

【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20年4月10日(2008.4.10)

【公表番号】特表2007-530492(P2007-530492A)

【公表日】平成19年11月1日(2007.11.1)

【年通号数】公開・登録公報2007-042

【出願番号】特願2007-504366(P2007-504366)

【国際特許分類】

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 K 9/22 (2006.01)

A 6 1 K 9/28 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/04 (2006.01)

A 6 1 K 9/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 K 9/50 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 37/02

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 31/04

A 6 1 K 9/22

A 6 1 K 9/28

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/04

A 6 1 K 9/32

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 9/50

【手続補正書】

【提出日】平成20年2月22日(2008.2.22)

【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】**

活性物質 N - (2 - (2 - フタルイミドエトキシ) - アセチル) - L - アラニル - D - グルタミン酸を含有するコアと、内側コートとおよび場合により外側コートとを含む被覆された医薬品投薬形態物。

【請求項 2】

ヒトおよび動物の胃腸管の遠位部分への前記活性物質の制御された送達および / または標的化された送達のために好適である、請求項 1 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 3】

胃腸管の遠位部分が、回腸、盲腸および結腸である、請求項 2 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 4】

投薬形態物が、単回服用量または多分割服用量での、請求項 1 に記載される活性物質の約 10 mg から約 1000 mg の量でヒトまたは動物に投与される、請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 5】

コアおよび内側コートを含む、請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 6】

コアが活性物質 N - (2 - (2 - フタルイミドエトキシ) - アセチル) - L - アラニル - D - グルタミン酸および多糖を含む、請求項 5 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 7】

多糖が、ペクチンまたはアルギナート（酸の形態または金属塩の形態のいずれかで）、ガラクトマンナン、共有結合架橋デキストラン、アミロース、キサンタン、カラギーナンおよびデンプン、または、前記多糖または同じ特異的分解性を有するそれらの塩の組合せからなる群より選択される、請求項 6 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 8】

多糖が、ペプチンおよびペクチン酸カルシウムからなる群より選択される、請求項 7 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 9】

コアが、ペクチン酸カルシウムのマトリックスを形成するペプチン酸カルシウムにおける前記活性物質の固体分散物である、請求項 6 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 10】

コアがさらに、ステアリン酸マグネシウム、ステアリン酸カルシウムおよびエアロシルからなる群より選択される流動促進剤を含む、請求項 6 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 11】

内側コートが小腸の近位部分における前記活性物質の放出を防止する、請求項 5 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 12】

内側コートが、メタクリレートエステルコポリマー、ポリ酢酸ビニルおよびポリビニルピロリドンの混合物、ならびに / または、その組合せからなる群より選択されるポリマーを含む、請求項 11 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 13】

ポリマーの選択された組合せが、第四級アンモニウム基の含有量が低いアクリル酸エステルおよびメタクリル酸エステルのコポリマーの組合せである、請求項 12 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 14】

5 よりも低い pH での酸性環境で不溶性であり、および、胃の酸性媒体における前記活性物質の放出を防止する外側コートをさら含む、請求項 5 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 15】

外側コートが、メタクリル酸コポリマーの誘導体、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレート、ヒドロキシエチルセルロースフタレート、セルロースアセタートフタレート、ポリビニルアセチルフタレート、ヒドロキシプロピルメチルセルロースアセタートスクシナート、または、これらの組合せからなる群より選択される耐酸性ポリマーを含む、請求項 14 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 16】

耐酸性ポリマーが、メタクリル酸およびアクリル酸エチルに基づくアニオン性コポリマーである、請求項 15 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 17】

コートがさらに、タルク、カオリンおよびグリセロールモノステアレートからなる群より選択される流動促進剤を含む、請求項 12 および 15 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 18】

流動促進剤がタルクである、請求項 17 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 19】

コートがさらに、クエン酸トリエチル、クエン酸トリブチル、クエン酸アセチルトリエチル、クエン酸アセチルトリブチル、フタル酸ジエチル、フタル酸ジブチル、セバシン酸ジブチル、グリセリルトリアセタート、トリアセチン、ポリエチレングリコール 6000 およびポリオキシエチレン(20)ソルビタンモノオレアートからなる群より選択される可塑剤を含む、請求項 12 および 15 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 20】

