

【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27年7月16日 (2015.7.16)

【公表番号】特表2014-513685(P2014-513685A)

【公表日】平成26年6月5日 (2014.6.5)

【年通号数】公開・登録公報2014-029

【出願番号】特願2014-510273(P2014-510273)

【国際特許分類】

A 6 1 K	9/20	(2006.01)
A 6 1 K	47/38	(2006.01)
A 6 1 K	31/506	(2006.01)
A 6 1 K	31/519	(2006.01)
A 6 1 K	31/568	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 K	45/06	(2006.01)
A 6 1 K	47/02	(2006.01)
A 6 1 K	47/04	(2006.01)
A 6 1 K	47/40	(2006.01)
A 6 1 K	47/32	(2006.01)
A 6 1 K	47/12	(2006.01)
A 6 1 K	47/44	(2006.01)
A 6 1 K	47/42	(2006.01)
A 6 1 K	31/522	(2006.01)
A 6 1 P	15/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/26	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	5/24	(2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K	9/20	
A 6 1 K	47/38	
A 6 1 K	31/506	
A 6 1 K	31/519	
A 6 1 K	31/568	
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 K	45/06	
A 6 1 K	47/02	
A 6 1 K	47/04	
A 6 1 K	47/40	
A 6 1 K	47/32	
A 6 1 K	47/12	
A 6 1 K	47/44	
A 6 1 K	47/42	
A 6 1 K	31/522	
A 6 1 P	15/00	
A 6 1 P	25/26	
A 6 1 P	43/00	1 2 1
A 6 1 P	5/24	
A 6 1 P	43/00	1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成27年5月13日(2015.5.13)

【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】

10～60重量%のセルロース、有機および/または無機塩から選択される20～70重量%の増量剤、および0.1～30重量%の第一の活性成分を含むコア；ならびに

疎水性ポリマーと親水性物質とを含む、コアを取り囲む第一コーティングを含む、それを必要とする対象に第一の活性成分を経口投与するための時間制御即放性薬物送達システム。

【請求項 2】

第一コーティングの疎水性ポリマーが、エチルセルロースである、請求項1記載のシステム。

【請求項 3】

第一コーティングの親水性物質が、水不溶性の親水性物質であり、好ましくはセルロースである、請求項1または請求項2記載のシステム。

【請求項 4】

第一の活性成分が、PDE5阻害剤、5HT1a受容体アゴニスト、および中性エンドペプチダーゼ阻害剤からなる群より選択される、前記請求項のいずれか1項記載のシステム。

【請求項 5】

親水性物質がラクトースであり、かつエチルセルロースとラクトースの重量比が約1：1である、請求項2記載のシステム。

【請求項 6】

コアが、0.5～6重量%の1つまたは複数の水不溶性のゲル形成崩壊剤をさらに含む、請求項1記載のシステム。

【請求項 7】

水不溶性のゲル形成崩壊剤が、架橋カルボキシメチルセルロースナトリウムである、請求項6記載の薬物送達システム。

【請求項 8】

薬物送達システムの第一コーティングが、第二の活性成分を含む第二コーティングによって取り囲まれている、請求項1～4のいずれか1項記載の時間制御即放性薬物送達システムを含む二重薬物送達装置。

【請求項 9】

第二の活性成分がテストステロンまたはテストステロンの機能的アナログである、請求項8記載の装置。

【請求項 10】

第二コーティングがシクロデキストリンまたはその誘導体またはポリマーを含む、請求項8～9のいずれか記載の装置。

【請求項 11】

外部コーティングが

- 約0.1～10 mgの量の非晶質形態の活性成分；
- 約0.25～25 mgの量のコーティングポリマー；および
- 外部コーティングの約0.0から10重量%の量の水

の混合物を含む、コア、コアの外部表面上のコーティング（外部コーティング）、および任意で外部コーティングをコアから分離するコーティング（分離コーティング）を含む、活性成分を舌下投与するための錠剤。

【請求項 1 2】

外部コーティングがテストステロンまたはその機能的アナログを含む、請求項11記載の錠剤。

【請求項 1 3】

コアが、請求項1～4のいずれか一項記載の時間制御即放性薬物送達システムを含む、請求項11または請求項12記載の錠剤。

【請求項 1 4】

混合物が、シクロデキストリンまたはポリビニルピロリドン、またはその組み合わせを0.25～25 mgの量でさらに含む、請求項11～13のいずれか一項記載の錠剤。

【請求項 1 5】

コアが、PDE5阻害剤、5HT1a受容体アゴニスト、および中性エンドペプチダーゼ阻害剤からなる群より選択される活性成分を含む、請求項11～14のいずれか一項記載の錠剤。

【請求項 1 6】

男性または女性の性機能障害、性欲機能障害、または勃起機能障害を処置するために用いるための、および好ましくは不感症を処置するために用いるための請求項8～10のいずれか1項記載の装置、または請求項11～15のいずれか1項記載の錠剤。

