

【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20年6月19日 (2008.6.19)

【公表番号】特表2004-515455(P2004-515455A)

【公表日】平成16年5月27日 (2004.5.27)

【年通号数】公開・登録公報2004-020

【出願番号】特願2001-581910(P2001-581910)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/16 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 K 31/137 (2006.01)

A 6 1 K 31/167 (2006.01)

A 6 1 K 31/4355 (2006.01)

A 6 1 K 31/451 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 31/56 (2006.01)

A 6 1 K 47/42 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 31/137

A 6 1 K 31/167

A 6 1 K 31/4355

A 6 1 K 31/451

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/56

A 6 1 K 47/42

A 6 1 P 25/00 1 0 1

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 29/00

【手続補正書】

【提出日】平成20年4月24日 (2008.4.24)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 約 0 . 0 0 0 1 m g ~ 約 1 m g または 1 m g 未満の量でオピオイドア

ンタゴニストを含む投薬形態。

【請求項 2】 前記アンタゴニストの量が、約 1 mg である、請求項 1 に記載の投薬形態。

【請求項 3】 前記アンタゴニストの量が、1 mg 未満である、請求項 1 に記載の投薬形態。

【請求項 4】 前記アンタゴニストの量が、約 0.5 mg 未満である、請求項 1 に記載の投薬形態。

【請求項 5】 前記アンタゴニストの量が、約 0.1 mg である、請求項 1 または 4 に記載の投薬形態。

【請求項 6】 前記アンタゴニストの量が、0.1 mg 未満である、請求項 1 または 4 に記載の投薬形態。

【請求項 7】 前記アンタゴニストの量が、0.1 mg より多い、請求項 1 または 4 に記載の投薬形態。

【請求項 8】 前記アンタゴニストの量が、約 0.01 mg である、請求項 1 または 4 に記載の投薬形態。

【請求項 9】 前記アンタゴニストの量が、0.01 mg 未満である、請求項 1 または 4 に記載の投薬形態。

【請求項 10】 前記アンタゴニストの量が、0.01 mg より多い、請求項 1 または 4 に記載の投薬形態。

【請求項 11】 前記アンタゴニストの量が、約 0.001 mg である、請求項 1 または 4 に記載の投薬形態。

【請求項 12】 前記アンタゴニストの量が、0.001 mg 未満である、請求項 1 または 4 に記載の投薬形態。

【請求項 13】 前記アンタゴニストの量が、0.001 mg より多い、請求項 1 または 4 に記載の投薬形態。

【請求項 14】 前記アンタゴニストの量が、約 0.0001 mg である、請求項 1 または 4 に記載の投薬形態。

【請求項 15】 前記アンタゴニストの量が、0.0001 mg より多い、請求項 1 または 4 に記載の投薬形態。

【請求項 16】 前記アンタゴニストが、薬学的に受容可能な塩として存在する、請求項 1 または 4 に記載の投薬形態。

【請求項 17】 前記アンタゴニストが、ナルトレキソン、ナルメフェン、またはナロキソンである、請求項 1 または 4 に記載の投薬形態。

【請求項 18】 さらにオピオイドアゴニストを含む、請求項 1 または 4 に記載の投薬形態。

【請求項 19】 前記アゴニストが、鎮痛量または鎮痛量未満である、請求項 18 に記載の投薬形態。

【請求項 20】 前記アゴニストが、モルフィン、ヒドロコドン、オキシコドン、コデイン、フェンタニル、アルフェンタニール、ヒドロモルフォン、メペリジン、メタドン、オキシモルフォン、プロボキシフェン、またはトラマドールである、請求項 18 に記載の投薬形態。

【請求項 21】 前記アゴニストが、モルフィン、ヒドロコドン、オキシコドン、またはトラマドールである、請求項 18 に記載の投薬形態。

【請求項 22】 前記アンタゴニストが、カプセル、錠剤、または丸剤として処方されている、請求項 1 または 4 に記載の投薬形態。

【請求項 23】 約 0.0001 mg ~ 約 1 mg または 1 mg 未満の量のオピオイドアンタゴニスト、および薬学的に受容可能なキャリアを含む、薬学的組成物。

