

【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26年11月6日(2014.11.6)

【公表番号】特表2013-537915(P2013-537915A)

【公表日】平成25年10月7日(2013.10.7)

【年通号数】公開・登録公報2013-055

【出願番号】特願2013-530379(P2013-530379)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/485 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/485

A 6 1 P 25/04

A 6 1 K 9/20

【手続補正書】

【提出日】平成26年9月19日(2014.9.19)

【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】

1 つ以上のオピオイド成分を含む、ヒトにおける疼痛を処置するための薬学的製剤であって、ここで、

(a) 該 1 つ以上のオピオイド成分は、1 つ以上の放出プロファイルを有し；

(b) 該オピオイド成分の少なくとも 1 つは、オピオイドを含む制御放出オピオイド成分であり、ここで、該オピオイドは、オキシコドンまたはその塩であり；

該薬学的製剤は、反復投与後に約 4 . 5 ~ 約 8 時間というオキシコドンまたはその塩の最高血漿中濃度到達時間 (T_{max}) を提供する、薬学的製剤。

【請求項 2】

前記制御放出オピオイド成分が、モルヒネ、コデイン、ヒドロモルホン、ヒドロコドン、ジヒドロコデイン、ジヒドロモルヒネ、オキシモルホン、それらの混合物およびそれらの塩からなる群から選択される、1 つ以上のさらなるオピオイド類をさらに含む、請求項 1 に記載の薬学的製剤。

【請求項 3】

前記製剤が、約 2 mg という総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、単回投与後に約 14 . 7 ng · hr / mL ~ 約 23 . 0 ng · hr / mL という約 0 ~ 約 24 時間の曲線下面積 (AUC_{24}) を提供する、請求項 1 に記載の薬学的製剤。

【請求項 4】

約 2 mg とは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記 2 mg の AUC_{24} に比例する AUC_{24} を有する、請求項 3 に記載の薬学的製剤。

【請求項 5】

前記製剤が、約 2 mg という総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、定常状態条件の間においてである反復投与後に約 1 ~ 約 3 ng / mL というオキシコドンまたはその塩の平均最高血漿中濃度 (C_{max}) を提供する、請求項 1 に記載の薬学的製剤。

【請求項 6】

約 2 mg とは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記 2 mg の C_{max} に比例する C_{max} を有する、請求項 5 に記載の薬学的製剤。

【請求項 7】

前記製剤が、約 5 mg という総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、単回投与後に約 $40.2 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{mL}$ ~ 約 $62.8 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{mL}$ という約 0 ~ 約 24 時間の曲線下面積 (AUC_{24}) を提供する、請求項 1 に記載の薬学的製剤。

【請求項 8】

約 5 mg とは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記 5 mg の AUC_{24} に比例する AUC_{24} を有する、請求項 7 に記載の薬学的製剤。

【請求項 9】

前記製剤が、約 5 mg という総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、定常状態条件の間においてである反復投与後に約 3 ~ 約 7 ng / mL というオキシコドンまたはその塩の平均最高血漿中濃度 (C_{max}) を提供する、請求項 1 に記載の薬学的製剤。

【請求項 10】

約 5 mg とは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記 5 mg の C_{max} に比例する C_{max} を有する、請求項 9 に記載の薬学的製剤。

【請求項 11】

前記製剤が、約 10 mg という総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、単回投与後に約 $80.5 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{mL}$ ~ 約 $125.9 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{mL}$ という約 0 ~ 約 24 時間の曲線下面積 (AUC_{24}) を提供する、請求項 1 に記載の薬学的製剤。

【請求項 12】

約 10 mg とは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記 10 mg の AUC_{24} に比例する AUC_{24} を有する、請求項 11 に記載の薬学的製剤。

【請求項 13】

前記製剤が、約 10 mg という総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、定常状態条件の間においてである反復投与後に約 5 ~ 約 15 ng / mL というオキシコドンまたはその塩の平均最高血漿中濃度 (C_{max}) を提供する、請求項 1 に記載の薬学的製剤。

【請求項 14】

約 10 mg とは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記 10 mg の C_{max} に比例する C_{max} を有する、請求項 13 に記載の薬学的製剤。

