形態であって、

ヘミフマル酸クエチアピンを含むことを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項 23】

請求項 21 に記載の経口腔投薬形態であって、

前記比は、定常状態で達成されることを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項 24】

請求項 21 に記載の経口腔投薬形態であって、

C_{max} 対 C_{24} の比は、約 2 : 1 未満であることを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項 25】

経口腔投薬形態であって、

定常状態で、最高クエチアピン血漿濃度 (C_{max})、投与してから約 12 時間後のクエチアピン血漿濃度 (C_{12})、および投与してから約 24 時間後のクエチアピン血漿濃度 (C_{24}) をもたらし、 C_{max} と C_{12} との間の平均クエチアピン血漿濃度が C_{12} と C_{24} との間の平均クエチアピン血漿濃度を実質的に等しい制御放出形態のクエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩を含むことを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項 26】

請求項 25 に記載の経口腔投薬形態であって、

ヘミフマル酸クエチアピンを含むことを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項 27】

請求項 21 に記載の経口腔投薬形態であって、

投与してから 5.5 から 12 時間の間に C_{max} をもたらしことを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項 28】

請求項 21 に記載の経口腔投薬形態であって、

投与してから2から3.5時間の間に C_{max} をもたらすことを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項29】

経口腔投薬形態であって、

定常状態で、投与してから0時間から約12時間までの間の第1の最高クエチアピン血漿濃度(C_{max1})、および投与してから約12時間から約24時間の間の第2の最高クエチアピン血漿濃度(C_{max2})をもたらす持続放出形態のクエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩を含むことを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項30】

請求項29に記載の経口腔投薬形態であって、

ヘミフマル酸クエチアピンを含むことを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項31】

請求項29に記載の経口腔投薬形態であって、

定常状態で、投与してから0時間から約12時間までの間の第1の最高クエチアピン血漿濃度(C_{max1})、投与してから約12時間から約24時間の間の第2の最高クエチアピン血漿濃度(C_{max2})、および投与してから約24時間後のクエチアピン血漿濃度(C_{24})をもたらし、約 C_{max1} と約 C_{max2} との間の平均クエチアピン血漿濃度が約 C_{max2} と約 C_{24} との間の平均クエチアピン血漿濃度を実質的に等しいことを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項32】

請求項29に記載の経口腔投薬形態であって、

定常状態で、投与してから0時間から約12時間までの間の第1の最高クエチアピン血漿濃度(C_{max1})および第1の最低クエチアピン血漿濃度(C_{min1})、第2の最高クエチアピン血漿濃度(C_{max2})、および投与してから約24時間後のクエチアピン血漿濃度(C_{24})をもたらし、 C_{max1} 対 C_{min1} の比が約4:1未満であるか、または C_{max2} 対 C_{24} の比が約4:1未満であることを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項33】

請求項32に記載の経口腔投薬形態であって、

C_{max2} は、投与してから約12から約14時間後に生じることを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項34】

請求項32に記載の経口腔投薬形態であって、

C_{max1} 対 C_{min1} の比は、約8:5未満であることを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項35】

請求項32に記載の経口腔投薬形態であって、

C_{max2} 対 C_{24} の比は、約2:1未満であることを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項36】

請求項35に記載の経口腔投薬形態であって、

定常状態で、 C_{max1} 対 C_{min1} の比と C_{max2} 対 C_{24} の比の差は、約30%未満であることを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項37】

請求項36に記載の経口腔投薬形態であって、

C_{max1} 対 C_{min1} の比と C_{max2} 対 C_{24} の比の差は、約20%未満であることを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項38】

請求項36に記載の経口腔投薬形態であって、

C_{max1} 対 C_{min1} の比と C_{max2} 対 C_{24} の比の差は、約10%未満であることを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項39】

第1のサブユニットと第2のサブユニットを含む経口腔投薬形態であって、

前記第1のサブユニットは、クエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩、および第1の放出遅延物質を含み、

前記第2のサブユニットは、クエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩、および第2の放出遅延物質を含み、

前記第1および第2の放出遅延物質は、同じ場合も異なる場合もあり、前記投薬形態は、定常状態で、最高クエチアピン血漿濃度 (C_{max}) および投与してから約24時間後のクエチアピン血漿濃度 (C_{24}) をもたらし、 C_{max} 対 C_{24} の比は約4:1未満であることを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項40】

ヘミフマル酸クエチアピンの同じ強さの投薬形態により投与してから0から24時間の間にもたらされるAUCの80%超、120%未満である、投与してから0から24時間までの間のAUCをもたらし請求項21に記載の経口腔投薬形態であって、

