

【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27年3月19日 (2015.3.19)

【公表番号】特表2014-506914(P2014-506914A)

【公表日】平成26年3月20日 (2014.3.20)

【年通号数】公開・登録公報2014-015

【出願番号】特願2013-555938(P2013-555938)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/05 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/46 (2006.01)

A 6 1 K 47/28 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/70 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/05

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/46

A 6 1 K 47/28

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/70

A 6 1 K 9/08

【手続補正書】

【提出日】平成27年1月30日 (2015.1.30)

【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】

有効量の医薬活性剤と、HLBが8～16の吸収促進剤とを含む水溶性マトリックスを含む医薬組成物であって、医薬活性剤が、ジエチルスチルベストロール及び医薬的に許容

可能なジエチルスチルベストロールの塩からなる群より選択される、医薬組成物。

【請求項 2】

(a) 口腔内で 0.25 分 ~ 15 分で溶解する、及び / 又は、(b) ジエチルスチルベストロールが 0.1 mg ~ 5 mg の量で存在する、及び / 又は、(c) 前記マトリックスが、1 種の吸収促進剤、又は、複数種の吸収促進剤の組み合わせを、マトリックスの重量に対して 0.1 重量 % ~ 20 重量 % の合計量で含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

医薬活性剤が、患者の前立腺又は乳癌を治療するための剤であり、前立腺又は乳癌を治療するのに有効な量で存在する、請求項 1 又は 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

吸収促進剤が、1 又は 2 以上のショ糖脂肪酸エステルを含み、その組み合わせの HLB が 8 ~ 16 である、請求項 1 ~ 3 の何れか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

(a) ショ糖脂肪酸エステルが、モノマー含量が 20 % ~ 80 % のショ糖脂肪酸エステルである、及び / 又は、(b) ショ糖脂肪酸エステルが、C12 ~ C20 の飽和脂肪酸とショ糖とのエステルである、及び / 又は、(c) ショ糖脂肪酸エステルが、ステアリン酸スクロース、パルミチン酸スクロース、ラウリン酸スクロース、ベヘン酸スクロース、オレイン酸スクロース、及びエルカ酸スクロースからなる群より選択される、請求項 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

更に非イオン性界面活性剤を含み、非イオン性界面活性剤とショ糖脂肪酸エステルとの組み合わせの HLB が 8 ~ 17 である、請求項 1 ~ 5 の何れか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

非イオン性界面活性剤が、ポリソルベート及びソルビタン脂肪酸エステルのうち少なくとも 1 種又は 2 種以上である、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

(a) ポリソルベートが、ポリオキシエチレン(20)ソルビタンモノラウレート、ポリオキシエチレン(20)ソルビタンモノパルミテート、ポリオキシエチレン(20)ソルビタン及びポリオキシエチレン(20)ソルビタンモノオレエートからなる群より選択される、及び / 又は、(b) ソルビタン脂肪酸エステルが、ソルビタンモノラウレート、ソルビタンモノパルミテート、ソルビタンモノステアレート、ソルビタントリスステアレート及びソルビタンモノオレエートからなる群より選択される、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

グリセロール、ジンジャー油、シネオール及びテルペンからなる群より選択される第二の吸収促進剤を更に含む、請求項 1 ~ 8 の何れか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

プルラン及びポリビニルピロリドンとアルギン酸ポリマー(polymeric alginate)とのポリマー混合物から選択されるフィルム形成剤を更に含む、請求項 1 ~ 9 の何れか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

(a) フィルム形成剤がプルランである、及び / 又は、(b) ポリマー混合物におけるポリビニルピロリドンのアルギン酸ポリマーに対する比率が、5 : 1 ~ 1 : 3 である、及び / 又は、(c) ポリマー混合物が、何れもポリマー混合物の重量を基準として、5 % ~ 95 重量のポリビニルピロリドンと、5 % ~ 95 重量 % のアルギン酸ポリマーとを含む、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

マトリックスがフィルムである、請求項 1 ~ 11 の何れか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