【請求項 15】

前記製剤が、約 20 mg という総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、単回投与後に約 $166.0 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{mL}$ ~ 約 $259.3 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{mL}$ という約 0 ~ 約 24 時間の曲線下面積 (AUC_{24}) を提供する、請求項 1 に記載の薬学的製剤。

【請求項 16】

約 20 mg とは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記 20 mg の AUC_{24} に比例する AUC_{24} を有する、請求項 15 に記載の薬学的製剤。

【請求項 17】

前記製剤が、約 20 mg という総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、定常状態条件の間においてである反復投与後に約 10 ~ 約 30 ng / mL というオキシコドンまたはその塩の平均最高血漿中濃度 (C_{max}) を提供する、請求項 1 に記載の薬学的製剤。

【請求項 18】

約 20 mg とは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記 20 mg の C_{max} に比例する C_{max} を有する、請求項 17 に記載の薬学的製剤。

【請求項 19】

前記製剤が、約 40 mg という総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、単回投与後に約 $338.5 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{mL}$ ~ 約 $528.9 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{mL}$ という約 0 ~ 約 24 時間の曲線下面積 (AUC_{24}) を提供する、請求項 1 に記載の薬学的製剤。

【請求項 20】

約 40 mg とは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記

40 mg の AUC_{24} に比例する AUC_{24} を有する、請求項 19 に記載の薬学的製剤。

【請求項 21】

前記製剤が、約 40 mg という総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、定常状態条件の間においてである反復投与後に約 25 ~ 約 55 ng / mL というオキシコドンまたはその塩の平均最高血漿中濃度 (C_{max}) を提供する、請求項 1 に記載の薬学的製剤。

【請求項 22】

約 40 mg とは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記 40 mg の C_{max} に比例する C_{max} を有する、請求項 21 に記載の薬学的製剤。

【請求項 23】

前記製剤が、約 80 mg という総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、単回投与後に約 868 . 4 ng · hr / mL ~ 約 1356 . 9 ng · hr / mL という約 0 ~ 約 24 時間の曲線下面積 (AUC_{24}) を提供する、請求項 1 に記載の薬学的製剤。

【請求項 24】

約 80 mg とは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記 80 mg の AUC_{24} に比例する AUC_{24} を有する、請求項 23 に記載の薬学的製剤。

【請求項 25】

前記製剤が、約 80 mg という総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、定常状態条件の間においてである反復投与後に約 50 ~ 約 110 ng / mL というオキシコドンまたはその塩の平均最高血漿 ($lasma$) 中濃度 (C_{max}) を提供する、請求項 1 に記載の薬学的製剤。

【請求項 26】

約 80 mg とは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記 80 mg の C_{max} に比例する C_{max} を有する、請求項 25 に記載の薬学的製剤。

【請求項 27】

第 2 の制御放出オピオイド成分を含む、請求項 1 に記載の薬学的製剤。

【請求項 28】

前記第 2 の制御放出オピオイド成分が、モルヒネ、コデイン、ヒドロモルホン、ヒドロコドン、オキシコドン、ジヒドロコデイン、ジヒドロモルヒネ、オキシモルホン、それらの混合物およびそれらの塩からなる群から選択されるオピオイドを含む、請求項 27 に記載の薬学的製剤。

【請求項 29】

即放性オピオイド成分を含む、請求項 1 に記載の薬学的製剤。

【請求項 30】

前記即放性オピオイド成分が、モルヒネ、コデイン、ヒドロモルホン、ヒドロコドン、オキシコドン、ジヒドロコデイン、ジヒドロモルヒネ、オキシモルホン、それらの混合物およびそれらの塩からなる群から選択されるオピオイドを含む、請求項 29 に記載の薬学的製剤。

【請求項 31】

前記即放性オピオイド成分中のオピオイドが、モルヒネまたはその塩である、請求項 30 に記載の薬学的製剤。

【請求項 32】

前記製剤中の全モルヒネまたはその塩および全オキシコドンまたはその塩が、約 3 : 2 というモルヒネまたはその塩とオキシコドンまたはその塩との重量比で存在する、請求項 31 に記載の薬学的製剤。

