

【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28年10月20日(2016.10.20)

【公表番号】特表2015-531770(P2015-531770A)

【公表日】平成27年11月5日(2015.11.5)

【年通号数】公開・登録公報2015-068

【出願番号】特願2015-528809(P2015-528809)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/538 (2006.01)  
A 6 1 K 9/28 (2006.01)  
A 6 1 K 9/48 (2006.01)  
A 6 1 K 9/52 (2006.01)  
A 6 1 K 9/22 (2006.01)  
A 6 1 K 9/10 (2006.01)  
A 6 1 K 9/14 (2006.01)  
A 6 1 K 9/16 (2006.01)  
A 6 1 K 9/12 (2006.01)  
A 6 1 K 45/00 (2006.01)  
A 6 1 P 43/00 (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 47/10 (2006.01)  
A 6 1 K 47/14 (2006.01)  
A 6 1 K 47/02 (2006.01)  
A 6 1 K 47/20 (2006.01)  
A 6 1 K 47/18 (2006.01)  
A 6 1 K 47/24 (2006.01)  
A 6 1 P 25/04 (2006.01)  
A 6 1 P 25/16 (2006.01)  
A 6 1 P 1/10 (2006.01)  
A 6 1 P 1/00 (2006.01)  
A 6 1 K 31/165 (2006.01)  
A 6 1 P 9/00 (2006.01)  
A 6 1 P 3/10 (2006.01)  
A 6 1 P 1/08 (2006.01)  
A 6 1 P 3/00 (2006.01)  
A 6 1 K 9/19 (2006.01)  
A 6 1 K 9/08 (2006.01)  
A 6 1 K 9/06 (2006.01)  
A 6 1 K 47/34 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/538  
A 6 1 K 9/28  
A 6 1 K 9/48  
A 6 1 K 9/52  
A 6 1 K 9/22  
A 6 1 K 9/10  
A 6 1 K 9/14

A 6 1 K	9/16
A 6 1 K	9/12
A 6 1 K	45/00
A 6 1 P	43/00
	1 2 1
A 6 1 K	47/38
A 6 1 K	47/32
A 6 1 K	47/44
A 6 1 K	47/10
A 6 1 K	47/14
A 6 1 K	47/02
A 6 1 K	47/20
A 6 1 K	47/18
A 6 1 K	47/24
A 6 1 P	25/04
A 6 1 P	25/16
A 6 1 P	1/10
A 6 1 P	1/00
A 6 1 K	31/165
A 6 1 P	9/00
A 6 1 P	3/10
A 6 1 P	1/08
A 6 1 P	3/00
A 6 1 K	9/19
A 6 1 K	9/08
A 6 1 K	9/06
A 6 1 K	47/34

**【手続補正書】****【提出日】**平成28年8月26日(2016.8.26)**【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】**

ビソキサチン（または、2,2-ビス(4-ヒドロキシフェニル)-2H-ベンゾ[b][1,4]オキサジン-3(4H)-オン）もしくは酢酸ビソキサチン、および、  
遅延または段階的腸溶性放出用のコーティング剤；  
を含む、遅延または段階的腸溶性放出用に製剤化された組成物。

**【請求項2】**

腸溶性のコーティング剤が、回腸末端においてpH7で溶解する胃耐性コーティング剤を含み、ここで、腸溶性のコーティング剤は、ポリ(メタ)アクリレート、メチルメタクリレートおよび/またはメタクリル酸エステルのようなアクリル系樹脂または等価物を含んでいてもよい、請求項1に記載の組成物。

**【請求項3】**

腸溶性のコーティング剤が、ビニルまたはポリビニルアセテートフタレート；ヒドロキシプロピルメチルセルロース(HPMC)、高粘度グレードHPMC、超高粘度グレードHPCM；ポリビニルピロリドン(PVP)、PVP-K90；セルロース、微結晶性セルロース(MCC)、メチルセルロース、ヒドロキシメチルセルロース、エチルセルロース

; エチルアクリレート、メチルメタクリレートおよびメタクリル酸エステルと第四級アンモニウム基とのコポリマー；またはそれらの任意の組み合わせもしくは混合物を含むか、または、

腸溶性のコーティング剤が、セルロースアセテートフタレート、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレート、ポリビニルアセテートフタレート、ヒドロキシプロピルメチルセルロースアセテートスクシネート、セルロースアセテートトリメリテート、ヒドロキシプロピルメチルセルローススクシネート、セルロースアセテートスクシネート、セルロースアセテートヘキサヒドロフタレート、セルロースプロピオネートフタレート、セルロースアセテートマレエート、セルロースアセテートブチレート、セルロースアセテートプロピオネート、メチルメタクリル酸とメチルメタクリレートとのコポリマー、メチルアクリレートと、メチルメタクリレートとメタクリル酸とのコポリマー、メチルビニルエーテルと無水マレイン酸とのコポリマー、エチルメチルアクリレート-メチルメタクリレート-クロロトリメチルアンモニウムエチルアクリレートコポリマー、天然樹脂、ゼイン、セラック、コーバルコロホリウムまたはアクリルコポリマーまたはそれらの任意の組み合わせもしくは混合物を含むか、または、

腸溶性のコーティング剤が、(i) ワックス、及び(ii) 少なくとも 1 つのモノステアリン酸グリセリン、ステアリン酸、パルミチン酸、モノパルミチン酸グリセリン、セチルアルコール、セラック、ゼイン、エチルセルロース、アクリル樹脂、セルロースアセテートまたはシリコーンエラストマー、またはそれらの任意の組み合わせもしくは混合物、を含む、請求項 1 に記載の組成物。