【請求項 24】 前記アンタゴニストの量が、約 1 mg である、請求項 23 に記載の薬学的組成物。

【請求項 25】 前記アンタゴニストの量が、1 mg 未満である、請求項 23 に記載

の薬学的組成物。

【請求項 26】 前記アンタゴニストの量が、約 0.1 mg である、請求項 23 に記載の薬学的組成物。

【請求項 27】 前記アンタゴニストの量が、0.1 mg 未満である、請求項 23 に記載の薬学的組成物。

【請求項 28】 前記アンタゴニストの量が、0.1 mg より多い、請求項 23 に記載の薬学的組成物。

【請求項 29】 前記アンタゴニストの量が、約 0.01 mg である、請求項 23 に記載の薬学的組成物。

【請求項 30】 前記アンタゴニストの量が、0.01 mg 未満である、請求項 23 に記載の薬学的組成物。

【請求項 31】 前記アンタゴニストの量が、0.01 mg より多い、請求項 23 に記載の薬学的組成物。

【請求項 32】 前記アンタゴニストの量が、約 0.001 mg である、請求項 23 に記載の薬学的組成物。

【請求項 33】 前記アンタゴニストの量が、0.001 mg 未満である、請求項 23 に記載の薬学的組成物。

【請求項 34】 前記アンタゴニストの量が、0.001 mg より多い、請求項 23 に記載の薬学的組成物。

【請求項 35】 前記アンタゴニストの量が、約 0.0001 mg である、請求項 23 に記載の薬学的組成物。

【請求項 36】 前記アンタゴニストの量が、0.0001 mg より多い、請求項 23 に記載の薬学的組成物。

【請求項 37】 前記アンタゴニストが薬学的に受容可能な塩として存在する、請求項 23 に記載の薬学的組成物。

【請求項 38】 前記アンタゴニストが、ナルトレキソン、ナルメフェン、またはナロキソンである、請求項 23 に記載の薬学的組成物。

【請求項 39】 さらにオピオイドアンタゴニストを含む、請求項 23 に記載の薬学的組成物。

【請求項 40】 前記アゴニストが、鎮痛量または鎮痛量未満である、請求項 39 に記載の薬学的組成物。

【請求項 41】 前記アゴニストが、モルフィン、ヒドロコドン、オキシコドン、コデイン、フェンタニル、アルフェentanil、ヒドロモルフォン、メペリジン、メタドン、オキシモルフォン、プロボキシフェン、またはトラマドールである、請求項 39 に記載の投薬形態。

【請求項 42】 前記アゴニストが、モルフィン、ヒドロコドン、オキシコドン、またはトラマドールである、請求項 39 に記載の薬学的組成物。

【請求項 43】 前記アンタゴニストが、カプセル、錠剤、または丸剤として処方されている、請求項 23 または 39 に記載の薬学的組成物。

【請求項 44】 ヒト被験体にオピオイドアンタゴニストの治療用量を投与するための、請求項 1 または 4 に記載の投薬形態。

【請求項 45】 ヒト被験体にオピオイドアンタゴニストの治療用量を投与するための、請求項 18 に記載の投薬形態。

【請求項 46】 請求項 1 または 4 に記載の投薬形態を備える、薬学的キット。

【請求項 47】 請求項 18 に記載の投薬形態および容器を備える、薬学的キット。

【請求項 48】 本質的に、約 0.0001 mg ~ 0.5 mg 未満の量のオピオイドアンタゴニストからなる、固体経口投薬形態。

【請求項 49】 前記アンタゴニストの量が、約 0.4 mg 未満である、請求項 48 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 50】 前記アンタゴニストの量が、約 0.3 mg 未満である、請求項 48

