

【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31年2月28日(2019.2.28)

【公表番号】特表2018-501292(P2018-501292A)

【公表日】平成30年1月18日(2018.1.18)

【年通号数】公開・登録公報2018-002

【出願番号】特願2017-536831(P2017-536831)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/30 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/16 (2006.01)

A 6 1 K 31/65 (2006.01)

A 6 1 K 31/351 (2006.01)

A 6 1 K 31/7036 (2006.01)

A 6 1 K 31/216 (2006.01)

A 6 1 K 38/02 (2006.01)

A 6 1 K 38/22 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 9/30

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/18

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/32

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 31/16

A 6 1 K 31/65

A 6 1 K 31/351

A 6 1 K 31/7036

A 6 1 K 31/216

A 6 1 K 38/02

A 6 1 K 38/22

【手続補正書】

【提出日】平成31年1月11日(2019.1.11)

【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】

(a) (i) ペプチド、ペプチド模倣物、小分子、またはそれらの組み合わせである有効量の活性医薬成分、(ii) 酸性粒子が水溶性コーティング剤でコーティングされているコーティングされた酸性粒子であり、このコーティングされた酸性粒子の酸である pH 低下剤、(iii) 吸収促進剤、(iv) 2% 溶液が 20℃ で 3,000 cP から 120,000 cP の粘度を有するヒドロゲル形成ポリマーを有するフィラー、及び (v) 前記活性医薬成分、前記コーティングされた粒子、前記吸収促進剤、前記フィラー及び 0.01 重量% 以下の崩壊剤が混合されている 0.01 重量% 以下の崩壊剤、を有しているコアと、

(b) 前記コアを囲む約 5 mg/cm² から約 25 mg/cm² の腸溶性コーティングとからなる改良された放出固体経口組成物 (release solid oral composition) であって、

前記組成物は、T_{lag} が投与後 1.0 時間以上で 16 時間以下、T_{max} が投与後 (T_{lag} + 0.5 時間) 以上で 20 時間以下、の活性薬剤の薬物動態プロファイルをもち、

前記組成物が 10 mL の 0.1 M 重炭酸ナトリウム水溶液に加えられれば、溶液の pH が 5.5 より高くないように低下されることを特徴とする放出固体経口組成物。

【請求項 2】

(a) (i) ペプチド、ペプチド模倣物、小分子、またはそれらの組み合わせである有効量の活性医薬成分、(ii) 酸性粒子が水溶性コーティング剤でコーティングされているコーティングされた酸性粒子であり、このコーティングされた酸性粒子の酸である pH 低下剤、(iii) 吸収促進剤、(iv) 2% 溶液が 20℃ で 3,000 cP から 120,000 cP の粘度を有するヒドロゲル形成ポリマーを有するフィラーを含有し、前記活性医薬成分、前記コーティングされた粒子、前記吸収促進剤、及び前記フィラーが混合されており、実質的に崩壊剤を含有しないコアと、

(b) 前記コアを囲む約 5 mg/cm² から約 25 mg/cm² の腸溶性コーティングとからなる改良された放出固体経口組成物 (release solid oral composition) であって、

前記組成物は、T_{lag} が投与後 1.0 時間以上で 16 時間以下、T_{max} が投与後 (T_{lag} + 0.5 時間) 以上で 20 時間以下、の活性薬剤の薬物動態プロファイルをもち、

前記組成物が 10 mL の 0.1 M 重炭酸ナトリウム水溶液に加えられれば、溶液の pH が 5.5 より高くないように低下されることを特徴とする放出固体経口組成物。

【請求項 3】

さらに、前記腸溶性コーティングの下に水溶性バリア層を有することを特徴とする請求項 1 又は 2 に記載の放出固体経口組成物。

【請求項 4】

前記吸収促進剤が、約 1.0 mM から約 40 mM の臨界ミセル濃度を有することを特徴とする請求項 1 又は 2 に記載の放出固体経口組成物。

【請求項 5】

前記フィラーが、微結晶性セルロース、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、キトサン、またはそれらの組み合わせであることを特徴とする請求項 1 又は 2 に記載の放出固体経口組成物。

【請求項 6】

前記吸収促進剤が、カチオン性界面活性剤、アニオン性界面活性剤、またはそれらの組み合わせであることを特徴とする請求項 1 又は 2 に記載の放出固体経口組成物。

【請求項 7】

前記 pH 低下剤が、クエン酸、酒石酸、またはそれらの組み合わせであることを特徴とする請求項 1 又は 2 に記載の放出固体経口組成物。

【請求項 8】

約 50 mg から約 500 mg のクエン酸を有することを特徴とする請求項 1 又は 2 に記載の放出固体経口組成物。

【請求項 9】

前記ペプチドが、リュープロリド、インスリン、バソプレッシン、カルシトニン、カルシトニン遺伝子関連ペプチド、副甲状腺ホルモン、デスモプレシン、ゴナドトロピン放出ホルモン (GnRH)、黄体形成ホルモン放出因子、エリスロポイエチン、組織プラスミノーゲン活性化因子、ヒト成長ホルモン、副腎皮質刺激ホルモン、インターロイキン、エンケファリン、グルカゴン様ペプチド-1、デスモプレシン、2, 6-ジメチルチロシン-D-アルギニン-フェニルアラニン-リシンアミド、およびそれらの類似体のうちの 1 つであることを特徴とする請求項 1 又は 2 に記載の放出固体経口組成物。

【請求項 10】

前記小分子が、BCS クラス I I、BCS クラス I I I または BCS クラス I V として分類されることを特徴とする請求項 1 又は 2 に記載の放出固体経口組成物。

【請求項 11】

前記小分子が、チゲサイクリン、ザナミビル、カナマイシン、トブラマイシン、およびフェノフィブレードのうちの 1 つであることを特徴とする請求項 1 又は 2 に記載の放出固体経口組成物。

【請求項 12】

前記水溶性バリア層が、約 6 重量% から約 15 重量% の量であることを特徴とする請求項 3 に記載の放出固体経口組成物。

【請求項 13】

前記薬物動態プロファイルが、医薬活性成分の空腸、回腸、または空腸と回腸への放出をターゲットとすることを特徴とする請求項 1 又は 2 に記載の放出固体経口組成物。

【請求項 14】

前記組成物が、投与後、胃、十二指腸、または胃と十二指腸において活性医薬成分を実質的に放出しないように設計されることを特徴とする請求項 1 又は 2 に記載の放出固体経口組成物。