

【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24年2月16日 (2012.2.16)

【公表番号】特表2011-510024(P2011-510024A)

【公表日】平成23年3月31日 (2011.3.31)

【年通号数】公開・登録公報2011-013

【出願番号】特願2010-543345(P2010-543345)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/381 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/04 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/52 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/381

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 47/04

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/52

A 6 1 K 47/12

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/24

【手続補正書】

【提出日】平成23年12月16日 (2011.12.16)

【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】

デュロキセチン又はその医薬的に許容可能な塩、及び一種以上の医薬的に許容可能な賦型剤を含む医薬組成物において、デュロキセチンが $2 \sim 40 \mu\text{m}$ の D_{90} 粒子サイズを有することを特徴とする医薬組成物。

【請求項 2】

デュロキシセチンがコア中に存在することを特徴とする請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

腸溶性層がコアを包囲することを特徴とする請求項 2 に記載の組成物。

【請求項 4】

デュロキシセチンが約 10 ~ 35 μm の D_{90} 粒子サイズを有することを特徴とする請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 5】

デュロキシセチンが 25 ~ 35 μm の D_{90} 粒子サイズを有することを特徴とする請求項 4 に記載の組成物。

【請求項 6】

デュロキシセチンが塩酸塩として存在することを特徴とする請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 7】

腸溶性層が一つ以上のポリマーコートを含み、その少なくとも一つが腸溶性コートであることを特徴とする請求項 3 ~ 6 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 8】

少なくとも一つの腸溶性コートが、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタル酸塩、メタクリル酸コポリマー A 型、メタクリル酸コポリマー B 型、メタクリル酸コポリマー C 型、ヒドロキシプロピルメチルセルロース酢酸塩琥珀酸塩、及びそれらの混合物からなる群から選択されることを特徴とする請求項 7 に記載の組成物。

【請求項 9】

少なくとも一つの腸溶性コートがヒドロキシプロピルメチルセルロースフタル酸塩であることを特徴とする請求項 8 に記載の組成物。

【請求項 10】

少なくとも一つの腸溶性コートがラウリル硫酸ナトリウム及び精製されたタルクをさらに含むことを特徴とする請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 11】

少なくとも一つの腸溶性コートが可塑剤をさらに含むことを特徴とする請求項 3 ~ 10 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 12】

可塑剤が、ポリエチレングリコール、クエン酸トリエチル、及びフタル酸ジエチルからなる群から選択されることを特徴とする請求項 11 に記載の組成物。

【請求項 13】

コアを腸溶性層から分離する一つ以上のサブコート層をさらに含むことを特徴とする請求項 3 ~ 12 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 14】

組成物が仕上げ層をさらに含むことを特徴とする請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 15】

サブコート層及び / 又は仕上げ層がヒドロキシプロピルメチルセルロースを含むことを特徴とする請求項 13 又は 14 に記載の組成物。

【請求項 16】

サブコート層及び / 又は仕上げ層が、精製されたタルク及びポリエチレングリコールのいずれか又は両方を追加的に含むことを特徴とする請求項 15 に記載の組成物。

【請求項 17】

錠剤、ペレット、ビーズ、又はミニ錠剤からなる群から選択される単位投薬形態を含むことを特徴とする請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 18】

カプセルのシェルの内部に含有された請求項 17 に記載の一つ以上の単位投薬形態を含むことを特徴とする遅延放出カプセル。

【請求項 19】

a) デュロキシセチン又はその医薬的に許容可能な塩、及び一種以上の医薬的に許容可能な賦型剤を含むコアと、b) 腸溶性層とを含む医薬組成物において、デュロキシセチンが $2 \sim 40 \mu\text{m}$ の D_{90} 粒子サイズを有することを特徴とする医薬組成物。

【請求項 20】

コアを包囲するサブコート層をさらに含むことを特徴とする請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 21】

腸溶性層を包囲する仕上げ層をさらに含むことを特徴とする請求項 19 又は 20 に記載の組成物。

【請求項 22】

腸溶性層によって包囲された、錠剤、ペレット、ビーズ、又はミニ錠剤の形のコアを含む医薬組成物であって、前記コアが以下のものを含むことを特徴とする医薬組成物：

- a) $10 \sim 50\%$ の、 $2 \sim 40 \mu\text{m}$ の D_{90} 粒子サイズを有するデュロキシセチン又はその医薬的に許容可能な塩；
- b) $10 \sim 45\%$ の充填剤 / 希釈剤；
- c) $0.5 \sim 20\%$ の結合剤；
- d) $0.5 \sim 10\%$ の潤滑剤；
- e) $0.5 \sim 15\%$ の崩壊剤；及び
- f) $0.1 \sim 3\%$ の流動促進剤。

【請求項 23】

コアが以下のものを含むことを特徴とする請求項 22 に記載の組成物：

- a) $2 \sim 40 \mu\text{m}$ の D_{90} 粒子サイズを有するデュロキシセチン HCL 67.38 mg
- b) 微結晶性セルロース 101 54 mg
- c) クロスボビドン 6 mg
- d) 無水コロイドシリカ 1.62 mg
- e) ヒプロメロース E3 6 mg
- f) 水 qs
- g) クロスボビドン 12 mg
- h) ステアリン酸マグネシウム 3 mg

【請求項 24】

デュロキシセチンが約 $10 \sim 35 \mu\text{m}$ の D_{90} 粒子サイズを有することを特徴とする請求項 19 ～ 23 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 25】

デュロキシセチンが $25 \sim 35 \mu\text{m}$ の D_{90} 粒子サイズを有することを特徴とする請求項 24 に記載の組成物。

【請求項 26】

デュロキシセチンが塩酸塩として存在することを特徴とする請求項 19 ～ 25 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 27】

a) デュロキシセチン又はその医薬的に許容可能な塩、及び一種以上の医薬的に許容可能な賦型剤からなるコアを準備し、b) 腸溶性層を付与することを含む医薬組成物の調製方法において、デュロキシセチンが $2 \sim 40 \mu\text{m}$ の D_{90} 粒子サイズを有することを特徴とする方法。

【請求項 28】

デュロキシセチンが約 $10 \sim 35 \mu\text{m}$ の D_{90} 粒子サイズを有することを特徴とする請求項 27 に記載の方法。

【請求項 29】

デュロキシセチンが $25 \sim 35 \mu\text{m}$ の D_{90} 粒子サイズを有することを特徴とする請求項

２８に記載の方法。

【請求項３０】

腸溶性層の付与前にコアをサブコート層で包囲することをさらに含むことを特徴とする請求項２７～２９のいずれか一項に記載の方法。

【請求項３１】

腸溶性層を仕上げ層で包囲することをさらに含むことを特徴とする請求項２７～３０のいずれか一項に記載の方法。

【請求項３２】

腸溶性層が、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタル酸塩、及び所望により一種以上の医薬的に許容可能な賦型剤を含むことを特徴とする請求項２７～３１のいずれか一項に記載の方法。