に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 5 1】 前記アンタゴニストの量が、約 0.2 mg 未満である、請求項 4 8 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 5 2】 前記アンタゴニストの量が、約 0.1 mg である、請求項 4 8 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 5 3】 前記アンタゴニストの量が、0.1 mg 未満である、請求項 4 8 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 5 4】 前記アンタゴニストの量が、0.1 mg より多い、請求項 4 8 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 5 5】 前記アンタゴニストの量が、約 0.01 mg である、請求項 4 8 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 5 6】 前記アンタゴニストの量が、0.01 mg 未満である、請求項 4 8 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 5 7】 前記アンタゴニストの量が、0.01 mg より多い、請求項 4 8 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 5 8】 前記アンタゴニストの量が、約 0.001 mg である、請求項 4 8 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 5 9】 前記アンタゴニストの量が、約 0.001 mg 未満である、請求項 4 8 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 6 0】 前記アンタゴニストの量が、0.001 mg より多い、請求項 4 8 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 6 1】 前記アンタゴニストの量が、約 0.0001 mg である、請求項 4 8 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 6 2】 前記アンタゴニストの量が、0.0001 mg より多い、請求項 4 8 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 6 3】 前記アンタゴニストが、ナルトレキソンまたはナルメフェンである、請求項 4 8 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 6 4】 本質的に、約 0.0001 mg ~ 約 0.5 mg 未満の量のナルトレキソンからなる、固体経口投薬形態。

【請求項 6 5】 前記ナルトレキシソンの量が、有効なアンタゴニスト量未満である、請求項 6 4 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 6 6】 本質的に約 0.0001 mg ~ 約 0.5 mg 未満の量のナルメフェンからなる、固体経口投薬形態。

【請求項 6 7】 前記ナルメフェンの量が、有効なアンタゴニスト量未満である、請求項 6 6 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 6 8】 約 0.0001 mg ~ 約 0.5 mg 未満の量のオピオイドアンタゴニスト、および約 0.1 mg ~ 約 300 mg の量のオピオイドアゴニストを含む、固体経口投薬形態。

【請求項 6 9】 前記アンタゴニストが、有効アンタゴニスト量未満で存在する、請求項 6 8 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 7 0】 前記アンタゴニストの量が、約 0.1 mg である、請求項 6 8 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 7 1】 前記アンタゴニストの量が、0.1 mg 未満である、請求項 6 8 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 7 2】 前記アンタゴニストの量が、0.1 mg より多い、請求項 6 8 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 7 3】 前記アンタゴニストの量が、約 0.01 mg である、請求項 6 8 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 7 4】 前記アンタゴニストの量が、0.01 mg 未満である、請求項 6 8 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 75】 前記アンタゴニストの量が、0.01 mg より多い、請求項 68 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 76】 前記アンタゴニストの量が、約 0.001 mg である、請求項 68 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 77】 前記アンタゴニストの量が、約 0.001 mg 未満である、請求項 68 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 78】 前記アンタゴニストの量が、0.001 mg より多い、請求項 68 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 79】 前記アンタゴニストの量が、約 0.0001 mg である、請求項 68 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 80】 前記アンタゴニストの量が、0.0001 mg より多い、請求項 68 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 81】 前記アンタゴニストが、薬学的に受容可能な塩として存在する、請求項 68 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 82】 前記アンタゴニストが、ナルトレキソンまたはナルメフェンである、請求項 68 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 83】 アンタゴニストとしてナルトレキソンを含む、請求項 68 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 84】 アンタゴニストとしてナルメフェンを含む、請求項 68 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 85】 前記アゴニストが、鎮痛未満の量で存在する、請求項 68 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 86】 前記アゴニストが、モルフィン、ヒドロコドン、オキシコドン、コデイン、フェンタニル、アルフェンタニール、ヒドロモルフォン、メペリジン、メタドン、オキシモルフォン、プロボキシフェン、またはトラマドールである、請求項 68 に記載の投薬形態。

