

【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2月2日(2012.2.2)

【公表番号】特表2011-506337(P2011-506337A)

【公表日】平成23年3月3日(2011.3.3)

【年通号数】公開・登録公報2011-009

【出願番号】特願2010-537049(P2010-537049)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/137	(2006.01)
A 6 1 K	9/12	(2006.01)
A 6 1 K	9/48	(2006.01)
A 6 1 K	9/70	(2006.01)
A 6 1 K	9/14	(2006.01)
A 6 1 K	9/20	(2006.01)
A 6 1 P	37/08	(2006.01)
A 6 1 P	11/02	(2006.01)
A 6 1 K	9/10	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/137
A 6 1 K	9/12
A 6 1 K	9/48
A 6 1 K	9/70
A 6 1 K	9/14
A 6 1 K	9/20
A 6 1 P	37/08
A 6 1 P	11/02
A 6 1 K	9/10

【手続補正書】

【提出日】平成23年12月2日(2011.12.2)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0017

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0017】

本発明はまた、フェニレフリンまたはその薬剤学的に許容可能な塩を含む組成物の徐放のために、口腔粘膜への適用および接着に適応した、医薬品調合物を提供し、ここでその組成物は、液体または半固体の形態である。

本発明は、例えば以下の項目を提供する。

(項目1)

フェニレフリンまたは薬剤学的に許容可能なその塩を含む医薬品組成物であって、該組成物は、口腔粘膜に適用されるように調合されて、治療的に活性な形態のフェニレフリンの全身性吸収の増強を可能にする、組成物。

(項目2)

治療的に活性な形態のフェニレフリンの即時全身性吸収を可能にするように調合される、項目1に記載の組成物。

(項目3)

治療的に活性な形態のフェニレフリンの持続全身性吸収を可能にするように調合される、

項目 1 に記載の組成物。(項目 4 )

フェニレフリンまたは薬剤学的に許容可能なその塩の舌下全身性投与のために適切な医薬品組成物であって、該組成物は、口床からのフェニレフリンの全身性吸収を可能にする、組成物。

(項目 5 )

フェニレフリンの即時放出を提供するように調合される、項目 4 に記載の組成物。

(項目 6 )

フェニレフリンの持続放出を提供するように調合される、項目 4 に記載の組成物。

(項目 7 )

フェニレフリンまたは薬剤学的に許容可能なその塩の口腔全身性投与のために適切な医薬品組成物であって、該組成物は、頬側粘膜からのフェニレフリンの吸収を可能にする、組成物。

(項目 8 )

フェニレフリンの即時放出を提供するように調合される、項目 7 に記載の組成物。

(項目 9 )

フェニレフリンの持続放出を提供するように調合される、項目 7 に記載の組成物。

(項目 10 )

少なくとも 4 時間の期間にわたって、被験体において治療的に活性な形態のフェニレフリンの測定可能な血漿濃度を提供するように、フェニレフリンの放出を提供する、項目 1 に記載の組成物。

(項目 11 )

少なくとも 6 時間の期間にわたって、被験体において治療的に活性な形態のフェニレフリンの測定可能な血漿濃度を提供するように、フェニレフリンの放出を提供する、項目 1 に記載の組成物。

(項目 12 )

少なくとも 8 時間の期間にわたって、被験体において治療的に活性な形態のフェニレフリンの測定可能な血漿濃度を提供するように、フェニレフリンの放出を提供する、項目 1 に記載の組成物。

(項目 13 )

少なくとも 12 時間の期間にわたって、被験体において治療的に活性な形態のフェニレフリンの測定可能な血漿濃度を提供するように、フェニレフリンの放出を提供する、項目 1 に記載の組成物。

(項目 14 )

少なくとも 16 時間の期間にわたって、被験体において治療的に活性な形態のフェニレフリンの測定可能な血漿濃度を提供するように、フェニレフリンの放出を提供する、項目 1 に記載の組成物。

(項目 15 )

少なくとも 20 時間の期間にわたって、被験体において治療的に活性な形態のフェニレフリンの測定可能な血漿濃度を提供するように、フェニレフリンの放出を提供する、項目 1 に記載の組成物。

(項目 16 )

少なくとも 24 時間の期間にわたって、被験体において治療的に活性な形態のフェニレフリンの測定可能な血漿濃度を提供するように、フェニレフリンの放出を提供する、項目 1 に記載の組成物。

(項目 17 )

