

【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24年12月6日 (2012.12.6)

【公開番号】特開2012-21024(P2012-21024A)

【公開日】平成24年2月2日 (2012.2.2)

【年通号数】公開・登録公報2012-005

【出願番号】特願2011-221108(P2011-221108)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/44 (2006.01)

A 6 1 K 47/42 (2006.01)

A 6 1 K 47/48 (2006.01)

A 6 1 P 25/30 (2006.01)

A 6 1 P 25/36 (2006.01)

A 6 1 K 31/485 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/44

A 6 1 K 47/42

A 6 1 K 47/48

A 6 1 P 25/30

A 6 1 P 25/36

A 6 1 K 31/485

A 6 1 P 25/04

【手続補正書】

【提出日】平成24年10月22日 (2012.10.22)

【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】

乱用抵抗性の医薬組成物であって、

(i) ポリマー部分と、全マトリックス組成物重量に対して 2 ～ 50 % の 8 個 ～ 20 個の炭素原子を有する脂肪族アルコールとから本質的になるポリマーマトリックス組成物と、

(i i) 水に不溶性の制御放表面コーティングが施された乱用可能な活性成分の複数の粒子であって、該粒子が前記ポリマーマトリックスに化学結合されることにより、該乱用

可能な活性成分はポリマーマトリックスから即時放出できない、複数の粒子と、を備え、前記医薬組成物は前記乱用可能な活性成分のアンタゴニストを含まない、乱用抵抗性医薬組成物。

【請求項 2】

前記脂肪族アルコールは脂肪酸アルコールである請求項 1 に記載の乱用抵抗性医薬組成物。

【請求項 3】

前記脂肪酸アルコールはセチルアルコール、ステアリルアルコールおよびそれらの組み合わせから選択される請求項 2 に記載の乱用抵抗性医薬組成物。

【請求項 4】

前記マトリックス材料が、胆汁酸塩およびリパーゼの存在下で侵食性である、請求項 1 に記載の乱用抵抗性組成物。

【請求項 5】

前記水溶性活性成分がオピオイド鎮痛薬である請求項 2 に記載の乱用抵抗性組成物。

【請求項 6】

前記オピオイド鎮痛薬は、ヒドロモルフォン、オキシコドン、ヒドロキシコドン、プロボキシフェン、メサドン、チリジン、ブトルファノール、ブプレノルフィン、レボルファノール、コデイン、オキシモルフォン、メペリジン、およびジヒドロコデイノンから選択される請求項 1 に記載の乱用抵抗性組成物。

【請求項 7】

前記ポリマー部分が、エチルセルロース、酢酸セルロース、酢酸ビニル/塩化ビニルコポリマー、アクリレート/メタクリレートコポリマー、ポリエチレンオキシド、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、トリグリセリド、水素化植物油、トリグリセリドポリアルコキシアルキルエステル、脂肪、水素化された綿実油ワックス、部分的に水素化したダイズ油、カルナウバ・ワックス、水に不溶性の部分的に分解されたタンパク質、およびこれらの混合物から選択される請求項 1 に記載の乱用抵抗性組成物。

【請求項 8】

複数のミクロスフェアを含む、乱用抵抗性の放出制御型医薬組成物であって、各ミクロスフェアは、

ヒドロコドン、ヒドロキシコドン、ヒドロモルフォン、オキシコドン、プロボキシフェン、メサドン、コデイン、オキシモルフォン、およびジヒドロコデイノン、ならびにそれらの薬学的に許容可能な塩からなる群から選択された医薬として有効な量のオピオイドアゴニストを含む複数の粒子と、

多型ワックス、カルナウバ・ワックス、キサンタン・ガム、およびペクチンからなる群から選択された水に不溶性のマトリックス材料と
を含み、

前記放出制御型医薬組成物の破碎、圧縮、割砕、タンブリング、ローリング、または粉碎により、前記オピオイドアゴニストの水への溶解が、インビトロの溶解試験の最初の 1 時間において、医薬組成物中の医薬として有効なオピオイドアゴニストの全体量の 15 % 未満しか増大せず、

前記医薬組成物は乱用可能なオピオイドのアンタゴニストを含まない、乱用抵抗性医薬組成物。

【請求項 9】

乱用の可能性が低減された請求項 8 に記載の乱用抵抗性医薬組成物の調製方法であって

(a) ヒドロコドン、ヒドロキシコドン、ヒドロモルフォン、オキシコドン、プロボキシフェン、メサドン、コデイン、オキシモルフォン、およびジヒドロコデイノンからなる群から選択された医薬として有効な量のオピオイドアゴニストを含む複数の粒子を提供する工程と、

(b) 前記複数の粒子と、多型ワックス、カルナウバ・ワックス、キサンタン・ガム、

およびペクチンからなる群から選択された水に不溶性のマトリックス材料とを含む混合物に圧力を加え、表面がコーティングされた粒子を得る工程と、

(c) 応力を加えても水性環境における前記オピオイド・アゴニストの即時放出を増大させない医薬組成物に、前記表面がコーティングされた粒子を組み込む工程、
からなる方法。