

【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 21 年 1 月 29 日 (2009.1.29)

【公表番号】特表 2008-534438 (P2008-534438A)

【公表日】平成 20 年 8 月 28 日 (2008.8.28)

【年通号数】公開・登録公報 2008-034

【出願番号】特願 2007-551316 (P2007-551316)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/28 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 9/28

【手続補正書】

【提出日】平成 20 年 12 月 2 日 (2008.12.2)

【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】

a) 腸溶性コーティングに囲まれた治療有効量のプロトンポンプ阻害剤を含む腸溶性コーティングされたコアであって、前記腸溶性コーティングが、周囲の媒体の pH が少なくとも 3.5 となるまで、前記プロトンポンプ阻害剤を放出しないコア；および

b) 前記腸溶性コーティングされたコアを囲む外部コーティングであって、

i) 前記外部コーティングは、患者による摂取後 6 時間以内に胃酸分泌を抑制するのに十分な量の酸阻害剤を含み、前記酸阻害剤は、プロトンポンプ阻害剤および H₂ ブロッカーからなる群より選択され；

ii) 前記外部コーティングは腸溶性コーティングではなく、腸溶性コーティングで囲まれておらず、摂取後 60 分以内に前記酸阻害剤を放出する外部コーティングを含む、錠剤形態の医薬組成物。

【請求項 2】

前記外部コーティングが 1000 ミクロン未満の厚さを有する、請求項 1 に記載の 医薬組成物。

【請求項 3】

前記外部コーティングが 25 ミクロンと 500 ミクロンとの間の厚さを有する、請求項 1 に記載の 医薬組成物。

【請求項 4】

前記外部コーティングが、安定剤または緩衝剤をさらに含む、請求項 2 に記載の 医薬組成物。

【請求項 5】

前記外部コーティング中の前記酸阻害剤がプロトンポンプ阻害剤である、請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の 医薬組成物。

【請求項 6】

前記酸阻害剤が、オメプラゾール；エソメプラゾール；ランソプラゾール；パントプラゾールおよびラベプラゾールからなる群より選択される、請求項 5 に記載の 医薬組成物。

【請求項 7】

前記外部コーティング中の前記プロトンポンプ阻害剤が、1.0 ~ 3.0 の pH で安定である、請求項 5 に記載の 医薬組成物。

【請求項 8】

前記プロトンポンプ阻害剤が、A Z D - 0 8 6 5、A R - H 0 4 7 1 0 8、C S - 5 2 6、ブマブラゾール、レバブラザンおよびソラブラザンからなる群より選択される、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

前記酸阻害剤が 1 ~ 2 0 0 m g で前記外部コーティング中に存在する、請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

前記酸阻害剤が 5 ~ 1 0 0 m g で前記外部コーティング中に存在する、請求項 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

前記腸溶性コーティングされたコアが、5 ~ 6 0 0 m g の前記プロトンポンプ阻害剤を含み、前記プロトンポンプ阻害剤が、オメブラゾール；エソメブラゾール；ランソプラゾール；パントプラゾールおよびラベプラゾールからなる群より選択される、請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

前記プロトンポンプ阻害剤がオメブラゾールであり、前記腸溶性コーティングされたコア中に 5 m g と 5 0 m g との間で存在する、請求項 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

前記プロトンポンプ阻害剤がエソメブラゾールであり、前記腸溶性コーティングされたコア中に 5 ~ 1 0 0 m g で存在する、請求項 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

前記プロトンポンプ阻害剤がランソプラゾールであり、前記腸溶性コーティングされたコア中に 1 5 ~ 1 5 0 m g で存在する、請求項 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

前記プロトンポンプ阻害剤がパントプラゾールであり、前記腸溶性コーティングされたコア中に 1 0 m g と 2 0 0 m g との間で存在する、請求項 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

前記プロトンポンプ阻害剤がラベプラゾールであり、前記腸溶性コーティングされたコア中に 5 m g と 1 0 0 m g との間で存在する、請求項 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

a) 前記外部コーティング中の前記酸阻害剤が、1 ~ 2 0 0 m g で存在し、オメブラゾール；エソメブラゾール；ランソプラゾール；パントプラゾール；ラベプラゾール；A Z D - 0 8 6 5；A R - H 0 4 7 1 0 8；C S - 5 2 6；ブマブラゾール；レバブラザンおよびソラブラザンからなる群より選択されるプロトンポンプ阻害剤であり；

b) 前記腸溶性コーティングされたコアが 1 ~ 6 0 0 m g の前記プロトンポンプ阻害剤を含み、前記プロトンポンプ阻害剤が、オメブラゾール；エソメブラゾール；ランソプラゾール；パントプラゾールおよびラベプラゾールからなる群より選択される、請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

