(19)日本国特許庁(JP)　(12)公表特許公報(A)　(11)公表番号
特表2024-501839
(P2024-501839A)
(43)公表日　令和6年1月16日(2024.1.16)

(51)国際特許分類		FI		テーマコード（参考）
Ａ６１Ｋ	*9/20 (2006.01)*	Ａ６１Ｋ	9/20	４Ｃ０７６
Ａ６１Ｐ	*1/00 (2006.01)*	Ａ６１Ｐ	1/00	４Ｃ０８６
Ａ６１Ｋ	*33/04 (2006.01)*	Ａ６１Ｋ	33/04	４Ｃ２０６
Ａ６１Ｋ	*9/48 (2006.01)*	Ａ６１Ｋ	9/48	
Ａ６１Ｐ	*1/10 (2006.01)*	Ａ６１Ｐ	1/10	

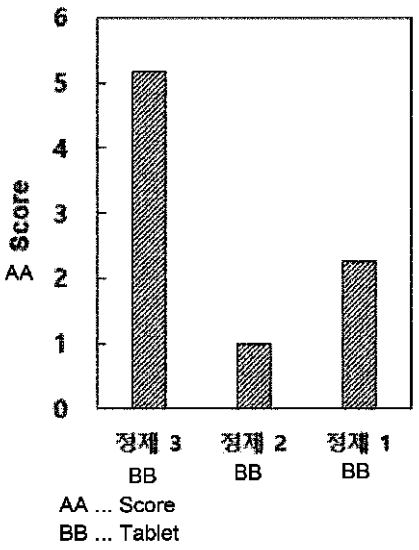
審査請求　未請求　予備審査請求　未請求　（全30頁）　最終頁に続く

(21)出願番号　特願2023-539331(P2023-539331)
(86)(22)出願日　令和3年12月30日(2021.12.30)
(85)翻訳文提出日　令和5年6月27日(2023.6.27)
(86)国際出願番号　PCT/KR2021/020327
(87)国際公開番号　WO2022/146089
(87)国際公開日　令和4年7月7日(2022.7.7)
(31)優先権主張番号　10-2020-0189688
(32)優先日　令和2年12月31日(2020.12.31)
(33)優先権主張国・地域又は機関
韓国(KR)
(31)優先権主張番号　10-2020-0189689
(32)優先日　令和2年12月31日(2020.12.31)
(33)優先権主張国・地域又は機関
韓国(KR)
(81)指定国・地域　AP(BW,GH,GM,KE,LR,LS,MW,MZ,NA
最終頁に続く

(71)出願人　519165216
テジュン ファーマシューティカル カンパニー リミテッド
ＴＡＥＪＯＯＮ ＰＨＡＲＭＡＣＥＵＴＩＣＡＬ ＣＯ．，ＬＴＤ．
大韓民国 ０４４０１ ソウル、ヨンサン－グ、デサグワン－ロ ３１－ギル、８８，Ｄａｅｓａｇｗａｎ－ｒｏ ３１－ｇｉｌ，Ｙｏｎｇｓａｎ－ｇｕ，Ｓｅｏｕｌ ０４４０１，Ｒｅｐｕｂｌｉｃ ｏｆ Ｋｏｒｅａ
(74)代理人　110002860
弁理士法人秀和特許事務所
(72)発明者　イ，ジュンヨブ
大韓民国 ０４４０１ ソウル ヨンサング
最終頁に続く

(54)【発明の名称】　腸管洗浄用の経口固形製剤

(57)【要約】
本発明は、副作用を最小限に抑え、服薬利便性および服薬順応度に優れ、迅速な薬効の発現が可能で、優れた腸管洗浄力を有する腸管洗浄用の経口固形製剤に関する。



【特許請求の範囲】
【請求項１】
硫酸塩を含み、単位固形製剤当たりの重量が約０．３ｇ以下である、経口固形製剤。
【請求項２】
前記硫酸塩を約２５～６０ｇ含む、請求項１に記載の経口固形製剤。
【請求項３】
前記硫酸塩は、硫酸ナトリウム、硫酸カリウム、および硫酸マグネシウムからなる群から選択される少なくとも一つを含む、請求項１に記載の経口固形製剤。
【請求項４】
前記硫酸塩は、硫酸ナトリウムおよび硫酸カリウムを含む、請求項３に記載の経口固形製剤。
【請求項５】
前記硫酸塩は、硫酸ナトリウム、硫酸マグネシウム、および硫酸カリウムを含む、請求項３に記載の経口固形製剤。
【請求項６】
シメチコンをさらに含む、請求項１に記載の経口固形製剤。
【請求項７】
前記固形製剤は、単位固形製剤を約８０～１２００個含むものである、請求項１に記載の経口固形製剤。
【請求項８】
下剤成分を含み、単位固形製剤当たりの重量が約０．５ｇ以下である、経口固形製剤。
【請求項９】
前記下剤成分は、ポリエチレングリコール、アスコルビン酸、アスコルビン酸の塩、ソルビトール、マンニトール、クエン酸、クエン酸の塩、マグネシウム塩、カルボキシメチルセルロース、カルボキシメチルセルロースの塩、ラクツロース、および硫酸塩からなる群から選択される少なくとも一つを含む、請求項８に記載の経口固形製剤。
【請求項１０】
前記マグネシウム塩は、酸化マグネシウム、重質酸化マグネシウム、水酸化マグネシウム、炭酸マグネシウム、重質炭酸マグネシウム、および硫酸マグネシウムからなる群から選択される少なくとも一つを含む、請求項９に記載の経口固形製剤。
【請求項１１】
前記硫酸塩は、硫酸ナトリウム、硫酸カリウム、および硫酸マグネシウムからなる群から選択される少なくとも一つを含む、請求項９に記載の経口固形製剤。
【請求項１２】
前記固形製剤は、単位固形製剤を約７０～２０００個含むものである、請求項８に記載の経口固形製剤。
【請求項１３】
前記単位固形製剤当たりの重量が約０．０５ｇ以上である、請求項１または８に記載の経口固形製剤。
【請求項１４】
薬学的に許容可能な添加剤をさらに含む、請求項１または８に記載の経口固形製剤。
【請求項１５】
前記単位固形製剤は、錠剤、ペレット、カプセル剤、または丸剤の形態である、請求項１または８に記載の経口固形製剤。
【請求項１６】
前記固形製剤は、腸管洗浄用のものである、請求項１または８に記載の経口固形製剤。
【発明の詳細な説明】
【技術分野】
【０００１】
本発明は、腸管洗浄用の経口固形製剤に関する。

【背景技術】
【０００２】
大腸癌は、世界的によく見られる癌の一つであり、その発症率は継続的に増加傾向にある。大腸癌は、特に症状がないため早期に発見することが難しく、大腸癌を早期に発見して診断するためには、大腸内視鏡検査が必須である。
【０００３】
大腸内視鏡検査において、正確な検査および疾患の診断のためには、腸管の洗浄有無および腸管内清浄度が非常に重要である。腸管がきれいに洗浄されていない場合、診断そのものが難しかったり検査の精度が低下するなどの問題があり、場合によっては腸管洗浄剤を再度服用し再検査を行うこともある。
【０００４】
特に、精密な大腸内視鏡検査および疾患の診断のためには、腸管洗浄剤の定められた用法および用量を守って全ての薬液を飲み切ることが重要である。腸管洗浄剤は、その特性上、医師から処方されたものを患者自ら事前に服用することが多い。
【０００５】
硫酸塩を有効成分とする代表的な腸管洗浄剤としては、無水硫酸ナトリウム３５ｇ、硫酸カリウム６．２６ｇ、無水硫酸マグネシウム３．２ｇからなるサプレップ液がある。
【０００６】
しかし、腸管洗浄用の液剤は、飲む薬液の量が多過ぎる、さらに苦味があるということから患者が薬液を飲みきれず、検査がうまくいかないことが多い。また、服用後に吐き気や嘔吐などの副作用を訴えるという問題があった。これらの問題を解決するために錠剤の腸管洗浄剤が開発されているが、腸管洗浄のためには約１．６～１．７ｇの大きめの錠剤を約２８錠以上も服用する必要がある。したがって、粒の大きい錠剤を飲み込まなければならず、依然として服用に困難があり、服用後においても胸焼けや吐き気、腹痛など、胃腸障害を訴える問題は残っているままである。また、大きめの錠剤が胃腸管内で完全に溶解されず残留物が残ることで発赤などの胃腸障害を起したり、胃内視鏡および大腸内視鏡検査を行う際に内視鏡カメラの視野を妨げたりするなど、内視鏡検査における精度を低下させる可能性がある。また、不十分な腸管内清浄度によって内視鏡検査の際に病変の発見が難しくなる可能性もある。
【０００７】
したがって、優れた洗浄力を示しつつも服薬利便性および服薬順応度が改善された腸管洗浄用製剤が求められている実情である。
【発明の概要】
【発明が解決しようとする課題】
【０００８】
本発明の目的は、腸管洗浄用の経口固形製剤を提供することである。
【課題を解決するための手段】
【０００９】
以下に本発明の実施形態を記載するが、これは本発明をより理解しやすくするために提供するものであって、本発明がこれに限定されるものではない。下記本発明で開示される各説明および実施形態は、それぞれ別の説明および実施形態にも適用することができる。すなわち、下記本発明で開示される様々な要素の全ての組み合わせが本発明の範囲に属する。
【００１０】
また、本明細書において、特に定義しない限り、単数は複数を含み、複数は単数を含む。
【００１１】
本発明は、有効成分として下剤成分を含む経口固形製剤を提供する。
【００１２】
本発明の経口固形製剤は、腸管洗浄用のものであってもよい。すなわち、本発明の経口

固形製剤は、腸管洗浄剤であってもよい。

【００１３】

前記経口固形製剤は、単位固形製剤を含み、前記経口固形製剤の単位固形製剤は、重量が約０．５ｇ以下であってもよい。また、前記経口固形製剤の単位固形製剤は、重量が約０．０５ｇ以上であってもよい。

【００１４】

本発明において、「単位固形製剤」は、固形製剤を構成する一つ（単数）の固形製剤を意味し、「固形製剤」は、複数の単位固形製剤を含む集団を意味する。

【００１５】

本発明において、単位固形製剤の重量は、単位固形製剤（１個）当たりの重量を意味し得る。すなわち、本発明の固形製剤は、単位固形製剤（１個）当たりの重量が約０．５ｇ以下である単位固形製剤を含んでいてもよい。また、前記単位固形製剤（１個）当たりの重量は、約０．０５ｇ以上であってもよい。

【００１６】

前記固形製剤は、複数の単位固形製剤を含む。本発明の実施形態において、前記固形製剤は、前記単位固形製剤を約７０～２０００個含んでいてもよい。具体的には、前記単位固形製剤を約７０個以上、約７１個以上、約７２個以上、約８０個以上、約８６個以上、約８９個以上、約９０個以上、約１００個以上、約１０７個以上、約１１０個以上、約１２０個以上、約１２５個以上、約１２９個以上、約１３０個以上、約１３４個以上、約１４０個以上、約１４３個以上、約１５０個以上、約１６０個以上、約１６１個以上、約１７０個以上、約１７２個以上、約１８０個以上、約１８８個以上、約１９０個以上、約２００個以上、約２１０個以上、約２１５個以上、約２２０個以上、約２３０個以上、約２４０個以上、約２５０個以上、約２６０個以上、約２７０個以上、約２８０個以上、約２８６個以上、約２９０個以上、約３００個以上、約３２２個以上、約３４４個以上、約３５０個以上、約３５８個以上、約３８７個以上、または約４００個以上含んでいてもよく、約２０００個以下、約１５００個以下、約１４３４個以下、約１２００個以下、約１１００個以下、約１０７５個以下、約１０００個以下、約９６８個以下、約９００個以下、約８６０個以下、約８００個以下、約７５３個以下、約７００個以下、約６４５個以下、約６００個以下、約５９２個以下、約５００個以下、または約４００個以下含んでいてもよい。