【請求項 87】 前記アゴニストが、モルフィン、ヒドロコドン、オキシコドン、またはトラマドールである、請求項 68 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 88】 前記アンタゴニストがナルトレキソンであり、前記アゴニストがモルフィンである、請求項 68 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 89】 前記アンタゴニストがナルトレキソンであり、前記アゴニストがオキシコドンである、請求項 68 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 90】 前記アンタゴニストがナルトレキソンであり、前記アゴニストがヒドロコドンである、請求項 68 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 91】 前記アンタゴニストがナルトレキソンであり、前記アゴニストがトラマドールである、請求項 68 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 92】 前記アンタゴニストが、ナルメフェンであり、前記アゴニストがモルフィンである、請求項 68 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 93】 前記アンタゴニストがナルメフェンであり、前記アゴニストがオキシコドンである、請求項 68 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 94】 前記アンタゴニストがナルメフェンであり、前記アゴニストがトラマドールである、請求項 68 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 95】 前記アンタゴニストがナルメフェンであり、前記アゴニストがヒドロコドンである、請求項 68 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 96】 前記アンタゴニストが、カプセル、錠剤、または丸剤として処方されている、請求項 68 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 97】 アセトアミノフェン、ステロイド性抗炎症薬、非ステロイド性抗炎症薬、COX-1 インヒビター、および COX-2 インヒビターからなる群より選択される別の活性な薬学成分をさらに含む、請求項 68 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 98】 ヒト被験体にオピオイドアンタゴニストの治療用量を投与する ため

の、請求項 2 2 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 9 9】 ヒト被験体にオピオイドアンタゴニストの治療用量を投与するため
の、請求項 2 3 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 1 0 0】 ヒト被験体にオピオイドアンタゴニストの治療用量を投与するた
めの、請求項 4 2 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 1 0 1】 ヒト被験体にオピオイドアンタゴニストの治療用量を投与するた
めの、請求項 4 3 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 1 0 2】 ヒト被験体にオピオイドアンタゴニストの治療用量を投与するた
めの、請求項 4 6 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 1 0 3】 ヒト被験体にオピオイドアンタゴニストの治療用量を投与するた
めの、請求項 6 2 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 1 0 4】 ヒト被験体にオピオイドアンタゴニストの治療用量を投与するた
めの、請求項 6 8 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 1 0 5】 請求項 1、4、または 4 6 に記載の投薬形態を備える、薬学的キ
ット。

【請求項 1 0 6】 オピオイドアゴニストの投薬形態をさらに備える、請求項 1 0 5
に記載のキット。

【請求項 1 0 7】 前記アゴニスト投薬形態および前記アンタゴニスト投薬形態が、
別個の投薬形態である、請求項 1 0 6 に記載のキット。

【請求項 1 0 8】 即時放出処方物として提供された、請求項 1 または 4 に記載の固
体経口投薬形態。

【請求項 1 0 9】 即時放出処方物として提供された、請求項 2 2 に記載の固体経口
投薬形態。

【請求項 1 1 0】 即時放出処方物として提供された、請求項 4 3 に記載の固体経口
投薬形態。

【請求項 1 1 1】 即時放出処方物として提供された、請求項 4 8 に記載の固体経口
投薬形態。

【請求項 1 1 2】 即時放出処方物として提供された、請求項 6 4 に記載の固体経口
投薬形態。

【請求項 1 1 3】 即時放出処方物として提供された、請求項 6 8 に記載の固体経口
投薬形態。

【請求項 1 1 4】 即時放出型固体経口投薬形態であって、以下：約 0 . 0 0 0 1 ~
約 0 . 5 m g 未満の量で存在するオピオイドアンタゴニスト；少なくとも 1 つの薬学的賦
形剤、を含み；ここで該オピオイドアンタゴニストの 9 0 % より多くが水性環境に対して
曝された後、約 4 5 分未満で放出される、即時放出型固体経口投薬形態。

【請求項 1 1 5】 請求項 1 1 4 に記載の即時放出型固体経口投薬形態であって、こ
こで前記オピオイドアンタゴニストの 9 0 % より多くが、水性環境に対して曝された後、
約 3 0 分未満で放出される、即時放出型固体経口投薬形態。

【請求項 1 1 6】 請求項 1 1 4 に記載の即時放出型固体経口投薬形態であって、こ
こで前記オピオイドアンタゴニストの 9 0 % より多くが、水性環境に対して曝された後、
約 2 0 分未満で放出される、即時放出型固体経口投薬形態。

【請求項 1 1 7】 請求項 1 1 4 に記載の固体経口投薬形態であって、ここで該投薬
形態は、薬学的組成物を含み、該薬学的組成物は、コーティングした固体基質を含み、該
固体基質は、以下：不活性な基質；該不活性な基質を少なくとも部分的に囲むコーティ
ングを含み；そして

