

【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30年10月25日 (2018.10.25)

【公表番号】特表2017-526719(P2017-526719A)

【公表日】平成29年9月14日 (2017.9.14)

【年通号数】公開・登録公報2017-035

【出願番号】特願2017-513760(P2017-513760)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/485 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 K 31/451 (2006.01)

A 6 1 K 38/07 (2006.01)

A 6 1 K 31/4468 (2006.01)

A 6 1 K 31/135 (2006.01)

A 6 1 K 9/70 (2006.01)

A 6 1 P 25/36 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 11/14 (2006.01)

A 6 1 P 1/12 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/485

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 31/451

A 6 1 K 38/07

A 6 1 K 31/4468

A 6 1 K 31/135

A 6 1 K 9/70 4 0 1

A 6 1 P 25/36

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 11/14

A 6 1 P 1/12

A 6 1 P 43/00 1 2 1

【手続補正書】

【提出日】平成30年9月13日 (2018.9.13)

【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】

ブプレノルフィン以外のオピオイドによって誘発される多幸症を防止または減弱するための医薬組成物であって、前記他のオピオイドによって誘発される前記多幸症を防止また

は減弱するのに有効な量のブプレノルフィン、及び医薬的に有効な量の前記他のオピオイドを含有する、前記医薬組成物。

【請求項 2】

前記他のオピオイドが、鎮痛効果を提供する有効量で存在する、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

前記他のオピオイドが、25 % よりも大きい、または 40 % よりも大きい  $E_{max}$  を有する、請求項 1 または 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

前記ブプレノルフィンが、ブプレノルフィン塩基、その薬学的に許容される塩、その溶媒和化合物、その多形体、及びその混合物からなる群から選択される、請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 5】

前記ブプレノルフィンが、ブプレノルフィン塩基、ブプレノルフィン塩酸塩、またはレブリン酸ブプレノルフィンである、請求項 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

前記ブプレノルフィンが、経皮投与のためである、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 7】

前記ブプレノルフィンが、24 時間または 3 日または 7 日の投与間隔での経皮投与のためである、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

前記ブプレノルフィンが、5 mcg / 時または 5 mcg / 時未満の速度での経皮投与のためである、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

前記ブプレノルフィンが、経口、経皮、舌下、頬側、歯肉、直腸、皮下、筋肉内、静脈内、及び非経口からなる群から選択される前記他のオピオイドと同じ経路による投与のために製剤化される、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 10】

前記他のオピオイド及び前記ブプレノルフィンが、両方経口投与のために製剤化される、請求項 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

前記医薬組成物が、錠剤またはカプセルから選択される単一の固形経口製剤である、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

前記他のオピオイド及び前記ブプレノルフィンが、制御放出用もしくは即時放出用に両方製剤化される、または、

前記他のオピオイドが、制御放出用に製剤化され、前記ブプレノルフィンが、即時放出用に製剤化される、または、

前記他のオピオイドが、即時放出用に製剤化され、前記ブプレノルフィンが、制御放出用に製剤化される、請求項 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

前記ブプレノルフィンが、1 mg / kg 未満または 0.5 mg / kg 未満または 0.1 mg / kg 未満を提供する量での投与のために製剤化される、請求項 1 ~ 12 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 14】

ブプレノルフィン対前記他のオピオイドの日用量の比率が、1 : 5 (w / w) 以下または 1 : 10 (w / w) 以下または 1 : 50 (w / w) 以下または 1 : 100 (w / w) 以下である、請求項 1 ~ 12 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 15】

前記他のオピオイドが、オキシコドン、メサドン、モルヒネ、コデイン、オキシモルホン、フェンタニル、ヒドロコドン、ヒドロモルホン、トラマドール、及びそれらの薬学的に許容される塩からなる群から選択される、または、前記他のオピオイドが、ロペラミド、フラケファミド ( f r a k e f a m i d e )、及びそれらの薬学的に許容される塩からなる群から選択される末梢限定オピオイドである、請求項 1 ~ 1 4 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 1 6】

前記他のオピオイドが、オキシコドン遊離塩基またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 ~ 1 5 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 1 7】

