【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19年11月1日(2007.11.1)

【公表番号】特表2007-518696(P2007-518696A)
【公表日】平成19年7月12日(2007.7.12)
【年通号数】公開・登録公報2007-026
【出願番号】特願2006-527123(P2006-527123)
【国際特許分類】
Ａ６１Ｋ　31/165　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　 9/52　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/32　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/38　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　 9/10　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　13/02　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　25/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　25/16　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　25/24　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　25/28　(2006.01)
【ＦＩ】
Ａ６１Ｋ　31/165
Ａ６１Ｋ　 9/52
Ａ６１Ｋ　47/32
Ａ６１Ｋ　47/38
Ａ６１Ｐ　 9/10
Ａ６１Ｐ　13/02
Ａ６１Ｐ　25/00
Ａ６１Ｐ　25/16
Ａ６１Ｐ　25/24
Ａ６１Ｐ　25/28

【手続補正書】
【提出日】平成19年9月11日(2007.9.11)
【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】
患者への投与に際して２つ若しくはそれより多くの量のモダフィニル化合物を放出する、単位投与剤形（ｕｎｉｔ　ｄｏｓｅ　ｆｏｒｍ）の製薬学的組成物。
【請求項２】
患者への投与に際して、単位投薬形態物（ｕｎｉｔ　ｄｏｓａｇｅ　ｆｏｒｍ）が第一の有効量のモダフィニル化合物を放出し、次いで実質的にモダフィニル化合物が該投薬形態物から放出されない時間間隔、およびその時間間隔後に第二の量のモダフィニル化合物が該投薬形態物から放出される、請求項１に記載の製薬学的組成物。
【請求項３】
ａ）有効量のモダフィニル化合物を含んでなる核粒子；
ｂ）腸溶ポリマーを含んでなる第一の膜；

ｃ）水不溶性ポリマーおよび腸溶ポリマーが約１０：１ないし１：１の重量比で第二の膜中に存在する該水不溶性ポリマーおよび腸溶ポリマーを含んでなる第二の膜；
を含んでなり；
かつ、核粒子が、いずれかの順序で第一および第二の膜で被覆されて活性薬物の粒子を形成し、そして、第一および第二の膜の総重量が活性薬物の粒子の総重量の約１５ないし８０重量パーセントである、
請求項１に記載の製薬学的組成物。
【請求項４】
有機酸を含む中間膜をさらに含んでなり、かつ該中間膜が核粒子を被覆しかつ第一の膜と第二の膜との間にある、請求項３に記載の製薬学的組成物。
【請求項５】
核粒子が、モダフィニル化合物およびポリマー性結合剤で被覆されたノンパレイユ（ｎｏｎ－ｐａｒｅｉｌ）糖核である、請求項３に記載の製薬学的組成物。
【請求項６】
核粒子が、沈殿、造粒および微粉砕、若しくは押出成型／球状化により製造される、請求項３に記載の製薬学的組成物。
【請求項７】
腸溶ポリマーが、セルロースのエステル、ポリビニルアセテートフタレート、ｐＨ感受性のメタクリル酸－メチルメタクリレートコポリマーおよびセラックよりなる群からそれぞれ独立に選択される、請求項３に記載の製薬学的組成物。
【請求項８】
水不溶性ポリマーが、エチルセルロース；ポリビニルアセテート；エチルアクリレートおよびメチルメタクリレートに基づく中性のコポリマー；ならびに四級アンモニウム基を有するアクリル酸およびメタクリル酸エステルのコポリマーよりなる群から選択される、請求項３に記載の製薬学的組成物。
【請求項９】
膜の少なくとも１種が可塑剤をさらに含んでなる、請求項３に記載の製薬学的組成物。
【請求項１０】
可塑剤が、トリアセチン、クエン酸トリブチル、クエン酸トリエチル、クエン酸アセチルトリｎ－ブチル、フタル酸ジエチル、ヒマシ油、セバシン酸ジブチル、アセチル化モノグリセリドおよびそれらの混合物よりなる群から選択される、請求項９に記載の製薬学的組成物。
【請求項１１】
第二の膜が、患者への経口投与後３ないし６時間の間のモダフィニル化合物の実質的な放出を予防するのに十分な厚さを有する、請求項３に記載の製薬学的組成物。
【請求項１２】
有機酸が、フマル酸、コハク酸、酒石酸、クエン酸、リンゴ酸およびマレイン酸よりなる群から選択される、請求項４に記載の製薬学的組成物。
【請求項１３】
製薬学的組成物がカプセル剤である、請求項３に記載の製薬学的組成物。
【請求項１４】
カプセル剤が硬ゼラチンカプセル剤である、請求項１３に記載の製薬学的組成物。
【請求項１５】
カプセル剤が、該組成物が患者への経口投与に際してモダフィニル化合物の調時パルス放出を提供するような単一の形態の活性薬物の粒子を含んでなる、請求項１３に記載の製薬学的組成物。
【請求項１６】
モダフィニル化合物が、患者への経口投与３ないし６時間後に放出される、請求項１５に記載の製薬学的組成物。
【請求項１７】