該コーティングは、オピオイドアンタゴニストおよび少なくとも 1 つの薬学的賦形剤、
そして必要に応じて結合剤および可塑剤を含む、固体経口投薬形態。

【請求項 1 1 8】 前記コーティングが約 1 ~ 7 0 重量 % のコーティングした固体基
質を含む、請求項 1 1 7 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 1 1 9】 前記薬学的組成物が、前記コーティングした固体基質と混合して

少なくとも１つの薬学的賦形剤をさらに含む、請求項１１８に記載の投薬形態。

【請求項１２０】 前記投薬形態が、カプセルまたは錠剤である、請求項１１８に記載の固体経口投薬形態。

【請求項１２１】 請求項１１４に記載の固体経口投薬形態であって、ここで該投薬形態は、薬学的組成物を含み、該薬学的組成物は、コーティングした顆粒を含み、該コーティングした顆粒は、以下：２つ以上の薬学的賦形剤の混合物を含む顆粒；および該顆粒の各々を少なくとも部分的に囲むコーティングを含み；そして該コーティングは、該薬学的賦形剤および前記オピオイドアンタゴニストを含む、固体経口投薬形態。

【請求項１２２】 前記薬学的組成物が、前記コーティングした顆粒と混合して、少なくとも１つの薬学的賦形剤をさらに含む、請求項１２１に記載の固体経口投薬形態。

【請求項１２３】 前記コーティングした顆粒が、約１０～８５重量％の固体の薬学的組成物を含む、請求項１２２に記載の固体経口投薬形態。

【請求項１２４】 前記投薬形態が、カプセルまたは錠剤である、請求項１２３に記載の固体経口投薬形態。

【請求項１２５】 請求項１１４に記載の固体経口投薬形態であって、該固体経口投薬形態は、少なくとも１つの薬学的賦形剤およびオピオイドアンタゴニストの混合物を含む噴霧乾燥した薬学的組成物を含む、固体経口投薬形態。

【請求項１２６】 前記薬学的組成物が、前記噴霧乾燥した薬学的組成物と混合してさらに少なくとも１つの薬学的賦形剤を含む、請求項１２５に記載の投薬形態。

【請求項１２７】 前記噴霧乾燥した薬学的組成物が、約５～９９重量％の投薬形態を含む、請求項１２６に記載の固体経口投薬形態。

【請求項１２８】 前記投薬形態が、カプセルまたは錠剤である、請求項１２７に記載の固体経口投薬形態。

【請求項１２９】 請求項１２８に記載の固体経口投薬形態であって、該固体投薬形態は、懸濁物を充填した軟質ゼラチンカプセルを含み、該カプセルは、以下：軟質ゼラチンカプセル；および該カプセル内の懸濁物を含み、該懸濁物は、液体形態の非水性ビヒクルおよび固体形態のオピオイドアンタゴニストを含む、固体投薬形態。

【請求項１３０】 前記懸濁物がさらに、少なくとも１つの薬学的賦形剤を含む、請求項１２８に記載の投薬形態。

【請求項１３１】 即時放出型固体経口投薬形態であって、以下：約０．０００１～約０．５ｍｇ未満の量で存在するオピオイドアンタゴニスト；別の活性な薬学的成分；少なくとも１つの薬学的賦形剤、を含み；ここで該オピオイドアンタゴニストおよび該他の活性成分が、水性環境に対して曝された後、約１．５分未満で放出される、即時放出型固体経口投薬形態。

【請求項１３２】 請求項１３１に記載の固体経口投薬形態であって、ここで前記他の活性な薬学的成分が、約０．１ｍｇ～約３００ｍｇの量で存在するオピオイドアンタゴニストである、固体経口投薬形態。

【請求項１３３】 同時放出型組み合わせ型固体経口投薬形態であって、以下：約０．０００１～０．５ｍｇ未満の量で存在するオピオイドアンタゴニスト；別の活性な薬学的成分；少なくとも１つの薬学的賦形剤、を含み；ここで該オピオイドアンタゴニストおよび該他の活性な薬学的成分が、同時に放出される、固体経口投薬形態。

