

【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、0.1 N 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、0.1 N 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（クロスポビドン）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 13 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 13 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 0.5～50 mg 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、0.05 mg、0.1 mg、0.2 mg、0.4 mg、0.5 mg、1 mg、2 mg、3 mg、4 mg、5 mg、6 mg、7 mg、7.5 mg、8 mg、10 mg、12 mg、15 mg、30 mg および 60 mg からなる群から選択される、請求項 16 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 18 に記載の医薬組成物。