

【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ンオキシド；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コール酸ナトリウムなどの胆汁酸塩；ポリオキシルヒマシ油；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、又は頸側投与用である、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碎して、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；及び担体に該粉碎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。