【００１７】

本発明の実施形態において、前記単位固形製剤の重量は、約０．０５ｇ以上、約０．１ｇ以上、約０．１５ｇ以上、約０．２ｇ以上、約０．２５ｇ以上であってもよく、約０．５ｇ以下、約０．５ｇ未満、約０．４ｇ以下、約０．３ｇ以下、約０．２５ｇ以下、約０．２ｇ以下であってもよい。

【００１８】

本発明の実施形態において、前記単位固形製剤の重量は、約０．０５～０．５ｇ、約０．１～０．５ｇ、約０．１ｇ以上約０．５ｇ未満、約０．１～０．４ｇ、約０．０５～０．４ｇ、約０．０５～０．３ｇ、約０．１～０．３ｇであってもよく、より具体的には、約０．１～０．２ｇ、または約０．１５～０．２ｇであってもよい。

【００１９】

本発明の下剤成分を含む固形製剤は、前記単位固形製剤の重量を約０．５ｇ以下、具体的には、約０．５ｇ未満、約０．４ｇ以下、より具体的には、約０．３ｇ以下とすることで、副作用を最小限に抑え、服薬利便性を高め、迅速な薬効の発現が可能で、優れた腸管洗浄力を示すことができる。前記下剤成分を含む固形製剤は、単位固形製剤の重量が前記重量より高い場合、服用時に嚥下困難（嚥下障害）や胸焼け、吐き気、むかつき、嘔吐などの胃腸障害および／または胃腸や大腸の充血、出血、びらん、浮腫などの副作用が著しく高くなり、服薬利便性および服薬順応度が大きく低下することがある。また、崩壊速度が大幅に低下し、腸管洗浄力が低下する可能性があり、体内に製剤残留物が残って内視鏡曇りなどを引き起こす可能性がある。

【００２０】
すなわち、前記下剤成分を含む固形製剤は、単位固形製剤の重量範囲を前後して安全性（副作用）、服薬利便性、服薬順応度、腸管洗浄力、崩壊、製剤残留物の発生などに著しい差が生じることがある。
【００２１】
下剤成分は、腸管内容物を排泄する目的で用いられる成分を意味し、前記下剤成分は、ポリエチレングリコール、アスコルビン酸、アスコルビン酸の塩、ソルビトール、マンニトール、クエン酸、クエン酸の塩、マグネシウム塩、カルボキシメチルセルロース、カルボキシメチルセルロースの塩、ラクツロース、および硫酸塩からなる群から選択される少なくとも一つを含んでいてもよい。
【００２２】
前記塩は、薬学的に許容可能な塩であれば制限なく使用可能であるが、例えば、ナトリウム、カリウム、マグネシウムなどであってもよい。具体的に、前記アスコルビン酸の塩は、アスコルビン酸ナトリウム、アスコルビン酸カリウム、アスコルビン酸マグネシウムなどであってもよい。また、前記クエン酸の塩は、クエン酸ナトリウム、クエン酸カリウム、クエン酸マグネシウムなどであってもよい。また、前記カルボキシメチルセルロースの塩は、カルボキシメチルセルロースナトリウムであってもよい。
【００２３】
本発明の実施形態において、マグネシウム塩は、酸化マグネシウム、重質酸化マグネシウム、水酸化マグネシウム、炭酸マグネシウム、重質炭酸マグネシウム、および硫酸マグネシウムからなる群から選択される少なくとも一つを含んでいてもよい。
【００２４】
本発明の実施形態において、前記硫酸塩は、硫酸ナトリウム、硫酸カリウム、および硫酸マグネシウムからなる群から選択される少なくとも一つを含んでいてもよい。本発明の実施形態において、前記硫酸塩は、硫酸ナトリウムおよび硫酸カリウムであってもよい。別の実施形態において、前記硫酸塩は、硫酸ナトリウムおよび硫酸マグネシウムであってもよい。さらに別の実施形態において、前記硫酸塩は、硫酸ナトリウム、硫酸カリウム、および硫酸マグネシウムの混合物であってもよい。また、前記硫酸塩は、無水物または水和物であってもよく、好ましくは、前記硫酸ナトリウムまたは前記硫酸マグネシウムは、無水物であってもよい。
【００２５】
前記固形製剤は、前記下剤成分を約２０ｇ以上含んでいてもよい。具体的には、前記固形製剤は、前記下剤成分を約２５ｇ以上、約３０ｇ以上、約３５ｇ以上含んでいてもよいが、必ずしもこれに限定されるものではない。前記固形製剤は、前記下剤成分を約５００ｇ以下含んでいてもよい。具体的には、前記固形製剤は、前記下剤成分を約４６５ｇ以下、約４２０ｇ以下、約３７２ｇ以下、約３００ｇ以下、約２７９ｇ以下、約２７０ｇ以下、約２６０ｇ以下、約２４０ｇ以下、約２３０ｇ以下、約２００ｇ以下、約１８６ｇ以下含んでいてもよい。より具体的には、前記固形製剤は、前記下剤成分を約１５０ｇ以下、約１４０ｇ以下、約１３０ｇ以下、約１２０ｇ以下、約１１０ｇ以下、約１００ｇ以下、約９３ｇ以下、約９０ｇ以下、約８０ｇ以下、約７０ｇ以下、約６０ｇ以下、約５５ｇ以下含んでいてもよいが、必ずしもこれに限定されるものではない。
【００２６】
本発明の実施形態において、前記固形製剤は、下剤成分を合計約２０～５００ｇ含んでいてもよい。具体的には、前記固形製剤は、前記下剤成分を合計約２０～４２０ｇ、約２０～３００ｇ、約２０～２００ｇ、約２０～１５０ｇ含んでいてもよい。より具体的には、前記固形製剤は、前記下剤成分を約２０～１００ｇ、約２０～９０ｇ、約２０～８０ｇ、約２５～１００ｇ、約２５～９０ｇ、約２５～８０ｇ、約２５～７０ｇ、約２５～６０ｇ、約２５～５５ｇ含んでいてもよいが、必ずしもこれに限定されるものではない。
【００２７】
本発明の実施形態において、前記固形製剤は、前記硫酸塩を合計約０．１ｇ以上、約５

ｇ以上、約１０ｇ以上含んでいてもよく、前記硫酸塩を合計約６０ｇ以下、約５０ｇ以下、約４５ｇ以下、約４０ｇ以下含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。本発明の実施形態において、前記固形製剤は、前記硫酸塩を合計約０．１～６０ｇ含んでいてもよい。具体的には、前記固形製剤は、前記硫酸塩を合計約５～５０ｇ含んでいてもよい。より具体的には、前記固形製剤は、前記硫酸塩を約５～４５ｇ、または約１０～４０ｇ含んでいてもよいが、必ずしもこれに限定されるものではない。

【００２８】

本発明の実施形態において、前記固形製剤は、ポリエチレングリコールを合計約０．１ｇ以上、約５ｇ以上、約１０ｇ以上含んでいてもよく、合計約４５０ｇ以下、約３００ｇ以下、約２５０ｇ以下、約２００ｇ以下、約１００ｇ以下、約８０ｇ以下、約５０ｇ以下、約４０ｇ以下含んでいてもよいが、必ずしもこれに限定されるものではない。本発明の実施形態において、前記固形製剤は、前記ポリエチレングリコールを合計約０．１～４５０ｇ含んでいてもよい。具体的には、前記固形製剤は、合計約０．１～３００ｇ、合計約５～２５０ｇのポリエチレングリコールを含んでいてもよい。より具体的には、前記固形製剤は、合計約１０～２００ｇ、合計約１０～１００ｇ、合計約１０～８０ｇ、合計約１０～５０ｇ、合計約１０～４０ｇのポリエチレングリコールを含んでいてもよいが、必ずしもこれに限定されるものではない。

【００２９】

本発明の実施形態において、前記固形製剤は、前記アスコルビン酸および／またはその塩を合計約０．１ｇ以上、約５ｇ以上、約１０ｇ以上含んでいてもよく、合計約１５０ｇ以下、約１００ｇ以下、約５０ｇ以下、約３０ｇ以下含んでいてもよいが、必ずしもこれに限定されるものではない。本発明の実施形態において、前記固形製剤は、前記アスコルビン酸および／またはその塩を合計約０．１～１５０ｇ含んでいてもよく、具体的には、合計約５～１００ｇ、より具体的には、合計約５～５０ｇ、合計約１０～３０ｇ含んでいてもよいが、必ずしもこれに限定されるものではない。

【００３０】

本発明の実施形態において、前記固形製剤は、前記ソルビトールおよび／またはマンニトールを合計約０．１ｇ以上、約５ｇ以上、約１０ｇ以上含んでいてもよく、合計約１５０ｇ以下、約１００ｇ以下、約５０ｇ以下含んでいてもよいが、必ずしもこれに限定されるものではない。本発明の実施形態において、前記固形製剤は、前記ソルビトールおよび／またはマンニトールを合計約０．１～１５０ｇ含んでいてもよく、具体的には、約５～１００ｇ、より具体的には、約５～５０ｇ含んでいてもよいが、必ずしもこれに限定されるものではない。

【００３１】

本発明の実施形態において、前記固形製剤は、前記クエン酸および／またはその塩を合計約０．１ｇ以上、約１ｇ以上、約１０ｇ以上含んでいてもよく、合計約１００ｇ以下、約５０ｇ以下、約３０ｇ以下含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。本発明の実施形態において、前記固形製剤は、前記クエン酸および／またはその塩を合計約０．１～１００ｇ含んでいてもよく、具体的には、合計約１～５０ｇ、より具体的には、合計約１０～３０ｇ含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。

【００３２】

本発明の実施形態において、前記固形製剤は、前記マグネシウム塩を合計約０．１ｇ以上、約１ｇ以上含んでいてもよく、合計約３０ｇ以下、約１０ｇ以下含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。本発明の実施形態において、前記固形製剤は、前記マグネシウム塩を合計約０．１～３０ｇ含んでいてもよく、具体的には、合計約１～３０ｇ、より具体的には、合計約１～１０ｇ含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。

【００３３】

本発明の実施形態において、前記固形製剤は、前記カルボキシメチルセルロースおよび／またはその塩を合計約０．１ｇ以上、約０．２ｇ以上含んでいてもよく、合計約２０ｇ

以下、約１２ｇ以下、約８ｇ以下、約６ｇ以下含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。本発明の実施形態において、前記固形製剤は、前記カルボキシメチルセルロースおよび／またはその塩を合計約０．１～２０ｇ含んでいてもよく、具体的には、合計約０．２～６ｇ含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。

【００３４】

本発明の実施形態において、前記固形製剤は、前記ラクツロースを合計約１ｇ以上、約２ｇ以上、約５ｇ以上含んでいてもよく、合計約１００ｇ以下、約５０ｇ以下、約４０ｇ以下含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。本発明の実施形態において、前記固形製剤は、前記ラクツロースを合計約１～１００ｇ含んでいてもよく、具体的には、合計約２～５０ｇ、より具体的には、合計約５～４０ｇ含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。

【００３５】

前記固形製剤において、下剤成分の含有量は、固形製剤に含まれる複数の単位固形製剤に含まれる下剤成分の合計含有量を意味し得る。前記下剤成分を含む固形製剤は、前述した含有量で下剤成分を含むことで、優れた腸管洗浄力を示しつつ副作用を最小限に抑えることができる。

