

【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4年7月26日(2022.7.26)

【国際公開番号】WO2020/020790

【公表番号】特表2021-531297(P2021-531297A)

【公表日】令和3年11月18日(2021.11.18)

【出願番号】特願2021-503559(P2021-503559)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/192(2006.01)

10

A 6 1 P 9/00(2006.01)

A 6 1 P 13/12(2006.01)

A 6 1 P 25/00(2006.01)

A 6 1 P 3/00(2006.01)

A 6 1 P 21/00(2006.01)

A 6 1 P 19/00(2006.01)

A 6 1 P 27/02(2006.01)

A 6 1 K 45/00(2006.01)

A 6 1 P 29/00(2006.01)

A 6 1 K 47/32(2006.01)

20

A 6 1 K 47/36(2006.01)

A 6 1 K 47/38(2006.01)

A 6 1 K 9/14(2006.01)

A 6 1 K 9/20(2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/192

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 3/00

30

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 19/00

A 6 1 P 27/02

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 9/20

40

【手続補正書】

【提出日】令和4年7月15日(2022.7.15)

【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

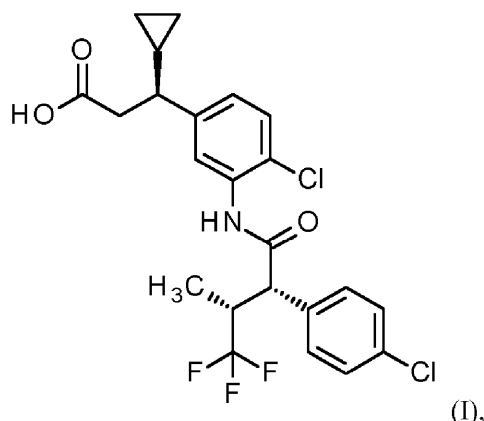
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

50

コアおよびシェルからなる浸透放出システムであって、シェルはコアの成分に対して不透過性の水透過性材料からなり、少なくとも1つのオリフィスを有し、コアは、式(I)



10

の(3S)-3-(4-クロロ-3-{[(2S,3R)-2-(4-クロロフェニル)-4,4,4-トリフルオロ-3-メチルブタノイル]アミノ}フェニル)-3-シクロプロピルプロパン酸、および少なくとも1つの親水性膨潤性ポリマーを含み、前記親水性膨潤性ポリマーはポリエチレンオキシドではない、浸透放出システム。

20

【請求項2】

前記浸透圧放出システムのコアが、

0.5重量%~50重量%の式(I)の化合物、

40重量%~99.5重量%の少なくとも1つの親水性膨潤性ポリマー、および

任意に少なくとも1つの浸透圧活性添加剤、および

任意に少なくとも1つの薬学的に慣用の賦形剤

を含む、請求項1に記載の浸透圧放出システム。

【請求項3】

前記コアが、

0.5重量%~50重量%の式(I)の化合物、

10重量%~50重量%のキサンタン

5重量%~40重量%のビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー、

任意に少なくとも1つのさらなる親水性膨潤性ポリマー、

任意に少なくとも1つのさらなる薬学的に慣用の賦形剤、および

任意に少なくとも1つの浸透圧活性添加剤

を含む、請求項1または2に記載の浸透圧放出システム。

30

【請求項4】

前記コアが、活性成分層および浸透層からなる2チャンバーシステムを含む、請求項1または2に記載の浸透放出システム。

【請求項5】

前記活性成分層が、

1重量%~50重量%の式(I)の化合物

20重量%~99重量%の少なくとも1種の親水性膨潤性ポリマー

任意に少なくとも1つの浸透圧活性添加剤および

任意に少なくとも1つの薬学的に慣用の賦形剤を含み、

前記浸透層が、

40重量%~90重量%の少なくとも1種の親水性膨潤性ポリマー

10重量%~60重量%の浸透活性添加剤、および

任意に少なくとも1つの薬学的に慣用の賦形剤を含む、

請求項4に記載の浸透圧放出システム。

40

【請求項6】

50

少なくとも1つの親水性膨潤性ポリマーが、キサンタン、セルロース誘導体、例えば、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またはカルボキシメチルセルロースナトリウム、デンプン誘導体、例えば、カルボキシメチルデンプンナトリウム、ビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー、ポリビニルピロリドン、メタクリル酸コポリマー、例えば、メタクリル酸-メタクリル酸メチルコポリマーおよびポリアクリル酸からなるリストから選択される、請求項1～5のいずれか一項に記載の浸透圧放出システム。

