

【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25年5月23日(2013.5.23)

【公表番号】特表2011-525536(P2011-525536A)

【公表日】平成23年9月22日(2011.9.22)

【年通号数】公開・登録公報2011-038

【出願番号】特願2011-516543(P2011-516543)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4535 (2006.01)

A 6 1 K 9/70 (2006.01)

A 6 1 K 9/50 (2006.01)

A 6 1 K 31/485 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/36 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/4535

A 6 1 K 9/70

A 6 1 K 9/50

A 6 1 K 31/485

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/36

【手続補正書】

【提出日】平成25年3月21日(2013.3.21)

【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】

活性剤を対象へ経粘膜的に送達する方法における使用のための柔軟な薬学的送達装置であって、

該薬学的送達装置が、

活性剤の経粘膜送達のための第1の粘膜付着表面、

活性剤の経粘膜送達のための、第1の粘膜付着表面と向かい合う第2の粘膜付着表面、および

装置中に組み入れられた活性剤およびアンタゴニストを含み；

第1および第2の粘膜付着表面が1つの単一の柔軟な粘膜付着薄膜層により規定され；活性剤がオピオイドであり；有効量の活性剤が対象へ送達され；かつ装置の厚さが約0.005 mm～約3 mmの範囲に渡る、前記薬学的送達装置。

【請求項2】

生体侵食性である、請求項1記載の装置。

【請求項3】

送達装置が粘膜腔(mucosal cavity)の少なくとも2つの表面に付着し、かつ活性剤が第1の粘膜付着表面および第2の粘膜付着表面を横切って拡散するように、対象の粘膜腔へ適用することにより対象に投与される、請求項1記載の装置。

## 【請求項 4】

有効量の活性剤が約1時間未満で対象に送達される、請求項3記載の装置。

## 【請求項 5】

有効量の活性剤が約30分未満で対象に送達される、請求項3記載の装置。

## 【請求項 6】

対象が有意な悪心を経験しない、請求項1記載の装置。

## 【請求項 7】

約0.1 mg ~ 約60 mgのブプレノルフィンを含有する、請求項1 ~ 6のいずれか一項記載の装置。

## 【請求項 8】

$T_{max}$  が約100分未満である、請求項7記載の装置。

## 【請求項 9】

$T_{max}$  が約80分未満である、請求項7記載の装置。

## 【請求項 10】

$T_{max}$  が約60分未満である、請求項7記載の装置。

## 【請求項 11】

$T_{max}$  が約30分未満である、請求項7記載の装置。

## 【請求項 12】

$T_{max}$  が約20分未満である、請求項7記載の装置。

## 【請求項 13】

30%を超えるブプレノルフィンが生物学的に利用可能になる、請求項7記載の装置。

## 【請求項 14】

50%を超えるブプレノルフィンが生物学的に利用可能になる、請求項7記載の装置。

## 【請求項 15】

60%を超えるブプレノルフィンが生物学的に利用可能になる、請求項7記載の装置。

## 【請求項 16】

嗜癮の処置に適応している、前記請求項のいずれか一項記載の装置。

## 【請求項 17】

疼痛の処置に適応している、前記請求項のいずれか一項記載の装置。

## 【請求項 18】

疼痛が癌性突出痛である、請求項17記載の装置。

## 【請求項 19】

有効量の活性剤が1つの単位用量において対象に送達される、前記請求項のいずれか一項記載の装置。

## 【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0022

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0022】

ある特定の態様において、上記の方法は、有効量の活性剤を1つの単位用量において対象へ送達する。

[本発明1001]

薄くかつ柔軟な薬学的送達装置を、活性剤を必要とする対象へ投与する段階を含む、活性剤をそれを必要とする対象へ経粘膜的に送達する方法であって、該薬学的送達装置が、

活性剤の経粘膜送達のための第1の粘膜付着表面、

活性剤の経粘膜送達のための、第1の粘膜付着表面と向かい合う第2の粘膜付着表面、および

装置中に組み入れられた活性剤

を含み；

第1および第2の粘膜付着表面が少なくとも1つの薄くかつ柔軟な粘膜付着薄膜層により規定され；かつ

有効量の活性剤が対象へ送達される、方法。

[本発明1002]

装置が生体侵食性である、本発明1001の方法。

[本発明1003]

第1および第2の粘膜付着表面が単一の粘膜付着層により規定される、本発明1001の方法。

[本発明1004]

第1および第2の粘膜付着表面が、少なくとも第1および第2の薄くかつ柔軟な粘膜付着薄膜層により規定される、本発明1001の方法。

[本発明1005]