カプセル剤が、異なる放出時間をもつ２種若しくはそれ以上の活性薬物の粒子を含んでなる、請求項１３に記載の製薬学的組成物。
【請求項１８】
カプセル剤が、２種若しくはそれ以上の薬物の多層コーティング粒子を含んでなる、請求項１３に記載の製薬学的組成物。
【請求項１９】
ａ）モダフィニル化合物およびポリマー性結合剤を含んでなる核粒子を製造すること；ｂ）段階ａ）で形成された核粒子を可塑化した腸溶ポリマー膜で被覆すること；ならびにｃ）段階ｂ）で形成された可塑化した腸溶コーティングした核粒子を、水不溶性ポリマーおよび腸溶ポリマーの混合物を含んでなり、ここで、該水不溶性ポリマーおよび腸溶ポリマーは約１０：１から１：１までの重量比で存在する膜で被覆すること
を含んでなり；
膜の総重量が被覆された粒子の総重量に基づき１５ないし８０重量パーセントである、薬物送達系の作成方法。
【請求項２０】
ａ）モダフィニル化合物を含有する薄膜形成組成物を含んでなる核粒子を製造すること；
ｂ）段階ａ）で形成された核粒子を、可塑化した腸溶ポリマー膜で被覆すること；
ｃ）段階ｂ）で形成された可塑化した腸溶コーティング核粒子を、有機酸を含有する中間膜で被覆すること；ならびに
ｄ）段階ｃ）で形成された有機酸コーティングした粒子を、水不溶性ポリマーおよび腸溶ポリマーの混合物を含んでなり、ここで、該水不溶性ポリマーおよび腸溶ポリマーは約１０：１から１：１までの重量比で存在する膜で被覆すること
を含んでなり；
膜の総重量が被覆された粒子の総重量の約１５ないし８０重量パーセントである、薬物送達系の作成方法。
【請求項２１】
製薬学的組成物が、モダフィニル化合物の即時放出製剤およびモダフィニル化合物の遅延長時間放出製剤を含んでなる、請求項１に記載の製薬学的組成物。
【請求項２２】
即時放出製剤中のモダフィニル化合物の量が該即時放出製剤の６０ないし９０重量パーセントである、請求項２１に記載の製薬学的組成物。
【請求項２３】
即時放出製剤が、約７９．９重量％のラセミ体のモダフィニル、約９．９％の乳糖一水和物、約５％のポリビニルピロリドン９０、約５％の架橋カルボキシメチルセルロースナトリウム、および約０．５％のステアリン酸マグネシウムを含んでなる、請求項２２に記載の製薬学的組成物。
【請求項２４】
遅延長時間放出製剤が重合体により（ｐｏｌｙｍｅｒｉｃａｌｌｙ）帯形成されかつ腸溶コーティングされた投薬形態物である、請求項２１に記載の製薬学的組成物。
【請求項２５】
遅延長時間放出製剤が少なくとも２個の円周状の帯を伴い重合体により帯形成される、請求項２１に記載の製薬学的組成物。
【請求項２６】
即時放出製剤中のモダフィニル化合物の量が該即時放出製剤の６０ないし９０重量％であり、かつ、遅延長時間放出製剤が重合体により帯形成されかつ腸溶コーティングされた投薬形態物である、請求項２１に記載の製薬学的組成物。
【請求項２７】
該組成物を投与した患者の血液プロファイルが、図２に示されるプロファイルに実質的に対応する、請求項１に記載の製薬学的組成物。

