

【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29年3月30日(2017.3.30)

【公表番号】特表2016-513133(P2016-513133A)

【公表日】平成28年5月12日(2016.5.12)

【年通号数】公開・登録公報2016-028

【出願番号】特願2015-559595(P2015-559595)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/445 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/22 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/445

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/20

A 6 1 K 9/22

【手続補正書】

【提出日】平成29年2月24日(2017.2.24)

【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】

ドネペジルを含む徐放性医薬組成物であって、前記組成物は、被覆された組成物であり、前記組成物は、a)ドネペジル及び1つ以上の放出制御剤を含むコアと、b)1つ以上の放出制御剤を含む機能的被覆とを含み、

朝に投与される前記組成物の単回投与AUC<sub>(14-22)</sub>は、夜に投与されるドネペジルの即時放出組成物の単回投与AUC<sub>(2-10)</sub>の約5%～約30%未満であり、前記組成物は共に、同じ用量のドネペジルを有する、組成物。

【請求項2】

ドネペジルを含む徐放性医薬組成物であって、前記組成物は、被覆された組成物であり、前記組成物は、a)ドネペジル及び1つ以上の放出制御剤を含むコアと、b)1つ以上の放出制御剤を含む機能的被覆とを含み、

朝に投与される前記組成物の定常状態AUC<sub>(14-22)</sub>は、夜に投与されるドネペジルの即時放出組成物の定常状態AUC<sub>(2-10)</sub>の約5%～約25%未満であり、前記組成物は共に、同じ用量のドネペジルを有し、経口投与される、組成物。

【請求項3】

ドネペジルを含む徐放性医薬組成物であって、前記組成物は、被覆された組成物であり、前記組成物は、a)ドネペジル及び1つ以上の放出制御剤を含むコアと、b)1つ以上の放出制御剤を含む機能的被覆とを含み、

朝に投与される前記組成物の単回投与AUC<sub>(7-10)</sub>は、夜に投与されるドネペジルの即時放出組成物の単回投与AUC<sub>(19-22)</sub>の約25%～約85%を超える、前記組成物は共に、同じ用量のドネペジルを有する、組成物。

【請求項4】

ドネペジルを含む徐放性医薬組成物であって、前記組成物は、被覆された組成物であり

、前記組成物は、a) ドネペジル及び1つ以上の放出制御剤を含むコアと、b) 1つ以上の放出制御剤を含む機能的被覆とを含み、

朝に投与される前記組成物の定常状態AUC<sub>(7-10)</sub>は、夜に投与されるドネペジルの即時放出組成物の定常状態AUC<sub>(19-22)</sub>の約100%～約50%を超える、前記組成物は共に、同じ用量のドネペジルを有し、経口投与される、組成物。

#### 【請求項5】

ドネペジルを含む徐放性医薬組成物であって、前記組成物は、被覆された組成物であり、前記組成物は、a) ドネペジル及び1つ以上の放出制御剤を含むコアと、b) 1つ以上の放出制御剤を含む機能的被覆とを含み、

前記組成物は、37、50 rpmでのパドル溶出装置で、6.8バッファー900mL中で試験された場合に次のインビトロ溶出プロファイル、

約20%w/w未満のドネペジルは3～4時間で放出される、および  
85%w/wを超えるドネペジルは12時間後に放出される、  
を示す、組成物。

#### 【請求項6】

ドネペジルを含む徐放性医薬組成物であって、前記組成物は、被覆された組成物であり、前記組成物は、a) ドネペジル及び1つ以上の放出制御剤を含むコアと、b) 1つ以上の放出制御剤を含む機能的被覆とを含み、前記組成物の単回経口投与は、単回投与で経口的に投与されるドネペジルの持続放出組成物の用量修正AUC<sub>(0-t)</sub>の約80～約125%以内の用量修正AUC<sub>(0-t)</sub>を提供する、組成物。

#### 【請求項7】

請求項1, 2, 5または6のいずれか一項に記載の徐放性医薬組成物であって、前記組成物は、ドネペジル投与に必要な滴定期間を2～4週間短縮する、組成物。

#### 【請求項8】

ドネペジルを含む徐放性医薬組成物であって、前記組成物は、被覆された組成物であり、前記組成物は、a) ドネペジル及び1つ以上の放出制御剤を含むコアと、b) 1つ以上の放出制御剤を含む機能的被覆とを含み、前記組成物は、脳の内因性アセチルコリン血漿プロファイルにおいて、Ach分泌を刺激する血漿ドネペジル濃度を提供する、組成物。

#### 【請求項9】

請求項8に記載の徐放性医薬組成物であって、当該放出が約2～約8時間遅れるような薬物放出プロファイルを有し、ドネペジルの最大血漿濃度(C<sub>max</sub>)は、投与後、約8～約12時間で達成される、組成物。

#### 【請求項10】

請求項1, 2, 5, 6、又は8のいずれか一項に記載の徐放性医薬組成物であって、前記組成物(請求項5の組成物の場合、経口投与される)は、不眠症および悪夢の発生率の低下を提供する、組成物。

#### 【請求項11】

請求項1, 3, 4, 5、または8のいずれか一項に記載の徐放性医薬組成物であって、前記組成物(請求項5の組成物の場合、経口投与される)は、夕暮れ症候群の発生率の低下を提供する、組成物。

#### 【請求項12】

請求項1, 2, 5, 6または8のいずれか一項に記載の徐放性医薬組成物であって、前記組成物は、ドネペジル投与に必要な滴定期間を短縮する、組成物。

#### 【請求項13】

請求項1～6又は8のいずれか一項に記載の徐放性医薬組成物であって、前記組成物は、認知症および/または認識機能障害の兆候によって特徴づけられる疾患または状態の患者の治療における使用のための、組成物。

#### 【請求項14】

請求項1～6又は8のいずれか一項に記載の徐放性医薬組成物であって、前記組成物は、軽度、中程度、または重度のアルツハイマー病患者の治療における使用のための、組成

物。