

【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7月10日(2014.7.10)

【公表番号】特表2013-537182(P2013-537182A)

【公表日】平成25年9月30日(2013.9.30)

【年通号数】公開・登録公報2013-053

【出願番号】特願2013-527670(P2013-527670)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/439 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

A 6 1 K 9/16 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 K 47/28 (2006.01)

A 6 1 K 47/08 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/24 (2006.01)

A 6 1 K 47/22 (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 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/40 (2006.01)

A 6 1 K 47/16 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/439

A 6 1 P 31/04

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 47/18

A 6 1 K 47/28

A 6 1 K 47/08

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/24

A 6 1 K 47/22

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/40

A 6 1 K 47/16

【手続補正書】

【提出日】平成26年5月22日(2014.5.22)

【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】

粒子の形態のリファキシミンを含む組成物であって、実質的に全ての該粒子が2マイクロメートル以下の粒径を有する、前記組成物。

【請求項 2】

実質的に全ての前記粒子が1マイクロメートル以下の粒径を有する、請求項1記載の組成物。

【請求項 3】

少なくとも1種の表面安定剤、少なくとも1種の粘度付与剤、及び/又は少なくとも1種のポリマーをさらに含み、実質的に全ての前記粒子が2マイクロメートル以下の粒径を有する、請求項1又は2記載の組成物。

【請求項 4】

実質的に全ての前記粒子が1マイクロメートル以下の粒径を有する、請求項3記載の組成物。

【請求項 5】

前記表面安定剤が界面活性剤である、請求項3又は4記載の組成物。

【請求項 6】

前記界面活性剤が、両性、非イオン性、陽イオン性、又は陰イオン性界面活性剤である、請求項5記載の組成物。

【請求項 7】

前記界面活性剤が、ポリソルベート;ドデシル硫酸ナトリウム(ラウリル硫酸ナトリウム);ラウリルジメチルアミノオキシド;ドキュセートナトリウム;臭化セチルトリメチルアンモニウム(CTAB);ポリエトキシ化アルコール;ポリオキシエチレンソルビタン;オクトキシノール;N,N-ジメチルドデシルアミン-N-オキシド;臭化ヘキサデシルトリメチルアンモニウム、ポリオキシシル10ラウリルエーテル、ブリジ、デオキシコール酸ナトリウム若しくははコール酸ナトリウムなどの胆汁酸塩;ポリオキシシルヒマシ油;ノニルフェノールエトキシレート;シクロデキストリン;レシチン;塩化メチルベンゼトニウム;カルボン酸塩;スルホン酸塩;石油スルホン酸塩;アルキルベンゼンスルホン酸塩;ナフタレンスルホン酸塩;及び、オレフィンスルホン酸塩;硫酸塩界面活性剤;アルキル硫酸塩;硫酸化天然油若しくは脂;硫酸化エステル;硫酸化アルカノールアミド;任意にエトキシ化及び硫酸化されたアルキルフェノール;エトキシ化脂肪族アルコール;ポリオキシエチレン;カルボン酸エステル;ポリエチレングリコールエステル;無水ソルビトールエステル、若しくはそのエトキシ化誘導体;脂肪酸のグリコールエステル;カルボン酸アミド;モノアルカノールアミン縮合物;ポリオキシエチレン脂肪酸アミド;第4級アンモニウム塩;アミド結合を有するアミン;ポリオキシエチレンアルキルアミン;ポリオキシエチレン脂環式アミン;N,N,N,N-テトラキス置換エチレンジアミン;2-アルキル-1-ヒドロキシエチル-2-イミダゾリン;N-ココ-3-アミノプロピオン酸、若しくはそのナトリウム塩;N-タロウ-3-イミノジプロピオン酸二ナトリウム塩;N-カルボキシメチル-n-ジメチル-n-9オクタデセニル水酸化アンモニウム;n-ココアミドエチル-n-ヒドロキシエチルグリシンナトリウム塩;又は、これらの混合物である、請求項5又は6記載の組成物。

【請求項 8】

前記界面活性剤が、ドキュセートナトリウム及び/又はラウリル硫酸ナトリウムである、請求項 5、6、又は 7 記載の組成物。

【請求項 9】

前記粘度付与剤が、ラクトース;スクロース;サッカロース; マルトデキストリンなどの加水分解デンプン;又はこれらの混合物である、請求項 3 ~ 8 のいずれか一項記載の組成物。

【請求項 10】

前記粘度付与剤がスクロースである、請求項 9 記載の組成物。

【請求項 11】

前記ポリマーが、ヒドロキシプロピルセルロース;ヒドロキシメチルセルロース;ヒドロキシプロピルメチルセルロース;メチルセルロースポリマー;ヒドロキシエチルセルロース;カルボキシメチルセルロースナトリウム;カルボキシメチレンヒドロキシエチルセルロース及び/又はカルボキシメチルヒドロキシエチルセルロース;アクリルポリマー、例えば、アクリル酸、アクリルアミド、及び無水マレイン酸ポリマー及びコポリマー;又はこれらのブレンド;又はこれらの混合物である、請求項 3 ~ 10 のいずれか一項記載の組成物。

【請求項 12】

前記ポリマーがヒドロキシプロピルメチルセルロースである、請求項 12 記載の組成物。

【請求項 13】

実質的に全ての前記粒子が1ナノメートルを超える粒径を有する、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項記載の組成物。

【請求項 14】

医薬として許容し得る担体をさらに含み、前記粒子が該担体の表面に吸着されている、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項記載の組成物。

【請求項 15】

請求項 1 ~ 14 のいずれか一項記載の組成物を含む医薬組成物。

【請求項 16】

医薬として許容し得る担体と組み合わせた、請求項 1 ~ 15 のいずれか一項記載の組成物を含む医薬組成物。

【請求項 17】

前記担体が、1種以上の希釈剤若しくは充填剤;1種以上の結合剤;1種以上の潤滑剤;1種以上の流動促進剤;1種以上の崩壊剤;1種以上の保存剤;1種以上の保湿剤;1種以上の溶解遅延剤;1種以上の吸収促進剤;1種以上の湿潤剤;1種以上の吸着剤;1種以上の緩衝剤、又はこれらの混合物を含む、請求項 16 記載の医薬組成物。

【請求項 18】

経口、経眼、非経口、大槽内、腔内、腹腔内、又は頬側投与用である、請求項 16 又は 17 記載の医薬組成物。

【請求項 19】

経口投与用である、請求項 16 又は 17 記載の医薬組成物。

【請求項 20】

固体経口剤形である、請求項 17 ~ 19 のいずれか一項記載の医薬組成物。

【請求項 21】

カプセル剤、錠剤、散剤、又は顆粒剤の形態である、請求項 19 又は 20 記載の医薬組成物。

【請求項 22】

腸溶性コーティングをさらに含む、請求項 20 又は 21 記載の医薬組成物。

【請求項 23】

細菌感染の治療に使用するための、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項記載の組成物。

【請求項 24】

細菌感染を治療するための医薬の製造における、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項記載の組成物の使用。

【請求項 25】

医薬組成物の製造方法であって、リファキシミン、少なくとも1種の表面安定剤、少なくとも1種の粘度付与剤、及び少なくとも1種のポリマーを均質化して、該表面活性剤、該粘度付与剤、及び該ポリマー中のリファキシミンの均質な分散体を生成する工程；該均質化した分散体を粉砕して、2マイクロメートル以下の粒径を有する粒子のスラリーを生成する工程；及び担体に該粉砕スラリーを吸着させて、顆粒を形成する工程を含む、前記製造方法。