

【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 1 年 7 月 4 日 (2019.7.4)

【公表番号】特表 2018-516937 (P2018-516937A)

【公表日】平成 30 年 6 月 28 日 (2018.6.28)

【年通号数】公開・登録公報 2018-024

【出願番号】特願 2017-562994 (P2017-562994)

【国際特許分類】

A 6 1 K 38/12 (2006.01)

A 6 1 K 9/28 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/22 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/04 (2006.01)

A 6 1 P 19/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/10 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

C 0 7 K 7/00 (2006.01)

C 0 7 K 7/54 (2006.01)

A 0 1 K 67/027 (2006.01)

C 1 2 N 5/071 (2010.01)

【 F I 】

A 6 1 K 38/12

A 6 1 K 9/28

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/22

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/38

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/04

A 6 1 P 19/00

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 13/10

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 1/04

C 0 7 K 7/00 Z N A

C 0 7 K 7/54

A 0 1 K 67/027

C 1 2 N 5/071

【手続補正書】

【提出日】令和1年5月31日(2019.5.31)

【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】

腸溶性コーティング錠剤を含む遅延放出組成物であって、前記錠剤が、
リナクロチド；
 Ca^{2+} ；
ヒスチジン；及び
ポリビニルアルコール（PVA）
を含み、
前記リナクロチドが、前記組成物中に $30\text{ }\mu\text{g}$ ～ $300\text{ }\mu\text{g}$ の量で存在する、
前記組成物。

【請求項 2】

前記リナクロチドが、 $30\text{ }\mu\text{g}$ 、 $100\text{ }\mu\text{g}$ 、または $300\text{ }\mu\text{g}$ の量で存在する、請求
項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

前記腸溶性コーティングが、アクリル酸メチル - メタクリル酸コポリマー（例えば E u
d r a g i t（登録商標））を含む、請求項 1 または 2 に記載の組成物。

【請求項 4】

前記腸溶性コーティングが、E u d r a g i t（登録商標）S 1 0 0、E u d r a g i
t（登録商標）L 1 0 0、または E u d r a g i t（登録商標）S 1 0 0 / E u d r a g
i t（登録商標）L 1 0 0 混合物を含む、請求項 1 ～ 3 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 5】

さらに保護ポリマーフィルムまたはサブコーティングを含む、請求項 1 ～ 4 のいずれか
1 項に記載の組成物。

【請求項 6】

前記サブコーティングが、O p a d r y I I（登録商標）を含む、請求項 5 に記載の
組成物。

【請求項 7】

請求項 1 に記載の医薬組成物を含む単位剤形。

【請求項 8】

請求項 1 ～ 6 のいずれか 1 項に記載の組成物の製造方法であって、
i) リナクロチド基剤、前造粒充填剤、及びプラセボ基剤を調製すること；
i i) 前記リナクロチド基剤、前造粒充填剤、及びプラセボ基剤をブレンド及び圧縮して
錠剤にすること；及び
i i i) 腸溶性コーティングを前記錠剤に適用すること
を含む、前記方法。

【請求項 9】

前記前造粒充填剤が、湿式造粒を介して調製され、ブレンド及び圧縮して錠剤にする前
に乾燥される、請求項 8 に記載の方法。

【請求項 10】

前記方法が、前記錠剤にサブコートを適用することをさらに含む、請求項 8 または 9 に
記載の方法。

【請求項 11】

前記サブコートがOpadry II（登録商標）を含む、請求項10に記載の方法。

【請求項12】

前記腸溶性コーティングが、Eudragit（登録商標）S100、Eudragit（登録商標）L100、またはEudragit（登録商標）S100/Eudragit（登録商標）L100混合物を含む、請求項8～11のいずれか1項に記載の方法。

【請求項13】

請求項8～12のいずれか1項に記載の方法によって調製される組成物。

【請求項14】

胃腸障害の治療における使用のための請求項1～6または13のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項15】

前記胃腸障害が、過敏性腸症候群（IBS）、便秘、機能性胃腸障害、胃食道逆流症、機能性胸やけ、ディスペプシア、憩室炎、内臓痛、腹部痛、胃不全麻痺、慢性偽性腸閉塞、偽性結腸閉塞、クローン病、潰瘍性大腸炎、及び炎症性腸疾患から成る群より選択される、請求項14に記載の使用のための組成物。

【請求項16】

前記胃腸障害が便秘である、請求項14に記載の使用のための組成物。

【請求項17】

前記便秘が、慢性便秘、特発性便秘、慢性特発性便秘、術後イレウスが原因の便秘、またはオピエート使用に起因する便秘である、請求項16に記載の使用のための組成物。

【請求項18】

前記胃腸障害が過敏性腸症候群（IBS）である、請求項14に記載の使用のための組成物。

【請求項19】

前記過敏性腸症候群が、便秘型過敏性腸症候群（IBS-c）、下痢型過敏性腸症候群（IBS-d）または混合型過敏性腸症候群（IBS-m）である、請求項18に記載の使用のための組成物。