【請求項7】

前記シェルが酢酸セルロース、または酢酸セルロースとポリエチレングリコールとの混合物からなる、請求項1～6のいずれか一項に記載の浸透放出システム。

10

【請求項8】

前記コアの成分を互いに混合し、顆粒化し、錠剤化し、得られたコアをシェルでコーティングし、次いで前記シェルに式(I)の化合物を逃がすのに適した1つ以上のオリフィスが設けることを特徴とする、請求項1～7のいずれか一項に記載の浸透放出システムの製造方法。

【請求項9】

活性成分層の成分を混合し、顆粒化し、

浸透層の成分を混合し、顆粒化し

前記2種の顆粒を2層錠を得るために二層錠剤プレスでプレスし、

次に、得られたコアをシェルでコーティングし、

前記シェルは活性成分側に、1つ以上のオリフィスを備える、

請求項4～7のいずれかに記載の浸透圧放出システムの製造方法。

20

【請求項10】

疾患の治療および/または予防のための、請求項1～7のいずれかに記載の浸透圧放出システム。

【請求項11】

腎臓および心腎臓疾患、特に慢性腎臓疾患(CKD)および糖尿病性腎疾患(DKD)、心臓および心臓血管疾患、特に心不全(HFpEFおよびHFrEF)、心筋梗塞、狭心症、心筋症、高血圧および動脈硬化、肺および心肺疾患、特に肺高血圧症(PH)、眼科疾患、特に非増殖性糖尿病性網膜症(NPDR)および糖尿病性黄斑浮腫(DMO)、中枢神経系の障害、特に痴呆、骨障害、特に骨形成不全症、血栓塞栓性障害、筋ジストロフィー、虚血、血管障害、微小循環障害、繊維性疾患、特に全身性硬化症、炎症性疾患、代謝疾患、特にメタボリックシンドローム、脂質代謝異常および糖尿病の治療および/または予防のための、請求項1～7のいずれか一項に記載の浸透圧放出システム。

30

【請求項12】

有機硝酸塩、NOドナー、cGMP-PDE阻害薬、グアニル酸シクラーゼの刺激剤、抗血栓薬、降圧薬、MR拮抗薬、IP受容体作動薬、抗炎症活性物質、抗認知症薬、抗糖尿病薬、脂肪代謝を修飾する活性物質および骨・筋障害治療用活性物質からなる群から選択される1つ以上の他の活性成分と組み合わせ、請求項1～7のいずれか一項に記載の浸透圧放出システム。

40

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0161

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0161】

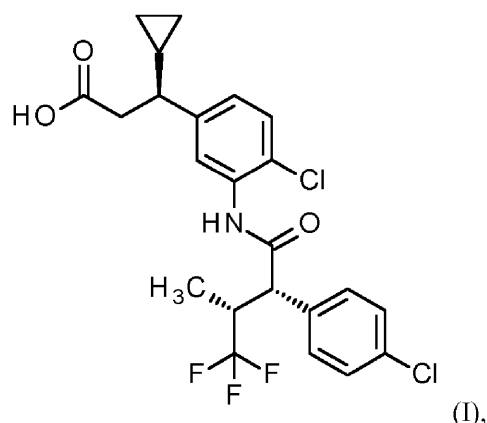
より正確に特定されない限り、使用される物質は引用された名称で当業者に公知の医薬賦形剤を指し、それぞれの薬局方に列挙される場合、欧州薬局方(PhEur 9)、米国薬局方(USP 41およびNF 36)および/または日本薬局方(JP、17th edition)の薬局方のそれぞれの要件を満たす。

50

一態様において、本発明は以下を提供する。

[項目 1]

コアおよびシェルからなる浸透放出システムであって、シェルはコアの成分に対して不透過性の水透過性材料からなり、少なくとも1つのオリフィスを有し、コアは、式(I)



10

の(3S)-3-(4-クロロ-3-{[(2S,3R)-2-(4-クロロフェニル)-4,4,4-トリフルオロ-3-メチルブタノイル]アミノ}フェニル)-3-シクロプロピルプロパン酸、および少なくとも1つの親水性膨潤性ポリマーを含み、前記親水性膨潤性ポリマーはポリエチレンオキシドではない、浸透放出システム。

20

[項目 2]

前記浸透圧放出システムのコアが、

0.5重量%~50重量%の式(I)の化合物、

40重量%~99.5重量%の少なくとも1つの親水性膨潤性ポリマー、および

任意に少なくとも1つの浸透圧活性添加剤、および

任意に少なくとも1つの薬学的に慣用の賦形剤

を含む、項目1に記載の浸透圧放出システム。

30

[項目 3]

前記コアが、

0.5重量%~50重量%の式(I)の化合物、

10重量%~50重量%のキサンタン

5重量%~40重量%のビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー、

任意に少なくとも1つのさらなる親水性膨潤性ポリマー、

任意に少なくとも1つのさらなる薬学的に慣用の賦形剤、および

任意に少なくとも1つの浸透圧活性添加剤

を含む、項目1または2に記載の浸透圧放出システム。

[項目 4]

