

【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31年1月31日(2019.1.31)

【公開番号】特開2017-2092(P2017-2092A)

【公開日】平成29年1月5日(2017.1.5)

【年通号数】公開・登録公報2017-001

【出願番号】特願2016-202730(P2016-202730)

【国際特許分類】

A 61 K 31/496 (2006.01)

A 61 K 31/7042 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 K 9/20 (2006.01)

A 61 K 9/48 (2006.01)

A 61 K 9/16 (2006.01)

A 61 K 9/14 (2006.01)

A 61 K 47/38 (2006.01)

A 61 K 47/14 (2006.01)

A 61 K 47/10 (2006.01)

【F I】

A 61 K 31/496

A 61 K 31/7042

A 61 P 3/10

A 61 K 9/20

A 61 K 9/48

A 61 K 9/16

A 61 K 9/14

A 61 K 47/38

A 61 K 47/14

A 61 K 47/10

【手続補正書】

【提出日】平成30年12月14日(2018.12.14)

【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】

テネリグリブチン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分と、カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分とを配合してなる固形製剤であって、当該テネリグリブチン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分に、ラクトース、マンニトール、キシリトール、エリスリトール、ソルビトール、マルチトール、フルクトース、乳糖、ショ糖、白糖、デンプン、プレゼラチン化デンプン、デキストロース、トウモロコシデンプン、変性トウモロコシデンプン、バレイショデンプン、コムギデンプン、コメデンプン、デキストリン、デキストレート、マルトデキストリン、圧縮用糖類、クエン酸カルシウム、リン酸カルシウム、メタケイ酸アルミン酸カルシウム、炭酸カルシウム、リン酸二カルシウム、硫酸カルシウム、結晶セルロース、及び木材セルロースから選ばれる1種または2種以上を含有し、

当該カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分に、ラクトース、マンニトール、キシリトール、エリスリトール、ソルビトール、マルチトール、フルクトース、乳糖、ショ糖、白糖、デンプン、プレゼラチン化デンプン、デキストロース、トウモロコシデンプン、変性トウモロコシデンプン、バレイショデンプン、コムギデンプン、コメデンプン、デキストリン、デキストレート、マルトデキストリン、圧縮用糖類、クエン酸カルシウム、リン酸カルシウム、メタケイ酸アルミン酸カルシウム、炭酸カルシウム、リン酸二カルシウム、硫酸カルシウム、結晶セルロース、及び木材セルロースから選ばれる1種または2種以上を含有し、

テネリグリブチン又はその薬学的に許容しうる塩と、カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩とが実質的に互いに接しないように該製剤中に独立して存在することを特徴とする固形製剤。

【請求項2】

テネリグリブチン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分と、カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分とを配合してなり、さらに、テネリグリブチン又はその薬学的に許容しうる塩及びカナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩を実質的に含まない部分を含有する固形製剤であって、

当該テネリグリブチン又はその薬学的に許容しうる塩及びカナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩を実質的に含まない部分にカルボキシメチルセルロース、カルボキシメチルセルロースカルシウム、カルボキシメチルスターーチナトリウム、クロスカルメロースナトリウム、クロスカルメロースカルシウム、クロスポビドン、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、及びヒドロキシプロピルスターーチから選ばれる1種又は2種以上、並びに、ステアリン酸、ステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸カルシウム、タルク、ショ糖脂肪酸エステル、及びフマル酸ステアリルナトリウムから選ばれる1種又は2種以上を含有し、

テネリグリブチン又はその薬学的に許容しうる塩と、カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩とが実質的に互いに接しないように該製剤中に独立して存在することを特徴とする固形製剤。