前記外部コーティング中の前記酸阻害剤が 5 ~ 1 0 0 m g で存在し、前記腸溶性コーティングされたコアが 5 ~ 2 0 0 m g の前記プロトンポンプ阻害剤を含む、請求項 17 に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

前記外部コーティング中の前記酸阻害剤が H 2 ブロッカーである、請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の錠剤。

【請求項 20】

前記酸阻害剤が、シメチジン；ラニチジン；ファモチジン；エプロチジン；パプチジン；ラフチジンおよびニザチジンからなる群より選択される、請求項 19 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 1】

前記酸阻害剤が 1 ~ 3 0 0 m g で前記外部コーティング中に存在する、請求項 2 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 2】

前記酸阻害剤が 5 ~ 1 5 0 m g で前記外部コーティング中に存在する、請求項 2 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 3】

前記腸溶性コーティングされたコアが 1 ~ 6 0 0 m g の前記プロトンポンプ阻害剤を含み、前記プロトンポンプ阻害剤が、オメプラゾール；エソメプラゾール；ランソプラゾール；パントプラゾールおよびラベプラゾールからなる群より選択される、請求項 1 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 4】

前記プロトンポンプ阻害剤がオメプラゾールであり、前記腸溶性コーティングされたコア中に 5 m g と 5 0 m g との間で存在する、請求項 2 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 5】

前記プロトンポンプ阻害剤がエソメプラゾールであり、前記腸溶性コーティングされたコア中に 5 ~ 1 0 0 m g で存在する、請求項 2 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 6】

前記プロトンポンプ阻害剤がランソプラゾールであり、前記腸溶性コーティングされたコア中に 1 5 ~ 1 5 0 m g で存在する、請求項 2 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 7】

前記プロトンポンプ阻害剤がパントプラゾールであり、前記腸溶性コーティングされたコア中に 1 0 m g と 2 0 0 m g との間で存在する、請求項 2 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 8】

前記プロトンポンプ阻害剤がラベプラゾールであり、前記腸溶性コーティングされたコア中に 5 m g と 1 0 0 m g との間で存在する、請求項 2 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 9】

a) 前記外部コーティング中の前記酸阻害剤が、1 ~ 3 0 0 m g で存在し、シメチジン；ラニチジン；ファモチジン；エプロチジン；パブチジン；ラフチジンおよびニザチジンからなる群より選択される H 2 ブロッカーであり；

b) 前記腸溶性コーティングされたコアが 5 ~ 6 0 0 m g の前記プロトンポンプ阻害剤を含み、前記プロトンポンプ阻害剤が、オメプラゾール；エソメプラゾール；ランソプラゾール；パントプラゾールおよびラベプラゾールからなる群より選択される、請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 3 0】

前記外部コーティング中の前記酸阻害剤が 5 ~ 1 5 0 m g で存在し、前記腸溶性コーティングされたコアが 5 ~ 2 0 0 m g の前記プロトンポンプ阻害剤を含む、請求項 2 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 1】

a) 治療有効量のプロトンポンプ阻害剤と一緒に含む複数の粒子であって、各粒子は、周囲の媒体の p H が少なくとも 3 . 5 となるまで、前記プロトンポンプ阻害剤を放出しない腸溶性コーティングで囲まれている複数の粒子；

b) 各腸溶性コーティングされた粒子を囲む外部コーティングまたは複数の粒子を囲む 1 つもしくは複数の外部コーティングであって、

i) 前記外部コーティングは、患者による摂取後 6 時間以内に胃酸分泌を抑制するのに十分な量の酸阻害剤を含み、前記酸阻害剤は、プロトンポンプ阻害剤および H 2 ブロッカーからなる群より選択され；

i i) 前記外部コーティングは腸溶性コーティングではなく、腸溶性コーティングで囲まれていない外部コーティングを含む、錠剤形態またはカプセル形態の医薬組成物。

【請求項 3 2】

前記外部コーティングが 1 0 0 0 ミクロン未満の厚さを有する、請求項 3 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 3】

前記外部コーティングが 2 5 ミクロンと 5 0 0 ミクロンとの間の厚さを有する、請求項 3 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 4】

前記外部コーティングが、安定剤または緩衝剤をさらに含む、請求項 3 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 5】

前記外部コーティング中の前記酸阻害剤がプロトンポンプ阻害剤である、請求項 3 1 から 3 4 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 3 6】

前記酸阻害剤が、オメプラゾール；エソメプラゾール；ランソプラゾール；パントプラゾールおよびラベプラゾールからなる群より選択される、請求項 3 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 7】

前記酸阻害剤が 1 ~ 2 0 0 m g で前記外部コーティング中に存在する、請求項 3 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 8】