前記ヘミフマル酸クエチアピンの同じ強さの投薬形態は、

ヘミフマル酸クエチアピンに対し約0.072:1の重量対重量比のポビドンと、

ヘミフマル酸クエチアピンに対し約0.087:1の重量対重量比の二塩基性リン酸二カルシウム水和物と、

ヘミフマル酸クエチアピンに対し約0.286:1の重量対重量比の微結晶性セルロースと、

ヘミフマル酸クエチアピンに対し約0.072:1の重量対重量比のグリコール酸デンプンナトリウムと、

ヘミフマル酸クエチアピンに対し約0.194:1の重量対重量比の乳糖一水和物と、

ヘミフマル酸クエチアピンに対し約0.026:1の重量対重量比のステアリン酸マグネシウムと、

ヘミフマル酸クエチアピンに対し約0.043:1の重量対重量比のヒドロキシプロピルメチルセルロースと、

ヘミフマル酸クエチアピンに対し約0.009:1の重量対重量比のポリエチレングリコールと、

ヘミフマル酸クエチアピンに対し約0.016:1の重量対重量比の二酸化チタンと、

を含むことを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項41】

ヘミフマル酸クエチアピンの当量の2倍を含む投薬形態により投与してから0から24時間の間にもたらされるAUCの80%超、120%未満である、投与してから0から24時間までの間のAUCをもたらし請求項21に記載の経口腔投薬形態であって、

前記ヘミフマル酸クエチアピンの当量の2倍を含む前記投薬形態は、

ヘミフマル酸クエチアピンに対し約0.072:1の重量対重量比のポビドンと、

ヘミフマル酸クエチアピンに対し約0.087:1の重量対重量比の二塩基性リン酸二カルシウム水和物と、

ヘミフマル酸クエチアピンに対し約0.286:1の重量対重量比の微結晶性セルロースと、

ヘミフマル酸クエチアピンに対し約0.072:1の重量対重量比のグリコール酸デンプンナトリウムと、

ヘミフマル酸クエチアピンに対し約0.194:1の重量対重量比の乳糖一水和物と、

ヘミフマル酸クエチアピンに対し約0.026:1の重量対重量比のステアリン酸マグネシウムと、

ヘミフマル酸クエチアピンに対し約0.043:1の重量対重量比のヒドロキシプロピルメチルセルロースと、

ヘミフマル酸クエチアピンに対し約0.009:1の重量対重量比のポリエチレングリコールと、

ヘミフマル酸クエチアピンに対し約0.016:1の重量対重量比の二酸化チタンと、

を含むことを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項 4 2】

経口腔投薬形態であって、

定常状態で、0 時間から約 1 2 時間までの間の第 1 の AUC (AUC_1) および約 1 2 時間から約 2 4 時間までの間の第 2 の AUC (AUC_2) をもたらし、 AUC_2 と AUC_1 との差は約 5 0 % 未満である持続放出形態のクエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩を含むことを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項 4 3】

請求項 4 2 に記載の経口腔投薬形態であって、

AUC_1 および AUC_2 はほぼ等しいことを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項 4 4】

請求項 2 9 に記載の経口腔投薬形態であって、

C_{max1} 対 C_{max2} の比は、約 1 : 1. 5 よりも大きく、約 1 : 4 よりも小さいことを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項 4 5】

請求項 4 4 に記載の経口腔投薬形態であって、

C_{max1} 対 C_{max2} の比は、1 : 3 よりも大きいことを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項 4 6】

請求項 4 4 に記載の経口腔投薬形態であって、

C_{max1} は、投与してから 0 から約 2. 5 時間の間に生じ、 C_{max2} は、投与してから約 1 0 から約 1 5 時間の間に生じることを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項 4 7】

請求項 4 4 に記載の経口腔投薬形態であって、

C_{max1} は、投与してから約 2. 5 から約 3. 5 時間の間に生じ、 C_{max2} は、投与してから約 1 0 から約 1 5 時間の間に生じることを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項 4 8】

請求項 4 4 に記載の経口腔投薬形態であって、

C_{max1} は、投与してから 5. 5 から約 1 2 時間の間に生じ、 C_{max2} は、投与してから約 1 2 から約 1 6 時間の間に生じることを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項 4 9】

精神病または双極性躁病の治療用の薬物の製造であって、

前記薬物はマトリックスを含み、

前記マトリックスは、

治療有効量のクエチアピンまたは薬剤として許容されるその塩と、

ロウ物質と、

を含むことを特徴とする製造。

【請求項 5 0】

請求項 2 1 に記載の経口腔投薬形態を含むことを特徴とする錠剤。

【請求項 5 1】

請求項 5 0 に記載の錠剤であって、

さらに、機能性または非機能性コーティングを含むことを特徴とする錠剤。

【請求項 5 2】

請求項 2 1 に記載の経口腔投薬形態を含むことを特徴とするカプセル。

【請求項 5 3】

請求項 2 1 に記載の経口腔投薬形態であって、

前記経口腔投薬形態は、ゲル化剤を含まないことを特徴とする経口腔投薬形態。

【請求項 5 4】

請求項 5 3 に記載の経口腔投薬形態であって、

前記経口腔投薬形態は、錠剤またはカプセルであることを特徴とする経口腔投薬形態。