【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】令和3年11月4日(2021.11.4)

【公表番号】特表2020-535158(P2020-535158A)
【公表日】令和2年12月3日(2020.12.3)
【年通号数】公開・登録公報2020-049
【出願番号】特願2020-517352(P2020-517352)
【国際特許分類】
Ａ６１Ｋ　 9/22　　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/454　　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　43/00　　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　35/00　　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/12　　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/32　　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/04　　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/26　　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/02　　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/38　　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/36　　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/34　　(2017.01)
Ａ６１Ｋ　47/10　　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/44　　(2017.01)
Ａ６１Ｋ　47/46　　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/14　　(2006.01)
【ＦＩ】
Ａ６１Ｋ　 9/22
Ａ６１Ｋ　31/454
Ａ６１Ｐ　43/00　　１１１
Ａ６１Ｐ　35/00
Ａ６１Ｋ　47/12
Ａ６１Ｋ　47/32
Ａ６１Ｋ　47/04
Ａ６１Ｋ　47/26
Ａ６１Ｋ　47/02
Ａ６１Ｋ　47/38
Ａ６１Ｋ　47/36
Ａ６１Ｋ　47/34
Ａ６１Ｋ　47/10
Ａ６１Ｋ　47/44
Ａ６１Ｋ　47/46
Ａ６１Ｋ　47/14

【手続補正書】
【提出日】令和3年9月27日(2021.9.27)
【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】
ニラパリブを、ニラパリブ遊離塩基を基準として約５０ｍｇ～約３５０ｍｇの量で含んでなる組成物であって、
前記組成物は、粒間相と粒外相とを含んでなる錠剤として処方された医薬組成物であり、かつ、
（ａ）前記粒間相の少なくとも１つの成分が希釈剤、結合剤、崩壊剤、流動化剤、もしくは滑沢剤であり；かつ／または
（ｂ）前記粒外相の少なくとも１つの成分が崩壊剤、流動化剤、もしくは滑沢剤である、前記組成物。
【請求項２】
トシル酸ニラパリブ一水和物を約１００ｍｇ～約５５０ｍｇの量で含んでなる組成物であって、
前記組成物は、粒間相と粒外相とを含んでなる錠剤として処方された医薬組成物であり、かつ、
前記組成物は、トシル酸ニラパリブ一水和物を前記錠剤組成物の約４０～５０重量％の量で含んでなる、前記組成物。
【請求項３】
前記粒間相が希釈剤を前記錠剤組成物の約７．５～１５重量％、約８～１４重量％、または約９～１１重量％の量で含んでなる、請求項２に記載の組成物。
【請求項４】
前記粒間相が第２の希釈剤を前記錠剤組成物の約２５～４０重量％、約３０～４０重量％、または約３０～３５重量％の量で含んでなる、請求項３に記載の組成物。
【請求項５】
前記粒間相が結合剤を前記錠剤組成物の約１～３重量％の量で含んでなる、請求項２～４のいずれか一項に記載の組成物。
【請求項６】
前記粒間相が崩壊剤を前記錠剤組成物の約０．１～２重量％または約０．５～１．５重量％の量で含んでなる、請求項２～５のいずれか一項に記載の組成物。
【請求項７】
前記粒間相が流動化剤、吸着剤、または吸収剤を前記錠剤組成物の約１～５重量％または約２～４重量％の量で含んでなる、請求項２～６のいずれか一項に記載の組成物。
【請求項８】
前記粒間相が滑沢剤を前記錠剤組成物の約０．１～２重量％の量で含んでなる、請求項２～７のいずれか一項に記載の組成物。
【請求項９】
前記粒外相が崩壊剤を前記錠剤組成物の約０．１～２重量％の量で含んでなる、請求項２～８のいずれか一項に記載の組成物。
【請求項１０】
前記粒外相が流動化剤または吸着剤または吸収剤を前記錠剤組成物の約０．１～２重量％の量で含んでなる、請求項２～９のいずれか一項に記載の組成物。
【請求項１１】
前記粒外相が滑沢剤を前記錠剤組成物の約０．１～２重量％の量で含んでなる、請求項２～１０のいずれか一項に記載の組成物。
【請求項１２】
錠剤を含んでなる組成物であって、
前記錠剤は、重量％で、下記成分：
（ａ）粒間部分に
（ｉ）４０～５０％のトシル酸ニラパリブ一水和物；
（ｉｉ）９～１１％の第１の希釈剤；

（ｉｉｉ）３０～４０％の第２の希釈剤；
（ｉｖ）１～３％の結合剤；
（ｖ）０．１～２％の崩壊剤；
（ｖｉ）２～４％の流動化剤または吸着剤または吸収剤；および
（ｖｉｉ）０．１～２％の滑沢剤；
（ｂ）粒外部分に
（ｉ）０．１～２％の崩壊剤；
（ｉｉ）０．１～２％の流動化剤または吸着剤または吸収剤；および
（ｉｉｉ）０．１～２％の滑沢剤
を含んでなる、前記組成物。
【請求項１３】
前記滑沢剤がステアリン酸マグネシウムである、請求項１２に記載の組成物。
【請求項１４】
前記崩壊剤がクロスポビドンまたはクロスカルメロースである、請求項１２または１３に記載の組成物。
【請求項１５】
前記流動化剤が二酸化ケイ素であり、場合により、前記流動化剤が中間メソポーラスシリカであり、さらに場合により、前記中間メソポーラスシリカがサイロイドＦＰ－２４４を含んでなる、請求項１２～１４のいずれか一項に記載の組成物。
【請求項１６】
錠剤を含んでなる組成物であって、
前記錠剤は、
（ａ）それを必要とする対象に投与された際にポリアデノシン二リン酸リボースポリメラーゼ（ＰＡＲＰ）を阻害する有効量のニラパリブ；
（ｂ）ラクトース一水和物、無水ラクトース、マンニトール、および第二リン酸カルシウムから選択される第１の希釈剤；
（ｃ）ステアリン酸マグネシウム；
（ｄ）微晶質セルロース、デンプン、ポリエチレンオキシド、およびヒドロキシプロピルメチルセルロース（ＨＰＭＣ）から選択される第２の希釈剤；ならびに
（ｅ）ポビドン（ＰＶＰ）、ヒドロキシプロピルセルロース（ＨＰＣ）、およびヒドロキシプロピルメチルセルロース（ＨＰＭＣ）から選択される結合剤
を含んでなる、前記組成物。
【請求項１７】
前記組成物が崩壊剤を含んでなり、前記崩壊剤がクロスポビドンまたはクロスカルメロースである、請求項１６に記載の組成物。
【請求項１８】
前記第１の希釈剤がラクトース一水和物である、請求項１２～１７のいずれか一項に記載の組成物。
【請求項１９】
前記第２の希釈剤が微晶質セルロースである、請求項１２～１８のいずれか一項に記載の組成物。
【請求項２０】
前記結合剤がポビドン（ＰＶＰ）である、請求項１２～１９のいずれか一項に記載の組成物。
【請求項２１】
二酸化ケイ素をさらに含んでなる、請求項１～２０のいずれか一項に記載の組成物。