

【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26年3月6日(2014.3.6)

【公表番号】特表2013-517304(P2013-517304A)

【公表日】平成25年5月16日(2013.5.16)

【年通号数】公開・登録公報2013-024

【出願番号】特願2012-549215(P2012-549215)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/192 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 K 31/137 (2006.01)

A 6 1 K 31/439 (2006.01)

A 6 1 K 31/4402 (2006.01)

A 6 1 K 47/42 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/405 (2006.01)

A 6 1 K 31/196 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/192

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 31/137

A 6 1 K 31/439

A 6 1 K 31/4402

A 6 1 K 47/42

A 6 1 P 29/00

A 6 1 K 31/405

A 6 1 K 31/196

【手続補正書】

【提出日】平成26年1月14日(2014.1.14)

【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】

ナプロキセン；

ナプロキセンナトリウム；

ポリエチレングリコール；

プロピレングリコール；

ポビドン；および

水

を含み、追加のpH調整剤を含まない、ソフトゲル中へのカプセル化に適したナプロキセンの医薬処方。

【請求項 2】

ナプロキセンの量が約2重量%から約25重量%までの範囲であり、ナプロキセンナトリウムの量が約25重量%から約2重量%までの範囲であり、ポリエチレングリコールの量が約40重量%から約70重量%までの範囲であり、プロピレングリコールの量が約1重量%から約5重量%までの範囲であり、ポビドンの量が約1重量%から約6重量%までの範囲であり、水の量が約1重量%から約10重量%までの範囲である、請求項1に記載の処方。

【請求項 3】

ナプロキセンおよびナプロキセンナトリウムの総量が、約22重量%から約30重量%までの範囲である、請求項2に記載の処方。

【請求項 4】

ポリエチレングリコールがPEG 400を含む、請求項1に記載の処方。

【請求項 5】

ポビドンがポビドンK12を含む、請求項1に記載の処方。

【請求項 6】

pHが約2から約8までの範囲である、請求項1から5のいずれか一項に記載の処方。

【請求項 7】

フェニレフリン塩酸塩をさらに含む、請求項1から6のいずれか一項に記載の処方。

【請求項 8】

フェニレフリン塩酸塩の量が約0.01重量%から約1重量%までの範囲である、請求項7に記載の処方。

【請求項 9】

pHが約4から約6までの範囲である、請求項7または8に記載の処方。

【請求項 10】

デキストロメトルファン臭化水素酸塩をさらに含む、請求項1から9のいずれか一項に記載の処方。

【請求項 11】

デキストロメトルファン臭化水素酸塩の量が約1重量%から約2重量%までの範囲である、請求項10に記載の処方。

【請求項 12】

コハク酸ドキシラミンをさらに含む、請求項1から11のいずれか一項に記載の処方。

【請求項 13】

コハク酸ドキシラミンの量が約0.01重量%から約1重量%までの範囲である、請求項12に記載の処方。

【請求項 14】

ナプロキセンの、ナプロキセンナトリウムに対する比が約9:1から約3:7までの範囲である、請求項1から13のいずれか一項に記載の処方。

【請求項 15】

ナプロキセンの、ナプロキセンナトリウムに対する比が約3:2から約2:3までの範囲である、請求項14に記載の処方。

【請求項 16】

ナプロキセンの、ナプロキセンナトリウムに対する比が約1:1である、請求項15に記載の処方。

【請求項 17】

薬物送達媒体;ならびに

薬物送達媒体内に配置されているナプロキセン、ナプロキセンナトリウム、ポリエチレングリコール、プロピレングリコール、ポビドンおよび水を含む充填処方を含む、ナプロキセンの経口投与のための剤形であって、前記充填処方が追加のpH調整剤を含まない、剤形。

## 【請求項 18】

ナプロキセンの量が約2重量%から約25重量%までの範囲であり、ナプロキセンナトリウムの量が約25重量%から約2重量%までの範囲であり、ポリエチレングリコールの量が約40重量%から約70重量%までの範囲であり、プロピレングリコールの量が約1重量%から約5重量%までの範囲であり、ポビドンの量が約1重量%から約6重量%までの範囲であり、水の量が約1重量%から約10重量%までの範囲である、請求項17に記載の剤形。