【請求項3】

テネリグリブチン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分に、ラクトース、マンニトール、キシリトール、エリスリトール、ソルビトール、マルチトール、フルクトース、乳糖、ショ糖、白糖、デンプン、プレゼラチン化デンプン、デキストロース、トウモロコシデンプン、変性トウモロコシデンプン、バレイショデンプン、コムギデンプン、コメデンプン、デキストリン、デキストレート、マルトデキストリン、圧縮用糖類、クエン酸カルシウム、リン酸カルシウム、メタケイ酸アルミン酸カルシウム、炭酸カルシウム、リン酸二カルシウム、硫酸カルシウム、結晶セルロース、及び木材セルロースから選ばれる1種または2種以上を含有し、

カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分に、ラクトース、マンニトール、キシリトール、エリスリトール、ソルビトール、マルチトール、フルクトース、乳糖、ショ糖、白糖、デンプン、プレゼラチン化デンプン、デキストロース、トウモロコシデンプン、変性トウモロコシデンプン、バレイショデンプン、コムギデンプン、コメデンプン、デキストリン、デキストレート、マルトデキストリン、圧縮用糖類、クエン酸カルシウム、リン酸カルシウム、メタケイ酸アルミン酸カルシウム、炭酸カルシウム、リン酸二カルシウム、硫酸カルシウム、結晶セルロース、及び木材セルロースから選ばれる1種または2種以上を含有する、請求項2記載の固形製剤。

【請求項4】

テネリグリブチン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分において、該部分100重量部に対して、テネリグリブチン又はその薬学的に許容しうる塩の含量が1～70重量部であり、並びに、ラクトース、マンニトール、キシリトール、エリスリトール、ソルビトール、マルチトール、フルクトース、乳糖、ショ糖、白糖、デンプン、プレゼラチン化デンプン、デキストロース、トウモロコシデンプン、変性トウモロコシデンプン、バレイショデンプン、

イショデンブン、コムギデンブン、コメデンブン、デキストリン、デキストレート、マルトデキストリン、圧縮用糖類、クエン酸カルシウム、リン酸カルシウム、メタケイ酸アルミン酸カルシウム、炭酸カルシウム、リン酸二カルシウム、硫酸カルシウム、結晶セルロース、及び木材セルロースから選ばれる1種または2種以上の含量が1~95重量部であり、

カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分において、該部分100重量部に対して、カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩が20~95重量部であり、並びに、ラクトース、マンニトール、キシリトール、エリスリトール、ソルビトール、マルチトール、フルクトース、乳糖、ショ糖、白糖、デンブン、プレゼラチン化デンブン、デキストロース、トウモロコシデンブン、変性トウモロコシデンブン、バレイショデンブン、コムギデンブン、コメデンブン、デキストリン、デキストレート、マルトデキストリン、圧縮用糖類、クエン酸カルシウム、リン酸カルシウム、メタケイ酸アルミン酸カルシウム、炭酸カルシウム、リン酸二カルシウム、硫酸カルシウム、結晶セルロース、及び木材セルロースから選ばれる1種または2種以上の含量が5~80重量部である、請求項1又は3記載の固体製剤。

【請求項5】

テネリグリップチン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分にラクトース、マンニトール、キシリトール、エリスリトール、ソルビトール、マルチトール、フルクトース、乳糖、ショ糖、白糖、デンブン、プレゼラチン化デンブン、デキストロース、トウモロコシデンブン、変性トウモロコシデンブン、バレイショデンブン、コムギデンブン、コメデンブン、デキストリン、デキストレート、マルトデキストリン、圧縮用糖類、クエン酸カルシウム、リン酸カルシウム、メタケイ酸アルミン酸カルシウム、炭酸カルシウム、リン酸二カルシウム、硫酸カルシウム、結晶セルロース、及び木材セルロースから選ばれる1種または2種以上、並びに、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリビニルピロリドン、及びアラビアゴムから選ばれる1種または2種以上を含有し、

カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分にラクトース、マンニトール、キシリトール、エリスリトール、ソルビトール、マルチトール、フルクトース、乳糖、ショ糖、白糖、デンブン、プレゼラチン化デンブン、デキストロース、トウモロコシデンブン、変性トウモロコシデンブン、バレイショデンブン、コムギデンブン、コメデンブン、デキストリン、デキストレート、マルトデキストリン、圧縮用糖類、クエン酸カルシウム、リン酸カルシウム、メタケイ酸アルミン酸カルシウム、炭酸カルシウム、リン酸二カルシウム、硫酸カルシウム、結晶セルロース、及び木材セルロースから選ばれる1種または2種以上、並びに、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリビニルピロリドン、及びアラビアゴムから選ばれる1種または2種以上を含有する、請求項1又は3に記載の固体製剤。

【請求項6】

テネリグリップチン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分において、該部分100重量部に対して、テネリグリップチン又はその薬学的に許容しうる塩の含量が1~70重量部であり、ラクトース、マンニトール、キシリトール、エリスリトール、ソルビトール、マルチトール、フルクトース、乳糖、ショ糖、白糖、デンブン、プレゼラチン化デンブン、デキストロース、トウモロコシデンブン、変性トウモロコシデンブン、バレイショデンブン、コムギデンブン、コメデンブン、デキストリン、デキストレート、マルトデキストリン、圧縮用糖類、クエン酸カルシウム、リン酸カルシウム、メタケイ酸アルミン酸カルシウム、炭酸カルシウム、リン酸二カルシウム、硫酸カルシウム、結晶セルロース、及び木材セルロースから選ばれる1種または2種以上の含量が1~95重量部であり、並びに、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリビニルピロリドン、及びアラビアゴムから選ばれる1種または2種以上の含量が1~5重量部であり

カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分において、該部分100

重量部に対して、カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩が30～90重量部であり、ラクトース、マンニトール、キシリトール、エリスリトール、ソルビトール、マルチトール、フルクトース、乳糖、ショ糖、白糖、デンプン、ブレゼラチン化デンプン、デキストロース、トウモロコシデンプン、変性トウモロコシデンプン、バレイショデンプン、コムギデンプン、コメデンプン、デキストリン、デキストレート、マルトデキストリン、圧縮用糖類、クエン酸カルシウム、リン酸カルシウム、メタケイ酸アルミン酸カルシウム、炭酸カルシウム、リン酸二カルシウム、硫酸カルシウム、結晶セルロース、及び木材セルロースから選ばれる1種または2種以上の含量が9～69重量部であり、並びに、結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリビニルピロリドン、及びアラビアゴムから選ばれる1種または2種以上の含量が1～5重量部である、請求項5記載の固形製剤。

【請求項7】

テネリグリップチン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分が流動層造粒により製造された顆粒である請求項1～6のいずれか1項に記載の固形製剤。

【請求項8】

カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分が高速攪拌造粒により製造された顆粒である請求項1～7のいずれか1項に記載の固形製剤。

【請求項9】

テネリグリップチン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分が粒状であり、カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分が粒状である請求項1～6のいずれか1項に記載の固形製剤。

【請求項10】

テネリグリップチン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分の粒径が重量平均粒子径30μm以上、350μm以下の粒状であり、カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分の粒径が重量平均粒子径30μm以上、350μm以下の粒状である請求項9に記載の固形製剤。

【請求項11】

テネリグリップチン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分と、カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分とを配合してなる固形製剤であって、当該テネリグリップチン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分に、賦形剤、並びに、崩壊剤、結合剤、滑沢剤、着色剤、pH調整剤、界面活性剤、安定化剤、矯味剤、香料、流動化剤、コーティング基剤、及びコーティング添加剤から選ばれる1種又は2種以上を含有し、

当該カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分に、賦形剤、並びに、崩壊剤、結合剤、滑沢剤、着色剤、pH調整剤、界面活性剤、安定化剤、矯味剤、香料、流動化剤、コーティング基剤、及びコーティング添加剤から選ばれる1種又は2種以上を含有し、

テネリグリップチン又はその薬学的に許容しうる塩と、カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩とが実質的に互いに接しないように該製剤中に独立して存在することを特徴とする固形製剤。