前記コアが、活性成分層および浸透層からなる2チャンバーシステムを含む、項目1または2に記載の浸透放出システム。

40

[項目 5]

前記活性成分層が、

1重量%~50重量%の式(I)の化合物

20重量%~99重量%の少なくとも1種の親水性膨潤性ポリマー

任意に少なくとも1つの浸透圧活性添加剤および

任意に少なくとも1つの薬学的に慣用の賦形剤を含み、

前記浸透層が、

40重量%~90重量%の少なくとも1種の親水性膨潤性ポリマー

50

10重量%～60重量%の浸透活性添加剤、および任意に少なくとも1つの薬学的に慣用の賦形剤を含む、項目4に記載の浸透圧放出システム。

[項目6]

少なくとも1つの親水性膨潤性ポリマーが、キサンタン、セルロース誘導体、例えば、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またはカルボキシメチルセルロースナトリウム、デンプン誘導体、例えば、カルボキシメチルデンプンナトリウム、ビニルピロリドン-酢酸ビニルコポリマー、ポリビニルピロリドン、メタクリル酸コポリマー、例えば、メタクリル酸-メタクリル酸メチルコポリマーおよびポリアクリル酸からなるリストから選択される、項目1～5のいずれか一項に記載の浸透圧放出システム。

10

[項目7]

前記シェルが酢酸セルロース、または酢酸セルロースとポリエチレングリコールとの混合物からなる、項目1～6のいずれか一項に記載の浸透放出システム。

[項目8]

前記コアの成分を互いに混合し、顆粒化し、錠剤化し、得られたコアをシェルでコーティングし、次いで前記シェルに式(I)の化合物を逃がすのに適した1つ以上のオリフィスが設けることを特徴とする、項目1～7のいずれか一項に記載の浸透放出システムの製造方法。

20

[項目9]

活性成分層の成分を混合し、顆粒化し、浸透層の成分を混合し、顆粒化し、前記2種の顆粒を2層錠を得るために二層錠剤プレスでプレスし、次に、得られたコアをシェルでコーティングし、前記シェルは活性成分側に、1つ以上のオリフィスを備える、項目4～7のいずれかに記載の浸透圧放出システムの製造方法。

[項目10]

疾患の治療および/または予防のための、項目1～7のいずれかに記載の浸透圧放出システム。

[項目11]

腎臓および心腎臓疾患、特に慢性腎臓疾患(CKD)および糖尿病性腎疾患(DKD)、心臓および心臓血管疾患、特に心不全(HFpEFおよびHFREF)、心筋梗塞、狭心症、心筋症、高血圧および動脈硬化、肺および心肺疾患、特に肺高血圧症(PH)、眼科疾患、特に非増殖性糖尿病性網膜症(NPDR)および糖尿病性黄斑浮腫(DMO)、中枢神経系の障害、特に痴呆、骨障害、特に骨形成不全症、血栓塞栓性障害、筋ジストロフィー、虚血、血管障害、微小循環障害、繊維性疾患、特に全身性硬化症、炎症性疾患、代謝疾患、特にメタボリックシンドローム、脂質代謝異常および糖尿病の治療および/または予防のための、項目1～7のいずれか一項に記載の浸透圧放出システム。

30

[項目12]

有機硝酸塩、NOドナー、cGMP-PDE阻害薬、グアニル酸シクラーゼの刺激剤、抗血栓薬、降圧薬、MR拮抗薬、IP受容体作動薬、抗炎症活性物質、抗認知症薬、抗糖尿病薬、脂肪代謝を修飾する活性物質および骨・筋障害治療用活性物質からなる群から選択される1つ以上の他の活性成分と組み合わせ、項目1～7のいずれか一項に記載の浸透圧放出システム。

40

[項目13]

項目1～7のいずれかに定義される浸透圧放出システムの投与による、ヒトおよび動物の腎および心腎障害、特に慢性腎疾患(CKD)および糖尿病性腎疾患(DKD)、心および心臓血管障害、特に心不全(HFpEFおよびHFREF)、心筋梗塞、狭心症、心筋症、高血圧および動脈硬化、肺および心肺障害、特に肺高血圧(PH)、眼科障害、特に非増殖性糖尿病性網膜症(NPDR)および糖尿病性黄斑浮腫(DMO)、中枢神経系の

50

障害、特に骨形成不全、血栓塞栓性障害、筋ジストロフィー、虚血、血管障害、微小循環障害、繊維性疾患、特に全身性硬化症、炎症性障害、および代謝性障害、特にメタボリックシンドローム、脂質代謝異常および糖尿病の治療および/または予防のための方法。

10

20

30

40

50