

【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22年4月22日 (2010.4.22)

【公表番号】特表2009-529046(P2009-529046A)

【公表日】平成21年8月13日 (2009.8.13)

【年通号数】公開・登録公報2009-032

【出願番号】特願2008-558328(P2008-558328)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/137 (2006.01)

A 6 1 P 25/30 (2006.01)

A 6 1 P 25/32 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/137

A 6 1 P 25/30

A 6 1 P 25/32

A 6 1 K 9/20

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 25/36

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/14

【手続補正書】

【提出日】平成22年3月2日 (2010.3.2)

【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】

薬物で治療されている間にエタノールを摂取しそうな患者にエタノール耐性徐放性製剤の形態にて有効量の薬物を提供することを含む、エタノール存在下における薬物の過量放出を予防するキットであって、エタノール耐性徐放性製剤が薬物と、少なくとも一つのヘテロ多糖類樹脂、少なくとも一つのホモ多糖類樹脂および少なくとも一つの医薬的希釈剤を含む徐放性送達系とを含み、エタノールの存在下においてその徐放性溶解プロファイルを本質的に保持する、キット。

【請求項 2】

薬物で治療されている間にエタノールを摂取しそうな患者にエタノール耐性徐放性製剤の形態にて有効量の薬物を提供することを含む、エタノール存在下における薬物の過量放出を予防するキットであって、エタノール耐性徐放性製剤が薬物と、少なくとも一つのヘ

テロ多糖類樹脂、一価金属カチオン、多価金属カチオンおよび塩から選択される少なくとも一つのカチオン性架橋化合物、および少なくとも一つの医薬的希釈剤を含む徐放性送達系とを含み、エタノールの存在下においてその徐放性溶解プロファイルを本質的に保持する、キット。

【請求項 3】

患者が物質乱用歴を有する、請求項 1 または 2 のいずれか記載のキット。

【請求項 4】

物質乱用がアルコール乱用である、請求項 1 または 2 のいずれか記載のキット。

【請求項 5】

物質乱用が薬物乱用である、請求項 1 または 2 のいずれか記載のキット。

【請求項 6】

エタノール耐性徐放性製剤が固形投与製剤である、請求項 1 または 2 のいずれか記載のキット。

【請求項 7】

固形投与製剤が圧搾または粉末化された場合にその溶解プロファイルを保持する、請求項 6 記載のキット。

【請求項 8】

固形投与製剤が流動体と接触して圧搾または粉末化された場合に粘膜接着性のあるゲルマトリックスを形成する、請求項 6 記載のキット。

【請求項 9】

固形投与製剤が流動体と接触して圧搾または粉末化された場合に粘性溶液を形成する、請求項 6 記載のキット。

【請求項 10】

固形投与製剤が錠剤である、請求項 6 記載のキット。

【請求項 11】

徐放性送達系がさらに少なくとも一つの疎水性ポリマーを 5 重量%未満の量にて含む、請求項 1 または 2 のいずれか記載のキット。

【請求項 12】

送達系がさらに一価カチオン、多価カチオンおよび塩から選択される少なくとも一つのカチオン性架橋化合物を含む、請求項 1 記載のキット。

【請求項 13】

少なくとも一つのカチオン性架橋化合物がナトリウム塩である、請求項 2 記載のキット。

【請求項 14】

薬物が抗鬱剤である、請求項 1 または 2 のいずれか記載のキット。

【請求項 15】

薬物が双極性障害、パニック障害、てんかん、片頭痛および / または注意欠陥過活動性障害を治療するのに用いられる薬物である、請求項 1 または 2 のいずれか記載のキット。

【請求項 16】

薬物がオピオイドである、請求項 1 または 2 のいずれか記載のキット。

【請求項 17】

オピオイドがミュー-アゴニストまたは混合ミュー-アゴニスト / アンタゴニストである、請求項 16 記載のキット。

【請求項 18】

オピオイドがアルフェンタニル、ア ril プロジン、アルファプロジン、アニレリジン、ベンジルモルフィン、ベジトラミド、ブプレノルフィン、ブトルファノール、クロニタゼン、コデイン、シクラゾシン、デソモルフィン、デキストロモラミド、デゾシン、ジアンプロミド、ジヒドロコデイン、ジヒドロモルフィン、ジメノキサドール、ジメフェブタノール、ジメチルチアンプテン、ジオキサフェチルブチレート、ジピパノン、エブタゾシン、エトヘブタジン、エチルメチルチアンプテン、エチルモルフィン、エトニタゼン、フェ