フェニレフリンを全身投与する方法であって、該方法は、口腔粘膜を、フェニレフリンまたは薬剤学的に許容可能なその塩を含む医薬品組成物と接触させる工程を含み、該組成物は、口腔粘膜へのフェニレフリンの放出を可能にする、方法。

(項目 18 )

水溶性基剤物質に分布したフェニレフリンを含む溶解性組成物であって、該組成物は、ヒトまたは動物被験体の口の粘膜への、フェニレフリンの口腔間投与のための細片として提供される、組成物。

(項目19)

前記基剤物質が、計りとった投与量のフェニレフリンのための送達システムとして働く細片として適合する担体を含む、項目18に記載の組成物。

(項目20)

前記細片は、該細片上に被覆されたフェニレフリンを含む、項目18に記載の組成物。

(項目21)

前記細片は、約20ミクロンから約250ミクロンの厚さを有する可撓性フィルムを含む、項目18に記載の組成物。

(項目22)

前記細片の担体または前記細片の基剤物質が、可溶性ゲル状物質を含む、項目18に記載の組成物。

(項目23)

前記フェニレフリンまたは薬剤学的に許容可能なその塩の一部または全てが、カプセル化構造の中にカプセル化される、項目1に記載の組成物。

(項目24)

前記カプセル化構造は、口腔の粘膜へ接着するように選択される、項目23に記載の組成物。

(項目25)

前記カプセル化構造は、前記フェニレフリンまたは薬剤学的に許容可能なその塩を経時にゆっくり放出するように選択される、項目1に記載の組成物。

(項目26)

前記カプセル化構造は、多層状微粒子を含む、項目23に記載の組成物。

(項目27)

非生体接着性裏打ち層、生体接着性層、およびフェニレフリンまたは薬剤学的に許容可能なその塩を含む組成物を含む、生体分解性、水溶性担体デバイスであって、該生体接着性層は、哺乳動物の粘膜表面に接着するよう調合され、そして該組成物の持続性送達を提供する、担体デバイス。

(項目28)

前記組成物はさらに、哺乳動物の粘膜表面への投与に適切な液体担体を含む、項目27に記載の担体デバイス。

(項目29)

前記液体担体は、酢酸、アセトン、アニソール、1-ブタノール、2-ブタノール、酢酸ブチル、tert-ブチルメチルエーテル、クメン、ジメチルスルホキシド、エタノール、酢酸エチル、エチルエーテル、メタノール、ギ酸エチル、ギ酸、ヘプタン、酢酸イソブチル、酢酸イソプロピル、酢酸メチル、3-メチル-1-ブタノール、メチルエチルケトン、メチルイソブチルケトン、2-メチル-1-プロパノール、ペンタン、1-ペンタノール、1-プロパノール、2-プロパノール、酢酸プロピル、またはテトラヒドロフランを含む、項目28に記載の担体デバイス。

(項目30)

前記組成物が、ポリマー性または非ポリマー性の親水性薬剤を含む、項目27に記載の担体デバイス。

(項目31)

前記親水性薬剤が、ポリエチレングリコールを含む、項目30に記載の担体デバイス。

(項目32)

前記生体接着性層は、水溶性である、項目27に記載の担体デバイス。

(項目33)

前記生体接着性層は、水溶性ポリマーを形成するフィルムを含む、項目27に記載の担体

デバイス。

(項目34)

前記生体接着性層は、生体接着性ポリマーを含む、項目27に記載の担体デバイス。

(項目35)

前記生体接着性層の水溶性ポリマーを形成するフィルムは、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、ヒドロキシエチルメチルセルロース、またはそれらの組合せを含む、項目33に記載の担体デバイス。

(項目36)

前記生体接着性層の水溶性ポリマーを形成するフィルムは、架橋されるか、または可塑化されている、項目33に記載の担体デバイス。

(項目37)

前記生体接着性層の生体接着性ポリマーは、ポリアクリル酸、カルボキシメチルセルロースナトリウムまたはポリビニルピロリドン、あるいはそれらの組み合わせを含む、項目34に記載の担体デバイス。

(項目38)

前記ポリアクリル酸は、部分的に架橋される、項目37に記載の担体デバイス。

(項目39)

前記非生体接着性裏打ち層は、薬剤学的に許容可能な、フィルムを形成する水溶性ポリマーを含む、項目27に記載の担体デバイス。

(項目40)