装置が、2つの粘膜接着表面の間に配置された中間層をさらに含む、本発明1004の方法。

[本発明1006]

中間層が、乱用防止マトリックス、および経粘膜的には実質的に利用不可能であるように乱用防止マトリックスに付随しているアンタゴニストを含む、本発明1005の方法。

[本発明1007]

中間層がマイクロカプセル化されたアンタゴニストを含む、本発明1005の方法。

[本発明1008]

粘膜付着層がマイクロカプセル化されたアンタゴニストを含む、本発明1001の方法。

[本発明1009]

中間層が活性剤に対して閉塞性である、本発明1004の方法。

[本発明1010]

活性剤が、第1の粘膜付着層および第2の粘膜付着層の中に組み入れられる、本発明1004の方法。

[本発明1011]

活性剤が乱用性薬物である、本発明1001の方法。

[本発明1012]

活性剤がオピオイドである、前記本発明のいずれかの方法。

[本発明1013]

活性剤がブプレノルフィンである、本発明1012の方法。

[本発明1014]

活性剤がフェンタニルである、本発明1012の方法。

[本発明1015]

アンタゴニストがナロキソンである、本発明1006の方法。

[本発明1016]

活性剤が2つ以上の粘膜表面へ経粘膜的に送達される、本発明1001の方法。

[本発明1017]

送達装置が粘膜腔 (mucosal cavity) の少なくとも2つの表面に付着し、かつ活性剤が第1の粘膜付着表面および第2の粘膜付着表面を横切って拡散するように、対象の粘膜腔へ装置を適用することにより、装置が対象に投与される、本発明1001の方法。

[本発明1018]

有効量の活性剤が約1時間未満で対象に送達される、本発明1017の方法。

[本発明1019]

有効量の活性剤が約30分未満で対象に送達される、本発明1017の方法。

[本発明1020]

対象が有意な悪心を経験しない、本発明1001または1006の方法。

[ 本 発 明1021]

疼痛緩和の開始が約15分未満で達成される、本発明1014の方法。

[ 本 発 明1022]

$T_{max}$  が約1.5時間未満である、本発明1014の方法。

[ 本 発 明1023]

$T_{max}$  が約1時間未満である、本発明1014の方法。

[ 本 発 明1024]

$T_{max}$  が約0.5時間未満である、本発明1014の方法。

[ 本 発 明1025]

$T_{max}$  が約0.25時間未満である、本発明1014の方法。

[ 本 発 明1026]

装置が約800  $\mu$ gのフェンタニルを含む、本発明1014の方法。

[ 本 発 明1027]

$C_{max}$  が約2 ng/mLを上回る、本発明1026の方法。

[ 本 発 明1028]

$C_{max}$  が約3 ng/mLを上回る、本発明1026の方法。

[ 本 発 明1029]

$C_{max}$  が約4 ng/mLを上回る、本発明1026の方法。

[ 本 発 明1030]

約30%を超えるフェンタニルが生物学的に利用可能になる、本発明1026の方法。

[ 本 発 明1031]

約60%を超えるフェンタニルが生物学的に利用可能になる、本発明1026の方法。

[ 本 発 明1032]

約70%を超えるフェンタニルが生物学的に利用可能になる、本発明1026の方法。

[ 本 発 明1033]

装置が約0.1 mg ~ 約60 mgのブプレノルフィンを含有する、本発明1013の方法。

[ 本 発 明1034]

$T_{max}$  が約100分未満である、本発明1033の方法。

[ 本 発 明1035]

$T_{max}$  が約80分未満である、本発明1033の方法。

[ 本 発 明1036]

$T_{max}$  が約60分未満である、本発明1033の方法。

[ 本 発 明1037]

$T_{max}$  が約30分未満である、本発明1033の方法。

[ 本 発 明1038]

$T_{max}$  が約20分未満である、本発明1033の方法。

[ 本 発 明1039]

30%を超えるブプレノルフィンが生物学的に利用可能になる、本発明1033の方法。

[ 本 発 明1040]

50%を超えるブプレノルフィンが生物学的に利用可能になる、本発明1033の方法。

[ 本 発 明1041]

60%を超えるブプレノルフィンが生物学的に利用可能になる、本発明1033の方法。

[ 本 発 明1042]

前記本発明のいずれかの方法を含む、嗜癮を処置する方法。

[ 本 発 明1043]

前記本発明のいずれかの方法のいずれかにより活性剤を対象に投与する段階を含む、疼痛を処置する方法。

[ 本 発 明1044]

疼痛が癌性突出痛である、本発明1043の方法。

[ 本 発 明1045]

有効量の活性剤が1つの単位用量において対象に送達される、前記本発明のいずれかの方法。