

【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23年3月17日(2011.3.17)

【公表番号】特表2010-521525(P2010-521525A)

【公表日】平成22年6月24日(2010.6.24)

【年通号数】公開・登録公報2010-025

【出願番号】特願2009-554528(P2009-554528)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/70 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 9/70 4 0 1

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/34

【手続補正書】

【提出日】平成23年1月31日(2011.1.31)

【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】

a) バッキング層と、

b) 接着剤マトリックス層であって、前記接着剤マトリックス層中で実質的に非晶質形にある過飽和濃度の少なくとも1つの活性物質を含む、接着剤マトリックス層と、

c) 剥離ライナーとを含む経皮送達デバイス。

【請求項2】

前記活性物質が、オキシブチニンである請求項1に記載の経皮送達デバイス。

【請求項3】

前記活性物質が、ピロキシカム、フェンタニル、ナルトレキソン、スコポラミンおよびステロイドからなる群から選択される請求項1に記載の経皮送達デバイス。

【請求項4】

前記ステロイドが、エストロゲン類、プロゲストゲン類、テストステロン、ノルゲストレル、酢酸ノルエチンドロン、酢酸メドロキシプロゲステロン、レボノルゲストレル、およびノルエルゲストロミンからなる群から選択される請求項3に記載の経皮送達デバイス。

【請求項5】

前記活性物質が、前記接着剤マトリックスの約0.1質量%～約50質量%の量で存在している請求項1ないし4のいずれかに記載の経皮送達デバイス。

【請求項6】

前記活性物質が、前記接着剤マトリックスの約1質量%～約20質量%の量で存在している請求項1ないし5のいずれかに記載の経皮送達デバイス。

【請求項7】

前記活性物質の濃度が、前記接着剤マトリックス内の前記活性物質の溶解度の約0.1%～約10,000%超である請求項1ないし6のいずれかに記載の経皮送達デバイス。

【請求項8】

前記活性物質の濃度が、前記接着剤マトリックス内の前記活性物質の溶解度の約5%～約5,000%超である請求項1ないし7のいずれかに記載の経皮送達デバイス。

【請求項9】

前記バッキング層および前記剥離ライナーが、実質的に非晶質化誘導性であり、結晶化核もしくは結晶化種粒子を含んでいない請求項1ないし8のいずれかに記載の経皮送達デバイス。

【請求項10】

前記バッキング層が、ポリエステルフィルム、ポリエチレンフィルム、金属フィルム、金属化ポリエステルフィルム、ナイロンフィルム、ポリエステルに積層させたエチレンビニルアセテートフィルム、金属化ポリエステルに積層させたエチレンビニルアセテートフィルム、フッ化ポリビニリデンフィルム、シリコーンコーティングされたポリエステルフィルム、シリコーンコーティングされたポリオレフィンフィルム、およびシリコーンコーティングされたエチルビニルアセテートフィルムからなる群から選択される請求項1ないし9のいずれかに記載の経皮送達デバイス。

【請求項11】

前記剥離ライナーが、ポリエステルライナー、ポリウレタンライナー、シリコーンコーティングを備えるポリエステルライナー、シリコーンコーティングを備えるポリウレタンライナー、フルオロシリコーンコーティングを備えるポリエステルライナー、フルオロシリコーンコーティングを備えるポリウレタンライナー、シリコーンコーティングされたポリエステルライナー、シリコーンコーティングされたポリウレタンライナー、フルオロポリマーコーティングを備えるポリエステルライナー、およびフルオロポリマーコーティングを備えるポリウレタンライナーからなる群から選択される請求項1ないし10のいずれかに記載の経皮送達デバイス。

【請求項12】

前記バッキング層または前記剥離ライナーの少なくとも1つが、前記接着剤マトリックス層と同一サイズである請求項1ないし11のいずれかに記載の経皮送達デバイス。

【請求項13】

前記バッキング層または剥離ライナーが、前記接着剤マトリックス層より約0.1mm～約20mm大きい請求項1ないし12のいずれかに記載の経皮送達デバイス。

【請求項14】

前記接着剤マトリックス層が、ポリイソブチレン、ポリシロキサン、アクリル接着剤、天然および合成ゴム接着剤、ならびにそれらの混合物からなる群から選択される接着剤材料を含み、前記接着剤材料が、前記接着剤マトリックス層の約50質量%～約99質量%の量で存在している請求項1ないし13のいずれかに記載の経皮送達デバイス。