【００３６】

本発明の実施形態において、本発明の単位固形製剤は、下剤成分を合計約２０ｍｇ以上、約２５ｍｇ以上、約３０ｍｇ以上、約３５ｍｇ以上、約４０ｍｇ以上、約４５ｍｇ以上含んでいてもよく、合計約５００ｍｇ以下、約５００ｍｇ未満、約４５０ｍｇ以下、約４００ｍｇ以下、約３５０ｍｇ以下、具体的には、約３００ｍｇ以下、約２９５ｍｇ以下、約２９０ｍｇ以下、約２８５ｍｇ以下、約２８０ｍｇ以下、約２７５ｍｇ以下、約２７０ｍｇ以下含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。

【００３７】

本発明の実施形態において、前記単位固形製剤は、前記下剤成分を約２０～５００ｍｇ含んでいてもよい。本発明の実施形態において、前記単位固形製剤は、前記下剤成分を約２０ｍｇ以上５００ｍｇ未満含んでいてもよい。具体的には、前記単位固形製剤は、前記下剤成分を合計約２０～３００ｍｇ、約２５～２９５ｍｇ、より具体的には、前記単位固形製剤は、前記下剤成分を約２９～２９０ｍｇ、約４０～２９０ｍｇ、約４５～２９０ｍｇ、約４０～２９５ｍｇ、約４５～２９５ｍｇ、約４０～２８５ｍｇ、または約４５～２８５ｍｇ含んでいてもよいが、必ずしもこれに限定されるものではない。

【００３８】

本発明の単位固形製剤は、下剤成分を単位固形製剤重量の約４０％以上、約５０％以上、約６０％以上、約７０％以上、約８０％以上、約９０％以上、約９５％以上、約９６％以上、約９７％以上、約９８％以上、約９９％以上、約１００％または約１００％以下含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。

【００３９】

前記下剤成分を含む単位固形製剤は、前述したのと同様の含有量で下剤成分を含むことで、優れた腸管洗浄力を示しつつ副作用を最小限に抑えることができ、単位固形製剤を製造したときに単位固形製剤の物性に優れる。

【００４０】

前記固形製剤は、シメチコンをさらに含んでいてもよい。前記シメチコンは、有効成分として前記固形製剤に含まれてもよい。

【００４１】

本発明の実施形態において、前記固形製剤は、シメチコンを合計約０．０１～１．２ｇ含んでいてもよい。具体的には、前記固形製剤は、シメチコンを合計約０．０１ｇ以上、約０．０４ｇ以上、約０．１ｇ以上、約０．２ｇ以上、約０．３ｇ以上、または約０．４ｇ以上含んでいてもよく、シメチコンを約１．２ｇ以下、約１ｇ以下、約０．８ｇ以下、約０．６ｇ以下、約０．５ｇ以下含んでいてもよい。

【００４２】

本発明の実施形態において、前記単位固形製剤は、約０．００５～１７．１４ｍｇのシメチコンを含んでいてもよい。具体的には、約０．０４～１７．１４ｍｇ、約０．０４～１４．３ｍｇのシメチコンを含んでいてもよい。具体的には、前記単位固形製剤は、約１～２ｍｇのシメチコンを含んでいてもよい。

【００４３】

前記固形製剤は、有効成分をさらに含んでいてもよい。例えば、刺激性緩和剤をさらに含んでいてもよい。例えば、ビサコジル（ｂｉｓａｃｏｄｙｌ）、ヒマシ油、センナ（ｓｅｎｎａ）、ビソキサチン（ｂｉｓｏｘａｔｉｎ）、ドキュセート（ｄｏｃｕｓａｔｅ）、ピコサルフェート（ｐｉｃｏｓｕｌｆａｔｅ）、リナクロチド（ｌｉｎａｃｌｏｔｉｄｅ）、ルビプロストン（ｌｕｂｉｐｒｏｓｔｏｎｅ）、食物繊維、体積形成緩和剤（車前子、カルシウムポリカルボフィル、メチルセルロース、小麦ふすまなど）、アントラキノン（ａｎｔｈｒａｑｕｉｎｏｎｅ）、ジフェニルメタン（ｄｉｐｈｅｎｙｌｍｅｔｈａｎｅ）、プロバイオティクスなどの成分から 一つ以上をさらに含んでいてもよい。

【００４４】

また、本発明は、有効成分として硫酸塩を含む経口固形製剤を提供する。

【００４５】

本発明の経口固形製剤は、腸管洗浄用のものであってもよい。すなわち、本発明の経口固形製剤は、腸管洗浄剤であってもよい。

【００４６】

前記経口固形製剤は、単位固形製剤を含み、前記経口固形製剤の単位固形製剤は、重量が約０．３ｇ以下であってもよい。また、前記経口固形製剤の単位固形製剤は、重量が約０．０５ｇ以上であってもよい。

【００４７】

本発明において、「単位固形製剤」は、固形製剤を構成する一つ（単数）の固形製剤を意味し、「固形製剤」は、複数の単位固形製剤を含む集団を意味する。

【００４８】

本発明において、単位固形製剤の重量は、単位固形製剤（１個）当たりの重量を意味し得る。すなわち、本発明の有効成分として硫酸塩を含む固形製剤は、単位固形製剤（１個）当たりの重量が約０．３ｇ以下である単位固形製剤を含んでいてもよい。また、前記有効成分として硫酸塩を含む固形製剤の単位固形製剤（１個）当たりの重量は、約０．０５ｇ以上であってもよい。

【００４９】

前記有効成分として硫酸塩を含む固形製剤は、有効成分として硫酸塩を含む単位固形製剤を複数含む。本発明の実施形態において、前記有効成分として硫酸塩を含む固形製剤は、前記有効成分として硫酸塩を含む単位固形製剤を約８０～１２００個含んでいてもよい。具体的には、前記単位固形製剤を約８０個以上、約９０個以上、約１００個以上、約１１０個以上、約１２０個以上、約１３０個以上、約１４０個以上、約１５０個以上、約１６０個以上、約１７０個以上、約１８０個以上、約１９０個以上、約２００個以上、約２１０個以上、約２２０個以上、約２３０個以上、約２４０個以上、約２５０個以上、約２６０個以上、約２７０個以上、約２８０個以上、約２９０個以上、約３００個以上、約３２０個以上、または約３５０個以上含んでいてもよく、約１２００個以下、約１１００個以下、約１０００個以下、約９００個以下、約８００個以下、約７００個以下、約６００個以下、または約５００個以下含んでいてもよい。

【００５０】

本発明の実施形態において、前記有効成分として硫酸塩を含む単位固形製剤の重量は、約０．０５ｇ以上、約０．１ｇ以上、約０．１５ｇ以上、約０．２ｇ以上、約０．２５ｇ以上であってもよく、０．３ｇ以下、約０．２５ｇ以下、約０．２ｇ以下であってもよい。

【００５１】

本発明の実施形態において、前記有効成分として硫酸塩を含む単位固形製剤の重量は、

約０．０５～０．３ｇ、約０．１～０．３ｇであってもよく、より具体的には、約０．１～０．２ｇ、または約０．１５～０．２ｇであってもよいが、これに限定されるものではない。

【００５２】

本発明の有効成分として硫酸塩を含む固形製剤は、前記単位固形製剤の重量を約０．３ｇ以下とすることで、服用時の嚥下困難（嚥下障害）や胸焼け、吐き気、むかつき、嘔吐などの胃腸障害、胃腸や大腸の充血、出血、びらん、浮腫などの副作用を最小限に抑え、服薬利便性を高め、迅速な薬効の発現を可能とし、優れた腸管洗浄力を示すことができる。さらに、胃腸管内に製剤残留物を残さず、大腸内視鏡検査の際に鮮明な視野を確保することができる。しかしながら、前記有効成分として硫酸塩を含む固形製剤は、単位固形製剤の重量が約０．３ｇより高い場合、胃腸障害および／または副作用などに著しい差が生じ、服薬利便性および服薬順応度が大きく低下することがある。また、崩壊速度が大幅に低下し、腸管洗浄力が低下する可能性があり、体内に製剤残留物が残って内視鏡曇りなどを引き起こす可能性がある。すなわち、前述した硫酸塩を含む固形製剤の単位固形製剤の重量範囲を前後して安全性（副作用）、服薬利便性、服薬順応度、腸管洗浄力、崩壊、製剤残留物の発生などに著しい差が生じることがある。

【００５３】

ここで、本発明の実施形態において、前記有効成分として硫酸塩を含む固形製剤およびその単位固形製剤は、有効成分が硫酸塩からなる固形製剤であってもよい。または、前記固形製剤は、有効成分が硫酸塩とシメチコンとからなる固形製剤であってもよい。

【００５４】

前記固形製剤において、前記硫酸塩は、硫酸ナトリウム、硫酸カリウム、および硫酸マグネシウムからなる群から選択される少なくとも一つを含んでいてもよい。本発明の実施形態において、前記硫酸塩は、硫酸ナトリウムを含んでいてもよい。別の実施形態において、前記硫酸塩は、硫酸カリウムを含んでいてもよい。さらに別の実施形態において、前記硫酸塩は、硫酸マグネシウムを含んでいてもよい。本発明の実施形態において、前記硫酸塩は、硫酸ナトリウムおよび硫酸カリウムであってもよい。別の実施形態において、前記硫酸塩は、硫酸ナトリウムおよび硫酸マグネシウムであってもよい。さらに別の実施形態において、前記硫酸塩は、硫酸ナトリウム、硫酸カリウム、および硫酸マグネシウムの混合物であってもよい。また、前記硫酸塩は、無水物または水和物であってもよく、好ましくは、前記硫酸ナトリウムまたは硫酸マグネシウムは、無水物であってもよい。

【００５５】

本発明の実施形態において、前記有効成分として硫酸塩を含む固形製剤は、前記硫酸塩を合計約２５ｇ以上含んでいてもよい。具体的には、前記固形製剤は、前記硫酸塩を合計約３０ｇ以上、約３５ｇ以上、約４０ｇ以上、約４５ｇ以上含んでいてもよいが、必ずしもこれに限定されるものではない。前記有効成分として硫酸塩を含む固形製剤は、前記硫酸塩を合計約６０ｇ以下含んでいてもよい。具体的には、前記固形製剤は、前記硫酸塩を合計約５５ｇ以下、約５０ｇ以下、約４５ｇ以下、約４０ｇ以下含んでいてもよいが、必ずしもこれに限定されるものではない。例えば、前記固形製剤は、前記硫酸塩を合計約４４．４６ｇ含んでいてもよい。

【００５６】

本発明の実施形態において、前記有効成分として硫酸塩を含む固形製剤は、前記硫酸塩を合計約２５～６０ｇ含んでいてもよい。具体的には、前記固形製剤は、前記硫酸塩を合計約２５～５５ｇ、約３０～６０ｇ、約３０～５５ｇ、または約３０～５０ｇ含んでいてもよい。より具体的には、前記固形製剤は、前記硫酸塩を合計約４０～５５ｇ、約４０～５０ｇ、約３５～５０ｇ、約３５～４５ｇ、約３０～４５ｇ、または約３０～４０ｇ含んでいてもよいが、必ずしもこれに限定されるものではない。

