

【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12月1日(2016.12.1)

【公表番号】特表2015-533174(P2015-533174A)

【公表日】平成27年11月19日(2015.11.19)

【年通号数】公開・登録公報2015-072

【出願番号】特願2015-536950(P2015-536950)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/4178	(2006.01)
A 6 1 P	1/02	(2006.01)
A 6 1 K	9/24	(2006.01)
A 6 1 K	47/38	(2006.01)
A 6 1 K	47/32	(2006.01)
A 6 1 K	47/04	(2006.01)
A 6 1 K	47/02	(2006.01)
A 6 1 K	47/12	(2006.01)
A 6 1 K	47/14	(2006.01)
A 6 1 K	47/36	(2006.01)
A 6 1 K	47/26	(2006.01)
A 6 1 K	47/24	(2006.01)
A 6 1 K	47/20	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/4178
A 6 1 P	1/02
A 6 1 K	9/24
A 6 1 K	47/38
A 6 1 K	47/32
A 6 1 K	47/04
A 6 1 K	47/02
A 6 1 K	47/12
A 6 1 K	47/14
A 6 1 K	47/36
A 6 1 K	47/26
A 6 1 K	47/24
A 6 1 K	47/20

【手続補正書】

【提出日】平成28年10月6日(2016.10.6)

【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】

少なくとも1つのミニ錠剤を含む医薬組成物であって、

前記ミニ錠剤は、

ピロカルピン、またはその薬学的に許容可能な塩を含むコアと、

ヒドロキシプロピルセルロースおよびエチルセルロースを含むコーティング層と

を含み、前記コーティング層は前記コーティング層の塗布前の前記ミニ錠剤の重量と比べて前記ミニ錠剤の重量を約10%から約25%増加させる量で存在し、

前記ヒドロキシプロピルセルロースおよびエチルセルロースは、

前記ミニ錠剤が、0.1NのHCl中に2時間以下浸されたとき、ピロカルピン、またはその薬学的に許容可能な塩の初期量の20%以下を放出し、

前記ミニ錠剤が、0.1NのHCl中に4時間以上浸されたとき、ピロカルピンまたはその薬学的に許容可能な塩の初期量の75%以上を放出するように

前記コーティング層中に配合される、医薬組成物。

【請求項2】

前記コアが、最終的に製剤化されたミニ錠剤の総重量の約70%～約99%を含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項3】

前記コアが、セルロースまたは微結晶性セルロースから選択される流動床を含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項4】

前記コアが、無機塩、崩壊剤および潤滑剤からなる群から選択される成分をさらに含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項5】

前記コアが無機塩を含み、前記無機塩が、塩化リチウム、臭化リチウム、ヨウ化リチウム、塩化ナトリウム、臭化ナトリウム、ヨウ化ナトリウム、塩化カリウム、臭化カリウムおよびヨウ化カリウムからなる群から選択される、請求項4に記載の医薬組成物。

【請求項6】

前記コアが崩壊剤を含み、前記崩壊剤が、加工デンプンまたは架橋ポリビニルピロリドン（クロスボビドン）および架橋カルボキシメチルセルロースナトリウム（クロスカルメロースナトリウム）からなる群から選択される架橋ポリマーである、請求項4に記載の医薬組成物。

【請求項7】

前記コアが潤滑剤を含み、前記潤滑剤が、タルクおよびシリカからなる群から選択される無機物であるか、または前記潤滑剤が、植物性ステアリン、ステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸および誘導体化ステアリン酸からなる群から選択される脂肪である、請求項4に記載の医薬組成物。

【請求項8】

前記ピロカルピンまたはその薬学的に許容可能な塩が、前記コアの約0.1重量%～約5重量%で前記コアに存在する、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項9】

前記流動床が、前記コアの約40重量%～約75重量%で存在する、請求項3に記載の医薬組成物。

【請求項10】

前記崩壊剤が、前記コアの約5重量%～約35重量%で存在する、請求項4に記載の医薬組成物。

【請求項11】

前記塩が、前記コアの約10重量%～約50重量%で存在する、請求項4に記載の医薬組成物。

【請求項12】

前記潤滑剤が、前記コアの約0.2重量%～約2重量%で存在する、請求項4に記載の医薬組成物。

【請求項13】

前記コーティングが、潤滑剤もしくは可塑剤またはそれらの組み合わせから選択される成分をさらに含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項14】

前記コーティングが潤滑剤を含み、前記潤滑剤が、タルクまたはシリカから選択される無機物であり、前記コーティングの約1重量%～約20重量%、約5重量%～約17重量%、または約10重量%～約16重量%で存在する、請求項1_3に記載の医薬組成物。

【請求項15】

前記コーティングが可塑剤を含み、前記可塑剤が、フタル酸系可塑剤、トリメリテート、アジピン酸系可塑剤、セバシン酸系可塑剤、有機リン酸塩、マレイン酸塩、スルホンアミド、グリコールまたはポリエーテル、アセチル化モノグリセリドおよびクエン酸アルキルからなる群から選択され、前記コーティングの約1重量%～約20重量%、約5重量%～約15重量%、または約7重量%～約10重量%で存在する、請求項1_3に記載の医薬組成物。

【請求項16】

前記組成物が、被験体に対して0.5～50mgのピロカルピンまたはその薬学的に許容可能な塩についての単一の投与可能な用量を提供するのに十分な数のミニ錠剤を含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項17】

前記ピロカルピンまたはその薬学的に許容可能な塩の前記単一の投与可能な用量が、0.05mg、0.1mg、0.2mg、0.4mg、0.5mg、1mg、2mg、3mg、4mg、5mg、6mg、7mg、7.5mg、8mg、10mg、12mg、15mg、30mgおよび60mgからなる群から選択される、請求項1_6に記載の医薬組成物。

【請求項18】

ヒドロキシプロピルセルロース対エチルセルロースの重量比が約5：1～約1：1である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項19】

ヒドロキシプロピルセルロース対エチルセルロースの重量比が約4：1である、請求項1_8に記載の医薬組成物。