【請求項20】

前記胃腸障害が内臓痛である、請求項14に記載の使用のための組成物。

【請求項21】

前記胃腸障害が腹部痛である、請求項14に記載の使用のための組成物。

【請求項22】

疼痛の治療または緩和における使用のための請求項1～6または13のいずれか1項に記載の組成物であって、

前記疼痛が、内臓痛；憩室炎痛；骨盤痛；腹部痛；または胃腸障害、性病、膀胱痛症候群、または間質性膀胱炎と関連する疼痛から選択されるか；あるいは、

前記疼痛が、過敏性腸症候群（IBS）関連疼痛、慢性または急性放射線直腸障害（放射線直腸炎とも呼ばれる）、直腸痛、慢性肛門周囲痛、消散性肛門直腸痛、肛門部痛、慢性裂肛、術後肛門部痛、過活動膀胱症候群、腹圧性尿失禁、癌関連痛、胃腸管新生物関連痛、子宮内膜症、睾丸痛、慢性前立腺炎、前立腺痛、外陰部痛、尿道症候群、陰茎痛、肛門周囲痛、及び潰瘍性大腸炎、潰瘍性直腸炎、またはクローン病と関連する疼痛から選択される、使用のための組成物。

【請求項23】

過活動膀胱症候群、膀胱過敏症または大腸炎誘発膀胱求心性活動亢進の治療における使用のための請求項1～6または13のいずれか1項に記載の使用のための組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0269

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0269】

本出願全体を通じて引用する全ての特許、特許出願、公表文献、製品説明、及びプロトコルは、参照によってそれらの全体が全ての目的のため本出願に組み込まれる。

本発明の実施形態において、例えば以下の項目が提供される。

(項目1)

腸溶性コーティング錠剤を含む遅延放出組成物であって、前記錠剤が、
リナクロチド；

Ca^{2+} ；

ヒスチジン；及び

ポリビニルアルコール (PVA)

を含み、

前記リナクロチドが、前記組成物中に $30\text{ }\mu\text{g}$ ~ $300\text{ }\mu\text{g}$ の量で存在する、
前記組成物。

(項目2)

前記リナクロチドが、 $30\text{ }\mu\text{g}$ の量で存在する、項目1に記載の組成物。

(項目3)

前記リナクロチドが、 $100\text{ }\mu\text{g}$ の量で存在する、項目1に記載の組成物。

(項目4)

前記リナクロチドが、 $300\text{ }\mu\text{g}$ の量で存在する、項目1に記載の組成物。

(項目5)

前記腸溶性コーティングが、アクリル酸メチル - メタクリル酸コポリマー (例えば Eudragit (登録商標)) を含む、項目1 ~ 4のいずれか1項に記載の組成物。

(項目6)

前記腸溶性コーティングが、Eudragit (登録商標) S100、Eudragit (登録商標) L100、または Eudragit (登録商標) S100 / Eudragit (登録商標) L100 混合物を含む、項目1 ~ 5のいずれか1項に記載の組成物。

(項目7)

さらに腸溶性コーティング及び保護ポリマーフィルムまたはサブコーティングを含む、
項目1 ~ 6のいずれか1項に記載の組成物。

(項目8)

前記サブコーティングが、Opadry II (登録商標) を含む、項目7に記載の組成物。

(項目9)

項目1に記載の医薬組成物を含む単位剤形。

(項目10)

項目1 ~ 8のいずれか1項に記載の組成物の製造方法であって、

i) リナクロチド基剤、前造粒充填剤、及びプラセボ基剤を調製すること；及び

ii) 前記リナクロチド基剤、前造粒充填剤、及びプラセボ基剤をブレンド及び圧縮して錠剤にすること

を含む、前記方法。

(項目11)

前記前造粒充填剤が、湿式造粒を介して調製され、ブレンド及び圧縮して錠剤にする前に乾燥される、項目10に記載の方法。

(項目12)

前記方法が、前記錠剤にサブコートを適用することをさらに含む、項目10または11に記載の方法。

(項目13)

前記サブコートが Opadry II (登録商標) を含む、項目12に記載の方法。

(項目 1 4)

前記方法が、腸溶性または機能性コーティングを前記錠剤に適用することをさらに含む、項目 1 0 ~ 1 3 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 5)

前記腸溶性または機能性コーティングが、Eudragit (登録商標) S 1 0 0、Eudragit (登録商標) L 1 0 0、またはEudragit (登録商標) S 1 0 0 / Eudragit (登録商標) L 1 0 0 混合物を含む、項目 1 4 に記載の方法。

(項目 1 6)

項目 1 0 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の方法によって調製される組成物。

(項目 1 7)

胃腸障害の治療方法であって、治療が必要な患者に、治療的に有効な量の、項目 1 ~ 8 または 1 6 のいずれか 1 項に記載の組成物を投与することを含む、前記方法。