【００５７】

本発明の実施形態において、前記硫酸塩が硫酸ナトリウムを含む場合、前記有効成分として硫酸塩を含む固形製剤は、硫酸ナトリウムを合計約１０～６０ｇ含んでいてもよい。

具体的には、前記固形製剤は、硫酸ナトリウムを合計約１０ｇ以上、約１５ｇ以上、約２０ｇ以上、約２５ｇ以上、約３０ｇ以上、約３３ｇ以上、または約３５ｇ以上含んでいてもよく、合計約６０ｇ以下、約５５ｇ以下、約５２ｇ以下、約５０ｇ以下、約４５ｇ以下、約４２ｇ以下、約４０ｇ以下、または約３６ｇ以下含んでいてもよい。

【００５８】

本発明の実施形態において、前記硫酸塩が硫酸カリウムを含む場合、前記有効成分として硫酸塩を含む固形製剤は、硫酸カリウムを合計約０．１～１５ｇ含んでいてもよい。具体的には、前記固形製剤は、硫酸カリウムを合計約０．１ｇ以上、約０．５ｇ以上、約１ｇ以上、約２ｇ以上、約３ｇ以上、約４ｇ以上、約５ｇ以上、または約６ｇ以上含んでいてもよく、合計約１５ｇ以下、約１２ｇ以下、約１０ｇ以下、約９ｇ以下、約８ｇ以下、または約７ｇ以下含んでいてもよい。

【００５９】

本発明の実施形態において、前記硫酸塩が硫酸マグネシウムを含む場合、前記有効成分として硫酸塩を含む固形製剤は、硫酸マグネシウムを合計約０．１～８ｇ含んでいてもよい。具体的には、前記固形製剤は、硫酸マグネシウムを合計約０．１ｇ以上、約０．５ｇ以上、約１ｇ以上、約２ｇ以上、約３ｇ以上、または約４ｇ以上含んでいてもよく、合計約８ｇ以下、約７ｇ以下、または約６ｇ以下含んでいてもよい。

【００６０】

前記有効成分として硫酸塩を含む固形製剤において、硫酸塩の合計含有量は、前記有効成分として硫酸塩を含む固形製剤に含まれる複数の単位固形製剤に含まれた硫酸塩の合計含有量を意味し得る。前記有効成分として硫酸塩を含む固形製剤は、前述した含有量で硫酸塩を含むことで、優れた腸管洗浄力を示しつつ副作用を最小限に抑えることができる。

【００６１】

本発明の有効成分として硫酸塩を含む固形製剤の単位固形製剤は、硫酸塩を約２０～３００ｍｇ含んでいてもよい。具体的には、前記単位固形製剤は、硫酸塩を合計約２０ｍｇ以上、約２５ｍｇ以上、約３０ｍｇ以上、約３５ｍｇ以上、約４０ｍｇ以上、約４５ｍｇ以上含んでいてもよく、合計約３００ｍｇ以下、約２９５ｍｇ以下、約２９０ｍｇ以下、約２８５ｍｇ以下、約２８０ｍｇ以下、約２７５ｍｇ以下、約２７０ｍｇ以下含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。

【００６２】

本発明の実施形態において、前記有効成分として硫酸塩を含む固形製剤の単位固形製剤は、前記硫酸塩を合計約２５～２９５ｍｇ含んでいてもよい。より具体的には、前記単位固形製剤は、前記硫酸塩を約２９～２９０ｍｇ、約４０～２９０ｍｇ、約４５～２９０ｍｇ、約４０～２９５ｍｇ、約４５～２９５ｍｇ、約４０～２８５ｍｇ、または約４５～２８５ｍｇ含んでいてもよいが、必ずしもこれに限定されるものではない。

【００６３】

本発明の有効成分として硫酸塩を含む固形製剤の単位固形製剤は、前記硫酸塩を単位固形製剤重量の約６．７％以上、約９％以上、約１０％以上、約２０％以上、約３０％以上、より具体的には、約４０％以上、約５０％以上、約６０％以上、約７０％以上、約８０％以上、約９０％以上、約９５％以上、約９６％以上、約９７％以上、約９８％以上、約９９％以上、約１００％または約１００％以下含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。

【００６４】

本発明の実施形態において、前記硫酸塩が硫酸ナトリウムを含む場合、前記単位固形製剤は、硫酸ナトリウムを約８～３００ｍｇ含んでいてもよい。具体的には、前記単位固形製剤は、硫酸ナトリウムを約８ｍｇ以上、約１２ｍｇ以上、約１５ｍｇ以上、約１６ｍｇ以上、約２０ｍｇ以上、約２５ｍｇ以上、約２７ｍｇ以上、約２９ｍｇ以上、約３０ｍｇ以上含んでいてもよく、合計約３００ｍｇ以下、約２９５ｍｇ以下、約２９０ｍｇ以下、約２８５ｍｇ以下、約２８０ｍｇ以下、約２７５ｍｇ以下、約２７０ｍｇ以下含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。

【００６５】
本発明の実施形態において、前記単位固形製剤は、硫酸ナトリウムを約８～３００ｍｇ、約１２～３００ｍｇ、または約１５～３００ｍｇ、より具体的には、前記単位固形製剤は、硫酸ナトリウムを約３０～２７０ｍｇ、約３０～２５０ｍｇ、または約５０～２２０ｍｇ、より具体的には、前記単位固形製剤は、硫酸ナトリウムを約８０～１７０ｍｇ含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。
【００６６】
本発明の実施形態において、前記硫酸塩が硫酸ナトリウムを含む場合、前記単位固形製剤は、硫酸ナトリウムを単位固形製剤重量の約２．６７％以上、約５％以上、約１０％以上、具体的には、約１２％以上、約１６％以上、約２０％以上、約３０％以上、約４０％以上、約６０％以上、約７５％以上、約８０％以上、約８５％以上、約９０％以上、約９５％以上、約１００％または約１００％以下含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。
【００６７】
本発明の実施形態において、前記硫酸塩が硫酸カリウムを含む場合、前記単位固形製剤は、硫酸カリウムを約０．０８～１８７．５ｍｇ含んでいてもよい。具体的には、前記単位固形製剤は、硫酸カリウムを約０．０８ｍｇ以上、約０．４ｍｇ以上、約０．８ｍｇ以上、約１ｍｇ以上、約２ｍｇ以上、約３ｍｇ以上、約４ｍｇ以上、約５ｍｇ以上、約９ｍｇ以上、約１２ｍｇ以上含んでいてもよく、前記単位固形製剤は、硫酸カリウムを約１８７．５ｍｇ以下、約１８０ｍｇ以下、約１７０ｍｇ以下、約１５０ｍｇ以下、約１３０ｍｇ以下、約１２０ｍｇ以下、約１００ｍｇ以下、約９０ｍｇ以下、約８０ｍｇ以下、約５０ｍｇ以下、約４０ｍｇ以下、約３０ｍｇ以下含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。
【００６８】
本発明の実施形態において、前記単位固形製剤は、硫酸カリウムを約２～５０ｍｇ、具体的には、前記単位固形製剤は、硫酸カリウムを約５～３８ｍｇ、約９～３２ｍｇ、または約１２～２６ｍｇ含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。
【００６９】
本発明の実施形態において、前記硫酸塩が硫酸カリウムを含む場合、前記単位固形製剤は、硫酸カリウムを単位固形製剤重量の約０．０１％以上、約０．０２％以上、約０．０３％以上、約０．０５％以上、約０．０６７％以上、約０．０８％以上、約０．１％以上、約０．３％以上、約０．４％以上、約０．５％以上、約１％以上、約１．５％以上、約２％以上、約３％以上、約４％以上、約５％以上、約６％以上、約８％以上、約１０％以上、約２０％以上、約３０％以上、約５０％以上、約６０％または約６０％以下含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。
【００７０】
本発明の実施形態において、前記硫酸塩が硫酸マグネシウムを含む場合、前記単位固形製剤は、硫酸マグネシウムを約０．０８～１００ｍｇ含んでいてもよい。具体的には、前記単位固形製剤は、硫酸マグネシウムを約０．０８ｍｇ以上、約０．４ｍｇ以上、約０．８ｍｇ以上、約１ｍｇ以上、約２ｍｇ以上、約３ｍｇ以上、約４ｍｇ以上、約６ｍｇ以上、約８ｍｇ以上、約１０ｍｇ以上、約１２ｍｇ以上含んでいてもよく、前記単位固形製剤は、硫酸マグネシウムを約１００ｍｇ以下、約９０ｍｇ以下、約８０ｍｇ以下、約７０ｍｇ以下、約６０ｍｇ以下、約５０ｍｇ以下、約４０ｍｇ以下、約３０ｍｇ以下、約２０ｍｇ以下、約１０ｍｇ以下含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。
【００７１】
本発明の実施形態において、前記単位固形製剤は、硫酸マグネシウムを約１～２５ｍｇ含んでいてもよい。具体的には、前記単位固形製剤は、硫酸マグネシウムを約１～１３ｍｇ、約１～１２ｍｇ、または約１～１０ｍｇ含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。
【００７２】

本発明の実施形態において、前記硫酸塩が硫酸マグネシウムを含む場合、前記単位固形製剤は、硫酸マグネシウムを単位固形製剤重量の約０．０１％以上、約０．０２％以上、約０．０３％以上、約０．０５％以上、約０．０６７％以上、約０．０８％以上、約０．１％以上、約０．３％以上、約０．４％以上、約０．５％以上、約０．８％以上、約１％以上、約１．５％以上、約２％以上、約３％以上、約４％以上、約５％以上、約１０％以上、約２０％以上、約３０％以上、約３２％または約３２％以下含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。

【００７３】

前記有効成分として硫酸塩を含む単位固形製剤は、前述したのと同様の含有量で硫酸塩を含むことで、優れた腸管洗浄力を示しつつ副作用を最小限に抑えることができ、単位固形製剤を製造したときに単位固形製剤の物性に優れる。

【００７４】

前記有効成分として硫酸塩を含む固形製剤は、シメチコンをさらに含んでいてもよい。前記シメチコンは、有効成分として前記固形製剤に含まれてもよい。

【００７５】

本発明の実施形態において、前記有効成分として硫酸塩を含む固形製剤は、シメチコンを合計約０．０１～１．２ｇ含んでいてもよい。具体的には、前記固形製剤は、シメチコンを合計約０．０１ｇ以上、約０．０４ｇ以上、約０．１ｇ以上、約０．２ｇ以上、約０．３ｇ以上、または約０．４ｇ以上含んでいてもよく、シメチコンを約１．２ｇ以下、約１ｇ以下、約０．８ｇ以下、約０．６ｇ以下、約０．５ｇ以下含んでいてもよい。

【００７６】

本発明の実施形態において、前記有効成分として硫酸塩を含む固形製剤の単位固形製剤は、シメチコンを約０．００８～１５ｍｇ含んでいてもよい。具体的には、前記単位固形製剤は、シメチコンを約０．００８ｍｇ以上、約０．０１ｍｇ以上、約０．０５ｍｇ以上、約０．１ｍｇ以上、約０．５ｍｇ以上、約１ｍｇ以上含んでいてもよく、シメチコンを約１５ｍｇ以下、約１２．５ｍｇ以下、約１０ｍｇ以下、約８ｍｇ以下、約６ｍｇ以下含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。

【００７７】

本発明の実施形態において、前記単位固形製剤は、シメチコンを約０．０４～１５ｍｇ、より具体的には、前記単位固形製剤は、約１～２ｍｇのシメチコンを含んでいてもよいが、これに限定されるものではない。

