

【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】令和1年9月12日(2019.9.12)

【公表番号】特表2018-528175(P2018-528175A)

【公表日】平成30年9月27日(2018.9.27)

【年通号数】公開・登録公報2018-037

【出願番号】特願2018-504666(P2018-504666)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/485 (2006.01)

A 6 1 K 9/70 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/485

A 6 1 K 9/70 4 0 1

A 6 1 K 47/32

A 6 1 P 25/04

【手続補正書】

【提出日】令和1年7月26日(2019.7.26)

【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】

(R)-ジヒドロエトルフィン又はその塩、水和物若しくは誘導体を含む、経皮送達系、好ましくは経皮パッチであって、前記系が、例えば平均血漿濃度対時間曲線に基づいた場合、ヒト対象の皮膚への前記系の適用後、20時間未満で、好ましくは18時間未満で、より好ましくは12時間未満で、その C_{max} の少なくとも50%を達成する、(R)-ジヒドロエトルフィンの平均in vivo血漿濃度を特徴とする、(R)-ジヒドロエトルフィン血漿濃度の速やかな開始を有する、経皮送達系、好ましくは経皮パッチ。

【請求項2】

(R)-ジヒドロエトルフィン又はその塩、水和物若しくは誘導体を含む、経皮送達系、好ましくは経皮パッチであって、ヒト対象の皮膚に適用される場合、例えば平均血漿濃度対時間曲線に基づいた場合、前記系の適用後、20時間未満で、好ましくは18時間未満で、より好ましくは12時間未満で、その C_{max} の少なくとも50%を達成する、(R)-ジヒドロエトルフィンの平均in vivo血漿濃度を特徴とする、(R)-ジヒドロエトルフィン血漿濃度の速やかな開始をもたらす、経皮送達系、好ましくは経皮パッチ。

【請求項3】

例えば平均血漿濃度対時間曲線に基づいた場合、前記系の適用後、10時間未満で、好ましくは8時間未満で、より好ましくは6時間未満で、その C_{max} の少なくとも25%を達成する、及び/又は、前記系の適用後、24時間未満で、好ましくは18時間未満で、より好ましくは16時間未満で、その C_{max} の少なくとも75%を達成する、及び/又は、前記系の適用後、36時間未満で、好ましくは30時間未満で、より好ましくは28時間未満で、 C_{max} を達成する、(R)-ジヒドロエトルフィンの平均in vivo血漿濃度を特徴とする、請求項1又は2に記載の系。

【請求項4】

例えばサイズが25cm²であり(R)-ジヒドロエトルフィン6.25mgを含む単一パッチが適用される場合、前記系の適用後、12時間未満で、好ましくは10時間未満で、より好ましくは8時間未満で、少なくとも10pg/mLである、(R)-ジヒドロエトルフィンの平均in vivo血漿濃度、及び/又は、前記系の適用後、14時間未満で、好ましくは12時間未満で、より好ましくは10時間未満で、少なくとも50pg/mLである、(R)-ジヒドロエトルフィンの平均in vivo血漿濃度を特徴とする、請求項1から3のいずれか一項に記載の系。

【請求項5】

好ましくはサイズが25cm²であり(R)-ジヒドロエトルフィン6.25mgを含む単一パッチが適用される場合、(R)-ジヒドロエトルフィンの平均in vivo濃度が、C_{max}の50%に到達するまで、(R)-ジヒドロエトルフィンの平均in vivo血漿濃度が、平均速度5から20pg/ml/hで増加する(例えば平均血漿濃度対時間曲線に基づいた場合)、請求項1から4のいずれか一項に記載の系。

【請求項6】

例えばサイズが25cm²であり(R)-ジヒドロエトルフィン6.25mgを含む単一パッチが適用される場合、前記系の適用後、8時間未満で、好ましくは7時間未満で、より好ましくは6時間未満で、(R)-ジヒドロエトルフィンの平均in vivo血漿濃度が、50pg/mlの80から125%である、及び/又は、前記系の適用後、12時間未満で、好ましくは11時間未満で、より好ましくは10時間未満で、(R)-ジヒドロエトルフィンの平均in vivo血漿濃度が、100pg/mlの80から125%である、及び/又は、前記系の適用後、6時間未満で、好ましくは5時間未満で、より好ましくは4時間未満で、(R)-ジヒドロエトルフィンの平均in vivo血漿濃度が、10pg/mlの80から125%である、請求項1から5のいずれか一項に記載の系。

【請求項7】

前記系が、16時間未満で、好ましくは14時間未満で、より好ましくは12時間未満で、前記系の除去の時点におけるその濃度から少なくとも50%低下する(R)-ジヒドロエトルフィンの平均in vivo血漿濃度を特徴とする、(R)-ジヒドロエトルフィン血漿濃度の速やかな消失を有する、及び/又は、前記系が、8時間未満で、好ましくは6時間未満で、より好ましくは4時間未満で、前記系の除去の時点におけるその濃度から少なくとも25%低下する(R)-ジヒドロエトルフィンの平均in vivo血漿濃度を特徴とする、(R)-ジヒドロエトルフィン血漿濃度の速やかな消失を有する、請求項1から6のいずれか一項に記載の系。

