

【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25年8月22日(2013.8.22)

【公表番号】特表2012-532194(P2012-532194A)

【公表日】平成24年12月13日(2012.12.13)

【年通号数】公開・登録公報2012-053

【出願番号】特願2012-519612(P2012-519612)

【国際特許分類】

A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 K	9/48	(2006.01)
A 6 1 K	9/54	(2006.01)
A 6 1 K	47/38	(2006.01)
A 6 1 K	47/32	(2006.01)
A 6 1 K	47/44	(2006.01)
A 6 1 K	47/12	(2006.01)
A 6 1 K	47/18	(2006.01)
A 6 1 K	47/14	(2006.01)
A 6 1 K	47/34	(2006.01)
A 6 1 K	31/4178	(2006.01)
A 6 1 K	31/46	(2006.01)
A 6 1 K	31/439	(2006.01)
A 6 1 K	31/4184	(2006.01)
A 6 1 K	45/06	(2006.01)
A 6 1 K	31/485	(2006.01)
A 6 1 K	47/26	(2006.01)
A 6 1 K	47/24	(2006.01)
A 6 1 P	1/08	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	45/00
A 6 1 K	9/48
A 6 1 K	9/54
A 6 1 K	47/38
A 6 1 K	47/32
A 6 1 K	47/44
A 6 1 K	47/12
A 6 1 K	47/18
A 6 1 K	47/14
A 6 1 K	47/34
A 6 1 K	31/4178
A 6 1 K	31/46
A 6 1 K	31/439
A 6 1 K	31/4184
A 6 1 K	45/06
A 6 1 K	31/485
A 6 1 K	47/26
A 6 1 K	47/24
A 6 1 P	1/08

A 6 1 P 25/28  
A 6 1 P 43/00 1 2 1

【手続補正書】

【提出日】平成25年7月2日(2013.7.2)

【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】

P O N V又はP D N Vの処置方法又は予防方法で用いられる、選択的セロトニン5-HT<sub>3</sub>拮抗薬を含む少なくとも1つの持続放出型の製剤であって、当該製剤が手術の前及び/又は後に、前記製剤が必要な手術患者に経口投与される、製剤。

【請求項2】

前記持続放出製剤がTPR粒子及びIR粒子を含み、

前記TPR粒子それぞれがTPR層でコーティングされたコアを含み；

前記コアが、選択的セロトニン5-HT<sub>3</sub>拮抗薬及び薬学的に許容される有機酸を含み、前記選択的セロトニン5-HT<sub>3</sub>拮抗薬と前記薬学的に許容される有機酸がSR層により互いに隔てられており；

前記TPR層が、非水溶性ポリマー及び腸溶性ポリマーを含み；

前記SR層が、非水溶性ポリマーを含み；

前記IR粒子それぞれが、選択的セロトニン5-HT<sub>3</sub>拮抗薬を含み、米国薬局方の溶解方法を用いて溶解試験した時に(装置2-50RPMでパドル、0.1N HCl、37)約5分以内に前記選択的セロトニン5-HT<sub>3</sub>拮抗薬の少なくとも約80wt%を放出する。

請求項1に記載の製剤。

【請求項3】

前記選択的セロトニン5-HT<sub>3</sub>拮抗薬が、オンドンセトロン、トロピセトロン、グラニセトロン、ドラセトロン、パロノセトロン、ラモセトロン、並びにその塩及び/又は溶媒和物からなる群から選択される、請求項1に記載の製剤。

【請求項4】

前記選択的セロトニン5-HT<sub>3</sub>拮抗薬が、オンドンセトロン並びにその塩及び/又は溶媒和物である、請求項1に記載の製剤。

【請求項5】

前記TPR層及び前記SR層の前記非水溶性ポリマーが、独立して、エチルセルロース、酢酸セルロース、ポリ酢酸ビニル、エチルアクリラートとメチルメタクリラートの中性コポリマー、第四級アンモニウム基を含むアクリル酸エステルとメタクリル酸エステルのコポリマー、及びワックスからなる群から選択され；

前記腸溶性ポリマーが、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、酢酸コハク酸ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリ酢酸フタル酸ビニル、メタクリル酸とメチルメタクリラートのpH感受性コポリマー、及びセラックからなる群から選択され；

前記薬学的に許容される有機酸が、クエン酸、乳酸、フマル酸、リンゴ酸、マレイン酸、酒石酸、コハク酸、シウ酸、アスパラギン酸、及びグルタミン酸からなる群から選択される、

