

【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0.0001mg～約1mgまたは1mg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、プロポキシフェン、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 1 または 8 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 1 または 8 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 m g 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 m g 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 m g 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 m g 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 . 0 1 m g 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 . 0 1 m g 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 . 0 1 m g 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 . 0 0 1 m g 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 . 0 0 1 m g 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 . 0 0 1 m g 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 . 0 0 0 1 m g 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 . 0 0 0 1 m g 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 . 0 0 0 1 m g ~ 約 0 . 5 m g 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 . 0 0 0 1 m g ~ 約 0 . 5 m g 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 . 0 0 0 1 m g ~ 約 0 . 5 m g 未満の量のオピオイドアンタゴニスト、および約 0 . 1 m g ~ 約 3 0 0 m g 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 m g 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 m g 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 m g 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 . 0 1 m g 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 . 0 1 m g 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 5】 前記アンタゴニストの量が、0.01mgより多い、請求項68に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 7 6】 前記アンタゴニストの量が、約0.001mgである、請求項68に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 7 7】 前記アンタゴニストの量が、約0.001mg未満である、請求項68に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 7 8】 前記アンタゴニストの量が、0.001mgより多い、請求項68に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 7 9】 前記アンタゴニストの量が、約0.0001mgである、請求項68に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 8 0】 前記アンタゴニストの量が、0.0001mgより多い、請求項68に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 8 1】 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 8 2】 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 8 3】 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 8 4】 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 8 5】 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 8 6】 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、プロポキシフェン、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 8 7】 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 8 8】 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 8 9】 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 9 0】 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 9 1】 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 9 2】 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 9 3】 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 9 4】 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 9 5】 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 9 6】 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 9 7】 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的成分をさらに含む、請求項68に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 9 8】 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 mg 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 138】 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131または133に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 139】 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133に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 140】 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133に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 141】 請求項133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 142】 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、500m1の0.1HC1培地内で75rpmでU S P Add 1 e 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 143】 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142に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 144】 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142に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 145】 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144に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 146】 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 147】 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146に記載の固体経口投薬形態。

【請求項 148】 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 149】 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、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0.5mg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、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0.5mg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、オピオイドアゴニスト、およびオピオイドアゴニストを含む、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0.5mg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、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 1 6 0 に 記 載 の 固 体 経 口 投 薬 形 態。

【 請 求 項 1 6 2 】 前 記 コ ー テ イ ン グ し た 顆 粒 が 、 約 1 0 ~ 7 5 重 量 % の 固 体 薬 学 的 組 成 物 を 含 む 、 請 求 項 1 6 1 に 記 載 の 固 体 経 口 投 薬 形 態。

【 請 求 項 1 6 3 】 前 記 投 薬 形 態 が 、 カ プ セ 尔 ま た は 錠 剂 で あ る 、 請 求 項 1 6 2 に 記 載 の 固 体 経 口 投 薬 形 態。

【 請 求 項 1 6 4 】 組 合 わ せ 型 固 体 経 口 投 薬 形 態 で あ っ て 、 以 下 : 約 0 . 0 0 0 1 ~ 約 未 滿 の 量 で 存 在 す る オ ピ オ イ ド ア ン タ ゴ ニ ス ト ; 約 0 . 1 m g ~ 約 3 0 0 m g 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 ン タ ゴ ニ ス ト 、 お よ び 該 オ ピ オ イ ド ア ゴ ニ ス ト の 混 合 物 を 含 む 、 組 合 わ せ 型 固 体 経 口 投 薬 形 態。

【 請 求 項 1 6 5 】 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 1 6 4 に 記 載 の 固 体 経 口 投 薬 形 態。

【 請 求 項 1 6 6 】 前 記 噴 霧 乾 燥 し た 薬 学 的 組 成 物 が 、 約 5 ~ 9 9 重 量 % の 投 薬 形 態 を 含 む 、 請 求 項 1 6 5 に 記 載 の 固 体 経 口 投 薬 形 態。

【 請 求 項 1 6 7 】 前 記 投 薬 形 態 が カ プ セ 尔 ま た は 錠 剂 で あ る 、 請 求 項 1 6 6 に 記 載 の 固 体 経 口 投 薬 形 態。

【 請 求 項 1 6 8 】 組 合 わ せ 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 滿 の 量 で 存 在 す る オ ピ オ イ ド ア ン タ ゴ ニ ス ト ; 約 1 . 0 m g ~ 約 3 0 0 m g 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 ザ カ プ セ 尔 を 含 み 、 該 ゼ ラ チ ザ カ プ セ 尔 は 軟 質 ゼ ラ チ ザ カ ブ セ 尔 を 含 み ; そ し て 該 カ ブ セ 尔 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 ン タ ゴ ニ ス ト 、 お よ び 固 体 形 態 の 該 オ ピ オ イ ド ア ゴ ニ ス ト を 含 む 、 組 合 わ せ 型 固 体 経 口 投 薬 形 態。

【 請 求 項 1 6 9 】 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 1 6 8 に 記 載 の 固 体 経 口 投 薬 形 態。

【 請 求 項 1 7 0 】 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 . 0 0 0 1 m g ~ 約 0 . 5 m g 未 滿 の 量 で 存 在 す る オ ピ オ イ ド ア ン タ ゴ ニ ス ト 、 お よ び

約 0 . 1 m g ~ 約 3 0 0 m g 未 滿 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 1 7 1 】 薬 学 的 キ ッ ト で あ っ て 、 以 下 : 約 0 . 0 0 0 1 m g ~ 約 0 . 5 m g 未 滿 の 量 で 存 在 す る オ ピ オ イ ド ア ン タ ゴ ニ ス ト 、 お よ び 約 0 . 1 m g ~ 約 3 0 0 m g 未 滿 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。