

【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

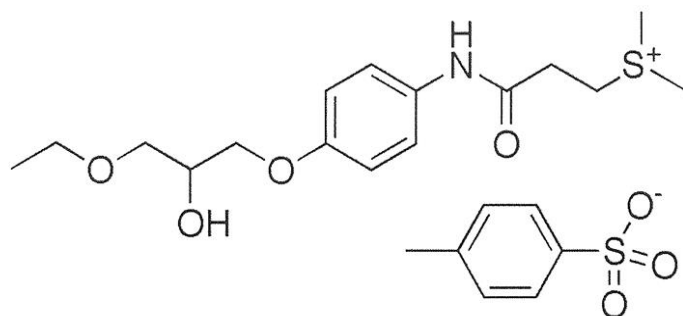
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の化合物：

【化 1】



(式 I ; トシル酸スプラタスト)、

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】

前記トシル酸スプラタストがラセミ化合物であり、および／または、
前記トシル酸スプラタストが、(+) - トシル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、
前記トシル酸スプラタストが、(-) - トシル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、続いておよび随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、続いておよび随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 ～ 500 mg のトシル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 ～ 100 mg、100 ～ 150 mg、150 ～ 200 mg、200 ～ 250 mg、250 ～ 300 mg、300 ～ 350 mg、350 ～ 400 mg、400 ～ 450 mg、450 ～ 500 mg 等；50 mg、100 mg、150 mg、200 mg、250 mg、300 mg、350 mg、400 mg、450 mg または 500 mg 等のトシル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 ～ 250 mg のトシル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 ～ 50 mg、50 ～ 75 mg、75 ～ 100 mg、100 ～ 150 mg、150 ～ 200 mg、200 ～ 250 mg 等；25 mg、50 mg、75 mg、100 mg、150 mg、200 mg または 250 mg 等のトシル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 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 1 3】

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 ~ 1 2 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 1 4】

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 ~ 1 3 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 1 5】

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 ~ 1 4 のいずれか一項に記載の組成物。