【請求項8】

例えばサイズが25cm²であり(R)-ジヒドロエトルフィン6.25mgを含む単一パッチが除去される場合、前記系の除去後、(R)-ジヒドロエトルフィンの平均in vivo血漿濃度が、12時間未満で、好ましくは10時間未満で、より好ましくは8時間未満で、50pg/ml未満である、及び/又は、(R)-ジヒドロエトルフィンの平均in vivo血漿濃度が、48時間未満で、好ましくは36時間未満で、より好ましくは24時間未満で、10pg/ml未満である、請求項1から7のいずれか一項に記載の系。

【請求項9】

例えばサイズが25cm²であり(R)-ジヒドロエトルフィン6.25mgを含む単一パッチが適用される場合、(R)-ジヒドロエトルフィンの平均in vivo血漿濃度が、前記系の除去後、10時間未満で、好ましくは8時間未満で、より好ましくは6時間未満で、80pg/mlの80から125%である、及び/又は、(R)-ジヒドロエトルフィンの平均in vivo血漿濃度が、前記系の除去後、12時間未満で、好ましくは10時間未満で、より好ましくは8時間未満で、50pg/mlの80から125%である、及び/又は、(R)-ジヒドロエトルフィンの平均in vivo血漿濃度が、前記系の除去後、12時間未満で、好ましくは10時間未満で、より好ましくは8時間未満で、40pg/mlの80から125%である、請求項1から8のいずれか一項に記載の系。

【請求項10】

例えば平均血漿濃度対時間曲線に基づいた場合、(R)-ジヒドロエトルフィンの平均in vivo血漿濃度が、C_{max}が達成された後、少なくとも72時間、好ましくは少なくとも84時間、より好ましくは少なくとも96時間、C_{max}の少なくとも50%である、及び/又は、(R)-ジヒドロエトルフィンの平均in vivo血漿濃度が、前記系の適用後、少なくとも96時間、好ま

しくは少なくとも108時間、より好ましくは少なくとも120時間、 C_{max} の少なくとも40%である、及び/又は、(R)-ジヒドロエトルフィンの平均in vivo血漿濃度が、前記系の適用後、少なくとも144時間、より好ましくは少なくとも156時間、更により好ましくは少なくとも168時間、 C_{max} の少なくとも25%である、請求項1から9のいずれか一項に記載の系。

【請求項11】

(R)-ジヒドロエトルフィンの平均in vivo血漿濃度が、好ましくはサイズが 25cm^2 であり(R)-ジヒドロエトルフィン 6.25mg を含む単一パッチが適用される場合、 C_{max} が達成された後、少なくとも72時間、好ましくは少なくとも84時間、より好ましくは少なくとも96時間、少なくとも 50pg/ml である(例えば平均血漿濃度対時間曲線に基づいた場合)、請求項1から10のいずれか一項に記載の系。

【請求項12】

例えば平均血漿濃度対時間曲線に基づいた場合、サイズが 25cm^2 であり(R)-ジヒドロエトルフィン 6.25mg を含む単一パッチに対して、 180pg/ml の80から125%の、用量について調整された C_{max} を達成する、請求項1から11のいずれか一項に記載の系。

【請求項13】

例えば平均血漿濃度対時間曲線に基づいた場合、サイズが 25cm^2 であり(R)-ジヒドロエトルフィン 6.25mg を含む単一パッチに対して、 $16210\text{pg}\cdot\text{h/ml}$ の80から125%の、用量について調整されたAUCtを達成する、請求項1から12のいずれか一項に記載の系。

【請求項14】

サイズが 25cm^2 であり(R)-ジヒドロエトルフィン 6.25mg を含む単一パッチが適用される場合、(R)-ジヒドロエトルフィンの平均in vivoフラックス速度が、168時間の間、5から 15pg/h である、請求項1から13のいずれか一項に記載の系。

【請求項15】

平均 t_{max} が、30から70時間である、請求項1から14のいずれか一項に記載の系。

【請求項16】

(R)-ジヒドロエトルフィン又はその塩若しくは水和物、及びポリ(メタ)アクリレートを含む薬物含有層;並びに支持体層を含み、

好ましくは、(R)-ジヒドロエトルフィンが、遊離塩基の形態であり、

前記ポリ(メタ)アクリレートが、好ましくは、少なくとも2種のアルキル(メタ)アクリレートモノマーを含む、

請求項1から15のいずれか一項に記載の系。

【請求項17】

前記アルキル(メタ)アクリレートモノマーが、アルキル基において1から12個の炭素原子を含む、請求項16に記載の系。

【請求項18】

前記ポリ(メタ)アクリレートが、アルキルアクリレートモノマー及び/又はアルキルメタクリレートモノマーからなる、請求項16又は17に記載の系。

【請求項19】

前記薬物含有層が、皮膚浸透促進剤を含まない、請求項1から18のいずれか一項に記載の系。

【請求項20】

医学における使用のための、好ましくは疼痛の治療における使用のための、請求項1から19のいずれか一項に記載の系。

【請求項21】

ヒト対象における疼痛の治療のための医薬の製造のための、請求項1から19のいずれか一項に記載の系の使用。