【請求項 33】

第 2 のオピオイド成分および第 3 のオピオイド成分を含み、ここで：

(a) 該第 2 のオピオイド成分は、即放性オピオイド成分であり、カップアゴニスト活性を有するオピオイドを含み；かつ

(b) 該第 3 のオピオイド成分は、制御放出オピオイド成分であり、ミューアゴニスト活性を有するオピオイドを含む、

請求項 1 に記載の薬学的製剤。

【請求項 3 4】

カップアゴニスト活性を有する前記オピオイドが、オキシコドンまたはその塩である、請求項 3 3 に記載の薬学的製剤。

【請求項 3 5】

ミューアゴニスト活性を有する前記オピオイドが、モルヒネまたはその塩である、請求項 3 3 に記載の薬学的製剤。

【請求項 3 6】

前記制御放出オピオイド成分が、モルヒネまたはその塩を含む、請求項 1 に記載の薬学的製剤。

【請求項 3 7】

前記制御放出オピオイド成分が、モルヒネまたはその塩およびオキシコドンまたはその塩を、重量で約 3 : 2 の量で含む、請求項 3 6 に記載の薬学的製剤。

【請求項 3 8】

前記製剤の溶出性は、USP I 型装置において約 3 7 の水中、約 5 0 r p m で測定されたとき、2 時間後に約 0 ~ 約 2 0 % の前記オキシコドンまたはその塩を放出する、請求項 1 に記載の薬学的製剤。

【請求項 3 9】

前記製剤の溶出性は、USP I 型装置において約 3 7 の水中、約 5 0 r p m で測定されたとき、4 時間後に約 1 5 ~ 約 6 0 % の前記オキシコドンまたはその塩を放出する、請求項 1 に記載の薬学的製剤。

【請求項 4 0】

前記製剤の溶出性は、USP I 型装置において約 3 7 の水中、約 5 0 r p m で測定されたとき、6 時間後に約 2 5 ~ 約 8 0 % の前記オキシコドンまたはその塩を放出する、請求項 1 に記載の薬学的製剤。

【請求項 4 1】

前記製剤の溶出性は、USP I 型装置において約 3 7 の水中、約 5 0 r p m で測定されたとき、8 時間後に約 3 5 ~ 約 8 5 % の前記オキシコドンまたはその塩を放出する、請求項 1 に記載の薬学的製剤。

【請求項 4 2】

前記製剤の溶出性は、USP I 型装置において約 3 7 の水中、約 5 0 r p m で測定されたとき、1 0 時間後に約 4 5 ~ 約 9 5 % の前記オキシコドンまたはその塩を放出する、請求項 1 に記載の薬学的製剤。

【請求項 4 3】

前記製剤の溶出性は、USP I 型装置において約 3 7 の水中、約 5 0 r p m で測定されたとき、1 2 時間後に約 6 0 ~ 約 1 0 0 % の前記オキシコドンまたはその塩を放出する、請求項 1 に記載の薬学的製剤。

【請求項 4 4】

ヒトにおける吸収のための、オピオイドレセプターアゴニスト活性を有する 1 つ以上の化合物の放出を制御するための薬学的製剤であって、該薬学的製剤は、1 つ以上のオピオイド成分を含み、ここで：

(a) 該 1 つ以上のオピオイド成分は、1 つ以上の放出プロファイルを有し；

(b) 該オピオイド成分の少なくとも 1 つは、オピオイドを含む制御放出オピオイド成分であり、該オピオイドは、オキシコドンまたはその塩であり；

該薬学的製剤は、反復投与後に約 4 . 5 ~ 約 8 時間という、オキシコドンまたはその塩の最高血漿中濃度到達時間 (T_{max}) を提供する、薬学的製剤。