(項目 1 8)

前記胃腸障害が、過敏性腸症候群 (I B S)、便秘、機能性胃腸障害、胃食道逆流症、機能性胸やけ、ディスペプシア、憩室炎、内臓痛、腹部痛、胃不全麻痺、慢性偽性腸閉塞、偽性結腸閉塞、クローン病、潰瘍性大腸炎、及び炎症性腸疾患から成る群より選択される、項目 1 7 に記載の方法。

(項目 1 9)

前記胃腸障害が便秘である、項目 1 7 に記載の方法。

(項目 2 0)

前記便秘が、慢性便秘、特発性便秘、慢性特発性便秘、術後イレウスが原因の便秘、またはオピエート使用に起因する便秘である、項目 1 9 に記載の方法。

(項目 2 1)

前記胃腸障害が過敏性腸症候群 (I B S) である、項目 1 7 に記載の方法。

(項目 2 2)

前記過敏性腸症候群が、便秘型過敏性腸症候群 (I B S - c)、下痢型過敏性腸症候群 (I B S - d) または混合型過敏性腸症候群 (I B S - m) である、項目 2 1 に記載の方法。

(項目 2 3)

前記胃腸障害がディスペプシアである、項目 1 7 に記載の方法。

(項目 2 4)

前記胃腸障害が胃不全麻痺である、項目 1 7 に記載の方法。

(項目 2 5)

前記胃不全麻痺が、特発性、糖尿病性または手術後胃不全麻痺である、項目 2 4 に記載の方法。

(項目 2 6)

前記胃腸障害が慢性偽性腸閉塞である、項目 1 7 に記載の方法。

(項目 2 7)

前記胃腸障害がクローン病である、項目 1 7 に記載の方法。

(項目 2 8)

前記胃腸障害が潰瘍性大腸炎である、項目 1 7 に記載の方法。

(項目 2 9)

前記胃腸障害が炎症性腸疾患である、項目 1 7 に記載の方法。

(項目 3 0)

前記胃腸障害が内臓痛である、項目 1 7 に記載の方法。

(項目 3 1)

前記胃腸障害が憩室炎である、項目 1 7 に記載の方法。

(項目 3 2)

前記胃腸障害が腹部痛である、項目 1 7 に記載の方法。

(項目 3 3)

前記胃腸障害が、結腸直腸／局所転移性結腸直腸癌、胃癌、腸ポリープ、胃腸管癌、結腸直腸組織の上皮細胞もしくはポリープの癌または前癌性成長もしくは転移性成長から選択される癌である、項目 17 に記載の方法。

(項目 34)

疼痛の治療または緩和方法であって、治療または緩和が必要な患者に、治療的に有効な量の、項目 1～8 または 16 のいずれか 1 項に記載の組成物を投与することを含む、前記方法。

(項目 35)

前記疼痛が、内臓痛；憩室炎痛；骨盤痛；腹部痛；または胃腸障害、性病、膀胱痛症候群、または間質性膀胱炎と関連する疼痛から選択される、項目 34 に記載の方法。

(項目 36)

前記疼痛が、一般的腹部痛、憩室性疾患、過敏性腸症候群 (IBS) 関連疼痛、慢性または急性放射線直腸障害 (放射線直腸炎とも呼ばれる)、直腸痛、慢性肛門周囲痛、消散性肛門直腸痛、肛門部痛、慢性裂肛、術後肛門部痛、過活動膀胱症候群、腹圧性尿失禁、間質性膀胱炎、膀胱痛症候群、癌関連痛、胃腸管新生物関連痛、一般的骨盤痛、子宮内膜症、睾丸痛、慢性前立腺炎、前立腺痛、外陰部痛、尿道症候群、陰茎痛、肛門周囲痛、及び潰瘍性大腸炎、潰瘍性直腸炎、またはクローン病と関連する疼痛から選択される、項目 34 に記載の方法。

(項目 37)

過活動膀胱症候群、膀胱過敏症または大腸炎誘発膀胱求心性活動亢進の治療方法であって、治療が必要な患者に、治療的に有効な量の、項目 1～8 または 16 のいずれか 1 項に記載の組成物を投与することを含む、前記方法。

(項目 38)

患者の腸運動の増加方法であって、項目 1～8 または 16 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物を前記患者に投与することを含む、前記方法。

(項目 39)

生体試料または生物中のグアニル酸シクラーゼ C (GC-C) 受容体活性を高める方法であって、前記生体試料または生物を項目 1～8 または 16 のいずれか 1 項に記載の組成物と接触させることを含む、前記方法。

(項目 40)

項目 1～8 のいずれか 1 項に記載の組成物の製造方法であって、

i) リナクロチド、またはその医薬的に許容される塩を含む水溶液を調製すること；及び

i i) 前記水溶液を医薬的に許容される担体に適用すること

を含む、前記方法。

(項目 41)

項目 40 に記載の方法によって調製される組成物。