

【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 7 月 19 日 (2012.7.19)

【公表番号】特表 2011-524890 (P2011-524890A)

【公表日】平成 23 年 9 月 8 日 (2011.9.8)

【年通号数】公開・登録公報 2011-036

【出願番号】特願 2011-514138 (P2011-514138)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/42 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/42

【手続補正書】

【提出日】平成 24 年 6 月 1 日 (2012.6.1)

【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】

ヒトまたは動物体内の異なる部位への 1 を超える活性医薬成分 (A P I) の部位特異的デリバリーのための医薬剤形であって、該医薬剤形は、

内部層を全体的または部分的に被包する殻を形成する外部層、ここに、外部層は、架橋したキトサンおよびアルギン酸塩を含み、胃へのデリバリー用の少なくとも 1 つの A P I を含み；および

ペクチンを含み、結腸領域へのデリバリー用の少なくとも 1 つの A P I を含む内部層を含み、

外部層は、胃酵素に応答して胃内で分解性であり、外部層から胃内にその A P I を放出するが、内部層は、胃および小腸内で無傷のままであり、結腸酵素に応答して結腸領域で分解して、内部層からその A P I を放出できることを特徴とする該医薬剤形。

【請求項 2】

外部層が、硫酸亜鉛で架橋されることを特徴とする請求項 1 記載の医薬剤形。

【請求項 3】

アルギン酸塩が、アルギン酸ナトリウムであることを特徴とする請求項 1 または 2 記載の医薬剤形。

【請求項 4】

キットサンが、外部層の形成中に酢酸に溶解されることを特徴とする請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 記載の医薬剤形。

【請求項 5】

外部層が、フィルムの状態であることを特徴とする請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 記載の医薬剤形。

【請求項 6】

内部層が架橋されていることを特徴とする請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 記載の医薬剤形。

【請求項 7】

架橋剤が、B a C l₂であることを特徴とする請求項 6 記載の医薬剤形。

【請求項 8】

内部層が、さらにポリ（エチレンオキシド）を含むことを特徴とする請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 記載の医薬剤形。

【請求項 9】

内部層が、さらに、p H 依存性ポリマー、好ましくは、Eudragit（登録商標）L100、および / またはステアリン酸マグネシウムを含むことを特徴とする請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 記載の医薬剤形。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 5 1

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 5 1】

部位特異的な薬物デリバリーを達成する比較的新しいアプローチは、いわゆる「スマート」ポリマーの使用による。これらのポリマーは、環境の p H、温度、電場または磁場における小さな変化に応答でき、それらの微構造における速い可逆性の変化を受けることができる。薬物デリバリーシステムへのこれらの刺激応答性ポリマーの組み込みは、化学的シグナル（例えば、基質の存在）を環境的シグナル（例えば、p H 変化）に、次いで、機械的シグナルに、すなわち、ヒドロゲルの縮小または膨潤および薬物放出の制御に変換するであろう(GalaevおよびMattiasson, 1999)。ヒドロゲルからの薬物放出速度を制御する有効なアプローチは、架橋剤に対するポリマーの曝露時間の変更を用いること、架橋剤の濃度を変更すること、または分解性ヒドロゲルを使用することによるマトリックスの架橋密度の変更である(Patilら, 1997; Ayら, 2007)。