

【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3年9月30日(2021.9.30)

【公表番号】特表2020-532548(P2020-532548A)

【公表日】令和2年11月12日(2020.11.12)

【年通号数】公開・登録公報2020-046

【出願番号】特願2020-512637(P2020-512637)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/167	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	37/08	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 K	9/14	(2006.01)
A 6 1 K	9/20	(2006.01)
A 6 1 K	9/28	(2006.01)
A 6 1 K	9/48	(2006.01)
A 6 1 K	9/56	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/167
A 6 1 P	17/00
A 6 1 P	37/08
A 6 1 P	11/06
A 6 1 K	9/14
A 6 1 K	9/20
A 6 1 K	9/28
A 6 1 K	9/48
A 6 1 K	9/56

【手続補正書】

【提出日】令和3年8月18日(2021.8.18)

【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

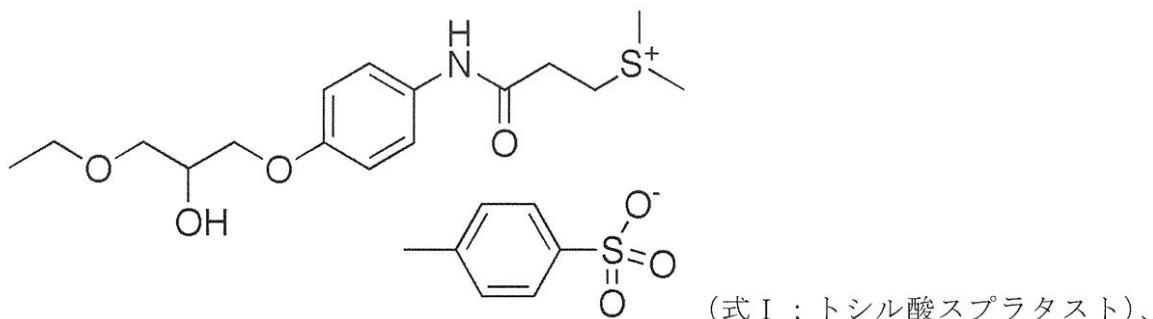
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物：

【化1】



または薬学的に許容されるその塩、エステル、プロドラッグ、前駆体または結晶形態を含

む医薬組成物であって、

- a . 前記化合物を含み、前記化合物の持続放出を提供する、第1の放出構成要素と、
- b . 前記化合物を含み、前記化合物の即時放出を提供する、第2の放出構成要素と、
を、分離してまたは一緒に含む、前記組成物。

【請求項2】

前記トシリ酸スプラタストがラセミ化合物であり、および／または、

前記トシリ酸スプラタストが、(+) - トシリ酸スプラタスト鏡像異性体であるかまたはそれを含み、および／または、

前記トシリ酸スプラタストが、(-) - トシリ酸スプラタスト鏡像異性体であるかまたはそれを含む、

請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

前記医薬組成物が医薬投薬形態である、請求項1および2のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項4】

前記組成物が、固体投薬形態、経口投薬形態、および／または経口固体投薬形態である、請求項1～3のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項5】

前記組成物が、錠剤、ミニ錠剤、マイクロ錠剤、球体、ペレット、顆粒およびカプセルからなる群から選択され、および／または、

前記組成物がコーティング(フィルムコーティング等)を含み、および／または、

前記組成物が、コーティングされた錠剤、コーティングされたミニ錠剤、コーティングされたマイクロ錠剤、コーティングされた球体、コーティングされたペレット、コーティングされた顆粒およびコーティングされたカプセルからなる群から選択される、