【請求項２８】
即時放出モダフィニル化合物の１製剤および２種の異なる遅延持続放出製剤を含んでなる、請求項１に記載の製薬学的組成物。
【請求項２９】
患者への投与に際して、単位投与剤形がモダフィニル化合物の２個若しくはそれ以上の有効量を放出し、該モダフィニル化合物の第一の有効量は即時放出製剤でありかつ該モダフィニル化合物の第二の有効量が持続放出製剤である、単位投与剤形の製薬学的組成物。
【請求項３０】
持続放出製剤が、被験体への投与後４ないし１２時間にわたって有効量のモダフィニル化合物を放出する、請求項２９に記載の製薬学的組成物。
【請求項３１】
持続放出製剤が、少なくとも１種の適するポリマーをさらに含んでなる、請求項２９に記載の製薬学的組成物。
【請求項３２】
適するポリマーが、持続放出製剤の総重量の７ないし１６．５重量パーセントのハイプロメロースである、請求項３１に記載の製薬学的組成物。
【請求項３３】
即時放出製剤が顆粒剤若しくは錠剤である、請求項２９に記載の製薬学的組成物。
【請求項３４】
単位投薬形態物がカプセル剤である、請求項２９に記載の製薬学的組成物。
【請求項３５】
患者への投与後３ないし１２時間にわたって放出されるモダフィニル化合物を含んでなる、単位投与剤形の製薬学的組成物。
【請求項３６】
モダフィニル化合物が４ないし１２時間にわたって放出される、請求項３５に記載の組成物。
【請求項３７】
モダフィニル化合物が６ないし１２時間にわたって放出される、請求項３５に記載の組成物。
【請求項３８】
モダフィニル処置に応答する状態を有する患者に投与することにより、該患者を処置するための、モダフィニル化合物のパルス放出投薬形態物を製造するためのモダフィニル化合物の使用。
【請求項３９】
モダフィニル処置に応答する状態を有する患者に投与することにより、該患者を処置するための、モダフィニル化合物の遅延長放出投薬形態物を製造するためのモダフィニル化合物の使用。
【請求項４０】
状態が、ナルコレプシー、眠気、過度の眠気、ナルコレプシーを伴う過度の日中の眠気、パーキンソン病、尿失禁、多発性硬化症の倦怠感、ＡＤＨＤ、アルツハイマー病、睡眠時無呼吸、閉塞性睡眠時無呼吸、うつ若しくは虚血である、請求項３８若しくは３９に記載の使用。
【請求項４１】
モダフィニルに応答する状態がＡＤＨＤである、請求項３８若しくは３９に記載の使用。
【請求項４２】
モダフィニル処置に応答する状態を有する患者に投与することにより、該患者を処置するための、モダフィニル化合物の持続放出投薬形態物を製造するためのモダフィニル化合物の使用。
【請求項４３】

モダフィニル化合物が投与後３から１２時間まで放出される、請求項４２に記載の使用。

【請求項４４】

状態が、ナルコレプシー、眠気、過度の眠気、ナルコレプシーを伴う過度の日中の眠気、パーキンソン病、尿失禁、多発性硬化症の倦怠感、ＡＤＨＤ、アルツハイマー病、睡眠時無呼吸、閉塞性睡眠時無呼吸、うつ若しくは虚血である、請求項４２に記載の使用。

【請求項４５】

有効量の抗うつ薬をさらに含んでなる、請求項１に記載の製薬学的組成物。

【請求項４６】

有効量のモダフィニル化合物の持続放出製剤を含んでなる単位投与剤形の製薬学的組成物。

【請求項４７】

有効量のモダフィニル化合物の遅延長時間放出製剤を含んでなる単位投与剤形の製薬学的組成物。

【請求項４８】

モダフィニル化合物がラセミ体のモダフィニルである、請求項１、３、１５、２１、２９、３５、４６若しくは４７に記載の製薬学的組成物。

【請求項４９】

モダフィニル化合物が左旋性の形態のモダフィニルである、請求項１、３、１５、２１、２９、３５、４６若しくは４７に記載の製薬学的組成物。

【請求項５０】

投薬形態物内に含有されるモダフィニル化合物の総量が１０ないし８００ｍｇのラセミ体のモダフィニルを含んでなる、請求項１、３若しくは２１に記載の製薬学的組成物。

【請求項５１】

モダフィニル化合物がラセミ体のモダフィニルである、請求項１９若しくは２０に記載の方法。

【請求項５２】

モダフィニル化合物が左旋性の形態のモダフィニルである、請求項１９若しくは２０に記載の方法。

【請求項５３】

モダフィニル化合物がラセミ体のモダフィニルである、請求項４０に記載の使用。

【請求項５４】

モダフィニル化合物が左旋性の形態のモダフィニルである、請求項４０に記載の使用。

【請求項５５】

モダフィニル化合物がラセミ体のモダフィニルである、請求項４４に記載の使用。

【請求項５６】

モダフィニル化合物が左旋性の形態のモダフィニルである、請求項４４に記載の使用。