

【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30年12月13日 (2018.12.13)

【公表番号】特表2017-532363(P2017-532363A)

【公表日】平成29年11月2日 (2017.11.2)

【年通号数】公開・登録公報2017-042

【出願番号】特願2017-523336(P2017-523336)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/56 (2006.01)

A 6 1 K 31/4458 (2006.01)

A 6 1 K 9/58 (2006.01)

A 6 1 K 9/62 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 11/08 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 23/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/34 (2006.01)

A 6 1 P 1/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/02 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/40 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2017.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 9/56

A 6 1 K 31/4458

A 6 1 K 9/58

A 6 1 K 9/62

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 11/08

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 23/00

A 6 1 P 25/34

A 6 1 P 1/08

A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	3/02	1 0 1
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 P	43/00	1 2 1
A 6 1 K	47/38	
A 6 1 K	47/40	
A 6 1 K	47/10	
A 6 1 K	47/32	
A 6 1 K	47/34	
A 6 1 K	47/36	

【手続補正書】

【提出日】平成30年10月30日(2018.10.30)

【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】

(a) 顆粒と、

(b) 前記顆粒にコーティングされた第1の層であって、中枢神経系刺激薬を含む医薬品活性成分を第1の量含む第1の層と、

(c) 前記第1の層にコーティングされた第2の層であって、コーティングされたビーズが、前記コーティングされたビーズが投与された対象の遠位の腸部分に到達する後まで、前記第1の層における前記医薬品活性成分の放出を実質的に遅延させるのに十分な量で存在している第2の層と、

(d) 前記第2の層にコーティングされた第3の層であって、第2の量の前記医薬品活性成分を含み、そこに含まれている前記医薬品活性成分の実質的な即時放出を可能にするように構成されている第3の層とを含むコーティングされたビーズ。

【請求項 2】

前記第2の層が内側制御放出コーティングおよび外側遅延放出コーティングを含む、請求項1に記載のコーティングされたビーズ。

【請求項 3】

前記内側制御放出コーティングが、エチルセルロースポリマー、セルロースエーテル、ポリエチレンオキシド、ポリビニルアルコール誘導体、メタクリル酸コポリマー、ポリエチレングリコール、ポリグリコール酸、ポリ乳酸、ポリカプロラクトン、ポリ(n-ヒドロキシブチレート)、ポリアミノ酸、ポリ(アミド-エナミン)、ポリエステル、エチレン-酢酸ビニル(EVA)、ポリビニルピロリドン(PVP)、ポリ(アクリル酸)(PAA)、ポリ(メタクリル酸)(PMAA)およびそれらのいずれかの2種以上の混合物からなる群から選択される、請求項2に記載のコーティングされたビーズ。

【請求項 4】

前記内側制御放出コーティングが、アクリル酸エチル、メタクリル酸メチルおよび第四級アンモニウム基を有するメタクリル酸エステルのコポリマー、またはアンモニオメタクリレートコポリマーを含む、請求項2に記載のコーティングされたビーズ。

【請求項 5】

前記内側制御放出ポリマーが、前記コーティングされたビーズの重量に対して 3重量% ~ 16重量%、5重量% ~ 14重量%、5.1重量% ~ 13.5重量%、10重量% ~ 10.7重量%、8.0重量%、8.1重量%、8.2重量%、8.3重量%、8.4重量%

％、 8 . 5 重量％、 8 . 6 重量％、 8 . 7 重量％、 8 . 8 重量％、 8 . 9 重量％、 9 . 0 重量％、 9 . 1 重量％、 9 . 2 重量％、 9 . 3 重量％、 9 . 4 重量％、 9 . 5 重量％、 9 . 6 重量％、 9 . 7 重量％、 9 . 8 重量％、 9 . 9 重量％、 10 . 0 重量％、 10 . 1 重量％、 10 . 2 重量％、 10 . 3 重量％、 10 . 4 重量％、 10 . 5 重量％、 10 . 6 重量％、または 10 . 7 重量％の量で存在している、請求項 2 から 4 のいずれか一項に記載のコーティングされたビーズ。