請求項2に記載の製剤。

【請求項6】

前記TPR層及び/又は前記SR層が、それぞれ独立して、薬学的に許容される可塑剤

を更に含む、請求項 5 に記載の製剤。

【請求項 7】

前記 T P R 層及び / 又は前記 S R 層の前記薬学的に許容される可塑剤が、独立して、トリアセチン、クエン酸トリブチル、クエン酸トリエチル、アセチルトリ - n - ブチルシトラート、フタル酸ジエチル、セバシン酸ジブチル、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、ひまし油、アセチル化モノ - 及びジ - グリセリド、並びにこれらの混合物からなる群から選択される、請求項 6 に記載の製剤。

【請求項 8】

前記 T P R 粒子それが、

不活性ビーズ；

前記不活性ビーズ上に設けられた、薬学的に許容される有機酸を含む酸層；

前記酸層上に設けられた S R 層；

前記 S R 層上に設けられた、選択的セロトニン 5 - H T<sub>3</sub> 拮抗薬を含む薬物層；及び

前記薬物層上に設けられた T P R 層

を含む請求項 2 に記載の製剤。

【請求項 9】

前記不活性粒子が、25 ~ 30 メッシュの平均粒径を有し、白糖球状顆粒、セルロース球状顆粒、ラクトース球状顆粒、ラクトース - M C C 球状顆粒、マンニトール - M C C 球状顆粒、及び二酸化シリコーン球状顆粒からなる群から選択される、請求項 8 に記載の製剤。

【請求項 10】

前記酸層がフマル酸を含み；

前記 S R 層がエチルセルロースを含み；

前記薬物層がオンドンセトロン又はその薬学的に許容される塩若しくは溶媒和物を含み；

前記 T P R 層がエチルセルロース及びフタル酸ヒドロキシプロピルメチルセルロースを含む、

請求項 9 に記載の製剤。

【請求項 11】

前記 I R 粒子が、薬学的に許容される有機酸を更に含み、前記 I R 粒子及び前記 T P R 粒子の前記薬学的に許容される有機酸が同じか異なる、請求項 2 に記載の製剤。

【請求項 12】

前記 I R 粒子が、前記薬学的に許容される有機酸、前記選択的セロトニン 5 - H T<sub>3</sub> 拮抗薬、及び必要に応じて用いるバインダーを含む顆粒化物である、請求項 11 に記載の製剤。

【請求項 13】

前記 I R 粒子が、フマル酸、オンドンセトロン又はその薬学的に許容される塩及び / 若しくは溶媒和物、並びにバインダーを含む顆粒化物である、請求項 12 に記載の製剤。

【請求項 14】

前記 I R 粒子が、フマル酸、オンドンセトロン又はその薬学的に許容される塩及び / 若しくは溶媒和物、並びにバインダーを含む顆粒化物である、請求項 10 に記載の製剤。

【請求項 15】

前記持続放出製剤が、治療有効量の前記 T P R 粒子及び前記 I R 粒子を含むカプセルであり、これにより、前記カプセルに含まれるオンドンセトロン又はその薬学的に許容される塩及び / 若しくは溶媒和物の総量がオンドンセトロン 24 mg 相当する、請求項 14 に記載の製剤。

【請求項 16】

前記患者が以下の基準：

( a ) 女性；

( b ) P O N V 及び / 又は動搖病の既往歴；

- ( c ) 非喫煙者；
- ( d ) 前記患者が外来手術を受けた；
- ( e ) 前記患者が少なくとも 60 分間の外来手術を受けた；
- ( f ) 前記患者が吸入によるバランス麻酔である全身麻酔を受けた；
- ( g ) 前記患者が亜酸化窒素麻酔を受けた；
- ( h ) 前記患者が、手術中又は手術後にオピオイドを投与されている；
- ( i ) 前記患者が、腹腔鏡検査、耳鼻咽喉、脳神経手術、乳房手術 (breast surgery)、斜視手術、開腹手術、及び形成手術からなる群から選択される手術を受けた；

のうちの 1 以上を満たす、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 17】

オピオイド鎮痛薬が手術後に前記手術患者に更に処置される、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 18】

オピオイド鎮痛薬が手術後に前記手術患者に更に処置される、請求項 15 に記載の製剤

。

【請求項 19】

少なくとも 1 つの更なる経口制吐薬が更に投与される、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 20】

少なくとも 1 つの更なる経口制吐薬が更に投与される、請求項 15 に記載の製剤。