前記酸阻害剤が 5 ~ 1 0 0 m g で前記外部コーティング中に存在する、請求項 3 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 9】

前記外部コーティング中の前記プロトンポンプ阻害剤が、1 . 0 ~ 3 . 0 の pH で安定である、請求項 3 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 0】

前記プロトンポンプ阻害剤が、AZD - 0 8 6 5、AR - H 0 4 7 1 0 8、CS - 5 2 6、プマプラゾール、レバプラザンおよびソラプラザンからなる群より選択される、請求項 3 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 1】

前記腸溶性コーティングされたコアが、1 ~ 6 0 0 m g の前記プロトンポンプ阻害剤を含み、前記プロトンポンプ阻害剤が、オメプラゾール；エソメプラゾール；ランソプラゾール；パントプラゾールおよびラベプラゾールからなる群より選択される、請求項 3 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 2】

前記プロトンポンプ阻害剤がオメプラゾールであり、前記腸溶性コーティングされたコア中に 5 m g と 5 0 m g との間で存在する、請求項 4 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 3】

前記プロトンポンプ阻害剤がエソメプラゾールであり、前記腸溶性コーティングされたコア中に 5 ~ 1 0 0 m g で存在する、請求項 4 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 4】

前記プロトンポンプ阻害剤がランソプラゾールであり、前記腸溶性コーティングされたコア中に 1 5 ~ 1 5 0 m g で存在する、請求項 4 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 5】

前記プロトンポンプ阻害剤がパントプラゾールであり、前記腸溶性コーティングされたコア中に 1 0 m g と 2 0 0 m g との間で存在する、請求項 4 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 6】

前記プロトンポンプ阻害剤がラベプラゾールであり、前記腸溶性コーティングされたコア中に 5 m g と 1 0 0 m g との間で存在する、請求項 4 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 7】

a) 前記外部コーティング中の前記酸阻害剤が、1～200mgで存在し、オメプラゾール；エソメプラゾール；ランソプラゾール；パントプラゾールおよびラベプラゾールからなる群より選択されるプロトンポンプ阻害剤であり；

b) 前記腸溶性コーティングされたコアが5～600mgの前記プロトンポンプ阻害剤を含み、前記プロトンポンプ阻害剤が、オメプラゾール；エソメプラゾール；ランソプラゾール；パントプラゾールおよびラベプラゾールからなる群より選択される、請求項31から34のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項48】

前記外部コーティング中の前記酸阻害剤が5～100mgで存在し、前記腸溶性コーティングされたコアが5～200mgの前記プロトンポンプ阻害剤を含む、請求項47に記載の医薬組成物。

【請求項49】

前記外部コーティング中の前記酸阻害剤がH₂ブロッカーである、請求項31から34のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項50】

前記酸阻害剤が、シメチジン；ラニチジン；ファモチジン；エプロチジン；パプチジン；ラフチジンおよびニザチジンからなる群より選択される、請求項49に記載の医薬組成物。

【請求項51】

前記酸阻害剤が1～300mgで前記外部コーティング中に存在する、請求項50に記載の医薬組成物。

【請求項52】

前記酸阻害剤が5～150mgで前記外部コーティング中に存在する、請求項50に記載の医薬組成物。

【請求項53】

前記腸溶性コーティングされたコアが5～600mgの前記プロトンポンプ阻害剤を含み、前記プロトンポンプ阻害剤が、オメプラゾール；エソメプラゾール；ランソプラゾール；パントプラゾールおよびラベプラゾールからなる群より選択される、請求項49に記載の医薬組成物。

【請求項54】

前記プロトンポンプ阻害剤がオメプラゾールであり、前記腸溶性コーティングされたコア中に5mgと50mgとの間で存在する、請求項53に記載の医薬組成物。

【請求項55】

前記プロトンポンプ阻害剤がエソメプラゾールであり、前記腸溶性コーティングされたコア中に5～100mgで存在する、請求項53に記載の医薬組成物。

【請求項56】

前記プロトンポンプ阻害剤がランソプラゾールであり、前記腸溶性コーティングされたコア中に15～150mgで存在する、請求項53に記載の医薬組成物。

【請求項57】

前記プロトンポンプ阻害剤がパントプラゾールであり、前記腸溶性コーティングされたコア中に10mgと200mgとの間で存在する、請求項53に記載の医薬組成物。

【請求項58】

前記プロトンポンプ阻害剤がラベプラゾールであり、前記腸溶性コーティングされたコア中に5mgと100mgとの間で存在する、請求項53に記載の医薬組成物。

【請求項59】

a) 前記外部コーティング中の前記酸阻害剤が、1～300mgで存在し、シメチジン；ラニチジン；ファモチジン；エプロチジン；パプチジン；ラフチジンおよびニザチジンからなる群より選択されるH₂ブロッカーであり；

b) 前記腸溶性コーティングされたコアが5～600mgの前記プロトンポンプ阻害剤を含み、前記プロトンポンプ阻害剤が、オメプラゾール；エソメプラゾール；ランソプラ

ゾール；パントプラゾールおよびラベプラゾールからなる群より選択される、請求項 3 1 から 3 4 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 6 0】