【請求項 4 5】

ヒトにおける疼痛を処置するための薬学的製剤であって、1 つ以上のオピオイド成分を含み、ここで：

(a) 該 1 つ以上のオピオイド成分は、1 つ以上の放出プロファイルを有し；

(b) 該オピオイド成分の少なくとも1つは、オピオイドを含む制御放出オピオイド成分であり、該オピオイドは、オキシコドンまたはその塩であり；

該薬学的製剤は、反復投与後に約4.5～約8時間という、オキシコドンまたはその塩の最高血漿中濃度到達時間 (T_{max}) を提供する、薬学的製剤。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0050

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0050】

ヒトにおける疼痛を処置する方法は、1つ以上の成分を含む薬学的製剤を投与する工程を包含し、その1つ以上のオピオイド成分は、1つ以上の放出プロファイルを有し、それらのオピオイド成分の少なくとも1つは、オピオイドを含む制御放出オピオイド成分である。ある特定の実施形態において、上記ヒトに投与される薬学的製剤は、本発明の薬学的製剤によるものである。

一実施形態において、例えば、以下の項目が提供される。

(項目1)

1つ以上のオピオイド成分を含む、ヒトにおける疼痛を処置するための薬学的製剤であって、ここで、

(a) 該1つ以上のオピオイド成分は、1つ以上の放出プロファイルを有し；

(b) 該オピオイド成分の少なくとも1つは、オピオイドを含む制御放出オピオイド成分であり、ここで、該オピオイドは、オキシコドンまたはその塩であり；

該薬学的製剤は、反復投与後に約4.5～約8時間というオキシコドンまたはその塩の最高血漿中濃度到達時間 (T_{max}) を提供する、薬学的製剤。

(項目2)

前記制御放出オピオイド成分が、モルヒネ、コデイン、ヒドロモルホン、ヒドロコドン、ジヒドロコデイン、ジヒドロモルヒネ、オキシモルホン、それらの混合物およびそれらの塩からなる群から選択される、1つ以上のさらなるオピオイド類をさらに含む、項目1に記載の薬学的製剤。

(項目3)

前記製剤が、約2mgという総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、単回投与後に約14.7ng·hr/mL～約23.0ng·hr/mLという約0～約24時間の曲線下面積 (AUC_{24}) を提供する、項目1に記載の薬学的製剤。

(項目4)

約2mgとは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記2mgの AUC_{24} に比例する AUC_{24} を有する、項目3に記載の薬学的製剤。

(項目5)

前記製剤が、約2mgという総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、定常状態条件の間においてである反復投与後に約1～約3ng/mLというオキシコドンまたはその塩の平均最高血漿中濃度 (C_{max}) を提供する、項目1に記載の薬学的製剤。

(項目6)

約2mgとは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記2mgの C_{max} に比例する C_{max} を有する、項目5に記載の薬学的製剤。

(項目7)

前記製剤が、約5mgという総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、単回投与後に約40.2ng·hr/mL～約62.8ng·hr/mLという約0～約24時間の曲線下面積 (AUC_{24}) を提供する、項目1に記載の薬学的製剤。

(項目8)

約5mgとは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記5mgの AUC_{24} に比例する AUC_{24} を有する、項目7に記載の薬学的製剤。

(項目9)

前記製剤が、約5mgという総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、定常状態条件の間においてである反復投与後に約3～約7ng/mLというオキシコドンまたはその塩の平均最高血漿中濃度(C_{max})を提供する、項目1に記載の薬学的製剤。

(項目10)

約5mgとは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記5mgの C_{max} に比例する C_{max} を有する、項目9に記載の薬学的製剤。

(項目11)

前記製剤が、約10mgという総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、単回投与後に約80.5ng·hr/mL～約125.9ng·hr/mLという約0～約24時間の曲線下面積(AUC_{24})を提供する、項目1に記載の薬学的製剤。

(項目12)

約10mgとは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記10mgの AUC_{24} に比例する AUC_{24} を有する、項目11に記載の薬学的製剤。

(項目13)

前記製剤が、約10mgという総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、定常状態条件の間においてである反復投与後に約5～約15ng/mLというオキシコドンまたはその塩の平均最高血漿中濃度(C_{max})を提供する、項目1に記載の薬学的製剤。

(項目14)

約10mgとは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記10mgの C_{max} に比例する C_{max} を有する、項目13に記載の薬学的製剤。