【００７８】

本発明の実施形態において、前記本発明の有効成分として硫酸塩を含む固形製剤および単位固形製剤は、有効成分として硫酸塩または硫酸塩とシメチコンとからなる固形製剤および単位固形製剤を意味し得る。前記有効成分が硫酸塩または硫酸塩とシメチコンとからなる固形製剤は、単位固形製剤の重量約０．３ｇ以下で副作用が最小限に抑えられ、服薬利便性を高めつつ優れた腸管洗浄力を示すことができるが、単位固形製剤の重量が約０．３ｇより高くなると、副作用などが著しく高くなり、安全性（副作用）、服薬利便性、服薬順応度、腸管洗浄力、崩壊、製剤残留物の発生などに著しい差が生じることがある。

【００７９】

本発明において、「有効成分」は、活性成分と同じ意味であり、有効成分を活性成分ということもある。

【００８０】

本発明において、「経口固形製剤」は、経口投与用の固形製剤と同じ意味であり、経口投与用固形製剤ということもある。

【００８１】

前記本発明の固形製剤は、薬学的に許容可能な添加剤をさらに含む。

【００８２】

本明細書において、薬学的に許容可能な添加剤は、有効成分の効果を損なわない成分を指すものであってもよい。例えば、前記添加剤は、充填剤、崩壊剤、結合剤、可塑剤、滑

沢剤、コーティング剤、ｐＨ調整剤、希釈剤、潤滑剤、防腐剤、緩衝剤、甘味剤、湿潤剤、懸濁剤、着色剤、芳香剤、賦形剤など、各製剤に通常用いられ、薬学的に許容されるものであれば、いずれも使用可能である。

【００８３】

前記添加剤は、公知の添加剤であってもよい。

【００８４】

例えば、前記崩壊剤としては、クロスポビドン、グアーガム、キサンタンガム、デンプングリコール酸ナトリウム、低置換度ヒドロキシプロピルセルロース、クロスカルメロースナトリウム、微結晶セルロース、デキストラン、マンニトール、またはこれらの混合物などを用いることができるが、これに限定されるものではない。

【００８５】

例えば、前記結合剤としては、アルギン酸、アルギン酸ナトリウム、カルボマー、コポビドン、デンプン、ポリエチレングリコール、ポリビニルピロリドン、ポリビニル誘導体、微結晶セルロース、メチルセルロース、エチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、低置換度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、またはこれらの混合物などを用いることができるが、これに限定されるものではない。

【００８６】

例えば、前記滑沢剤としては、ステアリン酸、ステアリン酸塩、ステアリルフマル酸塩、ラウリル硫酸塩、ステアリル硫酸塩、植物油、ポリエチレングリコール、ポロキサマー、カプリル酸塩、またはこれらの混合物などを用いることができるが、これに限定されるものではない。

【００８７】

例えば、前記コーティング剤としては、ポリビニルアルコール・ポリエチレングリコール共重合体、アミノメタクリレート共重合体、メチルメタクリレート共重合体、スクロース、ヒプロメロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシエチルメチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ポリエチレングリコール、エチルセルロース、またはこれらの混合物などを用いることができるが、これに限定されるものではない。

【００８８】

前記本発明の単位固形製剤は、円形または楕円形であってもよいが、必ずしもこれに限定されるものではない。

【００８９】

本発明の実施形態において、前記単位固形製剤が円形または楕円形である場合、前記単位固形製剤の直径または長さは、約１～２０ｍｍ、約１～１５ｍｍであってもよく、具体的には、約１～１２ｍｍ、約１～１０ｍｍであってもよいが、必ずしもこれに限定されるものではない。

【００９０】

本発明の実施形態において、前記単位固形製剤が円形または楕円形である場合、前記単位固形製剤の厚さまたは高さは、約１～１０ｍｍであってもよく、具体的には、約１～５ｍｍであってもよいが、必ずしもこれに限定されるものではない。

【００９１】

本発明の固形製剤において、前記単位固形製剤は、錠剤、ペレット、カプセル剤、または丸剤の形態であってもよく、前記固形製剤は、錠剤、ペレット、カプセル剤、または丸剤の形態である単位固形製剤、またはこれらの任意の組み合わせを含むものであってもよい。本発明の実施形態において、前記単位固形製剤は錠剤であり、前記固形製剤は、錠剤の形態である単位固形製剤を含むものであってもよい。さらに、前記錠剤は、素錠またはコーティング錠であってもよい。

【００９２】

本発明の経口固形製剤は、その具体的な剤形に応じて適切な方法で製造してもよい。本

発明の実施形態において、前記固形製剤を錠剤の形態に製造する場合、顆粒工程、混合工程および／または打錠工程を用いて製造してもよい。顆粒工程は、乾式顆粒法、湿式顆粒法、コーティング法の中から適宜選択してもよい。

【００９３】

本発明の単位固形製剤は、約０．０５ｇ以上の重量、より具体的には、約０．１ｇ以上の重量で製造することにより、生産効率を向上することができる。

【００９４】

本発明の単位固形製剤は、容易に製造することができ、固形製剤としての物性に優れる。また、本発明の単位固形製剤は、前述した重量を有することによって、服用する際に食道に引っかかったり異物感などを感じたりすることがなく、嚥下困難（嚥下障害）や胸焼け、吐き気、むかつき、嘔吐などの胃腸障害の副作用を最小限に抑えることができる。また、服用時に胃腸や大腸の充血、出血、びらん、浮腫などの副作用も最小限に抑えることができる。したがって、本発明の固形製剤は、服薬利便性および服薬順応度に非常に優れており、最後まで飲み切ることができ、優れた腸管洗浄効果を示し、服用による副作用を最小限に抑えることができる。さらに、服用後に胃腸管内で速やかに崩壊および溶解されるため、服用後の胃腸管内の充血、出血、びらん、浮腫などの副作用を減らすことができ、薬効を迅速に発揮することができ、これにより排便の開始時点および完了時点を短縮することができる。したがって、服用者の排便による苦痛を最小限に抑えることができる。さらに、前記固形製剤は、胃腸管内に製剤の残留物が残らず、大腸内視鏡検査の際に鮮明な視野を確保することができる。

【００９５】

本発明の経口固形製剤は、全量を一時点で全て服用（非分割投与または当日分割投与という）するか、または複数の時点に分けて服用（分割投与または２日分割投与という）してもよい。

【００９６】

非分割投与（当日分割投与）の一例としては、本発明の経口固形製剤を検査前日の夜または検査当日の午前に数時間かけて服用することが挙げられる。具体的には、まず一部を服用し、一定時間経った後に、例えば、約０．５～３時間後に残りを服用してもよい。

【００９７】

分割投与（または２日分割投与）の一例としては、本発明の経口固形製剤を検査前日の夜に一部を服用し、検査当日の午前に残りを服用することが挙げられる。

【００９８】

経口固形製剤を服用するにあたり、各服用量は、特定の時間以内に服用してもよい。具体的には、各服用量を約２時間以内、約１時間以内、または約３０分以内に服用してもよい。

【００９９】

本発明の経口固形製剤は、約１Ｌ以上の水と共に服用してもよい。具体的には、約２Ｌ以上の水と共に服用してもよい。本発明の経口固形製剤は、約１～４Ｌ、約２～３Ｌの水と共に服用してもよい。

【０１００】

本発明の実施形態において、本発明の経口固形製剤は、（１）有効成分として硫酸塩を含み、単位固形製剤当たりの重量が約０．３ｇ以下である、経口固形製剤である。

【０１０１】

（２）前記（１）において、前記固形製剤は、単位固形製剤当たりの重量が約０．０５ｇ以上である、経口固形製剤である。

【０１０２】

（３）前記（１）および（２）のいずれかにおいて、前記固形製剤は、前記硫酸塩を約２５～６０ｇ含む、経口固形製剤である。

【０１０３】

（４）前記（１）～（３）のいずれかにおいて、前記硫酸塩は、硫酸ナトリウム、硫酸

カリウム、および硫酸マグネシウムからなる群から選択される少なくとも一つを含む、経口固形製剤である。

【０１０４】

（５）前記（１）～（４）のいずれかにおいて、前記硫酸塩は、硫酸ナトリウムおよび硫酸カリウムを含む、経口固形製剤である。

【０１０５】

（６）前記（１）～（５）のいずれかにおいて、前記硫酸塩は、硫酸ナトリウム、硫酸マグネシウム、および硫酸カリウムを含む、経口固形製剤である。

【０１０６】

（７）前記（１）～（６）のいずれかにおいて、シメチコンをさらに含む、経口固形製剤である。

【０１０７】

（８）前記（１）～（７）のいずれかにおいて、薬学的に許容可能な添加剤をさらに含む、経口固形製剤である。

【０１０８】

（９）前記（１）～（８）のいずれかにおいて、前記固形製剤は、単位固形製剤を約８０～１２００個含むものである、経口固形製剤である。

【０１０９】

（１０）前記（１）～（９）のいずれかにおいて、前記単位固形製剤は、錠剤、ペレット、カプセル剤、または丸剤の形態である、経口固形製剤である。

【０１１０】

（１１）前記（１）～（１０）のいずれかにおいて、前記固形製剤は、腸管洗浄用のものである、経口固形製剤である。

【０１１１】

（１２）前記（１）～（１１）のいずれかにおいて、前記単位固形製剤は、硫酸塩を約２０～３００ｍｇ含む、経口固形製剤である。

【０１１２】

（１３）前記（１）～（１２）のいずれかにおいて、前記固形製剤は、シメチコンを合計約０．０１～１．２ｇ含む、経口固形製剤である。

【０１１３】

（１４）前記（１）～（１３）のいずれかにおいて、前記単位固形製剤は、シメチコンを約０．００８～１５ｍｇ含む、経口固形製剤である。

【０１１４】

本発明の別の実施形態において、本発明の経口固形製剤は、（ｉ）有効成分として下剤成分を含み、単位固形製剤当たりの重量が約０．５ｇ以下である、経口固形製剤である。

【０１１５】

（ｉｉ）前記（ｉ）において、前記経口固形製剤の単位固形製剤当たりの重量が約０．０５ｇ以上である、経口固形製剤である。

【０１１６】

（ｉｉｉ）前記（ｉ）及び（ｉｉ）のいずれかにおいて、前記経口固形製剤は、大腸下剤成分として、ポリエチレングリコール、アスコルビン酸、アスコルビン酸の塩、ソルビトール、マンニトール、クエン酸、クエン酸の塩、マグネシウム塩、カルボキシメチルセルロース、カルボキシメチルセルロースの塩、ラクツロース、および硫酸塩からなる群から選択される少なくとも一つを含む、経口固形製剤である。

【０１１７】

（ｉｖ）前記（ｉ）～（ｉｉｉ）のいずれかにおいて、前記マグネシウム塩は、酸化マグネシウム、重質酸化マグネシウム、水酸化マグネシウム、炭酸マグネシウム、重質炭酸マグネシウム、および硫酸マグネシウムからなる群から選択される少なくとも一つを含む、経口固形製剤である。

【０１１８】

（ｖ）前記（ｉ）～（ｉｖ）のいずれかにおいて、前記硫酸塩は、硫酸ナトリウム、硫酸カリウム、および硫酸マグネシウムからなる群から選択される少なくとも一つを含む、経口固形製剤である。

