

【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】令和6年11月13日(2024.11.13)

【国際公開番号】WO2022/104338

【公表番号】特表2023-549177(P2023-549177A)

【公表日】令和5年11月22日(2023.11.22)

【年通号数】公開公報(特許)2023-220

【出願番号】特願2023-528013(P2023-528013)

【国際特許分類】

A 61K 9/64(2006.01)

A 61K 47/10(2017.01)

A 61K 47/26(2006.01)

A 61K 47/42(2017.01)

A 61K 47/36(2006.01)

A 61K 47/44(2017.01)

A 61K 47/34(2017.01)

A 61K 47/38(2006.01)

A 61K 47/32(2006.01)

A 61K 47/04(2006.01)

10

20

【F I】

A 61K 9/64

A 61K 47/10

A 61K 47/26

A 61K 47/42

A 61K 47/36

A 61K 47/44

A 61K 47/34

A 61K 47/38

A 61K 47/32

A 61K 47/04

30

【手続補正書】

【提出日】令和6年11月5日(2024.11.5)

【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)少なくとも1種の活性剤を含む充填材料；ならびに

(b)ゼラチン、ペクチン、デキストロース、グリセリン、およびソルビトールを含むpH依存シェル組成物

を含む遅延放出ソフトガルカプセルであって、

前記pH依存シェル組成物が乾燥pH依存シェル組成物の総重量に対して5wt%～40wt%の量のグリセリンを含み、

前記pH依存シェル組成物中のグリセリン対ソルビトールのw:w比が1:1.5～1:7の範囲である、遅延放出ソフトガルカプセル。

【請求項2】

40

50

前記 pH 依存シェル組成物が、乾燥 pH 依存シェル組成物の総重量に対して 1 0 w t % ~ 2 5 w t % または 1 5 w t % ~ 2 0 w t % の量のグリセリンを含む、請求項 1 に記載の遅延放出ソフトゲルカプセル。

【請求項 3】

前記 pH 依存シェル組成物が、乾燥 pH 依存シェル組成物の総重量に対して 1 0 w t % ~ 2 0 w t %, 1 0 w t % ~ 1 8 w t %, 1 2 w t % ~ 1 7 w t %, または 1 3 w t % ~ 1 5 w t % の量のソルビトールを含む、請求項 1 または 2 に記載の遅延放出ソフトゲルカプセル。

【請求項 4】

前記ペクチンが低メトキシルペクチンである、請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載の遅延放出ソフトゲルカプセル。 10

【請求項 5】

前記ペクチンがアミド化ペクチン、非アミド化ペクチンおよびそれらの組合せからなる群から選択される、請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の遅延放出ソフトゲルカプセル。

【請求項 6】

前記 pH 依存シェル組成物が、乾燥 pH 依存シェル組成物の重量に対して 4 0 w t % ~ 8 0 w t %, 4 5 w t % ~ 7 5 w t %, または 4 5 w t % ~ 6 5 w t % のゼラチンを含む、請求項 1 から 5 のいずれか一項に記載の遅延放出ソフトゲルカプセル。

【請求項 7】

前記 pH 依存シェル組成物が、乾燥 pH 依存シェル組成物の重量に対して 2 w t % ~ 2 0 w t %, 3 w t % ~ 1 5 w t %, または 7 w t . % ~ 1 5 w t % のペクチンを含む、請求項 1 から 6 のいずれか一項に記載の遅延放出ソフトゲルカプセル。 20

【請求項 8】

前記 pH 依存シェル組成物が、乾燥 pH 依存シェル組成物の重量に対して 0 . 0 1 w t % ~ 4 w t %, 0 . 0 5 w t % ~ 0 . 5 w t %, または 0 . 1 w t % ~ 0 . 2 w t % のデキストロースを含む、請求項 1 から 7 のいずれか一項に記載の遅延放出ソフトゲルカプセル。

【請求項 9】

前記ゼラチンがタイプ A ゼラチン、タイプ B ゼラチンおよびそれら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遅延放出ソフトゲルカプセル。 30

【請求項 10】

前記ゼラチンが魚ゼラチン、獸皮ゼラチン、骨ゼラチンおよびそれら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遅延放出ソフトゲルカプセル。

【請求項 11】

前記ペクチンが非アミド化ペクチンである、請求項 1 から 10 のいずれか一項に記載の遅延放出ソフトゲルカプセル。

【請求項 12】

5 0 R P M ~ 2 5 0 R P M のパドル、リン酸緩衝溶液、水酸化ナトリウム溶液、または水酸化カリウム溶液で酸段階 pH に調整した 5 0 0 m l ~ 9 0 0 m l の 0 . 1 N H C L を用いる U S P A p p a r a t u s I I で測定した場合、前記 pH 依存シェル組成物が、1 . 2、2 . 0、3 . 0、4 . 0、5 . 0、6 . 0、またはその中の部分範囲の前記酸段階 pH で、少なくとも 1 5 分、少なくとも 3 0 分、少なくとも 4 5 分、少なくとも 6 0 分、少なくとも 9 0 分、または少なくとも 1 2 0 分間溶解せず； 40

