

【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6月7日(2012.6.7)

【公表番号】特表2010-523555(P2010-523555A)

【公表日】平成22年7月15日(2010.7.15)

【年通号数】公開・登録公報2010-028

【出願番号】特願2010-501662(P2010-501662)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/50 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/28 (2006.01)

A 6 1 K 47/44 (2006.01)

A 6 1 K 47/30 (2006.01)

A 6 1 K 47/40 (2006.01)

A 6 1 K 47/22 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/706 (2006.01)

A 6 1 K 31/4375 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/502 (2006.01)

A 6 1 P 1/10 (2006.01)

A 6 1 P 1/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/485 (2006.01)

A 6 1 K 31/4422 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 9/50

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/28

A 6 1 K 47/44

A 6 1 K 47/30

A 6 1 K 47/40

A 6 1 K 47/22

A 6 1 K 37/02

A 6 1 K 31/706

A 6 1 K 31/4375

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 31/502

A 6 1 P 1/10

A 6 1 P 1/12

A 6 1 K 31/485

A 6 1 K 31/4422

【手続補正書】

【提出日】平成23年4月4日(2011.4.4)

【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】

一層又は多層のミニカプセルを含む経口組成物であって、該ミニカプセルが、一つ又はそれ以上の治療又は予防のための物質を、液体、半固体又は固体のコアの中に有して、活性型の物質を胃腸管の一つ以上の部位で放出する、放出プロフィールをもち、該コア組成物は、外殻又はコーティングに合わせて又はこれらと独立して、放出制御又は持続的放出を可能とする賦形剤を含み、それが融解押出用のポリマー及び温度変化型の脂質ベースの賦形剤から選択されることにより特徴づけられる上記組成物。

【請求項 2】

ミニカプセルが硬質のゼラチンカプセル中に含まれる請求項1に記載の組成物。

【請求項 3】

ミニカプセルが一層である請求項1又は2に記載の組成物。

【請求項 4】

ミニカプセルが、液体、半固体又は固体のコアを封入し、外側に固体の外殻を有する二層を含む請求項1又は2のいずれかに記載の組成物。

【請求項 5】

ミニカプセルが、外側の固体の外殻；固体、半固体又は液体の中間緩衝層；および液体、半固体又は液体のコアの三層を含むものである請求項1又は2のいずれかに記載の組成物。

【請求項 6】

放出制御のためのコーティングがミニカプセルの外側の外殻に適用されている前述の請求項のいずれかに記載の組成物。

【請求項 7】

放出制御のために、ポリマー素材が用いられている前述の請求項のいずれかに記載の組成物。

【請求項 8】

ポリマー素材が、pH、時間、厚さ、腐食性およびバクテリア分解性の一つ以上に対して感受性がある請求項7記載の組成物。

【請求項 9】

ミニカプセルが、一つ以上の活性物質を一つの層に含んでおり、その層が活性物質の放出を制御する請求項1又は2のいずれかに記載の組成物。

【請求項 10】

一つ以上の治療及び予防物質が、可溶化しているか又は速やかに溶解する、液体、半液体又は固体の形態で存在する前述の請求項のいずれかに記載の組成物。

【請求項 11】

活性物質が、上部消化管の環境下においては保護されているが、近位結腸において急激に及び／又は持続的放出される前述の請求項いずれかに記載の組成物。

【請求項 12】

製剤が、接着物質を含む前述の請求項のいずれかに記載の組成物。

【請求項 13】

接着物質が、粘膜接着物質又は生物接着物質である請求項12記載の組成物。

【請求項 14】

製剤が、小腸粘膜又は全身の免疫反応を誘導するために抗原および／又はアジュバントを含む前述の請求項のいずれかに記載の組成物。

【請求項 15】

局所小腸疾患の治療を促進するために一つ以上の活性物質を、回腸及び結腸において放出する前述の請求項いずれかに記載の組成物。

【請求項 16】

一つ以上の活性物質の吸収を促進するために回腸及び結腸において一つ以上の活性物質を放出する請求項1ないし14に記載の組成物。

【請求項 17】

一つ以上の活性物質がペプチド及びタンパク質から選択される請求項16に記載の組成物。

【請求項 18】

移植片対宿主病の治療において用いられる前述の請求項いずれかに記載の組成物。

【請求項 19】

疾患が、胃腸-小腸管における移植片対宿主病である請求項18に記載の組成物。

【請求項 20】

一つ以上の活性物質が、結腸及び／又は回腸全体において放出される免疫抑制剤である前述の請求項いずれかに記載の組成物。

【請求項 21】

一つ以上の活性物質が免疫抑制剤である前述の請求項いずれかに記載の組成物。

【請求項 22】

免疫抑制剤が、シクロスポリンA、タクロリムス、シロリムス、及びそれらの誘導体からなる群から選択される請求項21に記載の組成物。

【請求項 23】

活性物質がヒドロキシラーゼ阻害剤である請求項1ないし19のいずれかに記載の組成物。

【請求項 24】

ヒドロキシラーゼ阻害剤が、PHD阻害剤、DMOG及び他のアスパラギン酸ヒドロキシラーゼ阻害剤から選択される請求項23に記載の組成物。

【請求項 25】

核因子カッパBキナーゼ サブユニット阻害剤又はNFkB活性化剤の標的放出のために用いられる請求項1ないし19のいずれかに記載の組成物。

【請求項 26】

ミニカプセルが、コア溶液及び外殻溶液の表面張力を用いることにより得られる前述の請求項いずれかに記載の組成物であって、特定の周波数をかけたノズルから押し出されて、球形を形成し、冷却気流、又は冷却又は硬化溶液に曝されることにより、外側の外殻溶液がゲル化又は固化され、ノズルは、単一のオリフィスを有し、液体の該コア溶液に賦形剤を含む、コア及び外殻溶液がそこから外殻/コア混合懸濁液として押し出される上記組成物。