【請求項１３４】 請求項１３３に記載の固体経口投薬形態であって、ここで前記オピオイドアンタゴニストおよび前記他の活性な薬学的成分の各々の９０％より多くが、水性環境に対して曝された後、４５分未満で放出される、固体経口投薬形態。

【請求項１３５】 前記他の活性成分が約０．１ｍｇ～約３００ｍｇの量で存在するオピオイドアンタゴニストである、請求項１３３に記載の固体経口投薬形態。

【請求項１３６】 前記投薬形態が、カプセルまたは錠剤である、請求項１３１または１３３に記載の固体経口投薬形態。

【請求項１３７】 前記オピオイドアンタゴニストの９０％より多くが、水性環境に対して曝された後、約４５分未満で放出される、請求項１３１または１３３に記載の固体

経口投薬形態。

【請求項 1 3 8】 前記他の活性な薬学的成分の 90%より多くが、水性環境に対して曝された後、約 45 分未満で放出される、請求項 1 3 1 または 1 3 3 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 1 3 9】 前記オピオイドアンタゴニストの大部分の放出が、前記他の活性な薬学的成分の大部分の放出と重複する、請求項 1 3 3 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 1 4 0】 前記オピオイドアンタゴニストの約 90%が、前記他の活性な薬学的成分の約 90%が放出される時間内に放出される、請求項 1 3 3 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 1 4 1】 請求項 1 3 3 に記載の固体経口投薬形態であって、該投薬形態は、アンタゴニスト溶解プロフィールおよび他の活性な薬学的成分の溶解プロフィールを提供し、そして該溶解プロフィールが実質的に同じである、固体経口投薬形態。

【請求項 1 4 2】 組み合わせ型固体経口投薬形態であって、以下：オピオイドアゴニスト；オピオイドアンタゴニスト；少なくとも 1 つの薬学的賦形剤を含み；ここで該投薬形態は、約 37 で、500 ml の 0.1 HCl 培地中で 75 rpm で USP Paddle Method によって測定した場合、アゴニスト溶解パーセンテージおよびアンタゴニスト溶解パーセンテージを提供し、そして該アゴニスト溶解パーセンテージおよびアンタゴニスト溶解パーセンテージは、5 分～30 分のいずれの時点でも実質的に同じである、固体経口投薬形態。

【請求項 1 4 3】 前記アゴニスト溶解パーセンテージおよび前記アンタゴニスト溶解パーセンテージが、5 分、10 分、15 分、20 分および 30 分のいずれの時点でも実質的に同じである、請求項 1 4 2 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 1 4 4】 前記アゴニスト溶解パーセンテージおよび前記アンタゴニスト溶解パーセンテージが、少なくとも 6 つの測定値の平均である、請求項 1 4 2 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 1 4 5】 前記アゴニスト溶解パーセンテージと前記アンタゴニスト溶解パーセンテージとの間の差異が、約 10%以下である、請求項 1 4 4 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 1 4 6】 組み合わせ型固体経口投薬形態であって、以下：約 0.0001～約 0.5 mg 未満の量で存在するオピオイドアンタゴニスト；約 0.1 mg～約 300 mg の量で存在するオピオイドアゴニスト；および少なくとも 1 つの薬学的賦形剤、を含み；ここで該投薬形態は、薬学的組成物を含み、該薬学的組成物は、コーティングした固体基質を含み、該コーティングした固体基質は、以下：該オピオイドアゴニストおよび少なくとも 1 つの薬学的賦形剤を含む固体基質；および該固体基質を少なくとも部分的に囲むコーティングを含み、そして該コーティングは、該オピオイドアンタゴニストおよび少なくとも 1 つの薬学的賦形剤を含む、組み合わせ型固体経口投薬形態。