ンタニル、ヘロイン、ヒドロコドン、ヒドロモルフォン、ヒドロキシペチジン、イソメタドン、ケトベミドン、レバロルファン、レボルファノール、レボフェナシルモルファン、ロフェンタニル、メペリジン、メブタジノール、メタゾシン、メタドン、メトボン、モルフィン、ミロフィン、ナルブフィン、ナルセイン、ニコモルフィン、ノルレボルファノール、ノルメタドン、ナロルフィン、ノルモルフィン、ノルビパノン、オピウム、オキシコドン、オキシモルフォン、6-ヒドロキシオキシモルフォン、パパベレタム、ペンタゾシン、フェナドキソン、フェノモルファン、フェナゾシン、フェノペリジン、ピミノジン、ピリトラミド、プロフェブタジン、プロメドール、プロペリジン、プロピラム、プロボキシフェン、スフェンタニル、トラマドール、チリジン、その立体異性体、代謝体、塩、エーテル、エステルおよび誘導体からなる群から選択される、請求項 16 記載のキット。

【請求項 19】

物質乱用歴を有する患者に有効量の薬物をエタノール耐性徐放性製剤の形態にて提供するキットであって、エタノール耐性徐放性製剤が少なくとも一つの薬物と、少なくとも一つのヘテロ多糖類樹脂、少なくとも一つのホモ多糖類樹脂および少なくとも一つの医薬的希釈剤を含む徐放性送達系とを含み、エタノールの存在下においてその徐放性溶解プロファイルを実質的に保持する、キット。

【請求項 20】

物質乱用歴を有する患者に有効量の薬物をエタノール耐性徐放性製剤の形態にて提供するキットであって、エタノール耐性徐放性製剤が少なくとも一つの薬物と、少なくとも一つのヘテロ多糖類樹脂、一価金属カチオン、多価金属カチオンおよび塩から選択される少なくとも一つのカチオン性架橋化合物、および少なくとも一つの医薬的希釈剤を含む徐放性送達系とを含み、エタノールの存在下においてその徐放性溶解プロファイルを実質的に保持する、キット。

【請求項 21】

物質乱用がアルコール乱用である、請求項 19 または 20 のいずれか記載のキット。

【請求項 22】

物質乱用が薬物乱用である、請求項 19 または 20 のいずれか記載のキット。

【請求項 23】

エタノール耐性製剤が固形投与製剤である、請求項 19 または 20 のいずれか記載のキット。

【請求項 24】

固形投与製剤が圧搾または粉末化された場合にその溶解プロファイルを実質的に保持する、請求項 23 記載のキット。

【請求項 25】

固形投与製剤が流動体と接触して圧搾または粉末化された場合に粘膜接着性のあるゲルマトリックスを形成する、請求項 23 記載のキット。

【請求項 26】

固形投与製剤が流動体と接触して圧搾または粉末化された場合に粘性溶液を形成する、請求項 23 記載のキット。

【請求項 27】

固形投与製剤が錠剤である、請求項 23 記載のキット。

【請求項 28】

送達系がさらに少なくとも一つの疎水性ポリマーを 5 重量%未満の量にて含む、請求項 19 または 20 のいずれか記載のキット。

【請求項 29】

送達系がさらに一価カチオン、多価カチオンおよび塩から選択される、少なくとも一つのカチオン性架橋化合物を含む、請求項 20 記載のキット。

【請求項 30】

薬物が抗鬱剤である、請求項 19 または 20 のいずれか記載のキット。

【請求項 31】

薬物が双極性障害、パニック障害、てんかん、片頭痛および／または注意欠陥過活動性障害の治療用薬物である、請求項 19 または 20 のいずれか記載の キット。

【請求項 32】

薬物がオピオイドである、請求項 19 または 20 のいずれか記載の キット。

【請求項 33】

オピオイドがミュー-アゴニストまたは混合ミュー-アゴニスト／アンタゴニストである、請求項 32 記載の キット。

【請求項 34】

オピオイドがアルフェentanil、ア rilプロジン、アルファプロジン、アニレリジン、ベンジルモルフィン、ベジトラミド、ブプレノルフィン、ブトルファノール、クロニタゼン、コデイン、シクラゾシン、デソモルフィン、デキストロモラミド、デゾシン、ジアンプロミド、ジヒドロコデイン、ジヒドロモルフィン、ジメノキサドール、ジメフェブタノール、ジメチルチアンブテン、ジオキサフェチルブチレート、ジピバノン、エブタゾシン、エトヘブタジン、エチルメチルチアンブテン、エチルモルフィン、エトニタゼン、フェンタニル、ヘロイン、ヒドロコドン、ヒドロモルフォン、ヒドロキシペチジン、イソメタドン、ケトベミドン、レパロルファン、レボルファノール、レボフェナシルモルファン、ロフェンタニル、メペリジン、メブタジノール、メタゾシン、メタドン、メトボン、モルフィン、ミロフィン、ナルブフィン、ナルセイン、ニコモルフィン、ノルレボルファノール、ノルメタドン、ナロルフィン、ノルモルフィン、ノルピバノン、オビウム、オキシコドン、オキシモルフォン、6-ヒドロキシオキシモルフォン、パパベレタム、ペンタゾシン、フェナドキソン、フェノモルファン、フェナゾシン、フェノペリジン、ピミノジン、ピリトラミド、プロフェブタジン、プロメドール、プロペリジン、プロピラム、プロボキシフェン、スフェンタニル、トラマドール、チリジン、その立体異性体、代謝体、塩、エーテル、エステルおよび誘導体からなる群から選択される、請求項 32 記載の キット。