【請求項 27】

賦形剤は、様々な範囲のゲルシール(登録商標)飽和トリグリセリド又はウイテプゾール(登録商標)飽和トリグリセリドから選択される前述の請求項いずれかに記載の組成物。

【請求項 28】

ミニカプセルが、ゲル化を押し出しにより作製する、懸濁液を含む前述の請求項いずれかに記載の組成物。

【請求項 29】

懸濁液が、二つの均一溶液を混合及びホモジナイズすることにより得られ、続いて、振動をかけた単一のノズルからミニカプセルが押し出され、冷却浴又は空気中で冷却されることにより得られる請求項28に記載の組成物。

【請求項 30】

コア溶液及び外殻溶液の表面張力を用いることにより得られるミニカプセル又はミニス

フェアであって、該溶液が、特定の周波数をかけたノズルから押し出されて、球形を形成し、冷却気流、又は冷却又は硬化溶液に曝されることにより、外側の外殻溶液がゲル化又は固化され、ノズルは、単一のオリフィスを有し、コア及び外殻溶液はそこから外殻/コア混合懸濁液として押し出され、外側の外殻溶液がゲル化剤であり、コア溶液が外殻又はコーティングに合わせて、又はこれらと独立して、放出制御又は持続的放出を可能とする液体の形態の賦形剤、すなわち、融解押出用のポリマー及び温度変化型の脂質ベースの賦形剤を含むミニカプセル又はミニスフェア。

【請求項 3 1】

外側の外殻溶液がゼラチンベースである、請求項30のミニカプセル又はミニスフェア。

【請求項 3 2】

放出制御のためのコーティングがミニカプセルの外殻に適用されている請求項30又は31のいずれかに記載のミニカプセル又はミニスフェア。

【請求項 3 3】

液体、半固体又は固体のコアの中に、免疫抑制剤を含み、結腸に薬剤を送達するためのミニカプセルを含む経口組成物。

【請求項 3 4】

免疫抑制剤が、シクロスポリンA、タクロリムス、シロリムス、及びそれらの誘導体からなる群から選択される請求項33に記載の組成物。

【請求項 3 5】

活性薬剤が溶解している請求項33又は請求項34に記載の組成物。

【請求項 3 6】

コアが疎水性溶液である、請求項33ないし35のいずれかに記載の組成物。

【請求項 3 7】

外殻がゼラチンベースである請求項33ないし36のいずれかに記載の組成物。

【請求項 3 8】

ミニカプセルが一層である請求項33ないし37のいずれかに記載の組成物。

【請求項 3 9】

ミニカプセルが、液体、半固体又は固体のコアを封入し、外側に固体の外殻を有する二層を含む請求項33ないし37のいずれかに記載の組成物。

【請求項 4 0】

ミニカプセルが、可溶化した活性薬剤を分散させた形態で封入しているゲル化剤を含む請求項33ないし37のいずれかに記載の組成物。

【請求項 4 1】

ミニカプセルが、ゲル化を押し出しにより作製する、懸濁液を含む請求項33ないし37のいずれかに記載の組成物。

【請求項 4 2】

放出制御のためのコーティングがミニカプセルの外側の外殻に適用されている請求項33又は41のいずれかに記載の組成物。

【請求項 4 3】

放出制御のために、ポリマー素材が用いられている請求項33ないし42のいずれかに記載の組成物。

【請求項 4 4】

ポリマー素材が、pH、時間、厚さ、腐食性およびバクテリア分解性の一つ又はそれ以上に対して感受性のある請求項43記載の組成物。

【請求項 4 5】

エチルセルロースを放出速度制御ポリマーとして用いたコーティングを有するミニカプセルである請求項33ないし41のいずれかに記載の組成物。

【請求項 4 6】

ミニカプセルが結腸用コーティングされている請求項40記載の組成物。

【請求項 4 7】

ミニカプセルが硬質のゼラチンカプセル中に含まれる請求項33ないし46のいずれかに記載の組成物。

【請求項 48】

ミニカプセルが、コア溶液及び外殻溶液の表面張力を用いることにより得られる請求項33ないし47のいずれかに記載の組成物であって、ここでそのコア溶液と外側の外殻溶液は、特定の周波数をかけたノズルから押し出されて、球形を形成し、冷却気流、又は冷却又は硬化溶液に曝されることにより、外側の外殻溶液がゲル化又は固化され、ノズルは、単一のオリフィスを有し、溶液のコア溶液に賦形剤を含む、コア及び外殻溶液はそこから外殻/コア混合懸濁液として押し出される上記組成物。