【請求項12】

テネリグリップチン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分と、カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分とを配合してなり、さらに、テネリグリップチン又はその薬学的に許容しうる塩及びカナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩を実質的に含まない部分を含有する固形製剤であって、

当該テネリグリップチン又はその薬学的に許容しうる塩及びカナグリフロジン又は、その薬学的に許容しうる塩を実質的に含まない部分に賦形剤、崩壊剤、結合剤、滑沢剤、着色剤、pH調整剤、界面活性剤、安定化剤、矯味剤、香料、流動化剤、コーティング基剤、及びコーティング添加剤から選ばれる1種または2種以上を含有し、

テネリグリップチン又はその薬学的に許容しうる塩と、カナグリフロジン又はその薬学的に

許容しうる塩とが実質的に互いに接しないように該製剤中に独立して存在することを特徴とする固形製剤。

【請求項 1 3】

固形製剤が

(A) テネリグリプチン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分、並びに、カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分がそれぞれ分散している固形製剤、

(B) テネリグリプチン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分、並びに、カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分が積層した固形製剤、又は

(C) テネリグリプチン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分、並びに、カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩を含有する部分のいずれか一方を核錠として配置した固形製剤

である、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか 1 項に記載の固形製剤。

【請求項 1 4】

(A) テネリグリプチン又はその薬学的に許容しうる塩、並びに、ラクトース、マンニトール、キシリトール、エリスリトール、ソルビトール、マルチトール、フルクトース、乳糖、ショ糖、白糖、デンプン、プレゼラチン化デンプン、デキストロース、トウモロコシデンプン、変性トウモロコシデンプン、バレイショデンプン、コムギデンプン、コメデンプン、デキストリン、デキストレート、マルトデキストリン、圧縮用糖類、クエン酸カルシウム、リン酸カルシウム、メタケイ酸アルミン酸カルシウム、炭酸カルシウム、リン酸二カルシウム、硫酸カルシウム、結晶セルロース、及び木材セルロースから選ばれる 1 種または 2 種以上を含有する固形組成物と、

(B) カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩、並びに、ラクトース、マンニトール、キシリトール、エリスリトール、ソルビトール、マルチトール、フルクトース、乳糖、ショ糖、白糖、デンプン、プレゼラチン化デンプン、デキストロース、トウモロコシデンプン、変性トウモロコシデンプン、バレイショデンプン、コムギデンプン、コメデンプン、デキストリン、デキストレート、マルトデキストリン、圧縮用糖類、クエン酸カルシウム、リン酸カルシウム、メタケイ酸アルミン酸カルシウム、炭酸カルシウム、リン酸二カルシウム、硫酸カルシウム、結晶セルロース、及び木材セルロースから選ばれる 1 種または 2 種以上を含有する固形組成物とを含有し、

テネリグリプチン又はその薬学的に許容しうる塩とカナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩とが互いに接しないように配置されている固形製剤。

【請求項 1 5】

テネリグリプチン又はその薬学的に許容しうる塩、並びに、ラクトース、マンニトール、キシリトール、エリスリトール、ソルビトール、マルチトール、フルクトース、乳糖、ショ糖、白糖、デンプン、プレゼラチン化デンプン、デキストロース、トウモロコシデンプン、変性トウモロコシデンプン、バレイショデンプン、コムギデンプン、コメデンプン、デキストリン、デキストレート、マルトデキストリン、圧縮用糖類、クエン酸カルシウム、リン酸カルシウム、メタケイ酸アルミン酸カルシウム、炭酸カルシウム、リン酸二カルシウム、硫酸カルシウム、結晶セルロース、及び木材セルロースから選ばれる 1 種または 2 種以上を含有する固形組成物が流動層造粒により製造された顆粒である請求項 1 4 記載の固形製剤。