請求項1～4のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項6】

前記組成物が、前記第1の放出構成要素および前記第2の放出構成要素を、分離した区画または層中で含み、および／または、

前記組成物が、

a . 前記化合物の持続放出を提供する内部コアである、第1の放出構成要素と、

b . 前記化合物の即時放出を提供する外部のコーティングまたは層である、第2の放出構成要素と、

を含み、そこで、前記第2の放出構成要素の外部のコーティングまたは層が前記第1の放出構成要素の内部コアの上へ適用され、および／または、

前記組成物が、

a . 前記化合物の持続放出を提供する錠剤、ミニ錠剤、球体、ペレットまたは顆粒である、第1の放出構成要素と、

b . 前記錠剤、ミニ錠剤、球体、ペレットまたは顆粒上の外部コーティングであり、前記化合物の即時放出を提供する、第2の放出構成要素と、

を含み、および／または、

前記組成物が、

a . 前記化合物の持続放出を提供する外部層である、第1の放出構成要素と、

b . 前記化合物の即時放出を提供する内部コアである、第2の放出構成要素と、

を含み、そこで、前記第1の放出構成要素の外部のコーティングまたは層が前記第2の放出構成要素の内部コアの上へ適用される、

請求項1～5のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項7】

前記組成物が、

a . 前記化合物の持続放出を提供する第1の放出層と、

b . 前記化合物の即時放出を提供する第2の放出層と、

を含み、

そこで、各々の層が同じ錠剤内に存在する、

二層化された錠剤である、請求項1～6のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項8】

前記組成物が、2つ以上の投薬形態を分離してまたは一緒に含む多重微粒子投薬形態である、請求項1～7のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項9】

前記組成物が、

a. 1つまたは複数の持続放出の錠剤、ミニ錠剤、顆粒またはペレットである、第1の放出構成要素と、

b. 1つまたは複数の即時放出の錠剤、ミニ錠剤、顆粒またはペレットである、第2の放出構成要素と、

を含み、および／または、

前記組成物が、

a. 半透過性フィルムを含む1つまたは複数の持続放出の錠剤またはミニ錠剤である、第1の放出構成要素と、

b. 可溶性フィルムを含む1つまたは複数の即時放出の錠剤またはミニ錠剤である、第2の放出構成要素と、

を含み、および／または、

前記組成物が、

a. 複数の持続放出の錠剤、ミニ錠剤、顆粒またはペレットである、第1の放出構成要素と、

b. 複数の即時放出の錠剤、ミニ錠剤、顆粒またはペレットである、第2の放出構成要素と、

を含み、そこで、前記第1の放出構成要素および第2の放出構成要素が、適切な容器（カプセル、パウチ、分包またはスティックパック等）中で一緒に提供される、

請求項1～8のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項10】

最初に前記第2の放出構成要素からの即時放出が、続いておよび隨意にオーバーラップして、前記第1の放出構成要素からの持続放出が起こり、および／または、

前記第2の放出構成要素からの即時放出および前記第1の放出構成要素からの持続放出が、同時に起こり、および／または、

最初に前記第1の放出構成要素からの持続放出が、続いておよび隨意にオーバーラップして、前記第2の放出構成要素からの即時放出が起こる、

請求項1～9のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項11】

前記第1の放出構成要素（ER）が、50～500mgのトシリ酸スプラタストまたは薬学的に許容されるその塩またはエステル（50～100mg、100～150mg、150～200mg、200～250mg、250～300mg、300～350mg、350～400mg、400～450mg、450～500mg等；50mg、100mg、150mg、200mg、250mg、300mg、350mg、400mg、450mgまたは500mg等のトシリ酸スプラタストまたは薬学的に許容されるその塩またはエステル）の投薬量を含み；

前記第2の放出構成要素（IR）が、25～250mgのトシリ酸スプラタストまたは薬学的に許容されるその塩またはエステル（25～50mg、50～75mg、75～100mg、100～150mg、150～200mg、200～250mg等；25mg、50mg、75mg、100mg、150mg、200mgまたは250mg等のトシリ酸スプラタストまたは薬学的に許容されるその塩またはエステル）の投薬量を含む、請求項1～10のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項12】

前記第1の放出構成要素および第2の放出構成要素が各々、1つまたは複数の賦形剤を含み、および／または、

前記第1の放出構成要素および第2の放出構成要素が各々、1つまたは複数の放出制御賦形剤を含む、

請求項1～11のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項13】

前記第1の放出構成要素が、持続放出を提供する1つまたは複数の放出制御賦形剤を含み、および／または、

前記第2の放出構成要素が、即時放出を提供する賦形剤（フィルム形成賦形剤等）を含む、

請求項1～12のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項14】

前記組成物が、1つまたは複数のさらなる医薬品有効成分を分離してまたは一緒に含む、
請求項1～13のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項15】

前記組成物が、1日1回（朝にまたは夜／睡眠の前に等）投与される予定であり、およ
び／または、

前記組成物が、1日2回（朝におよび夜／睡眠の前に等）投与される予定であり、およ
び／または、

前記組成物が、朝におよび／または夜／睡眠の前に；疾患の急性症状を緩和するために
要求に応じてまたは必要に応じて、投与される予定である、

請求項1～14のいずれか一項に記載の組成物。