前記外部コーティング中の前記酸阻害剤が 5 ～ 1 5 0 m g で存在し、前記腸溶性コーティングされたコアが 5 ～ 2 0 0 m g の前記プロトンポンプ阻害剤を含む、請求項 5 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 6 1】

異常な胃酸産生、胃酸逆流または胃腸管に対する損傷を特徴とする疾患または状態について患者を治療するためのものである、請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 6 2】

前記疾患または状態が、十二指腸潰瘍；胃潰瘍；胃食道逆流症（GERD）；重篤なびらん性食道炎；低応答性全身性 GERD およびゾリンジャー - エリソン症候群からなる群より選択される、請求項 6 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 6 3】

異常な胃酸産生、胃酸逆流または胃腸管に対する損傷を特徴とする疾患または状態について患者を治療するためのものである、請求項 1 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 6 4】

前記疾患または状態が、十二指腸潰瘍；胃潰瘍；胃食道逆流症（GERD）；重篤なびらん性食道炎；低応答性全身性 GERD およびゾリンジャー - エリソン症候群からなる群より選択される、請求項 6 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 6 5】

異常な胃酸産生、胃酸逆流または胃腸管に対する損傷を特徴とする疾患または状態について患者を治療するためのものである、請求項 3 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 6 6】

前記疾患または状態が、十二指腸潰瘍；胃潰瘍；胃食道逆流症（GERD）；重篤なびらん性食道炎；低応答性全身性 GERD およびゾリンジャー - エリソン症候群からなる群より選択される、請求項 6 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 6 7】

異常な胃酸産生、胃酸逆流または胃腸管に対する損傷を特徴とする疾患または状態について患者を治療するためのものである、請求項 4 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 6 8】

前記疾患または状態が、十二指腸潰瘍；胃潰瘍；胃食道逆流症（GERD）；重篤なびらん性食道炎；低応答性全身性 GERD およびゾリンジャー - エリソン症候群からなる群より選択される、請求項 6 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 6 9】

錠剤単位剤形、または錠剤もしくはカプセルに含めるためのコーティングされた薬物ペレットを製造する方法であって、

a) 5 ～ 6 0 0 m g のプロトンポンプ阻害剤を含むコアを形成するステップ；

(b) 前記コアに腸溶性コーティングを適用するステップ；および

(c) 前記腸溶性コーティング上に外部コーティングをスプレーするステップを含み、前記外部コーティングは、

i) 腸溶性ではなく；

i i) 1 ～ 2 0 0 m g のプロトンポンプ阻害剤または 1 ～ 3 0 0 m g の H 2 ブロッカーのいずれかを含む、方法。

【請求項 7 0】

前記外部コーティングが 1 0 0 0 ミクロン未満の厚さを有する、請求項 6 9 に記載の方法。

【請求項 7 1】

前記外部コーティングが 2 5 ミクロンと 5 0 0 ミクロンとの間の厚さを有する、請求項

69に記載の方法。

【請求項72】

前記外部コーティングが、安定剤または緩衝剤をさらに含む、請求項69に記載の方法。

【請求項73】

前記腸溶性コーティングがpH感受性であり、周囲のpHが5.5以上になるまで前記コア中のプロトンポンプ阻害剤を放出しない、請求項69に記載の方法。

【請求項74】

前記外部コーティング中の前記酸阻害剤がプロトンポンプ阻害剤である、請求項69から73のいずれか一項に記載の方法。

【請求項75】

前記酸阻害剤が、オメプラゾール；エソメプラゾール；ランソプラゾール；パントプラゾールおよびラベプラゾールからなる群より選択される、請求項74に記載の方法。

【請求項76】

前記外部コーティング中の前記プロトンポンプ阻害剤が、1.0～3.0のpHで安定である、請求項74に記載の方法。

【請求項77】

前記プロトンポンプ阻害剤が、AZD-0865、AR-H047108、CS-526、プマプラゾール、レバプラザンおよびソラプラザンからなる群より選択される、請求項74に記載の方法。

【請求項78】

前記外部コーティング中の前記酸阻害剤がH₂ブロッカーである、請求項69から73のいずれか一項に記載の方法。

【請求項79】

前記酸阻害剤が、シメチジン；ラニチジン；ファモチジン；エプロチジン；パプチジン；ラフチジンおよびニザチジンからなる群より選択される、請求項78に記載の方法。