

【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18年1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2005-500299(P2005-500299A)

【公表日】平成17年1月6日(2005.1.6)

【年通号数】公開・登録公報2005-001

【出願番号】特願2003-504976(P2003-504976)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/70 (2006.01)

A 6 1 K 31/403 (2006.01)

A 6 1 K 31/56 (2006.01)

A 6 1 K 31/5685 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 P 5/26 (2006.01)

A 6 1 P 5/30 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 9/70 4 0 1

A 6 1 K 9/70

A 6 1 K 31/403

A 6 1 K 31/56

A 6 1 K 31/5685

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/34

A 6 1 P 5/26

A 6 1 P 5/30

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 43/00 1 2 3

【手続補正書】

【提出日】平成17年6月20日(2005.6.20)

【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】

以下を含む混合物から得られる経皮送達組成物：

親ドラッグ及びプロドラッグを含む治療上有効な量の医薬；及び

薬剤として受容可能な担体、ここで、親ドラッグとプロドラッグは個別に薬理学的な作

用に関して十分な量で存在する。

【請求項 2】

組成物が、薬理的に等価な量の親ドラッグ又はプロドラッグを単独で有する同一の組成物より早いか又は遅い浸透速度を有する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

組成物が、薬理的に等価な量の親ドラッグ又はプロドラッグを単独で有する同一の組成物より長いか又は短い治療作用の発現を有する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 4】

組成物が、薬理的に等価な量の親ドラッグを単独で有する組成物より長いか又は短い治療作用の期間を有する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 5】

プロドラッグが親ドラッグより親油性であり、かつプロドラッグが皮膚を通過するより大きい浸透速度を有する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 6】

親ドラッグがステロイドでありかつプロドラッグが治療活性なステロイドの原料を提供するステロイド誘導体であり、ここでステロイドとステロイド誘導体が 10 : 1 ~ 1 : 10 のステロイド : ステロイド誘導体の質量 / 質量比率で存在する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 7】

ステロイドの誘導体がステロイドエステルである、請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 8】

ステロイドが一又は複数のプロゲスチンを含む、請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 9】

ステロイドが一又は複数のタンパク同化ステロイド及びアンドロゲンステロイドを含む、請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 10】

親ドラッグがステロイドでありかつプロドラッグがステロイドであって 3、11 又は 17 位における遊離のヒドロキシがアルコール成分と反応しているものである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 11】

組み合わせた親ドラッグとプロドラッグの融点が親ドラッグ又はプロドラッグ単独の融点のいずれより低い、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 12】

親ドラッグがノルエチンドロンでありかつプロドラッグがノルエチンドロンアセテートであり、ノルエチンドロンアセテート : ノルエチンドロンの質量比率が 1 に等しいか又はそれより大きい、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 13】

さらに追加のステロイドを含む、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 14】

追加のステロイドがエストラジオールである、請求項 11 に記載の組成物。

【請求項 15】

親ドラッグがエストラジオールでありかつプロドラッグがエストラジオール 17 - エナシテートである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 16】

親ドラッグが ACE 阻害剤である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 17】

ACE 阻害剤がラミプリル (ramipril) であり、プロドラッグが一又は複数のラミプリルエチルエステル及びラミプリルメチルエステルである、請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 18】

ラミプリル : ラミプリルエチルエステルの質量比が 1 : 1 ~ 1 : 5 である、請求項 17

に記載の組成物。

【請求項 19】

ラミプリル：ラミプリルメチルエステルの質量比が 2 : 1 ~ 1 : 9 である、請求項 17 に記載の組成物。

【請求項 20】

担体が 2 又はそれより多いポリマーを含む感圧接着剤を含み、かつ医薬の浸透が 2 又はそれより多いポリマーの型の変化及び / 又は比率の変化によって調整される、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 21】

以下を含む経皮医薬送達組成物からの血中濃度プロファイル又は浸透を調整する方法：

- (a) 親ドラッグ及びプロドラッグを選択する過程；
- (b) 少なくとも一つの感圧接着剤を含む担体において親ドラッグとプロドラッグを組み合わせる過程；
- (c) 医薬の浸透及び / 又は血中濃度プロファイルを測定する過程；
- (d) 以下の少なくとも一つを調整する過程：(i) プロドラッグの選択；(ii) 親ドラッグとプロドラッグの相対濃度；及び(iii) 親ドラッグとプロドラッグの全濃度。

【請求項 22】

少なくとも一つの感圧接着剤が二つの感圧接着剤を含み、調整過程(d)がさらに以下を含む、請求項 15 に記載の方法：(iv) 二つの感圧接着剤の型及び / 又は比率を調整する過程。

【請求項 23】

以下の組合せを含む薬剤として受容可能な担体中の医薬を投与することを含む、医薬の経皮送達を強化する方法：

治療上有効な量の少なくとも一つのステロイド；及び

治療活性のあるステロイドの原料を提供する対応するステロイド誘導体、ここで、ステロイド及び対応するステロイド誘導体は 10 : 1 ~ 1 : 10 のステロイド：対応するステロイド誘導体の質量 / 質量比率で存在する。

【請求項 24】

感圧接着担体組成物中で 2 又はそれより多いステロイドの対応する誘導体と組み合わせることを含む、経皮ドラッグデリバリーシステムにおけるステロイドの結晶形成を抑制する方法。