(項目15)

前記製剤が、約20mgという総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、単回投与後に約166.0ng·hr/mL～約259.3ng·hr/mLという約0～約24時間の曲線下面積(AUC_{24})を提供する、項目1に記載の薬学的製剤。

(項目16)

約20mgとは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記20mgの AUC_{24} に比例する AUC_{24} を有する、項目15に記載の薬学的製剤。

(項目17)

前記製剤が、約20mgという総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、定常状態条件の間においてである反復投与後に約10～約30ng/mLというオキシコドンまたはその塩の平均最高血漿中濃度(C_{max})を提供する、項目1に記載の薬学的製剤。

(項目18)

約20mgとは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記20mgの C_{max} に比例する C_{max} を有する、項目17に記載の薬学的製剤。

(項目19)

前記製剤が、約40mgという総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、単回投与後に約338.5ng·hr/mL～約528.9ng·hr/mLという約0～約24時間の曲線下面積(AUC_{24})を提供する、項目1に記載の薬学的製剤。

(項目20)

約40mgとは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記40mgの AUC_{24} に比例する AUC_{24} を有する、項目19に記載の薬学的製剤。

(項目21)

前記製剤が、約40mgという総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、定常状態条件の間においてである反復投与後に約25～約55ng/mLというオキシコドンまたはその塩の平均最高血漿中濃度(C_{max})を提供する、項目1に記載の薬学的製剤。

(項目22)

約40mgとは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記40mgの C_{max} に比例する C_{max} を有する、項目21に記載の薬学的製剤。

(項目23)

前記製剤が、約 80 mg という総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、単回投与後に約 $868.4 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{mL}$ ~ 約 $1356.9 \text{ ng} \cdot \text{hr} / \text{mL}$ という約 0 ~ 約 24 時間の曲線下面積 (AUC_{24}) を提供する、項目 1 に記載の薬学的製剤。

(項目 24)

約 80 mg とは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記 80 mg の AUC_{24} に比例する AUC_{24} を有する、項目 23 に記載の薬学的製剤。

(項目 25)

前記製剤が、約 80 mg という総用量のオキシコドンまたはその塩を含むとき、定常状態条件の間においてである反復投与後に約 50 ~ 約 110 ng/mL というオキシコドンまたはその塩の平均最高血漿 (l a s m a) 中濃度 ($\text{C}_{\text{m a x}}$) を提供する、項目 1 に記載の薬学的製剤。

(項目 26)

約 80 mg とは異なる総用量のオキシコドンまたはその塩について製剤化され、かつ前記 80 mg の $\text{C}_{\text{m a x}}$ に比例する $\text{C}_{\text{m a x}}$ を有する、項目 25 に記載の薬学的製剤。

(項目 27)

第 2 の制御放出オピオイド成分を含む、項目 1 に記載の薬学的製剤。

(項目 28)

前記第 2 の制御放出オピオイド成分が、モルヒネ、コデイン、ヒドロモルホン、ヒドロコドン、オキシコドン、ジヒドロコデイン、ジヒドロモルヒネ、オキシモルホン、それらの混合物およびそれらの塩からなる群から選択されるオピオイドを含む、項目 27 に記載の薬学的製剤。

(項目 29)

即放性オピオイド成分を含む、項目 1 に記載の薬学的製剤。

(項目 30)

前記即放性オピオイド成分が、モルヒネ、コデイン、ヒドロモルホン、ヒドロコドン、オキシコドン、ジヒドロコデイン、ジヒドロモルヒネ、オキシモルホン、それらの混合物およびそれらの塩からなる群から選択されるオピオイドを含む、項目 29 に記載の薬学的製剤。

(項目 31)

前記即放性オピオイド成分中のオピオイドが、モルヒネまたはその塩である、項目 30 に記載の薬学的製剤。

(項目 32)

前記製剤中の全モルヒネまたはその塩および全オキシコドンまたはその塩が、約 3 : 2 というモルヒネまたはその塩とオキシコドンまたはその塩との重量比で存在する、項目 31 に記載の薬学的製剤。