【請求項 1 6】

カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩、並びに、ラクトース、マンニトール、キシリトール、エリスリトール、ソルビトール、マルチトール、フルクトース、乳糖、ショ糖、白糖、デンプン、プレゼラチン化デンプン、デキストロース、トウモロコシデンプン、変性トウモロコシデンプン、バレイショデンプン、コムギデンプン、コメデンプン、デキストリン、デキストレート、マルトデキストリン、圧縮用糖類、クエン酸カルシウム、リン酸カルシウム、メタケイ酸アルミン酸カルシウム、炭酸カルシウム、リン酸二カルシウム、硫酸カルシウム、結晶セルロース、及び木材セルロースから選ばれる 1 種また

は2種以上を含有する固形組成物が高速攪拌造粒により製造された顆粒である請求項1_4又は1_5に記載の固形製剤。

【請求項17】

剤形が、カプセル剤、丸剤、顆粒剤、細粒剤、散剤又は錠剤である請求項1～1_6のいずれか1項に記載の固形製剤。

【請求項18】

テネリグリップチン又はその薬学的に許容しうる塩を、テネリグリップチン換算で、10mg～40mgを1日量として含有する請求項1～1_7のいずれか1項に記載の固形製剤。

【請求項19】

カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩を、カナグリフロジン換算で、50～200mgを1日量として含有する請求項1～1_8のいずれか1項に記載の固形製剤。

【請求項20】

テネリグリップチン又はその薬学的に許容しうる塩が、テネリグリップチン臭化水素酸塩である請求項1～1_9のいずれか1項に記載の固形製剤。

【請求項21】

カナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩が、カナグリフロジン水和物である請求項1～2_0のいずれか1項に記載の固形製剤。

【請求項22】

固形製剤100重量%に対して、
(A) 0.1～50重量%のテネリグリップチン又はその薬学的に許容しうる塩、0～50重量%のラクトース、マンニトール、キシリトール、エリスリトール、ソルビトール、マルチトール、フルクトース、乳糖、ショ糖、白糖、デンプン、プレゼラチン化デンプン、デキストロース、トウモロコシデンプン、変性トウモロコシデンプン、バレイショデンプン、コムギデンプン、コメデンプン、デキストリン、デキストレート、マルトデキストリン、圧縮用糖類、クエン酸カルシウム、リン酸カルシウム、メタケイ酸アルミン酸カルシウム、炭酸カルシウム、リン酸二カルシウム、硫酸カルシウム、結晶セルロース、及び木材セルロースから選ばれる1種または2種以上、並びに0～5重量%の結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリビニルピロリドン、及びアラビアゴムから選ばれる1種または2種以上を含有する固形組成物と、

(B) 0.1～95重量%のカナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩、0～50重量%のラクトース、マンニトール、キシリトール、エリスリトール、ソルビトール、マルチトール、フルクトース、乳糖、ショ糖、白糖、デンプン、プレゼラチン化デンプン、デキストロース、トウモロコシデンプン、変性トウモロコシデンプン、バレイショデンプン、コムギデンプン、コメデンプン、デキストリン、デキストレート、マルトデキストリン、圧縮用糖類、クエン酸カルシウム、リン酸カルシウム、メタケイ酸アルミン酸カルシウム、炭酸カルシウム、リン酸二カルシウム、硫酸カルシウム、結晶セルロース、及び木材セルロースから選ばれる1種または2種以上、並びに、0～5重量%の結晶セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリビニルピロリドン、及びアラビアゴムから選ばれる1種または2種以上を含有する固形組成物とを独立して含有し、テネリグリップチン又はその薬学的に許容しうる塩とカナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩とが互いに接しないように配置されている固形製剤。

【請求項23】

固形製剤100重量%に対して、
0.1～99重量%のテネリグリップチン又はその薬学的に許容しうる塩及びカナグリフロジン又はその薬学的に許容しうる塩を実質的に含まない部分を含有する請求項2_2記載の固形製剤。

【請求項24】

固形製剤が積層錠剤又は有核錠剤である、請求項1～2_3のいずれか1項に記載の固形製剤。

【請求項 2 5】

糖尿病又は糖尿病関連症状の治療及び／又は予防のための、請求項1～24のいずれか1項に記載の固形製剤。