ポリビニルピロリドンとアルギン酸ポリマーとのポリマー混合物を更に含む、請求項 1

2 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 4】

( a ) フィルムが口腔内で  $0.25$  分 ~  $5$  分で溶解する、及び / 又は、( b ) フィルムの厚さが  $0.01$  mm ~  $5$  mm である、及び / 又は、( c ) フィルムの表面積が  $0.25$  cm<sup>2</sup> ~  $20$  cm<sup>2</sup> であり、重さが  $1$  mg ~  $200$  mg である、及び / 又は、( d ) フィルムの表面積が  $1$  cm<sup>2</sup> ~  $10$  cm<sup>2</sup> であり、重さが  $10$  mg ~  $200$  mg である、及び / 又は、( e ) フィルムが 1 又は 2 以上の吸収促進剤を、フィルムに対して  $0.1$  重量% ~  $20$  重量% 含む、及び / 又は、( f ) フィルムが吸収促進剤を、フィルムに対して  $1$  重量% ~  $10$  重量% 含む、請求項 1 2 又は 1 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

マトリックスが錠剤である、請求項 1 ~ 1 4 の何れか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 6】

( a ) 錠剤が口腔内で  $0.25$  分 ~  $15$  分で溶解する、及び / 又は、錠剤が吸収促進剤を、錠剤に対し  $0.1$  重量% ~  $20$  重量% 含む、請求項 1 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 7】

マトリックスが液体である、請求項 1 ~ 1 6 の何れか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

前記液体が吸収促進剤を、前記液体に対し  $0.1$  重量% ~  $10$  重量% 含む、請求項 1 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 9】

患者の前立腺又は乳癌を治療するための薬剤の製造における、ジエチルスチルベストロール及び医薬的に許容可能なジエチルスチルベストロールの塩の使用であって、経口単位剤形を水溶性マトリックスの形態で、患者口腔の口腔粘膜に投与することを含み、ここでマトリックスが、ジエチルスチルベストロール及び医薬的に許容可能なジエチルスチルベストロールの塩を、マトリックスに分散された状態で含み、ジエチルスチルベストロール及び医薬的に許容可能なジエチルスチルベストロールの塩が、前記マトリックス内に、前記前立腺又は乳癌の治療に有効な量で存在し、前記マトリックスが、HLB が  $8 \sim 16$  の 1 又は 2 以上のショ糖脂肪酸エステルから構成される、使用。

【請求項 2 0】

ポリビニルピロリドンとアルギン酸ポリマーとのポリマー混合物を更に含む、請求項 1 9 に記載の使用。

【請求項 2 1】

( a ) ポリマー混合物におけるポリビニルピロリドンのアルギン酸ポリマーに対する比率が、 $5 : 1 \sim 1 : 3$  である、及び / 又は、( b ) ポリマー混合物が、何れもポリマー混合物の重量を基準として、 $5\% \sim 95$  重量% のポリビニルピロリドンと、 $5\% \sim 95$  重量% のアルギン酸ポリマーとを含む、請求項 2 0 に記載の使用。

【請求項 2 2】

( a ) ジエチルスチルベストロール及び医薬的に許容可能なジエチルスチルベストロールの塩が、 $0.1 \sim 5$  mg の量で存在する、及び / 又は、( b ) 前記マトリックスが患者の舌下に投与される、及び / 又は、( c ) 前記マトリックスが患者口腔の頬内組織に挿入される、請求項 1 9 ~ 2 1 の何れか一項に記載の使用。

【請求項 2 3】

( a ) ショ糖脂肪酸エステルのモノマー含量が  $20\% \sim 80\%$  である、及び / 又は、( b ) ショ糖脂肪酸エステルが、ステアリン酸スクロース、パルミチン酸スクロース、ラウリン酸スクロース、ベヘン酸スクロース、オレイン酸スクロース及びエルカ酸スクロースからなる群より選択される、請求項 1 9 ~ 2 2 の何れか一項に記載の使用。

【請求項 2 4】

吸収促進剤が、フィルムの重量を基準として、 $1\% \sim 20\%$  の量で存在する、請求項 1 9 ~ 2 3 の何れか一項に記載の使用。

【請求項 2 5】

( a ) 非イオン性界面活性剤を更に含み、非イオン性界面活性剤とショ糖脂肪酸エステルとの組み合わせの H L B が、8 ~ 17である、及び / 又は、( b ) グリセロール、トゥイーン ( tween )、スパン ( span )、ジンジャー油、シネオール及びテルペンからなる群より選択される第二の吸収促進剤を更に含む、請求項 19 ~ 24 の何れか一項に記載の使用。

【請求項 26】

マトリックスがフィルムである、請求項 19 ~ 25 の何れか一項に記載の使用。

【請求項 27】

活性剤が 0 . 25 分 ~ 15 分 の期間に亘って放出される、請求項 19 ~ 26 の何れか一項に記載の使用。

【請求項 28】

活性剤が 0 . 5 分 ~ 10 分 の期間に亘って放出される、請求項 27 に記載の使用。