【０１１９】

（ｖｉ）前記（ｉ）～（ｖ）のいずれかにおいて、前記単位固形製剤は、錠剤、ペレット、カプセル剤、または丸剤の形態である、経口固形製剤である。

【０１２０】

（ｖｉｉ）前記（ｉ）～（ｖｉ）のいずれかにおいて、薬学的に許容可能な添加剤をさらに含む、経口固形製剤である。

【０１２１】

（ｖｉｉｉ）前記（ｉ）～（ｖｉｉ）のいずれかにおいて、前記固形製剤は、単位固形製剤を約７０～２０００個含むものである、経口固形製剤である。

【０１２２】

（ｉｘ）前記（ｉ）～（ｖｉｉｉ）のいずれかにおいて、前記固形製剤は、腸管洗浄用のものである、経口固形製剤である。

【０１２３】

（ｘ）前記（ｉ）～（ｉｘ）のいずれかにおいて、前記固形製剤は、下剤成分を合計約２０～５００ｇ含むものである、経口固形製剤である。

【０１２４】

（ｘｉ）前記（ｉ）～（ｘ）のいずれかにおいて、前記単位固形製剤は、前記下剤成分を約２０～５００ｍｇ含むものである、経口固形製剤である。

【０１２５】

以上、本発明の実施形態による固形製剤を例示的に説明したが、本発明がこれに限定されるものではなく、前述した本発明の固形製剤に関する様々な要素の全ての組み合わせが、本発明の範囲に属する。

【０１２６】

また、本発明は、本発明の経口固形製剤（の有効量）を投与することを含む腸管洗浄方法を提供する。

【０１２７】

また、本発明は、腸管洗浄のための本発明の経口固形製剤の用途を提供する。

【０１２８】

前記方法、用途における本発明の経口固形製剤は、前記本発明の経口固形製剤において説明したものと同様である。

【発明の効果】

【０１２９】

本発明の経口固形製剤は、服用時に嚥下困難（嚥下障害）や胸焼け、吐き気などの胃腸障害の副作用を最小限に抑えることができ、服薬利便性および服薬順応度に優れる。また、本発明の固形製剤は、速やかに崩壊および溶解され、胃腸管内の充血、出血、びらん、浮腫などの副作用が軽減され、迅速に薬効を発現させることができ、これにより固形製剤の服用後に排便の開始時点および完了時点を短縮することができる。さらに、胃腸管内の残留物を最小限に抑えることができ、優れた腸管洗浄効果を示す。

【図面の簡単な説明】

【０１３０】

【図１】図１は、実験例４の副作用の評価結果を示すグラフである。

【図２】図２は、実験例７の腸管洗浄力の評価結果を示すグラフである。

【発明を実施するための形態】

【０１３１】

以下、本発明の理解を助けるために好ましい実施例を提示する。しかし、下記実施例は、本発明をより理解しやすくするために提供するものであって、本発明の内容がこれらの実施例によって限定されるものではない。

【０１３２】
実験例 1: 崩壊時間の確認
下記表１の成分および含有量にしたがって錠剤を製造した。具体的には、無水硫酸ナトリウム１０９．３７５ｇ、硫酸カリウム１９．５６３ｇ、無水硫酸マグネシウム１０ｇ、コポビドン４．６６３ｇを混合した後、精製水１ｍＬを徐々に加えながら混合し、この混合物を２０ｍｅｓｈに篩過した後、ステアリン酸１．４ｇを入れて混合し、打錠機で打錠した。
【０１３３】
【表１】

成分	実施例１（ｍｇ）	比較例１（ｍｇ）
無水硫酸ナトリウム	１０９．３７５	１０９３．７５
硫酸カリウム	１９．５６３	１９５．６３
無水硫酸マグネシウム	１０．０００	１００．００
コポビドン	４．６６３	４６．６３
ステアリン酸	１．４００	１４．００
１錠の重量（ｍｇ）	１４５．０	１４５０．０

【０１３４】
前記製造した実施例１および比較例１の錠剤の崩壊時間を大韓薬典の一般試験法に定められている崩壊試験法にしたがって水中で測定した。
【０１３５】
実施例１および比較例１の錠剤の崩壊時間は、それぞれ７分２０秒および１７分３０秒であり、実施例１の錠剤の方が圧倒的に速く崩壊することを確認した。速やかに崩壊する実施例１の錠剤が固形腸管洗浄剤としてより好適であることを確認した。
【０１３６】
実験例２：溶出時間の確認
下記表２の成分および含有量にしたがって錠剤を製造した。具体的には、無水硫酸ナトリウム１０９．３７５ｇ、硫酸カリウム１９．５６３ｇ、無水硫酸マグネシウム１０ｇ、コポビドン５．０６２ｇを混合した後、精製水３ｍＬを徐々に加えながら混合し、この混合物を２０ｍｅｓｈに篩過した後、ステアリン酸１．５ｇを入れて混合し、打錠機で打錠した。その後、ポリエチレングリコール・ポリビニルアルコール共重合体を５％濃度で精製水に溶かした後、コーティング機でフィルムコーティングを行った。
【０１３７】

【表２】

成分	実施例２（ｍｇ）	比較例２（ｍｇ）
無水硫酸ナトリウム	１０９．３７５	１０９３．７５
硫酸カリウム	１９．５６３	１９５．６３
無水硫酸マグネシウム	１０．００	１００．００
コポビドン	５．０６２	５０．６２
ステアリン酸	１．５０	１５．００
ポリエチレングリコール・ポリビニルアルコール共重合体	３．００	３０．００
１錠の重量（ｍｇ）	１４８．５０	１４８５．００

【０１３８】
製造した実施例２の錠剤３０錠および比較例２の錠剤３錠の溶出時間を約３７℃、５０ｒｐｍおよびｐＨ１．２の溶出液９００ｍｌの条件でパドル法により測定した（溶出機、Ｐｈａｒｍａｔｅｓｔ）。実施例２および比較例２の錠剤は、溶出機１ベッセル（ｖｅｓｓｅｌ）にそれぞれ１０錠および１錠ずつ入れて評価した。溶出率は、液体クロマトグラフ法（ＨＰＬＣ）により分析した。

【０１３９】
実施例２の錠剤は、１５分以内に全て溶出したのに対し、比較例２の錠剤は、約３０分で全て溶出したことを確認した。実施例２の錠剤が比較例２の錠剤に比べて固形腸管洗浄剤としてより好ましいことが分かる。

【０１４０】
実験例３：固形製剤の製造および崩壊時間の確認
下記表３の成分および含有量にしたがって実施例３および比較例３の錠剤を製造した。具体的には、ポリエチレングリコール３３５０　１２３．１５ｇ、アスコルビン酸５．７９ｇ、アスコルビン酸ナトリウム７．２７ｇ、無水硫酸ナトリウム９．２４ｇ、塩化ナトリウム３．３１ｇ、塩化カリウム１．２４ｇを２０ｍｅｓｈに篩過した後混合し、打錠機で打錠して錠剤を製造した。

【０１４１】
【表３】

成分	実施例３（ｍｇ）	比較例３（ｍｇ）
ポリエチレングリコール３３５０	１２３．１５	１２３１．５
アスコルビン酸	５．７９	５７．９
アスコルビン酸ナトリウム	７．２７	７２．７
無水硫酸ナトリウム	９．２４	９２．４
塩化ナトリウム	３．３１	３３．１
塩化カリウム	１．２４	１２．４
１錠の重量（ｍｇ）	１５０	１５００

【０１４２】
前記製造した実施例３および比較例３の錠剤の崩壊時間を大韓薬典の一般試験法に定め

られている崩壊試験法にしたがって水中で測定した。

【０１４３】

実施例３および比較例３の錠剤の崩壊時間は、それぞれ５分４５秒および１５分５０秒であり、実施例３の錠剤の方が圧倒的に速く崩壊することを確認した。速やかに崩壊した実施例３の錠剤が固形腸管洗浄剤としてより好適であることを確認した。

【０１４４】

実験例４：副作用の評価（１）

本発明の固形製剤における副作用の改善を確認するために、下記表４の成分および含有量にしたがって錠剤を製造した。具体的には、無水硫酸ナトリウム１０９．３７５ｇ、硫酸カリウム１９．５６３ｇ、無水硫酸マグネシウム１０ｇ、コポビドン５．０６２ｇを混合した後、精製水３ｍＬを徐々に加えながら混合し、この混合物を２０ｍｅｓｈに篩過した後、ステアリン酸１．５ｇを入れて混合し、打錠機で打錠した。その後、ポリエチレングリコール・ポリビニルアルコール共重合体を１０％濃度で５０％エタノール溶液に溶かした後、コーティング機でフィルムコーティングを行った。

【０１４５】

【表４】

成分	錠剤１（ｍｇ）	錠剤２（ｍｇ）	錠剤３（ｍｇ）
無水硫酸ナトリウム	１０９．３７５	２１８．７５	１０９３．７５
硫酸カリウム	１９．５６３	３９．１２５	１９５．６２５
無水硫酸マグネシウム	１０．００	２０．００	１００．００
コポビドン	５．０６２	１０．１２５	５０．６２５
ステアリン酸	１．５０	３．００	１５．００
ポリエチレングリコール・ポリビニルアルコール共重合体	３．００	６．００	３０．００
１錠の重量（ｍｇ）	１４８．５０	２９７．００	１４８５．００

【０１４６】

製造した錠剤１～３をビーグル（Ｂｅａｇｌｅ、約１０ｋｇ）に投与して胃腸管内で起きる副作用を観察した。同量の硫酸塩が投与されるよう、錠剤１は８０錠、錠剤２は４０錠、錠剤３は８錠経口投与し、嘔吐を防止するために麻酔状態で観察を行った。錠剤１～３を水と共にそれぞれ３匹のビーグルに投与した後、３時間目に安楽死させ、胃を採取および切開し、充血、出血、びらん、浮腫が発生した面積および強度に応じて０～１６点で胃粘膜の損傷程度を目視で評価した。具体的には、副作用の発生面積に応じて０～４点、副作用の発生強度に応じて０～４点で評価し、２つの値を掛けた。点数が高いほど副作用がひどいことを表す。

【０１４７】

副作用を評価した結果、錠剤１および２における副作用が錠剤３に比べてはるかに少ないことが分かる（図１）。錠剤１および２が錠剤３に比べて錠剤の数が多く、胃に接触する表面積がより広いにもかかわらず、副作用が低く現れたのは予想外の結果である。

【０１４８】

したがって、本発明による錠剤１および２は、副作用を改善することを確認できる。

【０１４９】

実験例５：副作用の評価（２）

前記表４の錠剤１～３を投与して、胃腸管内における副作用（浮腫）の発生有無を組織検査により評価した。錠剤１～３を製造し、それぞれ３匹のビーグルに投与し、胃を切開

する一連の過程は、実験例４と同様にして行った。切開した胃から組織を採取し、組織検査のための検体を作製した後、Ｈｅｍａｔｏｘｙｌｉｎ＆Ｅｏｓｉｎ（Ｈ＆Ｅ）染色を行い、光学顕微鏡を用いて浮腫の発生有無を観察した。

【０１５０】

その結果、錠剤１および２を投与した全ての個体において浮腫が発生しなかったのに対し、錠剤３を投与した個体では浮腫が発生していた（表５）。錠剤１および２が錠剤３に比べて錠剤の数が多く、胃に接触する表面積がより広いにもかかわらず、浮腫が発生しなかったのは予想外の結果である。

【０１５１】

【表５】

	錠剤１	錠剤２	錠剤３
浮腫の発生した個体の比率（％）	０	０	１００

【０１５２】

したがって、本発明による錠剤１および２は、副作用を改善することを確認できる。

【０１５３】

実験例６：服薬利便性の評価

前記表４の錠剤１および３をビーグルに投与して服薬利便性を比較した。ビーグル（Ｂｅａｇｌｅ、約１０ｋｇ）を麻酔しない状態で錠剤１を８０錠および錠剤３を８錠投与し、嚥下障害などの問題を起こすことなく投与が可能であるかを観察した。