## 【請求項 19】

ナプロキセンおよびナプロキセンナトリウムの総量が、約22重量%から約30重量%までの範囲である、請求項18に記載の剤形。

## 【請求項 20】

ポリエチレングリコールがPEG 400を含む、請求項17に記載の剤形。

## 【請求項 21】

ポビドンがポビドンK12を含む、請求項17に記載の剤形。

## 【請求項 22】

充填処方のpHが約2から約8までの範囲である、請求項17から21のいずれか一項に記載の剤形。

## 【請求項 23】

充填処方がフェニレフリン塩酸塩をさらに含む、請求項17から22のいずれか一項に記載の剤形。

## 【請求項 24】

フェニレフリン塩酸塩の量が約0.01重量%から約1重量%までの範囲である、請求項23に記載の剤形。

## 【請求項 25】

充填処方が約4.5から約5.5までのpHを有する、請求項23または24に記載の剤形。

## 【請求項 26】

デキストロメトルファン臭化水素酸塩をさらに含む、請求項17から25のいずれか一項に記載の剤形。

## 【請求項 27】

デキストロメトルファン臭化水素酸塩の量が約1重量%から約2重量%までの範囲である、請求項26に記載の剤形。

## 【請求項 28】

コハク酸ドキシラミンをさらに含む、請求項17から27のいずれか一項に記載の剤形。

## 【請求項 29】

コハク酸ドキシラミンの量が約0.01重量%から約1重量%までの範囲である、請求項28に記載の剤形。

## 【請求項 30】

ナプロキセンの、ナプロキセンナトリウムに対する比が約9:1から約3:7までの範囲である、請求項17から29のいずれか一項に記載の剤形。

## 【請求項 31】

ナプロキセンの、ナプロキセンナトリウムに対する比が約3:2から約2:3までの範囲である、請求項30に記載の剤形。

## 【請求項 32】

ナプロキセンの、ナプロキセンナトリウムに対する比が約1:1である、請求項31に記載の剤形。

## 【請求項 33】

薬物送達媒体がカプセルを含む、請求項17に記載の剤形。

## 【請求項 34】

カプセルがソフトゼラチンカプセルを含む、請求項33に記載の剤形。

## 【請求項 35】

カプセルがゼラチンから本質的になる、請求項33に記載の剤形。

## 【請求項 36】

a) ポリエチレングリコールおよびプロピレングリコールからなる成分を混合して、溶液を形成するステップと、  
b) ナプロキセンおよびナプロキセンナトリウムからなる成分を溶液に添加し、溶液を攪拌するステップと、  
c) ポビドンおよび水からなる成分を溶液に添加し、溶液を攪拌するステップと、  
d) 溶液を薬物送達デバイス中に配置するステップと  
を含む、ナプロキセンソフトゲル剤形を作製する方法。

## 【請求項 37】

薬物送達デバイスがカプセルを含む、請求項36に記載の方法。

## 【請求項 38】

カプセルがソフトゲルカプセルを含む、請求項37に記載の方法。

## 【請求項 39】

ステップa)が加熱ステップを含み、加熱ステップが、高温へのポリエチレングリコールおよびプロピレングリコールの加熱を含む、請求項36に記載の方法。

## 【請求項 40】

ステップb)を高温で実施する、請求項36に記載の方法。

## 【請求項 41】

ステップc)を高温で実施する、請求項36に記載の方法。

## 【請求項 42】

高温が少なくとも60 である、請求項39から41のいずれか一項に記載の方法。

## 【請求項 43】

高温が約65 から約75 までの範囲である、請求項42に記載の方法。

## 【請求項 44】

高温が約70 である、請求項43に記載の方法。

## 【請求項 45】

ステップb)の攪拌ステップを、成分が完全に溶解されるまで実施する、請求項36に記載の方法。

## 【請求項 46】

ステップb)の攪拌ステップを少なくとも約45分間実施する、請求項45に記載の方法。

## 【請求項 47】

ステップc)の攪拌ステップを、成分が完全に溶解されるまで実施する、請求項36に記載の方法。

## 【請求項 48】

ステップc)の攪拌ステップを、少なくとも約10分間実施する、請求項47に記載の方法。

## 【請求項 49】

酸性NSAID;

塩基性NSAID;

ポリエチレングリコール;

プロピレングリコール;

ポビドン;および

水

を含み、追加のpH調整剤を含まない、ソフトゲル中へのカプセル化に適した非ステロイド系抗炎症薬(NSAID)の医薬処方。

## 【請求項 50】

酸性NSAIDがナプロキセンを含み、塩基性NSAIDがナプロキセンナトリウムを含む、請求項49に記載の処方。

## 【請求項 51】

ナプロキセンの量が約2重量%から約25重量%までの範囲であり、ナプロキセンナトリウムの量が約25重量%から約2重量%までの範囲である、請求項50に記載の処方。

## 【請求項 5 2】

ナプロキセンおよびナプロキセンナトリウムの総量が、約22重量%から約30重量%までの範囲である、請求項51に記載の処方。

## 【請求項 5 3】

酸性NSAIDがインドメタシンを含み、塩基性NSAIDがインドメタシンナトリウム三水和物を含む、請求項49に記載の処方。

## 【請求項 5 4】

インドメタシンの量が約2重量%から約30重量%までの範囲であり、インドメタシンナトリウム三水和物の量が約30重量%から約2重量%までの範囲である、請求項53に記載の処方。

## 【請求項 5 5】

インドメタシンおよびインドメタシンナトリウム三水和物の総量が、約22重量%から約35重量%までの範囲である、請求項54に記載の処方。

## 【請求項 5 6】

酸性NSAIDがイブプロフェンを含み、塩基性NSAIDがイブプロフェンナトリウム二水和物を含む、請求項49に記載の処方。

## 【請求項 5 7】

イブプロフェンの量が約2重量%から約25重量%までの範囲であり、イブプロフェンナトリウム二水和物の量が約25重量%から約2重量%までの範囲である、請求項56に記載の処方。

