

【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 12 月 5 日 (2019.12.5)

【公表番号】特表 2019-501110 (P2019-501110A)

【公表日】平成 31 年 1 月 17 日 (2019.1.17)

【年通号数】公開・登録公報 2019-002

【出願番号】特願 2018-521218 (P2018-521218)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/56 (2017.01)

A 6 1 K 31/65 (2006.01)

A 6 1 K 31/445 (2006.01)

A 6 1 K 31/7048 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 31/495 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/13 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2017.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/24 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/22 (2006.01)

A 6 1 K 47/06 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/505 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 47/56

A 6 1 K 31/65

A 6 1 K 31/445

A 6 1 K 31/7048

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 31/495

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/13

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/24

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 47/22

A 6 1 K 47/06

A 6 1 K 47/10
A 6 1 K 31/505

【手続補正書】

【提出日】令和1年10月21日(2019.10.21)

【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】

複数の担体ポリマー - 薬剤成分を含む、患者に投与するための胃内滞留システムであって、

前記複数の担体ポリマー - 薬剤成分が、

担体ポリマー、

治療薬又はその医薬的に許容される塩、及び

賦形剤

を含み、前記賦形剤は、前記担体ポリマー - 薬剤成分の約 20 % ~ 約 40 % を含み、

前記担体ポリマー - 薬剤成分は 1 種以上の結合ポリマー成分によって一緒に連結され、

前記 1 種以上の結合ポリマー成分の少なくとも 1 種はエラストマーであり；

前記胃内滞留システムは、容器内では経口投与又は栄養管を介して投与するのに適した圧縮形態を有し、容器から放出されたときは非圧縮形態を有するように構成され；

前記胃内滞留システムは、少なくとも約 24 時間 ~ 約 1 ヶ月の滞留期間、胃内に保持され；

前記システムは、治療有効量の治療薬を有効放出期間にわたって放出し；そして

前記システムは、約 6 時間以内には、治療薬又はその医薬的に許容される塩の約 20 % 未満しか放出しない、システム。

【請求項 2】

前記システムは、約 30 % ~ 約 70 % の治療薬又はその医薬的に許容される塩を、有効放出期間の約 40 % ~ 60 % の時間内に放出する、請求項 1 の胃内滞留システム。

【請求項 3】

前記システムは、約 70 % を超える治療薬又はその医薬的に許容される塩を、有効放出期間の約 90 % の時間内に放出する、請求項 1 又は 2 の胃内滞留システム。

【請求項 4】

前記治療薬又はその医薬的に許容される塩の放出は、模擬胃液で測定される、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項の胃内滞留システム。

【請求項 5】

請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項の胃内滞留システムであって、前記治療薬又はその医薬的に許容される塩の放出は、40 % エタノール / 60 % 模擬胃液中では、模擬胃液中の同じ時間での放出に対して約 40 % 以下である、胃内滞留システム。

【請求項 6】

i i) 治療薬又はその医薬的に許容される塩は、約 10 % ~ 約 35 % の担体ポリマー - 薬剤成分を含有する、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項の胃内滞留システム。

【請求項 7】

前記前記治療薬又はその医薬的に許容される塩は、ドキシサイクリン、ドネペジル、イベルメクチン、リスペリドン、セチリジン、及びロスバスタチンから成る群から選択される、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項の胃内滞留システム。

【請求項 8】

前記賦形剤は、放出促進剤を含む、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項の胃内滞留システム。

【請求項 9】

前記放出促進剤は、アクリル酸ポリマー、アクリル酸コポリマー、ポリジオキサノン - ポリエチレングリコールポリマー、及びポリビニルピロリドンから成る群から選択される、請求項 8 の胃内滞留システム。

【請求項 10】

前記担体ポリマー - 薬剤成分は、分散剤をさらに含む、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項の胃内滞留システム。