【請求項 1 7】

コアが
100 mgから150 mgの、名目粒子サイズ100ミクロンおよび3.0から5.0%の水分を有する結晶セルロース、
100 mgから150 mgの無水第二リン酸カルシウム、
25 mgから100 mgのクエン酸シルデナフィル、
10 mgから20 mgのクロスカルメロース、
1 mgから2 mgのステアリン酸マグネシウムを含み、
第一コーティングが
5 mgから20 mgのエチルセルロース20 cps、
5 mgから20 mgの、名目粒子サイズ約20ミクロンおよび5.0%未満の水分を有する結晶セルロースを含み、
第二コーティングが
1 mgから2 mgのHPMC 5 cps、
2 mgから3.5 mgのヒドロキシプロピル -シクロデキストリン、および
0.1 mgから1 mgのテストステロンを含む、
請求項8～10のいずれか1項記載の二重薬物送達装置。

【請求項 1 8】

コアが
50 mgから150 mgの、名目粒子サイズ180ミクロンおよび1.5%未満の水分を有する結晶セルロース、
150 mgから250 mgの硫酸カルシウム二水和物、
1 mgから20 mgの塩酸ブスピロン、
10 mgから20 mgのクロスカルメロース、
1 mgから10 mgのステアリン酸マグネシウムを含み、
第一コーティングが
5 mgから20 mgのエチルセルロース20 cps、
10 mgから50 mgの、名目粒子サイズ約20ミクロンおよび5.0%未満の水分を有する結晶セルロースを含み、
第二コーティングが
1 mgから2 mgのHPMC 5 cps、
2 mgから3.5 mgのヒドロキシプロピル -シクロデキストリン、および
0.1 mgから1 mgのテストステロンを含む、
請求項8～10のいずれか1項記載の二重薬物送達装置。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0103

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0103】

好ましい二重薬物送達の第二コーティングは、好ましくはさらに1 mgから2 mg、好ましくは約1.34 mgのペパーミント油および0.5 mgから1.5 mg、好ましくは約1.0 mgのアスパルテムを含む。

[本発明1001]

セルロース、有機および/または無機塩から選択される増量剤、および第一の活性成分を含むコア；ならびに

疎水性ポリマーと親水性物質とを含む、コアを取り囲む第一コーティングを含む、それを必要とする対象に第一の活性成分を経口投与するための時間制御即放性薬物送達システム。

[本発明1002]

増量剤が無機塩である、本発明1001のシステム。

[本発明1003]

セルロースが結晶セルロースである、本発明1001または本発明1002のシステム。

[本発明1004]

無機塩が無水第二リン酸カルシウムである、本発明1001～1003のいずれかのシステム。

[本発明1005]

送達システムが錠剤である、本発明1001～1004のいずれかのシステム。

[本発明1006]

コアがさらに、架橋カルボキシメチルセルロースナトリウム、デンプングリコール酸ナトリウム、および/または架橋ポリビニルピロリドンを含む水不溶性のゲル形成崩壊剤を含む、前記本発明のいずれかのシステム。

[本発明1007]

第一コーティングの疎水性ポリマーが、エチルセルロースである、前記本発明のいずれかのシステム。

[本発明1008]

第一コーティングの親水性物質が、水不溶性の親水性物質である、前記本発明のいずれかのシステム。

[本発明1009]

第一コーティングが水性液体に曝露される前に孔を含む、本発明1008のシステム。

[本発明1010]

第一コーティングの親水性物質が水溶性親水性物質である、本発明1001～1007のいずれかのシステム。

[本発明1011]

水溶性親水性物質が、水性液体に曝露されると疎水性ポリマーにおいて孔を形成する、本発明1010のシステム。

[本発明1012]

第一の活性成分が、PDE5阻害剤、5HT1a受容体アゴニスト、および中性エンドペプチダーゼ阻害剤からなる群より選択される、前記本発明のいずれかのシステム。

[本発明1013]

PDE5阻害剤がシルденаフィルを含む、本発明1012のシステム。

[本発明1014]

5HT1a受容体アゴニストがブスピロンを含む、本発明1012のシステム。

[本発明1015]

薬物送達システムの第一コーティングが、第二の活性成分を含む第二コーティングによ

って取り囲まれている、本発明1001～1014のいずれかの時間制御即放性薬物送達システムを含む二重薬物送達装置。

[本発明1016]

第二コーティングが、ヒドロキシプロピルメチルセルロースを含む、本発明1015の装置。

[本発明1017]

第二コーティングが口中で第二の活性成分の即時送達を提供する、本発明1015または本発明1016の装置。

[本発明1018]

第二の活性成分がテストステロンまたはテストステロンの機能的アナログである、本発明1015～1017のいずれかの装置。

[本発明1019]