## 【請求項 5 8】

イブプロフェンおよびイブプロフェンナトリウム二水和物の総量が、約22重量%から約30重量%までの範囲である、請求項57に記載の処方。

## 【請求項 5 9】

酸性NSAIDがジクロフェナクを含み、塩基性NSAIDがジクロフェナクカリウムを含む、請求項49に記載の処方。

## 【請求項 6 0】

ジクロフェナクの量が約2重量%から約30重量%までの範囲であり、ジクロフェナクカリウムの量が約30重量%から約2重量%までの範囲である、請求項59に記載の処方。

## 【請求項 6 1】

ジクロフェナクおよびジクロフェナクカリウムの総量が、約22重量%から約35重量%までの範囲である、請求項60に記載の処方。

## 【請求項 6 2】

ポリエチレングリコールの量が約40重量%から約70重量%までの範囲であり、プロピレングリコールの量が約1重量%から約5重量%までの範囲であり、ポビドンの量が約1重量%から約6重量%までの範囲であり、水の量が約1重量%から約10重量%までの範囲である、請求項49から61のいずれか一項に記載の処方。

## 【請求項 6 3】

ポリエチレングリコールがPEG 400を含む、請求項49に記載の処方。

## 【請求項 6 4】

ポビドンがポビドンK12を含む、請求項49に記載の処方。

## 【請求項 6 5】

pHが約2から約8までの範囲である、請求項49から64のいずれか一項に記載の処方。

## 【請求項 6 6】

フェニレフリン塩酸塩をさらに含む、請求項49から65のいずれか一項に記載の処方。

## 【請求項 6 7】

フェニレフリン塩酸塩の量が約0.01重量%から約1重量%までの範囲である、請求項66に記載の処方。

## 【請求項 6 8】

pHが約4から約6までの範囲である、請求項66または67に記載の処方。

## 【請求項 69】

デキストロメトルファン臭化水素酸塩をさらに含む、請求項49から68のいずれか一項に記載の処方。

## 【請求項 70】

デキストロメトルファン臭化水素酸塩の量が約1重量%から約2重量%までの範囲である、請求項69に記載の処方。

## 【請求項 71】

コハク酸ドキシラミンをさらに含む、請求項49から70のいずれか一項に記載の処方。

## 【請求項 72】

コハク酸ドキシラミンの量が約0.01重量%から約1重量%までの範囲である、請求項71に記載の処方。

## 【請求項 73】

酸性NSAIDの、塩基性NSAIDに対する比が約9:1から約3:7までの範囲である、請求項49から72のいずれか一項に記載の処方。

## 【請求項 74】

酸性NSAIDの、塩基性NSAIDに対する比が約3:2から約2:3までの範囲である、請求項73に記載の処方。

## 【請求項 75】

酸性NSAIDの、塩基性NSAIDに対する比が約1:1である、請求項74に記載の処方。

## 【請求項 76】

薬物送達媒体;および

薬物送達媒体内に配置されている請求項49から75のいずれか一項に記載の充填処方を含む、非ステロイド系抗炎症薬(NSAID)の経口投与のための剤形であって、前記医薬処方が追加のpH調整剤を含まない、剤形。

## 【請求項 77】

a) ポリエチレングリコールおよびプロピレングリコールからなる成分を混合して、溶液を形成するステップと、

b) 酸性NSAID、塩基性NSAIDからなる成分を溶液に添加し、溶液を撹拌するステップと、

c) ポビドンおよび水からなる成分を溶液に添加し、溶液を撹拌するステップと、

d) 溶液を薬物送達デバイスの中に配置するステップと、

を含む、非ステロイド系抗炎症薬(NSAID)のためのソフトゲル剤形を作製する方法。

## 【請求項 78】

薬物送達デバイスがカプセルを含む、請求項77に記載の方法。

## 【請求項 79】

カプセルがソフトゼラチンカプセルを含む、請求項78に記載の方法。

## 【請求項 80】

ステップa)が加熱ステップを含み、加熱ステップが、高温へのポリエチレングリコールおよびプロピレングリコールの加熱を含む、請求項77に記載の方法。

## 【請求項 81】

ステップb)を高温で実施する、請求項77に記載の方法。

## 【請求項 82】

ステップc)を高温で実施する、請求項77に記載の方法。

## 【請求項 83】

高温が少なくとも60 である、請求項80から82のいずれか一項に記載の方法。

## 【請求項 84】

高温が約65 から約75 までの範囲である、請求項83に記載の方法。

## 【請求項 85】

高温が約70 である、請求項84に記載の方法。

## 【請求項 86】

ステップb)の撹拌ステップを、成分が完全に溶解されるまで実施する、請求項77に記載

の方法。

【請求項 87】

ステップb)の攪拌ステップを少なくとも約45分間実施する、請求項86に記載の方法。

【請求項 88】

ステップc)の攪拌ステップを、成分が完全に溶解されるまで実施する、請求項77に記載の方法。

【請求項 89】

ステップc)の攪拌ステップを少なくとも約10分間実施する、請求項88に記載の方法。