【請求項 35】

薬物で治療されている間にエタノールを摂取しそうな患者に改善された安全なエタノール耐性徐放性製剤の形態にて有効量の薬物を提供することを含む、従来の徐放性製剤と比較してエタノール存在下における薬物の安全性を改善する方法であって、改善された安全なエタノール耐性徐放性製剤が薬物と、少なくとも一つのヘテロ多糖類樹脂、少なくとも一つのホモ多糖類樹脂および少なくとも一つの医薬的希釈剤を含む 徐放性送達系 とを含み、改善された安全性が製剤のエタノール耐性徐放性特性の結果である、方法。

【請求項 36】

薬物で治療されている間にエタノールを摂取しそうな患者に改善された安全なエタノール耐性徐放性製剤の形態にて有効量の薬物を提供することを含む、従来の徐放性製剤と比較してエタノール存在下における薬物の安全性を改善する方法であって、改善された安全なエタノール耐性徐放性製剤が薬物と、少なくとも一つのヘテロ多糖類樹脂、一価金属カチオン、多価金属カチオンおよび塩から選択される少なくとも一つのカチオン性架橋化合物、および少なくとも一つの医薬的希釈剤を含む 徐放性送達系 とを含み、改善された安全性が製剤のエタノール耐性徐放性特性の結果である、方法。