前記他のオピオイドが、オキシコドン塩酸塩またはオキシコドンミリスチン酸塩である、請求項 1 ~ 1 5 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

前記他のオピオイドが、1 0 0 m g ~ 3 0 0 m g の量で存在するトラマドール塩酸塩である、または、前記他のオピオイドが、5 m g ~ 4 0 m g のオキシモルホン塩酸塩の量で存在するオキシモルホン塩酸塩である、または、前記他のオピオイドが、2 m g ~ 2 0 0 m g の量で存在するヒドロコドン酒石酸水素塩である、または、前記他のオピオイドが、2 m g ~ 2 0 0 m g のヒドロモルホン塩酸塩の量で存在するヒドロモルホン塩酸塩である、請求項 1 ~ 1 5 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 1 9】

前記ブプレノルフィンが、オピオイド誘発性多幸症を引き起こさないか、または増加させない量での投与のために製剤化される、請求項 1 ~ 1 8 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 2 0】

前記ブプレノルフィンが、前記他のオピオイドの鎮痛効果の減少または実質的減少を引き起こさない量での投与のために製剤化される、請求項 1 ~ 1 8 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 2 1】

前記ブプレノルフィンが、前記他のオピオイド単独で提供される鎮痛を超えて、鎮痛の増加を提供する量での投与のために製剤化される、請求項 1 ~ 1 8 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 2 2】

前記他のオピオイドが、疼痛、下痢、咳、または不安を治療する有効量で存在する、請求項 1 ~ 2 1 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 2 3】

前記ブプレノルフィンが、0 . 0 0 1 m c g / 時 ~ 5 m c g / 時の速度での経皮投与のために製剤化される、請求項 1 ~ 2 2 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 2 4】

前記ブプレノルフィンが、粘膜への投与のために製剤化される、請求項 1 ~ 2 2 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 2 5】

前記同時に投与されるオピオイドの鎮痛有効性に悪影響を及ぼすブプレノルフィンの濃度が、オピオイド誘発性多幸症を防止または減弱するブプレノルフィンの濃度の9 0 倍、8 0 倍、7 0 倍、6 0 倍、5 0 倍、4 0 倍、3 0 倍、2 0 倍、1 0 倍、5 倍、または2 倍である、請求項 1 ~ 2 4 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 2 6】

( i ) 別のオピオイドによって誘発されるオピオイド誘発性多幸症を防止または減弱するブプレノルフィンの有効量の単位用量と、( i i ) 疼痛、下痢、咳、または不安を治療する有効量の前記他のオピオイドの単位用量とを含む、キット。

【請求項 2 7】

オピオイド誘発性多幸症を防止または減弱するための前記ブプレノルフィンの使用に関するラベルまたは印刷された説明書をさらに備える、請求項 2 6 に記載のキット。

【請求項 2 8】

ブプレノルフィンの経皮パッチと、オキシコドン塩酸塩の制御放出経口固形製剤とを含み、前記ブプレノルフィン及びオキシコドンが、3 または 7 日間治療を提供するための量である、または、

ブプレノルフィンの経皮パッチと、オキシモルホン塩酸塩の制御放出経口固形製剤とを含み、前記ブプレノルフィン及びオキシモルホンが、3 または 7 日間治療を提供するための量である、または、

ブプレノルフィンの経皮パッチと、ヒドロコドン酒石酸水素塩の制御放出経口固形製剤とを含み、前記ブプレノルフィン及びヒドロコドンが、3 または 7 日間治療を提供するための量である、または、

ブプレノルフィンの経皮パッチと、ヒドロモルホン塩酸塩の制御放出経口固形製剤とを含み、前記ブプレノルフィン及びヒドロモルホンが、3 または 7 日間治療を提供するための量である、請求項 2 6 または 2 7 に記載のキット。

【請求項 2 9】

ブプレノルフィンの経口固形製剤と、オキシコドン、メサドン、モルヒネ、コデイン、オキシモルホン、フェンタニル、ヒドロコドン、ヒドロモルホン、トラマドール、及びそれらの薬学的に許容される塩からなる群から選択される別のオピオイドの経口固形製剤とを含む、請求項 2 6 または 2 7 に記載のキット。