

【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30年7月19日 (2018.7.19)

【公表番号】特表2017-517551(P2017-517551A)

【公表日】平成29年6月29日 (2017.6.29)

【年通号数】公開・登録公報2017-024

【出願番号】特願2016-572654(P2016-572654)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/5415 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 9/16 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/5415

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 25/04

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 47/26

C 0 7 D 417/12

【手続補正書】

【提出日】平成30年6月7日 (2018.6.7)

【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】

メロキシカム 5 m g を含む医薬組成物の単位剤形であって、単回用量が、絶食状態の健康成人の集団に経口投与したとき、 $7,500\text{ h} \cdot \text{ng} / \text{mL} \sim 20,000\text{ h} \cdot \text{ng} / \text{mL}$ の平均血漿中 AUC (0 -) を提供することを特徴とする単位剤形。

【請求項 2】

単回用量が、絶食状態の健康成人の集団に経口投与したとき、 $350\text{ ng} / \text{mL} \sim 950\text{ ng} / \text{mL}$ の平均血漿中 Cmax を提供する請求項 1 に記載の単位剤形。

【請求項 3】

溶出速度が、 37 ± 0.5 で 0.1% ラウリル硫酸ナトリウム (SLS) を含む pH 6.1 のリン酸緩衝液 500 mL 中にて回転速度 100 RPM に設定した USP 装置 1 (バスケット) を用いて試験したとき、30 分間以下；20 分間以下；10 分間以下；8 分間以下；7 分間以下；6 分間以下；及び 5 分間以下から選択される期間に前記メロキシカムの少なくとも 80% が溶出するような速度である請求項 1 に記載の単位剤形。

【請求項 4】

単回用量が、絶食状態の健常成人の集団に経口投与したとき、 $13,610 \text{ ng} \cdot \text{h} / \text{mL}$ の 80% ~ 125% である平均血漿中 AUC (0 -) を提供する請求項 1 に記載の単位剤形。

【請求項 5】

単回用量が、絶食状態の健常成人の集団に経口投与したとき、 7.5 mg Mobic 錠剤の AUC (0 -) の 60% ~ 80% である平均血漿中 AUC (0 -) を提供する請求項 1 に記載の単位剤形。

【請求項 6】

単回用量が、絶食状態の健常成人の集団に経口投与したとき、 7.5 mg Mobic 錠剤の Cmax の 80% ~ 125% である平均血漿中 Cmax を提供する請求項 1 に記載の単位剤形。

【請求項 7】

メロキシカム 10 mg を含む単位剤形であって、単回用量が、絶食状態の健常成人の集団に経口投与したとき、 $16,000 \text{ h} \cdot \text{ng} / \text{mL} \sim 44,000 \text{ h} \cdot \text{ng} / \text{mL}$ の平均血漿中 AUC (0 -) を提供することを特徴とする単位剤形。

【請求項 8】

単回用量が、絶食状態の健常成人の集団に経口投与したとき、 $700 \text{ ng} / \text{mL} \sim 1,900 \text{ ng} / \text{mL}$ の平均血漿中 Cmax を提供する請求項 7 に記載の単位剤形。

【請求項 9】

前記メロキシカムの粒子が、 $100 \text{ nm} \sim 5,000 \text{ nm}$ の体積平均に基づく中央粒径を有する請求項 1 又は 7 に記載の単位剤形。

【請求項 10】

前記メロキシカムの粒子の D (0.9) が、 $3,000 \text{ nm}$ 未満である請求項 1 又は 7 に記載の単位剤形。

【請求項 11】

前記メロキシカムの粒子の表面重み付け平均直径 (D [3, 2]) が、 $100 \text{ nm} \sim 800 \text{ nm}$ である請求項 1 又は 7 に記載の単位剤形。

【請求項 12】

前記メロキシカムの粒子の体積重み付け平均直径 (D [4, 3]) が、 $400 \text{ nm} \sim 1,300 \text{ nm}$ である請求項 1 又は 7 に記載の単位剤形。

【請求項 13】

溶出速度が、 37 ± 0.5 で 0.1% ラウリル硫酸ナトリウム (SLS) を含む pH 6.1 のリン酸緩衝液 1,000 mL 中にて回転速度 100 RPM に設定した USP 装置 1 (バスケット) を用いて試験したとき、30 分間以下；20 分間以下；15 分間以下；14 分間以下；13 分間以下；12 分間以下；11 分間以下；10 分間以下；及び 5 分間以下から選択される期間に前記メロキシカムの少なくとも 80% が溶出するような速度である請求項 7 に記載の単位剤形。

【請求項 14】

単回用量が、絶食状態の健常成人の集団に経口投与したとき、1 時間 ~ 3 時間の中央血漿中 Tmax を提供する請求項 1 又は 7 に記載の単位剤形。

【請求項 15】

単回用量が、絶食状態の健常成人の集団に経口投与したとき、 15 mg Mobic 錠剤の平均血漿中 AUC (0 -) の 60% ~ 80% である平均血漿中 AUC (0 -) を提供する請求項 7 に記載の単位剤形。

【請求項 16】

単回用量が、絶食状態の健常成人の集団に経口投与したとき、15mg Mobic錠剤の平均血漿中Cmaxの80%～125%である平均血漿中Cmaxを提供する請求項7に記載の単位剤形。

【請求項 17】

メロキシカム10mgを含む医薬組成物の単位剤形であって、単回用量が、摂食状態の健常成人の集団に経口投与したとき、525ng/mL～1,500ng/mLの平均血漿中Cmaxを提供することを特徴とする単位剤形。

【請求項 18】

単回用量が、摂食状態の健常成人の集団に経口投与したとき、3時間～7時間の中央血漿中Tmaxを提供する請求項17に記載の単位剤形。

【請求項 19】

単回用量が、摂食状態の健常成人の集団に経口投与したとき、15,000h*ng/mL～42,000h*ng/mLの平均血漿中AUC(0-)を提供する請求項17に記載の単位剤形。

【請求項 20】

変形性関節症又は関節リウマチの治療ために使用される請求項1から19のいずれかに記載の単位剤形。

【請求項 21】

請求項1から20のいずれかに記載の単位剤形を含むことを特徴とするカプセル剤又は錠剤。