【請求項15】

前記接着剤マトリックス層が、透過強化剤、結晶成長阻害剤、粘着付与剤、粘着強化剤、可塑剤、および酸化防止剤からなる群から選択される1つ以上の添加物をさらに含み、該1つ以上の添加物が、前記接着剤マトリックスの約0.1質量%～約50質量%の量で存在している請求項1ないし14のいずれかに記載の経皮送達デバイス。

【請求項16】

前記接着剤マトリックス層が、ポリブテン類、鉱油類、およびポリシロキサン類からなる群から選択される1つ以上の粘着付与剤をさらに含む請求項1ないし15のいずれかに記載の経皮送達デバイス。

【請求項17】

前記接着剤マトリックス層が、コロイド状二酸化ケイ素、酸化亜鉛、ポリビニルピロリドン、ポリビニルピロリドン-c o -ビニルアセテート、アクリレートコポリマー、クロスポビドン、ベントナイト類、粘土類、エチルセルロースおよびそれらの混合物からなる群から選択される1つ以上の粘着強化剤をさらに含む請求項1ないし16のいずれかに記載の経皮送達デバイス。

【請求項18】

前記接着剤マトリックス層が、プロピレングリコール、ブチレングリコール、ジプロピレングリコール、ジエチレングリコール、プロピルパルミテート、イソプロピルパルミート、プロピルミリストート、ペンダデカノール、オクタデカノール、プロピレングリコールモノエステル類、ポリエチレングリコールモノエステル類およびグリセロールモノエステル類からなる群から選択される1つ以上の流束強化剤をさらに含む請求項1ないし17のいずれかに記載の経皮送達デバイス。

【請求項19】

薬物放出調節膜層およびリザーバ層をさらに含み、  
前記薬物放出調節膜層および前記リザーバ層のうちの少なくとも1つが前記活性物質を含有する請求項1ないし18のいずれかに記載の経皮送達デバイス。

【請求項20】

前記バッキング層と連絡しているオーバーレイ層をさらに含む請求項1ないし19のいずれかに記載の経皮送達デバイス。

【請求項21】

前記オーバーレイ層が、前記バッキング層より大きい請求項1ないし20のいずれかに記載の経皮送達デバイス。

【請求項22】

過飽和していて非晶質形で存在する少なくとも1つの活性物質を含有する接着剤マトリックスを調製する方法であって、

a) 接着剤マトリックス溶液中で亜飽和濃度にある前記少なくとも1つの活性物質を提供できる量で、溶媒中に前記少なくとも1つの活性物質および接着剤材料を溶解させる工程と、

b) 前記接着剤マトリックス溶液中の前記亜飽和活性物質を剥離ライナーおよびバッキング層の1つへキャスティングする工程と、

c) 前記少なくとも1つの活性物質が過飽和濃度にある乾燥接着剤マトリックスを形成するために、前記少なくとも1つの活性物質の融点、融点より低い、または融点より高い温度で前記溶媒を除去する工程と、

d) 前記乾燥接着剤マトリックス内の前記過飽和活性物質が前記剥離ライナーおよび前記バッキング層の間にあるように、前記乾燥接着剤マトリックス内の前記過飽和活性物質へ前記剥離ライナーおよび前記バッキングフィルムの他方を積層させる工程とを含む方法。

【請求項23】

前記少なくとも1つの活性物質が、オキシブチニン、ピロキシカム、フェンタニル、ナルトレキソン、スコポラミン、および1つのステロイドからなる群から選択される請求項22に記載の経皮送達デバイス。

【請求項24】

前記剥離ライナーおよび前記バッキング層が、非晶質化誘導性であり、結晶化核もしくは結晶化種粒子を含んでいない請求項22または23に記載の方法。

【請求項25】

前記接着剤マトリックス内の前記過飽和活性物質が、前記乾燥接着剤マトリックス内の液体もしくは固体粒子として分散している1つ以上の添加物をさらに含み、

前記1つ以上の添加物が、透過強化剤、結晶成長阻害剤、粘着付与剤、粘着強化剤、可塑剤、および酸化防止剤からなる群から選択され、

前記1つ以上の添加物が、前記接着剤マトリックスの約1質量%～約50質量%の量で存在している請求項22ないし24のいずれかに記載の方法。

【請求項26】

前記1つ以上の接着剤が、前記接着剤マトリックスの約2質量%～約25質量%の量で存在している請求項22ないし25のいずれかに記載の方法。

【請求項27】

前記溶媒が、前記活性物質および前記接着剤を溶解させるために必要な量の約1%～約

200%超の量で存在しており、

前記溶媒が、ヘプタン、酢酸エチル、トルエン、キシレン、エタノールおよびイソプロパノールからなる群から選択される請求項22ないし26のいずれかに記載の方法。

【請求項28】

過飽和として非晶質形で存在する少なくとも1つの活性物質を含有する接着剤マトリックスを調製する方法であって、

a) 前記少なくとも1つの活性物質を接着剤マトリックスと過飽和濃度で混合する工程と、

b) ホットメルトを作成するために、前記接着剤マトリックス内の前記過飽和濃度の少なくとも1つの活性物質を、前記少なくとも1つの活性物質が完全に溶解されて前記接着剤マトリックス内に一様に分散することを可能にする温度へ加熱する工程と、