【請求項 6】

前記外側遅延放出コーティングが、グアーガム、ペクチン、ヒドロキシプロピルメチルセルロースフタレート、セルロースアセートフタレート、セルロースアセートトリメリレート、生分解性多糖、ポリ（メタクリル酸 - c o - メタクリル酸メチル）1：2、ポリ（メタクリル酸 - c o - メタクリル酸メチル）1：1、ポリビニルアセートフタレート、メタクリロイルオキシアゾベンゼン、メタクリル酸 2 - ヒドロキシエチル（H E M A）、デキストランヒドロゲルおよびそれらのいずれかの 2 種以上の混合物からなる群から選択される、請求項 2 から 5 のいずれか一項に記載のコーティングされたビーズ。

【請求項 7】

前記外側遅延放出コーティングが、それぞれ 7：3：1 の比で存在しているアクリル酸メチル、メタクリル酸メチルおよびメタクリル酸をベースにしたアニオン性コポリマーを含む、請求項 2 から 5 のいずれか一項に記載のコーティングされたビーズ。

【請求項 8】

前記外側遅延放出コーティングが、前記コーティングされたビーズの重量に対して 3 重量％～ 20 重量％、 8 重量％～ 18 重量％、 10 重量％～ 17 重量％、 10 . 1 重量％～ 16 . 5 重量％、 15 重量％～ 16 重量％、 15 . 0 重量％、 15 . 1 重量％、 15 . 2 重量％、 15 . 3 重量％、 15 . 4 重量％、 15 . 5 重量％、 15 . 6 重量％、 15 . 7 重量％、 15 . 8 重量％、 15 . 9 重量％、 16 . 0 重量％、 16 . 1 重量％、 16 . 2 重量％、 16 . 3 重量％、または 16 . 4 重量％の量で存在している、請求項 2 から 7 のいずれか一項に記載のコーティングされたビーズ。

【請求項 9】

前記第 3 の層にコーティングされた第 4 の層をさらに含み、前記第 4 の層が 1 % 水溶液の粘度が 30 ～ 720 c P のアルギン酸の少なくとも 1 種の塩を含み、前記アルギン酸の少なくとも 1 種の塩が、アルギン酸ナトリウム、アルギン酸カリウム、アルギン酸マグネシウム、アルギン酸リチウムまたはアルギン酸アンモニウムおよびそれらのいずれかの 2 種以上の混合物からなる群から選択される、請求項 1 から 8 のいずれか一項に記載のコーティングされたビーズ。

【請求項 10】

前記医薬品活性成分が、糖尿病薬、注意欠陥多動性障害制御薬（attention deficit hyperactivity controlled drug）、鎮痛薬、抗肥満製剤、抗炎症薬、抗ヒスタミン薬、鎮咳薬、鬱血除去薬、制吐剤、麻酔薬、気管支拡張薬、心臓脈管薬、中枢神経系（CNS）薬、ニコチン置換療法薬、硝酸薬、睡眠補助薬、鎮静薬、ビタミンおよびそれらのいずれかの 2 種以上の混合物からなる群から選択される、請求項 1 から 9 のいずれか一項に記載のコーティングされたビーズ。

【請求項 11】

前記医薬品活性成分がメチルフェニデートまたは薬学的に許容されるその塩である、請求項 1 から 10 のいずれか一項に記載のコーティングされたビーズ。

【請求項 12】

前記第 1 の量が、前記医薬品活性成分の全量の 70 重量％～ 99 重量％、 75 重量％～ 95 重量％、 75 重量％～ 90 重量％、 75 重量％～ 85 重量％、または 80 重量％を占める、請求項 1 から 11 のいずれか一項に記載のコーティングされたビーズ。

【請求項 13】

前記顆粒が、白糖球状顆粒、コーティングされていない微結晶セルロース顆粒およびマンニトール - ポリビニルピロリドン顆粒から選択される、請求項 1 から 12 のいずれか一

項に記載のコーティングされたビーズ。

【請求項 1 4】

カプセル剤の形態で請求項 1 から 1 3 のいずれか一項に記載のコーティングされた複数のビーズを含む経口用固体医薬組成物であって、前記コーティングされた複数のビーズが、前記カプセル剤に含まれている唯一のコーティングされたビーズであり、前記カプセル剤が硬質ゼラチンカプセル剤または H P M C カプセル剤である、前記経口用固体医薬組成物。

【請求項 1 5】

請求項 1 から 1 3 のいずれか一項に記載のコーティングされたビーズまたは請求項 1 4 に記載の経口用固体医薬組成物の、中枢神経系刺激薬に応答する障害または状態を治療するための使用。