【０１５４】

錠剤３は、飲み込むことが容易ではないことから、実験者が手で錠剤を喉部まで強制的に押して投与可能にしたのに対し、錠剤１は、投与する錠剤の数が錠剤３に比べて１０倍も多かったのにもかかわらず、複数の錠剤を一遍に自分で容易に飲めることが観察された。これにより、本発明の錠剤１は、市販の製品と同様の重量である錠剤３に比べて、服用すべき錠剤の数が約１０倍以上多いが、遥かに容易に服用できることが分かる。

【０１５５】

実験例７：腸管洗浄力の評価

実験例４の方法により製造された錠剤１を６０錠ビーグル（Ｂｅａｇｌｅ、約１０ｋｇ）に麻酔しない状態で投与し、３時間後に安楽死させ、大腸を採取および切開し、腸管内清浄度を確認した。

【０１５６】

その結果、図２に示すように、大腸がきれいに洗浄されていることが分かった。これにより、本発明の固形製剤は、優れた腸管洗浄力を有することが分かる。

【０１５７】

製造例１：固形製剤の製造

下記表６の成分および含有量にしたがって錠剤を製造した。具体的には、錠剤４は、無水硫酸ナトリウム１３８．９３８ｇ、コポビドン４．６６３ｇ、Ｄ－マンニトール２．４ｇを混合した後、精製水０．７ｍＬを徐々に加えながら混合し、この混合物を２０ｍｅｓｈに篩過した後、ステアリン酸１．０ｇを入れて混合し、打錠機で打錠した。その後、ポリエチレングリコール・ポリビニルアルコール共重合体を１０％濃度で５０％エタノール溶液に溶かした後、コーティング機でフィルムコーティングを行った。錠剤５は、無水硫酸ナトリウム１１３．９３８ｇ、無水硫酸マグネシウム２５．０ｇ、コポビドン４．６６３ｇを混合した後、精製水１．０ｍＬを徐々に加えながら混合し、この混合物を２０ｍｅｓｈに篩過した後、ステアリン酸１．４ｇを入れて混合し、打錠機で打錠した。その後、ポリエチレングリコール・ポリビニルアルコール共重合体を１０％濃度で５０％エタノール溶液に溶かした後、コーティング機でフィルムコーティングを行った。錠剤６は、無水硫酸ナトリウム１１３．９３８ｇ、硫酸カリウム２５．０ｇ、コポビドン４．６６３ｇ、

Ｄ－マンニトール２．４ｇを混合した後、精製水０．７ｍＬを徐々に加えながら混合し、この混合物を２０ｍｅｓｈに篩過した後、ステアリン酸１．０ｇを入れて混合し、打錠機で打錠した。その後、ポリエチレングリコール・ポリビニルアルコール共重合体を１０％濃度で５０％エタノール溶液に溶かした後、コーティング機でフィルムコーティングを行った。

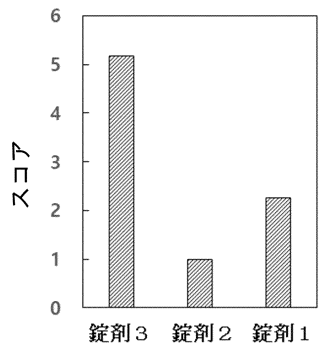
【０１５８】

【表６】

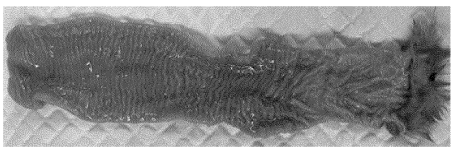
成分	錠剤４（ｍｇ）	錠剤５（ｍｇ）	錠剤６（ｍｇ）
無水硫酸ナトリウム	１３８．９３８	１１３．９３８	１１３．９３８
硫酸カリウム	－	－	２５．０
無水硫酸マグネシウム	－	２５．０	－
Ｄ－マンニトール	２．４	－	２．４
コポビドン	４．６６３	４．６６３	４．６６３
ステアリン酸	１．０	１．４	１．０
ポリエチレングリコール・ポリビニルアルコール共重合体	３．０	３．０	３．０
１錠の重量（ｍｇ）	１５０．０	１４８．０	１５０．４

【図面】

【図１】



【図２】



【国際調査報告】

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/KR2021/020327

A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

A61K 9/20(2006.01)i; **A61K 33/08**(2006.01)i; **A61K 33/10**(2006.01)i; **A61K 33/04**(2006.01)i; **A61P 1/10**(2006.01)i; **A61K 31/80**(2006.01)i

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

A61K 9/20(2006.01); A01N 25/26(2006.01); A61K 31/047(2006.01); A61K 31/185(2006.01); A61K 31/4402(2006.01); A61K 47/10(2006.01); A61K 9/08(2006.01); A61K 9/16(2006.01); A61K 9/28(2006.01); B29C 47/04(2006.01)

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Korean utility models and applications for utility models: IPC as above
Japanese utility models and applications for utility models: IPC as above

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practicable, search terms used)

eKOMPASS (KIPO internal) & keywords: 황산염(sulfate), 고형제제(solid formulation), 장세척제(bowel cleanser), 하제(purgation), 단위 용량(unit dosage), 경구 제형(oral dosage form)

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
X	WO 2007-099398 A2 (NATURALITE BENELUX B.V.) 07 September 2007 (2007-09-07) See paragraphs [0014], [0015], [0021], [0022], [0024], [0026], [0048], [00117], [00124], [00131], [00146], [00489]-[00492], [00498], [00502] and [00563]; and Table 2.	1-5,7
Y		6
Y	WO 98-18610 A1 (VAN LENGERICH, Bernhard, H.) 07 May 1998 (1998-05-07) See claim 20.	6
X	KR 10-2014-0018210 A (BORODY, Thomas, Julius et al.) 12 February 2014 (2014-02-12) See abstract; claims 6, 14, 20 and 53-56; and paragraphs [0044], [0139], [0153], [0157] and [0143]-[0149].	8-16
A	KR 10-2019-0093501 A (TAEJOON PHARMACEUTICAL CO., LTD.) 09 August 2019 (2019-08-09) See abstract; and claim 1.	1-16

☑ Further documents are listed in the continuation of Box C. ☑ See patent family annex.

* Special categories of cited documents:
"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
"D" document cited by the applicant in the international application
"E" earlier application or patent but published on or after the international filing date
"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
"P" document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed
"T" later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
"X" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art
"&" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search	Date of mailing of the international search report
27 April 2022	**27 April 2022**
Name and mailing address of the ISA/KR **Korean Intellectual Property Office** **Government Complex-Daejeon Building 4, 189 Cheongsa-ro, Seo-gu, Daejeon 35208** Facsimile No. **+82-42-481-8578**	Authorized officer Telephone No.

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 2019)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No.
PCT/KR2021/020327

C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

Category*	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
A	KR 10-2019-0041233 A (PHARMBIO KOREA CO., LTD. et al.) 22 April 2019 (2019-04-22) See abstract; and claims 1 and 4.	1-16
A	JP 2016-537404 A (KANG, Yoon Sik et al.) 01 December 2016 (2016-12-01) See entire document.	1-16
A	KR 10-2014-0044628 A (TAEJOON PHARMACEUTICAL CO., LTD.) 15 April 2014 (2014-04-15) See entire document.	1-16

Form PCT/ISA/210 (second sheet) (July 2019)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.
PCT/KR2021/020327

Patent document cited in search report	Publication date (day/month/year)	Patent family member(s)	Publication date (day/month/year)
WO 2007-099398 A2	07 September 2007	None	
WO 98-18610 A1	07 May 1998	None	
KR 10-2014-0018210 A	12 February 2014	AU 2011-342368 A1	21 June 2012
		AU 2011-342368 A1	09 May 2013
		AU 2011-342368 B2	17 November 2016
		BR 112013014827 A2	04 October 2016
		CA 2821196 A1	21 June 2012
		CN 103338768 A	02 October 2013
		CN 103338768 B	19 April 2019
		CN 110200954 A	06 September 2019
		DK 2651415 T3	30 November 2020
		EP 2651415 A1	23 October 2013
		EP 2651415 B1	07 October 2020
		IL 226831 A	29 August 2013
		IL 226831 B	28 February 2018
		JP 2014-502598 A	03 February 2014
		JP 6121334 B2	26 April 2017
		KR 10-1947720 B1	14 February 2019
		MX 2013006641 A	04 November 2013
		MX 355760 B	27 April 2018
		NZ 611868 A	27 November 2015
		PL 2651415 T3	19 April 2021
		SG 191145 A1	31 July 2013
		US 10092573 B2	09 October 2018
		US 2013-0296314 A1	07 November 2013
		US 2019-240229 A1	08 August 2019
		WO 2012-079118 A1	21 June 2012
KR 10-2019-0093501 A	09 August 2019	CA 3088145 A1	08 August 2019
		CN 111670039 A	15 September 2020
		EP 3747447 A1	09 December 2020
		JP 2021-513521 A	27 May 2021
		KR 10-1981069 B1	22 May 2019
		KR 10-2019-0093489 A	09 August 2019
		KR 10-2019-0093490 A	09 August 2019
		KR 10-2019-0093491 A	09 August 2019
		PH 12020551100 A1	31 May 2021
		US 2021-0052510 A1	25 February 2021
		WO 2019-151829 A1	08 August 2019
KR 10-2019-0041233 A	22 April 2019	KR 10-2127003 B1	25 June 2020
		WO 2019-074214 A2	18 April 2019
		WO 2019-074214 A3	31 May 2019
		WO 2019-074214 A9	18 April 2019
JP 2016-537404 A	01 December 2016	CA 2927719 A1	23 April 2015
		CN 105658212 A	08 June 2016
		CN 105658212 B	02 April 2019
		CN 109908142 A	21 June 2019
		EP 2926807 A1	07 October 2015
		EP 2926807 B1	09 November 2016
		EP 3015102 A1	04 May 2016

Form PCT/ISA/210 (patent family annex) (July 2019)

INTERNATIONAL SEARCH REPORT
Information on patent family members

International application No.
PCT/KR2021/020327

Patent document cited in search report	Publication date (day/month/year)	Patent family member(s)	Publication date (day/month/year)
		EP 3015102 B1	22 November 2017
		ES 2606773 T3	27 March 2017
		JP 2016-508498 A	22 March 2016
		JP 6062072 B2	18 January 2017
		JP 6570533 B2	04 September 2019
		KR 10-1423005 B1	28 July 2014
		KR 10-1508464 B1	07 April 2015
		US 10973808 B2	13 April 2021
		US 2015-0342937 A1	03 December 2015
		US 2016-0151340 A1	02 June 2016
		US 2018-0104225 A1	19 April 2018
		US 2021-0353603 A1	18 November 2021
		WO 2015-056896 A1	23 April 2015
		WO 2015-056897 A1	23 April 2015
KR 10-2014-0044628 A	15 April 2014	KR 10-2019-0041233 A	22 April 2019
		KR 10-2127003 B1	25 June 2020
		WO 2014-054880 A1	10 April 2014

Form PCT/ISA/210 (patent family annex) (July 2019)

국 제 조 사 보 고 서

국제출원번호
PCT/KR2021/020327

A. 발명이 속하는 기술분류(국제특허분류(IPC))

A61K 9/20(2006.01)i; **A61K 33/08**(2006.01)i; **A61K 33/10**(2006.01)i; **A61K 33/04**(2006.01)i; **A61P 1/10**(2006.01)i; **A61K 31/80**(2006.01)i

B. 조사된 분야

조사된 최소문헌(국제특허분류를 기재)

A61K 9/20(2006.01); A01N 25/26(2006.01); A61K 31/047(2006.01); A61K 31/185(2006.01); A61K 31/4402(2006.01); A61K 47/10(2006.01); A61K 9/08(2006.01); A61K 9/16(2006.01); A61K 9/28(2006.01); B29C 47/04(2006.01)