c) 前記ホットメルトを規定温度で剥離ライナーおよびバッキング層の1つへキャスティングする工程と、

d) 前記ホットメルトが前記剥離ライナーおよび前記バッキング層の間にあるように、前記剥離ライナーおよび前記バッキング層の他方を前記ホットメルトへ積層させる工程とを含む方法。

【請求項29】

前記少なくとも1つの活性物質が、オキシブチニン、ピロキシカム、フェンタニル、ナルトレキソン、スコポラミン、または1つのステロイドからなる群から選択され、

前記活性物質が、前記接着剤マトリックス層の約0.1質量%～約50質量%の量で存在している請求項28に記載の方法。

【請求項30】

前記剥離ライナーおよび前記バッキング層が、非晶質化誘導性であり、結晶化核もしくは結晶化種粒子を含んでいない請求項28または29に記載の方法。

【請求項31】

前記過飽和濃度の少なくとも1つの活性物質が、前記乾燥した接着剤マトリックス内に液体もしくは固体粒子として分散している1つ以上の添加物をさらに含み、

前記1つ以上の添加物が、透過強化剤、結晶成長阻害剤、粘着付与剤、粘着強化剤、可塑剤、および酸化防止剤からなる群から選択され、

前記1つ以上の添加物が、前記接着剤マトリックス層の約1質量%～約50質量%の量で存在している請求項28ないし30のいずれかに記載の方法。

【請求項32】

前記1つ以上の接着剤が、前記接着剤マトリックス層の約2質量%～約25質量%の量で存在している請求項28ないし31のいずれかに記載の方法。

【請求項33】

前記溶媒が、前記活性物質および前記接着剤を溶解させるために必要な量の約1%～約200%超の量で存在しており、

前記溶媒が、ヘプタン、酢酸エチル、トルエン、キシレン、エタノールおよびイソプロパノールからなる群から選択される請求項28ないし32のいずれかに記載の方法。

【請求項34】

結晶化核を取り除き、バッキング層と、接着剤マトリックス層中で実質的に非晶質形にある過飽和濃度の活性物質を有する接着剤マトリックス層と、剥離ライナーとを有する経皮薬物送達デバイスの、好ましい内部接着剤マトリックス環境を再確立する方法であって、前記経皮送達デバイスを硬化させる工程を含む方法。

【請求項35】

前記活性物質が、オキシブチニン、ピロキシカム、フェンタニル、ナルトレキソン、スコポラミン、および1つのステロイドからなる群から選択される請求項34に記載の方法。

【請求項36】

前記硬化させる工程が、前記経皮送達デバイスを、前記活性物質が完全に溶解する温度

へ加熱する工程を含む請求項3 4 または 3 5に記載の方法。

【請求項 3 7】

前記硬化させる工程が、前記経皮送達デバイスを、前記活性物質の融点の約 20 超の温度へ加熱する工程を含み、前記硬化させる工程が、約 1 秒間～約 10 分間の範囲内の期間実施される請求項3 4 ないし 3 6のいずれかに記載の方法。

【請求項 3 8】

前記硬化させる工程が、前記デバイスにオープンの赤外線ビームを受けさせる工程を含む請求項3 4 ないし 3 7のいずれかに記載の方法。

【請求項 3 9】

バッキング層と、接着剤マトリックス内で実質的に非晶質形にある過飽和濃度の少なくとも 1 つの活性物質を含む接着剤マトリックス層と、剥離ライナーと、を有する経皮送達デバイスを貯蔵および保護する方法であって、前記方法は前記経皮送達デバイスをパウチ内に包装する工程を含む方法。

【請求項 4 0】

前記パウチが、紙、ポリマーフィルム、金属箔、またはそれらの組み合わせから構成される請求項3 9に記載の方法。

【請求項 4 1】

前記パウチが、前記剥離ライナーと同一サイズであるか、または、前記剥離ライナーより大きい請求項3 9 または 4 0に記載の方法。

【請求項 4 2】

前記パウチが、前記剥離ライナーより約 0.1 mm～約 20 mm 大きい請求項3 9 ないし 4 1のいずれかに記載の方法。