

【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2年7月16日(2020.7.16)

【公開番号】特開2020-59755(P2020-59755A)

【公開日】令和2年4月16日(2020.4.16)

【年通号数】公開・登録公報2020-015

【出願番号】特願2019-234192(P2019-234192)

【国際特許分類】

| | | |
|---------|-------|-----------|
| A 6 1 K | 9/50 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/04 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/08 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 3/10 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 31/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 35/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/16 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 29/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 9/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/26 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 1/04 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 1/08 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 25/36 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 43/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 11/06 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 21/02 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 9/20 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 47/32 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 47/38 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 47/36 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 47/46 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 47/34 | (2017.01) |
| A 6 1 K | 47/14 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 47/44 | (2017.01) |
| A 6 1 K | 9/48 | (2006.01) |

【F I】

| | | |
|---------|-------|-------|
| A 6 1 K | 9/50 | |
| A 6 1 P | 25/04 | |
| A 6 1 P | 25/08 | |
| A 6 1 P | 3/10 | |
| A 6 1 P | 31/00 | |
| A 6 1 P | 35/00 | |
| A 6 1 P | 25/16 | |
| A 6 1 P | 29/00 | 1 0 1 |
| A 6 1 P | 9/00 | |
| A 6 1 P | 25/00 | |
| A 6 1 P | 25/26 | |
| A 6 1 P | 1/04 | |
| A 6 1 P | 1/08 | |
| A 6 1 P | 25/36 | |

| | | |
|---------|-------|-------|
| A 6 1 P | 43/00 | 1 1 3 |
| A 6 1 P | 11/06 | |
| A 6 1 P | 21/02 | |
| A 6 1 K | 9/20 | |
| A 6 1 K | 47/32 | |
| A 6 1 K | 47/38 | |
| A 6 1 K | 47/36 | |
| A 6 1 K | 47/46 | |
| A 6 1 K | 47/34 | |
| A 6 1 K | 47/14 | |
| A 6 1 K | 47/44 | |
| A 6 1 K | 9/48 | |

【手続補正書】

【提出日】令和2年4月20日(2020.4.20)

【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種または複数種の時限パルス放出ビーズを含む医薬組成物であって、

少なくとも1種の時限パルス放出ビーズが、

a) 活性薬剤成分またはその薬学的に許容される塩を含むコア粒子と、

b) 水溶性造孔高分子と組み合わせて水不溶性高分子を含む内側バリアコーティングと

c) 水不溶性高分子を腸溶性高分子と組み合わせて含む外側遅延コーティングであって、当該外側遅延コーティングの量が、前記時限パルス放出ビーズの少なくとも30重量%である、外側遅延コーティングと、

を含み、

前記水不溶性高分子が、エチルセルロース、酢酸セルロース、酢酸酪酸セルロース、ポリ酢酸ビニル、メタクリル酸メチルエステルの重合体、アクリル酸エチルとメタクリル酸メチルとの中性共重合体、アクリル酸エステルとメタアクリル酸エステルとの共重合体、およびそれらの混合物からなる群から選択され、

前記水溶性造孔高分子が、ポリビニルピロリドン、メチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリエチレングリコール、およびそれらの混合物からなる群から選択され、

前記腸溶性高分子が、酢酸フタル酸セルロース、フタル酸ヒドロキシプロピルメチルセルロース、コハク酸ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリ酢酸ビニルフタレート、pH感受性メタクリル酸-メタクリル酸メチル共重合体、シェラック、およびそれらの混合物からなる群から選択され、

前記内側バリアコーティングにおける水不溶性高分子と水溶性造孔高分子との重量比が9:1~1:1の範囲に及び、

前記外側遅延コーティングにおける前記水不溶性高分子と前記腸溶性高分子との重量比が10:1~1:2の範囲に及ぶ、医薬組成物。

【請求項2】

前記活性薬剤成分が、鎮痛薬、抗痙攣薬、抗糖尿病剤、抗感染剤、抗悪性腫瘍薬、抗パーキンソン病薬、抗リウマチ剤、心血管薬、中枢神経系刺激薬、ドーパミン受容体作動薬、制吐薬、胃腸薬、精神療法薬、オピオイド作動薬、オピオイド拮抗薬、抗てんかん剤、