조사된 기술분야에 속하는 최소문헌 이외의 문헌

한국등록실용신안공보 및 한국공개실용신안공보: 조사된 최소문헌란에 기재된 IPC
일본등록실용신안공보 및 일본공개실용신안공보: 조사된 최소문헌란에 기재된 IPC

국제조사에 이용된 전산 데이터베이스(데이터베이스의 명칭 및 검색어(해당하는 경우))

eKOMPASS(특허청 내부 검색시스템) & 키워드: 황산염(sulfate), 고형제제(solid formulation), 장세척제(bowel cleanser), 하제(purgation), 단위 용량(unit dosage), 경구 제형(oral dosage form)

C. 관련 문헌

카테고리*	인용문헌명 및 관련 구절(해당하는 경우)의 기재	관련 청구항
X Y	WO 2007-099398 A2 (NATURALITE BENELUX B.V.) 2007.09.07 단락 [0014], [0015], [0021], [0022], [0024], [0026], [0048], [00117], [00124], [00131], [00146], [00489]-[00492], [00498], [00502], [00563]; Table 2	1-5,7 6
Y	WO 98-18610 A1 (VAN LENGERICH, BERNHARD, H.) 1998.05.07 청구항 20	6
X	KR 10-2014-0018210 A (보로디 토마스 줄리어스 등) 2014.02.12 요약; 청구항 6, 14, 20, 53-56; 단락 [0044], [0139], [0153], [0157] [0143]-[0149]	8-16
A	KR 10-2019-0093501 A (주식회사태준제약) 2019.08.09 요약; 청구항 1	1-16
A	KR 10-2019-0041233 A (주식회사 한국팜비오 등) 2019.04.22 요약; 청구항 1, 4	1-16

☑ 추가 문헌이 C(계속)에 기재되어 있습니다. ☑ 대응특허에 관한 별지를 참조하십시오.

* 인용된 문헌의 특별 카테고리:

"A" 특별히 관련이 없는 것으로 보이는 일반적인 기술수준을 정의한 문헌
"D" 본 국제출원에서 출원인이 인용한 문헌
"E" 국제출원일보다 빠른 출원일 또는 우선일을 가지나 국제출원일 이후에 공개된 선출원 또는 특허 문헌
"L" 우선권 주장에 의문을 제기하는 문헌 또는 다른 인용문헌의 공개일 또는 다른 특별한 이유(이유를 명시)를 밝히기 위하여 인용된 문헌
"O" 구두 개시, 사용, 전시 또는 기타 수단을 언급하고 있는 문헌
"P" 우선일 이후에 공개되었으나 국제출원일 이전에 공개된 문헌
"T" 국제출원일 또는 우선일 후에 공개된 문헌으로, 출원과 상충하지 않으며 발명의 기초가 되는 원리나 이론을 이해하기 위해 인용된 문헌
"X" 특별한 관련이 있는 문헌. 해당 문헌 하나만으로 청구된 발명의 신규성 또는 진보성이 없는 것으로 본다.
"Y" 특별한 관련이 있는 문헌. 해당 문헌이 하나 이상의 다른 문헌과 조합하는 경우로 그 조합이 당업자에게 자명한 경우 청구된 발명은 진보성이 없는 것으로 본다.
"&" 동일한 대응특허문헌에 속하는 문헌

국제조사의 실제 완료일	국제조사보고서 발송일
2022년04월27일(27.04.2022)	**2022년04월27일(27.04.2022)**

ISA/KR의 명칭 및 우편주소	심사관
대한민국 특허청 **(35208) 대전광역시 서구 청사로 189, 4동 (둔산동, 정부대전청사)**	**허주형**
팩스 번호 **+82-42-481-8578**	전화번호 **+82-42-481-5373**

서식 PCT/ISA/210 (두 번째 용지) (2019년 7월)

국제조사보고서

국제출원번호
PCT/KR2021/020327

C. 관련 문헌

카테고리*	인용문헌명 및 관련 구절(해당하는 경우)의 기재	관련 청구항
A	JP 2016-537404 A (KANG, YOON SIK 등) 2016.12.01 문헌 전체	1-16
A	KR 10-2014-0044628 A (주식회사태준제약) 2014.04.15 문헌 전체	1-16

국제조사보고서
대응특허에 관한 정보

국제출원번호
PCT/KR2021/020327

국제조사보고서에서 인용된 특허문헌	공개일	대응특허문헌	공개일
WO 2007-099398 A2	2007/09/07	없음	
WO 98-18610 A1	1998/05/07	없음	
KR 10-2014-0018210 A	2014/02/12	AU 2011-342368 A1	2012/06/21
		AU 2011-342368 A1	2013/05/09
		AU 2011-342368 B2	2016/11/17
		BR 112013014827 A2	2016/10/04
		CA 2821196 A1	2012/06/21
		CN 103338768 A	2013/10/02
		CN 103338768 B	2019/04/19
		CN 110200954 A	2019/09/06
		DK 2651415 T3	2020/11/30
		EP 2651415 A1	2013/10/23
		EP 2651415 B1	2020/10/07
		IL 226831 A	2013/08/29
		IL 226831 B	2018/02/28
		JP 2014-502598 A	2014/02/03
		JP 6121334 B2	2017/04/26
		KR 10-1947720 B1	2019/02/14
		MX 2013006641 A	2013/11/04
		MX 355760 B	2018/04/27
		NZ 611868 A	2015/11/27
		PL 2651415 T3	2021/04/19
		SG 191145 A1	2013/07/31
		US 10092573 B2	2018/10/09
		US 2013-0296314 A1	2013/11/07
		US 2019-240229 A1	2019/08/08
		WO 2012-079118 A1	2012/06/21
KR 10-2019-0093501 A	2019/08/09	CA 3088145 A1	2019/08/08
		CN 111670039 A	2020/09/15
		EP 3747447 A1	2020/12/09
		JP 2021-513521 A	2021/05/27
		KR 10-1981069 B1	2019/05/22
		KR 10-2019-0093489 A	2019/08/09
		KR 10-2019-0093490 A	2019/08/09
		KR 10-2019-0093491 A	2019/08/09
		PH 12020551100 A1	2021/05/31
		US 2021-0052510 A1	2021/02/25
		WO 2019-151829 A1	2019/08/08
KR 10-2019-0041233 A	2019/04/22	KR 10-2127003 B1	2020/06/25
		WO 2019-074214 A2	2019/04/18
		WO 2019-074214 A3	2019/05/31
		WO 2019-074214 A9	2019/04/18
JP 2016-537404 A	2016/12/01	CA 2927719 A1	2015/04/23
		CN 105658212 A	2016/06/08
		CN 105658212 B	2019/04/02
		CN 109908142 A	2019/06/21
		EP 2926807 A1	2015/10/07
		EP 2926807 B1	2016/11/09
		EP 3015102 A1	2016/05/04

서식 PCT/ISA/210 (대응특허 추가용지) (2019년 7월)

국제조사보고서
대응특허에 관한 정보

국제출원번호
PCT/KR2021/020327

국제조사보고서에서 인용된 특허문헌	공개일	대응특허문헌	공개일
		EP 3015102 B1	2017/11/22
		ES 2606773 T3	2017/03/27
		JP 2016-508498 A	2016/03/22
		JP 6062072 B2	2017/01/18
		JP 6570533 B2	2019/09/04
		KR 10-1423005 B1	2014/07/28
		KR 10-1508464 B1	2015/04/07
		US 10973808 B2	2021/04/13
		US 2015-0342937 A1	2015/12/03
		US 2016-0151340 A1	2016/06/02
		US 2018-0104225 A1	2018/04/19
		US 2021-0353603 A1	2021/11/18
		WO 2015-056896 A1	2015/04/23
		WO 2015-056897 A1	2015/04/23
KR 10-2014-0044628 A	2014/04/15	KR 10-2019-0041233 A	2019/04/22
		KR 10-2127003 B1	2020/06/25
		WO 2014-054880 A1	2014/04/10

서식 PCT/ISA/210 (대응특허 추가용지) (2019년 7월)

フロントページの続き

(51)国際特許分類		FI		テーマコード（参考）
Ａ６１Ｋ	*47/34 (2017.01)*	Ａ６１Ｋ	47/34	
Ａ６１Ｋ	*31/77 (2006.01)*	Ａ６１Ｋ	31/77	
Ａ６１Ｋ	*31/375(2006.01)*	Ａ６１Ｋ	31/375	
Ａ６１Ｋ	*31/047(2006.01)*	Ａ６１Ｋ	31/047	
Ａ６１Ｋ	*31/194(2006.01)*	Ａ６１Ｋ	31/194	
Ａ６１Ｋ	*31/717(2006.01)*	Ａ６１Ｋ	31/717	
Ａ６１Ｋ	*31/7016(2006.01)*	Ａ６１Ｋ	31/7016	

,RW,SD,SL,ST,SZ,TZ,UG,ZM,ZW),EA(AM,AZ,BY,KG,KZ,RU,TJ,TM),EP(AL,AT,BE,BG,CH,CY,CZ,DE,DK,EE,ES,FI,FR,GB,GR,HR,HU,IE,IS,IT,LT,LU,LV,MC,MK,MT,NL,NO,PL,PT,RO,RS,SE,SI,SK,SM,TR),OA(BF,BJ,CF,CG,CI,CM,GA,GN,GQ,GW,KM,ML,MR,NE,SN,TD,TG),AE,AG,AL,AM,AO,AT,AU,AZ,BA,BB,BG,BH,BN,BR,BW,BY,BZ,CA,CH,CL,CN,CO,CR,CU,CZ,DE,DJ,DK,DM,DO,DZ,EC,EE,EG,ES,FI,GB,GD,GE,GH,GM,GT,HN,HR,HU,ID,IL,IN,IR,IS,IT,JO,JP,KE,KG,KH,KN,KP,KW,KZ,LA,LC,LK,LR,LS,LU,LY,MA,MD,ME,MG,MK,MN,MW,MX,MY,MZ,NA,NG,NI,NO,NZ,OM,PA,PE,PG,PH,PL,PT,QA,RO,RS,RU,RW,SA,SC,SD,SE,SG,SK,SL,ST,SV,SY,TH,TJ,TM,TN,TR,TT,TZ,UA,UG,US,UZ,VC,VN,WS,ZA,ZM,ZW

デサワンロ ３１ギル ８

(72)発明者 グ，ワン

大韓民国 キョンギド １３６１１ ソンナムシ プンダング ネウチロ ７０ ３０１－１３０２

(72)発明者 チャン，ウヨン

大韓民国 キョンギド １６３８０ スウォンシ クォンソング ソスウォンロ ５７７ボンギル ３０５ ２０５－１５０３

(72)発明者 キム，ヨンウン

大韓民国 キョンギド １６４３４ スウォンシ パルダルグ チャンガンロ ５ボンギル ４５ １０７－１３０４

(72)発明者 キム，ヨンジュン

大韓民国 キョンギド １６７１２ スウォンシ ヨントング ヨントンロ ５１４ボンギル ５３ １０３－２０４

Ｆターム（参考） 4C076 AA36 AA53 BB01 CC16 DD41 EE16 EE27 FF70

4C086 AA01 AA02 BA18 EA01 EA20 FA02 HA16 HA17 HA23 MA01 MA02 MA04 MA05 MA35 MA36 MA37 MA52 NA14 ZA72

4C206 AA01 AA02 CA05 DA34 MA01 MA02 MA04 MA55 MA56 MA57 MA72 NA14 ZA72