可塑剤がクエン酸トリエチルである、請求項 19 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 21】

下記を含む医薬品投薬形態物：

- ・ステアリン酸マグネシウムを含み、活性物質 N - (2 - (2 - フタルイミドエトキシ) - アセチル) - L - アラニル - D - グルタミン酸が分散されているコア - ペクチン酸カルシウムマトリックス；および
- ・ポリマー Eudragit RS および Eudragit RL、タルクおよびクエン酸トリエチルを含む内側コート；および
- ・ポリマー Eudragit L - 55、タルクおよびクエン酸トリエチルを含む外側コート。

【請求項 22】

下記を含む医薬品投薬形態物：

- ・ステアリン酸マグネシウムを含み、活性物質が分散されているコア - ペクチン酸カルシウムマトリックス；および
- ・ポリマー Eudragit RS および Eudragit RL、タルクおよびクエン酸トリエチルとを含む内側コート；および
- ・ポリマー Eudragit L - 55、タルクおよびクエン酸トリエチルを含む外側コート。

【請求項 23】

活性物質が、ヒトまたは動物の胃腸管の遠位部分への制御された送達および/または標的化された送達を必要とするいずれかの活性物質からなる群より選択される、請求項 22 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 24】

胃腸管の遠位部分が、回腸、盲腸および結腸である、請求項 23 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 25】

マイクロカプセル、被覆マイクロカプセル、被覆マイクロスフェア、被覆顆粒、被覆ペレット、錠剤またはカプセルの形態であり得る、請求項 1 から 24 のいずれかに記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 26】

マイクロカプセルの形態である、請求項 2 5 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 2 7】

マイクロカプセルがさらに、不活性な錠剤マトリックスまたは不活性なカプセルに組み込まれている、請求項 2 6 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 2 8】

・錠剤を形成する胃耐性の錠剤マトリックス、または
・錠剤を形成する胃耐性および/または耐酸性のポリマーに由来するコートにより後で被覆される不活性な錠剤マトリックス、または
・胃耐性および/または耐酸性のポリマーに由来するカプセル、または
・胃耐性および/または耐酸性のポリマーに由来するコートにより後で被覆される不活性なカプセル

のいずれかに埋め込まれているマイクロカプセルの形態である、請求項 5 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 2 9】

胃耐性の錠剤マトリックスに埋め込まれているマイクロカプセルを含む錠剤である、請求項 2 8 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 3 0】

錠剤マトリックスが、ポリ酢酸ビニルおよびポリビニルピロリドンの混合物とヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレートとの組合せである、請求項 2 9 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 3 1】

胃耐性および/または耐酸性のポリマーが、メタクリル酸コポリマーの誘導体、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレート、ヒドロキシエチルセルロースフタレート、セルロースアセタートフタレート、ポリビニルアセチルフタレート、ヒドロキシプロピルメチルセルロースアセタートスクシナート、または、これらの組合せからなる群より選択される、請求項 2 8 に記載の医薬品投薬形態物。

【請求項 3 2】

請求項 1 から 3 1 のいずれか一項に記載の投薬形態物が調製される、医薬品投薬形態物を調製するための方法。

【請求項 3 3】

ヒトまたは動物における慢性的炎症性疾患を処置するための医薬品を調製するための、請求項 1 から 3 1 のいずれか一項に記載の医薬品投薬形態物の使用。

【請求項 3 4】

慢性的炎症性疾患が、大腸炎、非特異性潰瘍性大腸炎およびクローン病からなる群より選択される、請求項 3 3 に記載の医薬品投薬形態物の使用。

【請求項 3 5】

ヒトまたは動物における慢性的炎症性疾患を処置するための、請求項 1 から 3 1 のいずれか一項に記載される医薬品投薬形態物の使用。

【請求項 3 6】

慢性的炎症性疾患が、大腸炎、非特異性潰瘍性大腸炎およびクローン病からなる群より選択される、請求項 3 5 に記載の医薬品投薬形態物の使用。