5 0 R P M ~ 2 5 0 R P M のパドル、緩衝 pH に調整した 5 0 0 m l ~ 9 0 0 m l のリン酸緩衝溶液、水酸化ナトリウム溶液、または水酸化カリウム溶液を用いる U S P A p p a r a t u s I I で測定した場合、前記 pH 依存シェル組成物が、6 . 5 より上、6 . 8 より上、7 . 0 より上、7 . 5 より上、8 . 0 より上、または 8 . 5 より上の前記緩衝 pH で、最大 6 0 分、最大 4 5 分、最大 3 0 分、最大 1 5 分、または最大 1 0 分で溶解す

る、請求項 1 から 11 のいずれか一項に記載の遅延放出ソフトゲルカプセル。

【請求項 13】

リン酸緩衝溶液、水酸化ナトリウム溶液、または水酸化カリウム溶液で酸段階 pH に調整した 500 ml ~ 900 ml の 0.1 N HCl の USP 崩壊装置で測定した場合、前記 pH 依存シェル組成物が、1.2、2.0、3.0、4.0、5.0、6.0、またはその中の部分範囲の前記酸段階 pH で、少なくとも 15 分、少なくとも 30 分、少なくとも 45 分、少なくとも 60 分、少なくとも 90 分、または少なくとも 120 分間崩壊せず；

緩衝 pH に調整した 500 ml ~ 900 ml のリン酸緩衝溶液、水酸化ナトリウム溶液、または水酸化カリウム溶液の USP 崩壊装置で測定した場合、前記 pH 依存シェル組成物が、6.5 より上、6.8 より上、7.0 より上、7.5 より上、8.0 より上、または 8.5 より上の前記緩衝 pH で、最大 60 分、最大 45 分、最大 30 分、最大 15 分、または最大 10 分で崩壊した、請求項 1 から 12 のいずれか一項に記載の遅延放出ソフトゲルカプセル。

【請求項 14】

前記 pH 依存シェル組成物が 2 : 1 ~ 20 : 1 または 6 : 1 ~ 18 : 1 の範囲のゼラチン対ペクチン w : w 比を有する、請求項 1 から 13 のいずれか一項に記載の遅延放出ソフトゲルカプセル。

【請求項 15】

前記 pH 依存シェル組成物中のグリセリン対ソルビトールの w : w 比が、1 : 2 ~ 1 : 5 の範囲である、請求項 1 から 14 のいずれか一項に記載の遅延放出ソフトゲルカプセル。

【請求項 16】

おくびの発生を減少させるための、請求項 1 から 15 のいずれか一項に記載の遅延放出ソフトゲルカプセル。

【請求項 17】

前記充填材料が、魚油、クリル油、ニンニク油、ポリエチレングリコール、またはそれらの組合せを含む、請求項 1 から 16 のいずれか一項に記載の遅延放出ソフトゲルカプセル。

【請求項 18】

(a) 少なくとも 1 種の活性剤を含む充填材料；ならびに
(b) フィルム形成剤、グリセリン、およびソルビトールを含む pH 依存シェル組成物を含む遅延放出ソフトゲルカプセルであって、

前記 pH 依存シェル組成物が、乾燥 pH 依存シェル組成物の総重量に対して 5 wt % ~ 40 wt % の量のグリセリンを含み、

前記 pH 依存シェル組成物中のグリセリン対ソルビトールの w : w 比が 1 : 1.5 ~ 1 : 7 の範囲である、遅延放出ソフトゲルカプセル。

【請求項 19】

前記 pH 依存シェル組成物がデキストロース、ペクチン、またはゼラチンの少なくとも 1 つをさらに含む、請求項 18 に記載の遅延放出ソフトゲルカプセル。

【請求項 20】

前記フィルム形成剤が、カラギーナン、デンプン、アルファ化デンプン、キサンタンガム、寒天、ペクチン、アルギン酸塩、糖、高分子量ポリエチレングリコール、糖由来のアルコール、セルロース誘導体、セルロースポリマー、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、微結晶セルロース、アタパルジャイト、ベントナイト、デキストリン、アルギン酸塩、カオリン、レシチン、ケイ酸アルミニウムマグネシウム、カルボマー、カルボボール、二酸化ケイ素、カードラン、ファーセレラン、アルブミン、ダイズタンパク質、キトサン、またはそれらの組合せを含む非動物由来のゲル化剤を含む、請求項 18 または 19 に記載の遅延放出ソフトゲルカプセル。

10

20

30

40

50

【請求項 2 1】

少なくとも 1 種の活性剤を含む充填材料；および
0 . 1 w t % ~ 2 w t % のジェランガムを含む pH 依存シェル組成物
を含む遅延放出ソフトゲルカプセルであって、4 の pH を有する媒体中にある場合、6 0
分後に溶解し始める、遅延放出ソフトゲルカプセル。

【請求項 2 2】

5 の pH を有する媒体中で 4 5 分後に溶解し始める、請求項 2 1 に記載の遅延放出ソ
フトゲルカプセル。

【請求項 2 3】

前記ジェランガムが 0 . 4 w t % ~ 2 w t % 含まれる、請求項 2 1 に記載の遅延放出ソ
フトゲルカプセル。 10

【請求項 2 4】

(a) 活性剤を含む充填材料を調製するステップと；
(b) 前記充填材料を pH 依存シェル組成物で封入するステップと
を含む、請求項 1 から 15 のいずれか一項に記載の遅延放出ソフトゲルカプセルを調製す
る方法。