【請求項 1 4 7】 前記固体基質が、ペレット、ビーズ、または顆粒である、請求項 1 4 6 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 1 4 8】 組み合わせ型固体経口投薬形態であって、以下：約 0.0001～約 0.5 mg 未満の量で存在するオピオイドアンタゴニスト；約 0.1 mg～約 300 mg の量で存在するオピオイドアゴニスト；および少なくとも 1 つの薬学的賦形剤、を含み；ここで該投薬形態は、薬学的組成物を含み、該薬学的組成物は、コーティングした固体基質を含み、該コーティングした固体基質は、以下：不活性な非実質性のビーズまたはペレット；該ビーズまたはペレットを少なくとも部分的に囲むコーティングを含み、そして該コーティングは、該オピオイドアンタゴニスト、オピオイドアゴニスト、結合剤、可塑剤、および少なくとも 1 つの薬学的賦形剤を含む、組み合わせ型固体経口投薬形態。

【請求項 1 4 9】 組み合わせ型固体経口投薬形態であって、以下：約 0.0001～約 0.5 mg 未満の量で存在するオピオイドアンタゴニスト；約 0.1 mg～約 300 mg の量で存在するオピオイドアゴニスト；および少なくとも 1 つの薬学的賦形剤、を含み；ここで該固体投薬形態は、薬学的組成物を含み、該薬学的組成物は、第 1 および第 2

のコーティングした固体基質を含み、そして該第 1 のコーティングした固体基質は、非実質性のペレットまたはビーズ、および該ペレットまたはビーズを少なくとも部分的に囲む第 1 のコーティングを含み、そして該第 1 のコーティングは、結合剤およびオピオイドアンタゴニストを含み；そして該第 2 のコーティングした固体基質は、非実質性のペレットまたはビーズ、および該ペレットまたはビーズを少なくとも部分的に囲む第 2 のコーティングを含み、そして該第 2 のコーティングは、結合剤およびオピオイドアンタゴニストを含む、組み合わせ型固体経口投薬形態。

【請求項 150】 請求項 149 に記載の固体経口投薬形態であって、前記第 1 のコーティングした固体基質が、約 0.5 ~ 80 重量%の固体薬学的組成物を含み；そして前記第 2 のコーティングした固体基質が、約 20 ~ 95 重量%の固体薬学的組成物を含む、固体経口投薬形態。

【請求項 151】 請求項 150 に記載の固体経口投薬形態であって、前記薬学的組成物は、前記第 1 および第 2 のコーティングされた基質と混合して少なくとも 1 つの薬学的賦形剤をさらに含む、固体経口投薬形態。

【請求項 152】 組み合わせ型固体経口投薬形態であって、以下：約 0.0001 ~ 約 0.5 mg 未満の量で存在するオピオイドアンタゴニスト；約 0.1 mg ~ 約 300 mg の量で存在するオピオイドアンタゴニスト；および少なくとも 1 つの薬学的賦形剤、を含み；ここで該固体投薬形態は、薬学的組成物を含み、該薬学的組成物は、第 1 および第 2 の顆粒を含み；そして該第 1 の顆粒は、結合剤および該オピオイドアンタゴニストを含み；そして該第 2 の顆粒は、結合剤および該オピオイドアンタゴニストを含む、組み合わせ型固体経口投薬形態。

【請求項 153】 前記第 1 顆粒が、約 0.5 ~ 50 重量%の固体薬学的組成物を含み；そして前記第 2 の顆粒が、約 20 ~ 95 重量%の固体薬学的組成物を含む、請求項 152 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 154】 前記薬学的組成物は、前記第 1 および第 2 の顆粒と混合して少なくとも 1 つの薬学的賦形剤をさらに含む、請求項 153 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 155】 前記投薬形態が、カプセルまたは錠剤である、請求項 154 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 156】 組み合わせ型固体経口投薬形態であって、以下：約 0.0001 ~ 約 0.5 mg 未満の量で存在するオピオイドアンタゴニスト；約 0.1 mg ~ 約 300 mg の量で存在するオピオイドアンタゴニスト；および少なくとも 1 つの薬学的賦形剤、を含み；ここで該投薬形態は、薬学的組成物を含み、該薬学的組成物は、コーティングした顆粒を含み、該コーティングした顆粒は、2 つ以上の薬学的賦形剤の混合物；および該混合物を少なくとも部分的に囲むコーティングを含み、そして該コーティングは、結合剤、オピオイドアンタゴニスト、およびオピオイドアンタゴニストを含む、組み合わせ型固体経口投薬形態。

