

【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24年1月12日(2012.1.12)

【公開番号】特開2011-153154(P2011-153154A)

【公開日】平成23年8月11日(2011.8.11)

【年通号数】公開・登録公報2011-032

【出願番号】特願2011-104235(P2011-104235)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/135 (2006.01)

A 6 1 K 9/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/135

A 6 1 K 9/26

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/32

A 6 1 P 29/00

【手続補正書】

【提出日】平成23年11月16日(2011.11.16)

【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】

第1の放出制御基剤中に分散された薬物を含む中心錠及び前記中心錠を覆って形成され第2の放出制御基剤中に分散された薬物を含むコーティングを含む固形投与製剤であって、第2の放出制御基剤がポリ酢酸ビニル及びポリビニルピロリドンの物理的混合物を含み、並びに、U S P I型装置を用い50mMリン酸pH6.8、100rpmで基剤を個別に測定したときに前記第2の放出制御基剤からの前記薬物の放出速度が前記中心錠からの前記薬物の放出速度の少なくとも2倍である、前記固形投与製剤。

【請求項2】

前記コーティングからの前記薬物の放出速度が前記中心錠からの前記薬物の放出速度の少なくとも3倍である、請求項1に記載された製剤。

【請求項3】

前記コーティングからの前記薬物の放出速度が前記中心錠からの前記薬物の放出速度の3倍から9倍である、請求項2に記載された製剤。

【請求項4】

U S P I型装置を用い50mMリン酸pH6.8中で、かつ50から150rpmで攪拌しながらin vitro試験するとき、0から2時間の測定時に前記製剤より前記薬物の10%から40%が放出され、2から7時間の測定時に前記製剤より前記薬物の30から60%が放出され、7から12時間の測定時に前記製剤より前記薬物の50%から80%が放出され、かつ20時間の測定後に前記製剤より前記薬物の80%～100%が放出される、請求項1～3のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項5】

中心錠中の前記薬物とコーティング中の前記薬物の比率( w / w )が 0 . 6 から 2 である請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 6】

前記中心錠が薬物重量にして 30 % から 70 % である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 7】

前記コーティング中の前記薬物に対する前記コーティングの前記基剤の比率( w / w )が 0 . 7 から 4 である、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 8】

前記コーティング中のポリ酢酸ビニルの分子量が 100 , 000 から 1 , 000 , 000 である、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 9】

前記コーティング中のポリビニルピロリドンの分子量が 10 , 000 から 100 , 000 である、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 10】

前記コーティングがさらにキサンタンガムを含む、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 11】

前記コーティングに対する前記中心錠の比率( w / w )が 0 . 2 から 0 . 5 である、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 12】

第 1 の放出制御基剤が架橋高アミロースデンプンを含む、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 13】

薬物の水に対する溶解度が 500 g/L 以上である、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 14】

薬物がイオン化可能な官能基を 1 つ含み、かつ前記官能基が胃酸( 0 . 1 M HCl )中で少なくとも 90 % イオン化される、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 15】

中心錠及びコーティングの薬物がトラマドールである、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 16】

トラマドールまたはその塩の放出制御のための 1 日 1 回型経口医薬組成物であって、組成物が、初回の 1 用量を投与する際に、投与より 2 時間以内に少なくとも 100 ng / mL の平均血漿濃度をもたらし、かつ投与後少なくとも 22 時間の間少なくとも 100 ng / mL の平均血漿濃度をもたらし続ける、請求項 15 記載の製剤。

【請求項 17】

平均最高血漿濃度(  $C_{max}$  )が投与後 24 時間に得られる平均血漿濃度(  $C_{24h}$  )の 2 . 2 倍未満である、請求項 16 記載の製剤。

【請求項 18】

初回の 1 用量を摂取する際に、トラマドールまたはその塩血漿濃度が平均最高血漿濃度(  $C_{max}$  )が観察された後に、対数線形型に低下し見かけ上の最終消失速度定数(  $-z$  )が 0 . 12 h<sup>-1</sup> である、請求項 15 ~ 17 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 19】

請求項 1 ~ 18 のいずれか一項に記載の製剤を含む錠剤。