(項目 33)

第 2 のオピオイド成分および第 3 のオピオイド成分を含み、ここで：

(a) 該第 2 のオピオイド成分は、即放性オピオイド成分であり、カップアゴニスト活性を有するオピオイドを含み；かつ

(b) 該第 3 のオピオイド成分は、制御放出オピオイド成分であり、ミューアゴニスト活性を有するオピオイドを含む、
項目 1 に記載の薬学的製剤。

(項目 34)

カップアゴニスト活性を有する前記オピオイドが、オキシコドンまたはその塩である、項目 33 に記載の薬学的製剤。

(項目 35)

ミューアゴニスト活性を有する前記オピオイドが、モルヒネまたはその塩である、項目 33 に記載の薬学的製剤。

(項目 36)

前記制御放出オピオイド成分が、モルヒネまたはその塩を含む、項目 1 に記載の薬学的製

剤。

(項目 37)

前記制御放出オピオイド成分が、モルヒネまたはその塩およびオキシコドンまたはその塩を、重量で約 3 : 2 の量で含む、項目 36 に記載の薬学的製剤。

(項目 38)

前記製剤の溶出性は、USP I 型装置において約 37 の水中、約 50 rpm で測定されたとき、2 時間後に約 0 ~ 約 20 % の前記オキシコドンまたはその塩を放出する、項目 1 に記載の薬学的製剤。

(項目 39)

前記製剤の溶出性は、USP I 型装置において約 37 の水中、約 50 rpm で測定されたとき、4 時間後に約 15 ~ 約 60 % の前記オキシコドンまたはその塩を放出する、項目 1 に記載の薬学的製剤。

(項目 40)

前記製剤の溶出性は、USP I 型装置において約 37 の水中、約 50 rpm で測定されたとき、6 時間後に約 25 ~ 約 80 % の前記オキシコドンまたはその塩を放出する、項目 1 に記載の薬学的製剤。

(項目 41)

前記製剤の溶出性は、USP I 型装置において約 37 の水中、約 50 rpm で測定されたとき、8 時間後に約 35 ~ 約 85 % の前記オキシコドンまたはその塩を放出する、項目 1 に記載の薬学的製剤。

(項目 42)

前記製剤の溶出性は、USP I 型装置において約 37 の水中、約 50 rpm で測定されたとき、10 時間後に約 45 ~ 約 95 % の前記オキシコドンまたはその塩を放出する、項目 1 に記載の薬学的製剤。

(項目 43)

前記製剤の溶出性は、USP I 型装置において約 37 の水中、約 50 rpm で測定されたとき、12 時間後に約 60 ~ 約 100 % の前記オキシコドンまたはその塩を放出する、項目 1 に記載の薬学的製剤。

(項目 44)

ヒトにおける吸収のための、オピオイドレセプターアゴニスト活性を有する 1 つ以上の化合物の放出を制御する方法であって、該方法は、1 つ以上の成分を含む薬学的製剤を投与する工程を包含し、ここで：

(a) 該 1 つ以上のオピオイド成分は、1 つ以上の放出プロファイルを有し；

(b) 該オピオイド成分の少なくとも 1 つは、オピオイドを含む制御放出オピオイド成分であり、該オピオイドは、オキシコドンまたはその塩であり；

該薬学的製剤は、反復投与後に約 4 . 5 ~ 約 8 時間という、オキシコドンまたはその塩の最高血漿中濃度到達時間 (T_{max}) を提供する、方法。

(項目 45)

ヒトにおける疼痛を処置する方法であって、1 つ以上の成分を含む薬学的製剤を投与する工程を包含し、ここで：

(a) 該 1 つ以上のオピオイド成分は、1 つ以上の放出プロファイルを有し；

(b) 該オピオイド成分の少なくとも 1 つは、オピオイドを含む制御放出オピオイド成分であり、該オピオイドは、オキシコドンまたはその塩であり；

該薬学的製剤は、反復投与後に約 4 . 5 ~ 約 8 時間という、オキシコドンまたはその塩の最高血漿中濃度到達時間 (T_{max}) を提供する、方法。