#### 【請求項 4】

ビソキサチン（または、2,2-ビス(4-ヒドロキシフェニル)-2H-ベンゾ[b][1,4]オキサジン-3(4H)-オン）もしくは酢酸ビソキサチンを含む、遅延放出用に製剤化された組成物であって、

ビソキサチンまたは酢酸ビソキサチンが、マイクロカプセル化されている、組成物。

#### 【請求項 5】

100mg ~ 4.5g のビソキサチンまたは酢酸ビソキサチンを含むか、

0.10mg ~ 1000mg のビソキサチンまたは酢酸ビソキサチン、例えば、

0.10mg ~ 500mg のビソキサチンまたは酢酸ビソキサチン、

10mg ~ 500mg のビソキサチンまたは酢酸ビソキサチン、

75mg ~ 200mg のビソキサチンまたは酢酸ビソキサチン、

50mg ~ 200mg のビソキサチンまたは酢酸ビソキサチン、

100mg ~ 250mg のビソキサチンまたは酢酸ビソキサチン、

60mg のビソキサチンまたは酢酸ビソキサチン、

120mg のビソキサチンまたは酢酸ビソキサチン、または

5mg ~ 15mg のビソキサチンまたは酢酸ビソキサチン、を含む、

請求項 1 ~ 4 のいずれかの請求項に記載の組成物。

#### 【請求項 6】

更に、少なくとも 1 つのビタミン、ミネラルおよび / または栄養補助食品をさらに含み、ここで、前記ビタミンは、チアミン、リボフラビン、ニコチン酸、パントテン酸、ピリドキシン、ビオチン、葉酸、ビタミン B<sub>1,2</sub>、リポ酸、アスコルビン酸、ビタミン A、ビタミン D、ビタミン E、ビタミン K、コリン、カルニチン、および / または、アルファ、ベータおよび / またはガンマカロチンを含んでいてもよい、請求項 1 ~ 5 のいずれかの請求項に記載の組成物。

#### 【請求項 7】

組成物が、腸溶性コーティング錠剤、多粒子または多層錠剤またはカプセル；または、ゼラチン、軟ゼラチンまたはその等価物を含む、請求項 1 ~ 6 のいずれかの請求項に記載の組成物。

#### 【請求項 8】

組成物が、粉末、凍結乾燥またはフリーズドライ製品、液体、懸濁液、スプレー、ゲル

、ヒドロゲル、ジェルタブ、半固体、錠剤、ロゼンジ、サシェまたはカプセルとして製造、ラベルまたは製剤化されているか、または、組成物が、食品、飲料、ヨーグルト、キャンディ、ロリーポップ(ロリー)またはペーストとして製造、ラベルまたは製剤化されている、請求項1～7のいずれかの請求項に記載の組成物。

**【請求項9】**

- ( i ) 抗生物質または抗菌薬、
- ( i i ) コルヒチンまたはその等価物、
- ( i i i ) 抗炎症剤、
- ( i v ) 繊維製品、
- ( v ) 運動促進剤、
- ( v i ) サルフェート、
- ( v i i ) ホスフェート、
- ( v i i i ) 緩下剤、
- ( i x ) 浸透性緩下剤、
- ( x ) 非浸透圧性下剤、
- ( x i ) 抗麻薬剤および／または神経刺激薬、
- ( x i i ) オピエート阻害薬またはオピエート拮抗薬、
- ( x i i i ) 制酸薬、酸中和薬および／またはプロトンポンプ阻害薬
- ( x i v ) プロバイオティック、および
- ( x v ) バイオフィルム搅乱化合物、

のうちの少なくとも1つをさらに含む、請求項1～8のいずれかの請求項に記載の組成物。  
。

**【請求項10】**

少なくとも1つの分散剤、緩衝剤、甘味剤、脱苦味剤、香味剤、pH安定剤、酸性化剤、保存剤、脱甘味剤および／または着色剤をさらに含む、請求項1～9のいずれか一項に記載の組成物。

**【請求項11】**

便秘の改善、処置または予防の用途に用いられる、請求項1～10のいずれか一項に記載の組成物。

**【請求項12】**

便秘が、機能性便秘、過敏性腸症候群(IBS)便秘、憩室症関連便秘、疑似閉塞、結腸

通過遅延型便秘、オーバーフローを伴う鬱血および糖尿病性胃不全麻痺の一以上である、請求項11に記載の用途に用いられる組成物。

**【請求項13】**

便秘に関連する症候又は症状が、巡回嘔吐、逆流性食道炎、自閉症腸疾患、鼓腸、口臭、慢性疲労症候群(CFS)、膨満、一過性直腸痛、小腸細菌異常増殖(SIBO)および大腸内細菌異常増殖(LIBO)、慢性吐気、機能性消化不良および膨満の一以上を含む、請求項11に記載の用途に用いられる組成物。

**【請求項14】**

ビソキサチン(または、2,2-ビス(4-ヒドロキシフェニル)-2H-ベンゾ[b][1,4]オキサジン-3(4H)-オン)もしくは酢酸ビソキサチンが、1日に1～360mgの投与量で投与されるか、または、

ビソキサチン(または、2,2-ビス(4-ヒドロキシフェニル)-2H-ベンゾ[b][1,4]オキサジン-3(4H)-オン)もしくは酢酸ビソキサチンの単位投与量が、20～125mg/単位投与量である、

請求項11～13のいずれかの請求項に記載の用途に用いられる組成物。

**【請求項15】**

少なくとも2つの製剤の組み合わせを含むパッケージまたはキットであって、ここで、1つの(第1の)製剤は、請求項1～10のいずれかの組成物を含み、第1の容器に含ま

れており、第2の製剤は第2の容器に含まれており、前記製剤は、処置またはレジメの一環として順番に服用されるように設計されており、それにより、第一の製剤は、第二の製剤の前に服用される、パッケージまたはキット。