第二コーティングがシクロデキストリンまたはその誘導体またはポリマーを含む、本発明1015～1018のいずれかの装置。

[本発明1020]

第二コーティングが香味化合物をさらに含む、本発明1015～1019のいずれかの装置。

[本発明1021]

香味料の存在が、装置を口中で保持すべきであることを示している、本発明1020の装置。

[本発明1022]

第二コーティングの外部表面が、第一コーティングの外部表面より粗い、本発明1015～1021のいずれかの装置。

[本発明1023]

第一コーティングの外部表面の粗さが、第二コーティングの外部表面の粗さとは異なる、第一および第二コーティングを含む二重送達薬物装置を調製する方法。

[本発明1024]

外部コーティングが
- 約0.1～10 mgの量の非晶質形態の活性成分；
- 約0.25～25 mgの量のコーティングポリマー；および
- 外部コーティングの約0.0から10重量%の量の水
の混合物を含む、コア、コアの外部表面上のコーティング（外部コーティング）、および
任意で外部コーティングをコアから分離するコーティング（分離コーティング）を含む、
活性成分を舌下投与するための錠剤。

[本発明1025]

混合物が約0.2～5.0 mgの量の活性成分；約0.5～12.5 mgの量のコーティングポリマー；
および外部コーティングの約0.0～5重量%の量の水を含む、本発明1024の錠剤。

[本発明1026]

混合物が、シクロデキストリンまたはポリビニルピロリドン、またはその組み合わせを
0.25～25 mgの量でさらに含む、本発明1024の錠剤。

[本発明1027]

混合物が、シクロデキストリンまたはポリビニルピロリドン、またはその組み合わせを
0.5～12.5 mgの量でさらに含む、本発明1025の錠剤。

[本発明1028]

外部コーティングをコアから分離する分離コーティングを含む、本発明1024～1027のい
ずれかの錠剤。

[本発明1029]

コアおよび任意の分離コーティングが50～1000 mm³の体積を有する、本発明1024～1028
のいずれかの錠剤。

[本発明1030]

コアがセルロース、無機塩、および第一の活性成分を含む、本発明1024～1029のいずれ

かの錠剤。

[本発明1031]

分離コーティングが疎水性ポリマーおよび親水性物質を含む、本発明1024～1030のいずれかの錠剤。

[本発明1032]

外部コーティングの混合物が甘味料および/または香料をさらに含む、本発明1024～1031のいずれかの錠剤。

[本発明1033]

分離コーティングがpH非依存的コーティングである、本発明1024～1032のいずれかの錠剤。

[本発明1034]

分離コーティングがpH依存的コーティングであり、好ましくは酸溶解コーティングまたは腸溶コーティングである、本発明1024～1032のいずれかの錠剤。

[本発明1035]

本発明1024～1034のいずれかの錠剤を、それを必要とする個体に提供する段階を含む、個体に活性成分を投与方法であって、該個体が該錠剤を口中で10秒間から5分間保持し、かつその後該個体が該錠剤を飲み込む、方法。

[本発明1036]

男性または女性の性機能障害、性欲機能障害、または勃起機能障害を処置するために用いるための、および好ましくは不感症を処置するために用いるための本発明1015～1022のいずれかの装置、または本発明1024～1034のいずれかの錠剤。

[本発明1037]

コアが

100 mgから150 mgのPharmacel pH 102、

100 mgから150 mgの無水第二リン酸カルシウム、

25 mgから100 mgのクエン酸シルデナフィル、

10 mgから20 mgのクロスカルメロース、

1 mgから2 mgのステアリン酸マグネシウムを含み、

第一コーティングが

5 mgから20 mgのEthocel 20、

5 mgから20 mgのAvicel pH 105を含み、

第二コーティングが

1 mgから2 mgのHPMC 5 cps、

2 mgから3.5 mgのヒドロキシプロピル -シクロデキストリン、および

0.1 mgから1 mgのテストステロンを含む、

本発明1015～1022または1036のいずれかの二重薬物送達装置。

[本発明1038]

コアが

50 mgから150 mgのPharmacel pH 200、

150 mgから250 mgの無水第二リン酸カルシウム、

1 mgから20 mgの塩酸ブスピロン、

10 mgから20 mgのクロスカルメロース、

1 mgから10 mgのステアリン酸マグネシウムを含み、

第一コーティングが

5 mgから20 mgのEthocel 20、

10 mgから50 mgのAvicel pH 105を含み、

第二コーティングが

1 mgから2 mgのHPMC 5 cps、

2 mgから3.5 mgのヒドロキシプロピル -シクロデキストリン、および

0.1 mgから1 mgのテストステロンを含む、

本発明1015～1022または1036のいずれかの二重薬物送達装置。

[本発明1039]

第二コーティングが1 mgから2 mgのペパーミント油および0.5 mgから1.5 mgのアスパル
テームをさらに含む、本発明1037または1038の二重薬物送達装置。