ヒスタミンH₂拮抗薬、抗喘息薬、および骨格筋弛緩剤、ならびにそれらの混合からなる群から選択される、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項3】

一日1回または2回の投与計画に適した目標薬物動態プロファイルを与える2種以上の時限パルス放出ビーズ集団を含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項4】

前記コア粒子が、
i) 前記活性薬剤成分と任意選択の高分子結合剤とで被覆された不活性粒子、あるいは

i i) 前記わずかに酸性の活性薬剤成分を含有するペレット、ミニもしくはミクロ錠剤、微粒剤または顆粒状粒子を含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項5】

前記高分子結合剤が、ポリビニルピロリドン、メチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、コーンスター、アルファ化でんぶん、およびそれらの混合物からなる群から選択される、請求項4に記載の医薬組成物。

【請求項6】

前記内側バリアコーティングが1.5~20重量%のバリア被覆ビーズを含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項7】

前記内側バリアコーティング及び前記外側遅延コーティングの少なくとも一つが、可塑剤を含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項8】

即時放出ビーズをさらに含み、
各即時放出ビーズが、前記わずかに酸性の活性薬剤成分またはその薬学的に許容される塩を含むコア粒子を含み、
前記即時放出ビーズが、前記医薬組成物の経口投与後の初めの1時間以内に前記即時放出ビーズに含まれている前記わずかに酸性の活性薬剤成分の90%以上を放出する、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項9】

(1) 第2の時限パルス放出ビーズ集団、または(2)即時放出ビーズ集団、または(3)第2の時限パルス放出ビーズ集団および即時放出ビーズ集団の混合物をさらに含み、
前記第1及び第2の時限パルス放出ビーズ集団が、異なる放出特性を示す、医薬組成物。

【請求項10】

前記外側遅延コーティングが、エチルセルロースをフタル酸ヒドロキシプロピルメチルセルロースと組み合わせて含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項11】

前記外側遅延コーティングにおける前記水不溶性高分子と前記腸溶性高分子との重量比が3:1~1:1の範囲に及ぶ、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項12】

1種の即時放出ビーズ集団と、2種の時限パルス放出ビーズ集団とを含み、
前記即時放出ビーズ集団と前記第1の時限パルス放出ビーズ集団と前記第2の時限パルス放出ビーズ集団との重量比が、10/20/70~30/60/10の範囲に及ぶ、請求項9に記載の医薬組成物。

【請求項13】

カプセル、錠剤、または経口崩壊性錠剤の形態をとる、請求項9に記載の医薬組成物。

【請求項14】

前記外側遅延コーティングが、腸溶性高分子と組み合わせた水不溶性高分子から本質的になる、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項15】

U S P 装置 1 または 2、および二段階溶出溶媒（最初に 700 mL の 0.1 N の HCl 中に 2 時間、その後に 900 mL（pH 6.8）中）を用いて試験を行ったときに、前記時限パルス放出ビーズが薬物放出開始までに最長 10 時間の遅延時間をもたらし、活性薬剤成分の 10% 未満が遅延時間の間に放出される、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

2 種以上の活性薬剤成分を含む、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

第 1 の時限パルス放出ビーズ集団および第 2 の時限パルス放出ビーズ集団を含み、前記第 1 及び第 2 の時限パルス放出ビーズ集団が、異なる放出特性を示す、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

2 種以上の活性薬剤成分を含む、請求項 17 に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

第 1 の時限パルス放出ビーズ集団および即時放出ビーズ集団を含み、2 種以上の活性薬剤成分を含む、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 20】

第 1 の時限パルス放出ビーズ集団、第 2 の時限パルス放出ビーズ集団、および即時放出ビーズ集団を含み、前記第 1 及び第 2 の時限パルス放出ビーズ集団が異なる放出特性を示す、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 21】

2 種以上の活性薬剤成分を含む、請求項 18 に記載の医薬組成物。

【請求項 22】

外側遅延コーティングの量が、前記時限パルス放出ビーズの 40 ~ 55 重量 % である、請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 23】

活性薬剤成分が酸性薬物である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 24】

活性薬剤成分が塩基性薬物である、請求項 1 に記載の医薬組成物。