前記薬剤学的に許容可能な、フィルムを形成する水溶性ポリマーは、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、ヒドロキシエチルメチルセルロース、ポリビニルアルコール、ポリエチレングリコール、ポリエチレンオキシド、エチレンオキシド-プロピレンオキシドコポリマー、またはそれらの組み合わせを含む、項目39に記載の担体デバイス。

(項目41)

基剤中に多層微粒子の分布を含む、頬側または舌下に適用するための組成物であって、ここでフェニレフリンまたは薬剤学的に許容可能なその塩は、微粒子の層に吸着され、その結果、頬側または舌下の粘膜に、経間的に徐々に放出される、組成物。

(項目42)

スプレー、ムース、または水薬の手段による適用のための形態の、項目41に記載の組成物。

(項目43)

可溶性の固体基剤またはゲル基剤中の多層微粒子の分布を含み、該基剤物質は口内で溶解し、そして該微粒子を放出して、該微粒子の口腔粘膜との接触を可能にするよう調合される、項目41に記載の組成物。

(項目44)

前期多層微粒子が、口腔粘膜への良好な接着を示すように選択される、項目41に記載の組成物。

(項目45)

前記多層微粒子は、0.1ミクロン～10ミクロンの範囲である、項目41に記載の組成物。

(項目46)

前記多層微粒子は、エアロゾルスプレーを含む、項目41に記載の組成物。

(項目47)

前記微粒子は、陽性の表面電荷を有する極性構造を一般的に含む、項目41に記載の組成物。

(項目48)

抗ヒスタミン薬、抗菌剤、抗炎症剤、および鎮痛薬化合物からなる群から選択されるさらなる活性成分をさらに含む、項目1に記載の組成物。

(項目49)

前記抗ヒスタミン薬は、ジフェンヒドラミン、クロルフェニラミン、トリペレナミン、プロメタジン、クレマスチン、ドキシラミン、アステミゾール、テルフェナジン、ロラタジン、デスロラタジン、シメチジン(cimetidine)、ファモチジン、ニザチジン、ラニチジン、クロモリン、およびそれらの組合せからなる群から選択される、項目48に記載の組成物。

(項目50)

1つまたはそれを超える潤滑剤および/または湿潤油を含む、項目1に記載の組成物。

(項目51)

前記潤滑剤および/または湿潤油は、ヒアルロン酸またはヒアルロン酸ナトリウム(sodium hyaluronique)、グリセロール、キンセンカの花の抽出物、またはグリセリン抽出物、グアーヒドロキシプロピルトリモニウム塩化物、キサンタンゴム、セルロースゴム、塩化ナトリウム、オリーブ油、ヒマワリ油、アーモンド油、ゴマ油、アロエベラ、バルバドスアロエ、およびその組み合わせからなる群から選択される、項目50に記載の組成物。

(項目52)

フェニレフリンまたは薬剤学的に許容可能なその塩を含む組成物の口腔への迅速な放出のための口腔での舌下適用のために適応した薬剤送達デバイスであって、該デバイスは、該デバイス中に分布した組成物を有する本体を含み、そして舌下適用に適したサイズおよび形を有する、デバイス。

(項目53)

前記本体は、錠剤、ソフトゲル、カプセル、または即時溶解フィルムの形態である、項目52に記載のデバイス。

(項目54)

前記錠剤は、即時溶解錠剤または即時融解錠剤である、項目53に記載のデバイス。

(項目55)

フェニレフリンまたは薬剤学的に許容可能なその塩を含む組成物の口腔粘膜上での徐放のために、口腔粘膜への適用および接着に適応した、医薬品調合物であって、該組成物は、液体または半固体の形態である、医薬品調合物。

(項目56)

前記液体または半固体は、口腔粘膜への適用後に凝結する、項目55に記載の医薬品調合物。

**【手続補正2】**

【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】

フェニレフリンまたは薬剤学的に許容可能なその塩を含む医薬品組成物であって、該組成物は、口腔粘膜に適用されるように調合されて、治療的に活性な形態のフェニレフリンの全身性吸収の増強を可能にする、組成物。

【請求項2】

治療的に活性な形態のフェニレフリンの即時全身性吸収を可能にするように調合される、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

治療的に活性な形態のフェニレフリンの持続全身性吸収を可能にするように調合される、請求項1に記載の組成物。

**【請求項 4】**

フェニレフリンまたは薬剤学的に許容可能なその塩の舌下全身性投与のために適切な医薬品組成物であって、該組成物は、口腔からのフェニレフリンの全身性吸収を可能にする、組成物。