【請求項 157】 前記薬学的組成物が、前記コーティングした顆粒と混合して少なくとも 1 つの薬学的賦形剤をさらに含む、請求項 156 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 158】 前記コーティングした顆粒が約 10 ~ 85 重量%の固体薬学的組成物を含む、請求項 157 に記載の固体経口投薬形態

【請求項 159】 前記投薬形態がカプセルまたは錠剤である、請求項 158 に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 160】 組み合わせ型固体経口投薬形態であって、以下：約 0.0001 ~ 約 0.5 mg 未満の量で存在するオピオイドアンタゴニスト；約 0.1 mg ~ 約 300 mg の量で存在するオピオイドアンタゴニスト；および少なくとも 1 つの薬学的賦形剤、を含み；ここで該固体投薬形態は、薬学的組成物を含み、該薬学的組成物は、2 つ以上の薬学的賦形剤およびオピオイドアンタゴニストの混合物を含むコーティングした顆粒；および該混合物を少なくとも部分的に囲むコーティングを含み、そして該コーティングは、結合剤および該オピオイドアンタゴニストを含む、組み合わせ型固体経口投薬形態。

【請求項 161】 前記薬学的組成物が、前記コーティングした顆粒と混合して少な

くとも1つの薬学的賦形剤をさらに含む、請求項160に記載の固体経口投薬形態。

【請求項162】 前記コーティングした顆粒が、約10～75重量%の固体薬学的組成物を含む、請求項161に記載の固体経口投薬形態。

【請求項163】 前記投薬形態が、カプセルまたは錠剤である、請求項162に記載の固体経口投薬形態。

【請求項164】 組み合わせ型固体経口投薬形態であって、以下：約0.0001～約未満の量で存在するオピオイドアンタゴニスト；約0.1mg～約300mgの量で存在するオピオイドアゴニスト；および少なくとも1つの薬学的賦形剤、を含み；ここで該固体投薬形態は、噴霧乾燥した薬学的組成物を含み、該薬学的組成物は、少なくとも1つの薬学的賦形剤、該オピオイドアゴニスト、および該オピオイドアンタゴニストの混合物を含む、組み合わせ型固体経口投薬形態。

【請求項165】 前記薬学的組成物が、前記噴霧乾燥した薬学的組成物と混合して少なくとも1つの薬学的賦形剤をさらに含む、請求項164に記載の固体経口投薬形態。

【請求項166】 前記噴霧乾燥した薬学的組成物が、約5～99重量%の投薬形態を含む、請求項165に記載の固体経口投薬形態。

【請求項167】 前記投薬形態がカプセルまたは錠剤である、請求項166に記載の固体経口投薬形態。

【請求項168】 組み合わせ型固体経口投薬形態であって、以下：約0.0001～約0.5mg未満の量で存在するオピオイドアンタゴニスト；約1.0mg～約300mgの量で存在するオピオイドアゴニスト；および少なくとも1つの薬学的賦形剤、を含み；ここで該固体投薬形態は、懸濁物充填軟質ゼラチンカプセルを含み、該ゼラチンカプセルは軟質ゼラチンカプセルを含み；そして該カプセル内の懸濁物は、液体形態の非水性ビヒクル、固体形態の該オピオイドアゴニスト、および固体形態の該オピオイドアンタゴニストを含む、組み合わせ型固体経口投薬形態。

【請求項169】 前記懸濁物が、少なくとも1つの薬学的賦形剤をさらに含む、請求項168に記載の固体経口投薬形態。

【請求項170】 ヒト被験体へのオピオイドアンタゴニストの治療用量の投与のための固体経口投薬形態であって、該固体経口投薬形態は、

約0.0001mg～約0.5mg未満の量で存在するオピオイドアンタゴニスト、および

約0.1mg～約300mg未満の量で存在するオピオイドアゴニストを含む、固体経口投薬形態。

【請求項171】 薬学的キットであって、以下：約0.0001mg～約0.5mg未満の量で存在するオピオイドアンタゴニスト、および約0.1mg～約300mg未満の量で存在するオピオイドアゴニストを含む投薬形態を備える、キット。