【請求項 37】

患者が物質乱用歴を有する、請求項 35 または 36 のいずれか記載の方法。

【請求項 38】

物質乱用がアルコール乱用である、請求項 37 記載の方法。

【請求項 39】

物質乱用が薬物乱用である、請求項 37 記載の方法。

【請求項 40】

エタノール耐性徐放性製剤が固形投与製剤である、請求項 35 または 36 のいずれか記載の方法。

【請求項 41】

固形投与製剤が圧搾または粉末化された場合にその溶解プロファイルを保持する、請求

項 4 0 記載の方法。

【請求項 4 2】

固形投与製剤が流動体と接触して圧搾または粉末化された場合に粘膜接着性のあるゲルマトリックスを形成する、請求項 4 0 記載の方法。

【請求項 4 3】

固形投与製剤が流動体と接触して圧搾または粉末化された場合に粘性溶液を形成する、請求項 4 0 記載の方法。

【請求項 4 4】

固形投与製剤が錠剤である、請求項 4 0 記載の方法。

【請求項 4 5】

徐放性送達系がさらに少なくとも一つの疎水性ポリマーを 5 重量%未満の量にて含む、請求項 3 5 または 3 6 のいずれか記載の方法。

【請求項 4 6】

送達系がさらに一価カチオン、多価カチオンおよび塩から選択される、少なくとも一つのカチオン性架橋化合物を含む、請求項 3 5 記載の方法。

【請求項 4 7】

少なくとも一つのカチオン性架橋化合物がナトリウム塩である、請求項 3 6 記載の方法。

【請求項 4 8】

薬物が抗鬱剤である、請求項 3 5 または 3 6 のいずれか記載の方法。

【請求項 4 9】

薬物が双極性障害、パニック障害、てんかん、片頭痛および / または注意欠陥過活動性障害の治療用薬物である、請求項 3 5 または 3 6 のいずれか記載の方法。

【請求項 5 0】

薬物がオピオイドである、請求項 3 5 または 3 6 のいずれか記載の方法。

【請求項 5 1】

オピオイドがミュー-アゴニストまたは混合ミュー-アゴニスト / アンタゴニストである、請求項 5 0 記載の方法。

【請求項 5 2】

オピオイドがアルフェentanil、ア rilプロジン、アルファプロジン、アニレリジン、ベンジルモルフィン、ベジトラミド、ブプレノルフィン、ブトルファノール、クロニタゼン、コデイン、シクラゾシン、デソモルフィン、デキストロモラミド、デゾシン、ジアンプロミド、ジヒドロコデイン、ジヒドロモルフィン、ジメノキサドール、ジメフェブタノール、ジメチルチアンプテン、ジオキサフェチルブチレート、ジピバノン、エブタゾシン、エトヘブタジン、エチルメチルチアンプテン、エチルモルフィン、エトニタゼン、フェンタニル、ヘロイン、ヒドロコドン、ヒドロモルフォン、ヒドロキシペチジン、イソメタドン、ケトベミドン、レパロルファン、レボルファノール、レボフェナシルモルファン、ロフェンタニル、メペリジン、メブタジノール、メタゾシン、メタドン、メトボン、モルフィン、ミロフィン、ナルブフィン、ナルセイン、ニコモルフィン、ノルレボルファノール、ノルメタドン、ナロルフィン、ノルモルフィン、ノルピバノン、オピウム、オキシコドン、オキシモルフォン、6-ヒドロキシオキシモルフォン、パパベレタム、ペンタゾシン、フェナドキソン、フェノモルファン、フェナゾシン、フェノペリジン、ピミノジン、ピリトラミド、プロフェブタジン、プロメドール、プロペリジン、プロピラム、プロボキシフェン、スフェンタニル、トラマドール、チリジン、その立体異性体、代謝体、塩、エーテル、エステルおよび誘導体からなる群から選択される、請求項 5 0 記載の方法。

【請求項 5 3】

少なくとも一つの薬物と、少なくとも一つのヘテロ多糖類樹脂、少なくとも一つのホモ多糖類樹脂および少なくとも一つの医薬的希釈剤を含む徐放性送達系とを含む固形投与エタノール耐性徐放性製剤を製造する方法であって、少なくとも一つのヘテロ多糖類樹脂、少なくとも一つのホモ多糖類樹脂および少なくとも一つの医薬的希釈剤を混合して顆粒を

形成させ；該顆粒を少なくとも一つの薬物またはその医薬的に許容される塩と混合して粒状組成物を形成させ；該粒状組成物を加圧して製剤を製造し；エタノール含有溶液中のエタノール耐性製剤の溶解プロファイルを記録する、方法。

【請求項 5 4】

少なくとも一つの薬物と、少なくとも一つのヘテロ多糖類樹脂、一価金属カチオン、多価金属カチオンおよび塩から選択される少なくとも一つのカチオン性架橋化合物、および少なくとも一つの医薬的希釈剤を含む徐放性送達系とを含む固形投与エタノール耐性製剤を製造する方法であって、少なくとも一つのヘテロ多糖類樹脂、一価金属カチオン、多価金属カチオンおよび塩から選択される少なくとも一つのカチオン性架橋化合物、および少なくとも一つの医薬的希釈剤を混合して顆粒を形成させ；該顆粒を少なくとも一つの薬物またはその医薬的に許容される塩と混合して粒状組成物を形成させ；該粒状組成物を加圧して製剤を製造し；エタノール含有溶液中のエタノール耐性製剤の溶解プロファイルを記録する、方法。

【請求項 5 5】

さらに徐放性製剤の少なくとも一部に外部コーティングを塗布することを含む、請求項 5 3 または 5 4 のいずれか記載の方法。

【請求項 5 6】

少なくとも一つの薬物がオピオイドである、請求項 5 3 または 5 4 のいずれか記載の方法。

【請求項 5 7】

オピオイドがミュー-アゴニストまたは混合ミュー-アゴニスト/アンタゴニストである、請求項 5 6 記載の方法。

【請求項 5 8】

オピオイドがアルフェentanil、アリルプロジン、アルファプロジン、アニレリジン、ベンジルモルフィン、ベジトラミド、ブプレノルフィン、ブトルファノール、クロニタゼン、コデイン、シクラゾシン、デソモルフィン、デキストロモラミド、デゾシン、ジアンプロミド、ジヒドロコデイン、ジヒドロモルフィン、ジメノキサドール、ジメフェブタノール、ジメチルチアンブテン、ジオキサフェチルブチレート、ジピパノン、エブタゾシン、エトヘブタジン、エチルメチルチアンブテン、エチルモルフィン、エトニタゼン、フェンタニル、ヘロイン、ヒドロコドン、ヒドロモルフォン、ヒドロキシペチジン、イソメタドン、ケトベミドン、レパロルファン、レボルファノール、レボフェナシルモルファン、ロフェンタニル、メペリジン、メブタジノール、メタゾシン、メタドン、メトポン、モルフィン、ミロフィン、ナルブフィン、ナルセイン、ニコモルフィン、ノルレボルファノール、ノルメタドン、ナロルフィン、ノルモルフィン、ノルピパノン、オピウム、オキシコドン、オキシモルフォン、6-ヒドロキシオキシモルフォン、パバベレタム、ペンタゾシン、フェナドキソン、フェノモルファン、フェナゾシン、フェノペリジン、ピミノジン、ピリトラミド、プロフェブタジン、プロメドール、プロペリジン、プロピラム、プロボキシフェン、スフェンタニル、トラマドール、チリジン、その立体異性体、代謝体、塩、エーテル、エステルおよび誘導体からなる群から選択される、請求項 5 6 記載の方法。