【請求項 11】

前記分散剤は、約 0.1 % ~ 約 4 % の担体ポリマー - 薬剤成分を含む、請求項 10 の胃内滞留システム。

【請求項 12】

請求項 10 又は 11 の胃内滞留システムであって、分散剤は、多孔性無機材料、極性無機材料、非毒性金属酸化物、両親媒性有機分子、多糖、セルロース、セルロース誘導体、脂肪酸、界面活性剤、シリカ、親水性ヒュームドシリカ、疎水性コロイド状シリカ、ケイ酸アルミニウムマグネシウム、ステアリン酸塩、ステアリン酸カルシウム、ステアリン酸マグネシウム、微結晶セルロース、カルボキシメチルセルロース、ヒプロメロース、リン脂質、ステアリン酸ポリオキシエチレン、酢酸亜鉛、アルギン酸、レシチン、ラウリル硫酸ナトリウム、及び酸化アルミニウムから成る群から選択される、システム。

【請求項 13】

前記分散剤はシリカをさらに含む、請求項 10 又は 11 の胃内滞留システム。

【請求項 14】

前記賦形剤は、可溶化剤である、請求項 7 及び 10 ~ 13 のいずれか 1 項の胃内滞留システム。

【請求項 15】

前記可溶化剤は、ポリアルキレンオキシド、ポリエトキシ化ヒマシ油、及び界面活性剤から成る群から選択される、請求項 14 の胃内滞留システム。

【請求項 16】

前記担体ポリマー - 薬剤成分は、安定剤をさらに含む、請求項 1 ~ 15 のいずれか 1 項の胃内滞留システム。

【請求項 17】

前記安定剤は、約 0.1 % ~ 約 2 % の担体ポリマー - 薬剤成分を含む、請求項 16 の胃内滞留システム。

【請求項 18】

請求項 16 又は 17 の胃内滞留システムであって、前記安定剤が、抗酸化剤、トコフェロール、アルファトコフェロール、アスコルビン酸、アスコルビン酸塩、カロチン、ブチル化ヒドロキシアニソール、ブチル化ヒドロキシトルエン、フマル酸、抗菌剤、緩衝物質、炭酸カルシウム、乳酸カルシウム、リン酸カルシウム、リン酸ナトリウム、及び重炭酸ナトリウムから成る群から選択される 1 種以上の化合物を含む、システム。

【請求項 19】

前記担体ポリマーはポリラクトンを含む、請求項 1 ~ 18 のいずれか 1 項の胃内滞留システム。

【請求項 20】

前記ポリラクトンはポリカプロラクトンを含み、ポリカプロラクトンは約 60,000 ~ 約 100,000 の平均 M_n を有する、請求項 19 の胃内滞留システム。

【請求項 21】

前記治療薬又はその医薬的に許容される塩が 1 mg / ml 未満の水中の溶解度を有する、請求項 1 ~ 20 のいずれか 1 項の胃内滞留システム。

【請求項 22】

前記可溶化剤がポリビニルカプロラクタム、ポリ酢酸ビニル、及びポリエチレングリコールのコポリマーである、請求項 14 の胃内滞留システム。

【請求項 23】

少なくとも 1 つの担体ポリマー - 薬剤成分を含む、患者に投与するための胃内滞留システムであって、

前記担体ポリマー - 薬剤成分が、

担体ポリマー、

治療薬又はその薬学的に許容される塩、及び

賦形剤

を含み、前記賦形剤は、前記担体ポリマー - 薬剤成分の約 20 % ~ 約 40 % を含み、

前記担体ポリマー - 薬剤成分は 1 種以上の結合ポリマー成分によって胃内滞留システムに連結され、

前記 1 種以上の結合ポリマー成分の少なくとも 1 種はエラストマーであり；

前記胃内滞留システムは、容器内では経口投与又は栄養管を介して投与するのに適した圧縮形態を有し、容器から放出されたときは非圧縮形態を有するように構成され；

前記胃内滞留システムは、少なくとも約 24 時間 ~ 約 1 ヶ月の滞留期間、胃内に保持され；

前記システムは、治療有効量の治療薬を有効放出期間にわたって放出し；そして

前記システムは、約 6 時間以内には、治療薬又はその医薬的に許容される塩の約 20 % 未満しか放出しない、システム。