

【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充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<sub>2</sub>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、スマプラゾール、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 7 に記載の医薬組成物。

**【請求項 9】**

前記酸阻害剤が1～200mg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5～100mg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、5～600mg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 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 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 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15～150mg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10mgと200mg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5mgと100mg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、1～200mg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；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；スマプラゾール；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1～600mg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 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5～100mg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 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、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1～300mgで前記外部コーティング中に存在する、請求項20に記載の医薬組成物。

**【請求項 2 2】**

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21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1～600mg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19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5mgと50mgとの間で存在する、請求項23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5～100mgで存在する、請求項23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15～150mgで存在する、請求項23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10mgと200mgとの間で存在する、請求項23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5mgと100mgとの間で存在する、請求項23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、1～300mgで存在し、シメチジン；ラニチジン；ファモチジン；エブロチジン；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<sub>2</sub>プロッカーであり；

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5～150mg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29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充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<sub>2</sub>プ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1000ミクロン未満の厚さを有する、請求項31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25ミクロンと500ミクロンとの間の厚さを有する、請求項31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32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31から34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35に記載の医薬組成物。

**【請求項 3 7】**

前記酸阻害剤が1～200mgで前記外部コーティング中に存在する、請求項36に記載の医薬組成物。

**【請求項 3 8】**

前記酸阻害剤が5～100mgで前記外部コーティング中に存在する、請求項37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35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-0865、AR-H047108、CS-526、スマプラゾール、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39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、1～600mg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37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5mgと50mgとの間で存在する、請求項41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5～100mgで存在する、請求項41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15～150mgで存在する、請求項41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10mgと200mgとの間で存在する、請求項41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5mgと100mgとの間で存在する、請求項41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プロッカーである、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、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H2プロッカーであり；

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（G E R D）；重篤なびらん性食道炎；低応答性全身性 G E R D 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（G E R D）；重篤なびらん性食道炎；低応答性全身性 G E R D 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（G E R D）；重篤なびらん性食道炎；低応答性全身性 G E R D 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（G E R D）；重篤なびらん性食道炎；低応答性全身性 G E R D 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 プ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

6 9 に記載の方法。

【請求項 7 2】

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 6 9 に記載の方法

。

【請求項 7 3】

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 6 9 に記載の方法。

【請求項 7 4】

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 6 9 から 7 3 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 7 5】

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 7 4 に記載の方法。

【請求項 7 6】

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 7 4 に記載の方法。

【請求項 7 7】

前記プロトンポンプ阻害剤が、AZD - 0865、AR - H047108、CS - 526、スマプラゾール、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 7 4 に記載の方法。

【請求項 7 8】

前記外部コーティング中の前記酸阻害剤が H<sub>2</sub> ブロッカーである、請求項 6 9 から 7 3 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 7 9】

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、請求項 7 8 に記載の方法。