**【請求項 5】**

フェニレフリンの即時放出を提供するように調合される、請求項 4 に記載の組成物。

**【請求項 6】**

フェニレフリンの持続放出を提供するように調合される、請求項 4 に記載の組成物。

**【請求項 7】**

フェニレフリンまたは薬剤学的に許容可能なその塩の口腔全身性投与のために適切な医薬品組成物であって、該組成物は、頬側粘膜からのフェニレフリンの吸収を可能にする、組成物。

**【請求項 8】**

フェニレフリンの即時放出を提供するように調合される、請求項 7 に記載の組成物。

**【請求項 9】**

フェニレフリンの持続放出を提供するように調合される、請求項 7 に記載の組成物。

**【請求項 10】**

少なくとも 4 時間の期間にわたって、被験体において治療的に活性な形態のフェニレフリンの測定可能な血漿濃度を提供するように、フェニレフリンの放出を提供する、請求項 1 に記載の組成物。

**【請求項 11】**

少なくとも 6 時間の期間にわたって、被験体において治療的に活性な形態のフェニレフリンの測定可能な血漿濃度を提供するように、フェニレフリンの放出を提供する、請求項 1 に記載の組成物。

**【請求項 12】**

少なくとも 8 時間の期間にわたって、被験体において治療的に活性な形態のフェニレフリンの測定可能な血漿濃度を提供するように、フェニレフリンの放出を提供する、請求項 1 に記載の組成物。

**【請求項 13】**

少なくとも 12 時間の期間にわたって、被験体において治療的に活性な形態のフェニレフリンの測定可能な血漿濃度を提供するように、フェニレフリンの放出を提供する、請求項 1 に記載の組成物。

**【請求項 14】**

少なくとも 16 時間の期間にわたって、被験体において治療的に活性な形態のフェニレフリンの測定可能な血漿濃度を提供するように、フェニレフリンの放出を提供する、請求項 1 に記載の組成物。

**【請求項 15】**

少なくとも 20 時間の期間にわたって、被験体において治療的に活性な形態のフェニレフリンの測定可能な血漿濃度を提供するように、フェニレフリンの放出を提供する、請求項 1 に記載の組成物。

**【請求項 16】**

少なくとも 24 時間の期間にわたって、被験体において治療的に活性な形態のフェニレフリンの測定可能な血漿濃度を提供するように、フェニレフリンの放出を提供する、請求項 1 に記載の組成物。

**【請求項 17】**

前記フェニレフリンまたは薬剤学的に許容可能なその塩の一部または全てが、カプセル化構造の中にカプセル化される、請求項 1 に記載の組成物。

**【請求項 18】**

前記カプセル化構造は、口腔の粘膜へ接着するように選択される、請求項 17 に記載の組成物。

**【請求項 19】**

前記カプセル化構造は、前記フェニレフリンまたは薬剤学的に許容可能なその塩を経時にゆっくり放出するように選択される、請求項1に記載の組成物。

**【請求項 20】**

前記カプセル化構造は、多層状微粒子を含む、請求項1\_7に記載の組成物。

**【請求項 21】**

抗ヒスタミン薬、抗菌剤、抗炎症剤、および鎮痛薬化合物からなる群から選択されるさらなる活性成分をさらに含む、請求項1に記載の組成物。

**【請求項 22】**

前記抗ヒスタミン薬は、ジフェンヒドラミン、クロルフェニラミン、トリペレナミン、プロメタジン、クレマスチン、ドキシラミン、アステミゾール、テルフェナジン、ロラタジン、デスロラタジン、シメチジン(*c i m e t a d i n e*)、ファモチジン、ニザチジン、ラニチジン、クロモリン、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2\_1に記載の組成物。

**【請求項 23】**

1つまたはそれを超える潤滑剤および／または湿潤油を含む、請求項1に記載の組成物。

**【請求項 24】**

前記潤滑剤および／または湿潤油は、ヒアルロン酸またはヒアルロン酸ナトリウム(*sodium hyaluronique*)、グリセロール、キンセンカの花の抽出物、またはグリセリン抽出物、グアーヒドロキシプロピルトリモニウム塩化物、キサンタンゴム、セルロースゴム、塩化ナトリウム、オリーブ油、ヒマワリ油、アーモンド油、ゴマ油、アロエベラ、バルバドスアロエ、およびその組み合わせからなる群から選択される、請求項2\_3に記載の組成物。