

【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 2 年 8 月 27 日 (2020.8.27)

【公表番号】特表 2019-525932 (P2019-525932A)

【公表日】令和 1 年 9 月 12 日 (2019.9.12)

【年通号数】公開・登録公報 2019-037

【出願番号】特願 2019-504000 (P2019-504000)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/16 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/04 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2017.01)

A 6 1 K 9/70 (2006.01)

A 6 1 K 31/445 (2006.01)

A 6 1 K 31/13 (2006.01)

A 6 1 K 31/4468 (2006.01)

A 6 1 K 31/216 (2006.01)

A 6 1 K 31/381 (2006.01)

A 6 1 K 31/4045 (2006.01)

A 6 1 K 31/27 (2006.01)

A 6 1 K 31/18 (2006.01)

A 6 1 K 31/4458 (2006.01)

A 6 1 K 31/485 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 13/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/36 (2006.01)

A 6 1 P 25/02 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 9/00

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 47/16

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/04

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 9/70 4 0 5

| | | |
|---------|---------|-------|
| A 6 1 K | 31/445 | |
| A 6 1 K | 31/13 | |
| A 6 1 K | 31/4468 | |
| A 6 1 K | 31/216 | |
| A 6 1 K | 31/381 | |
| A 6 1 K | 31/4045 | |
| A 6 1 K | 31/27 | |
| A 6 1 K | 31/18 | |
| A 6 1 K | 31/4458 | |
| A 6 1 K | 31/485 | |
| A 6 1 P | 25/28 | |
| A 6 1 P | 25/16 | |
| A 6 1 P | 25/00 | |
| A 6 1 P | 25/14 | |
| A 6 1 P | 25/24 | |
| A 6 1 P | 25/22 | |
| A 6 1 P | 13/08 | |
| A 6 1 P | 13/02 | |
| A 6 1 P | 25/36 | |
| A 6 1 P | 25/02 | 1 0 1 |

【手続補正書】**【提出日】** 令和2年7月20日 (2020.7.20)**【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】**

アミン塩形態の活性剤および両性無機塩基化合物を含む薬物リザーバを含む、経皮送達のための組成物であって、
前記両性無機塩基化合物の pK_a が、前記アミン塩形態の前記活性剤のものよりも低い、組成物。

【請求項 2】

粘着剤、アミン塩形態の活性剤、および両性無機塩基化合物を含む、経皮送達のための組成物であって、
前記両性無機塩基化合物の pK_a が、前記アミン塩形態の前記活性剤のものよりも低い、組成物。

【請求項 3】

前記両性無機塩基化合物が、炭酸水素ナトリウムである、請求項 1 または請求項 2 に記載の組成物。

【請求項 4】

前記活性剤が、ドネペジル、メマンチン、フェンタニル、オキシブチニン、ロチゴチン、ロピニロール、リバスチグミン、タムスロシン、メチルフェニデート、またはブプレノルフィンである、請求項 1 から 3 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 5】

前記粘着剤マトリックスが、約 5 ~ 35 % w / w の前記活性剤を含む、請求項 1 から 4 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 6】

約 0.5 ~ 35 % w / w の前記炭酸水素ナトリウムを含む、請求項 3 から 5 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 7】

水、アルコール、グリセロール、プロピレングリコール、エチレングリコール、ジメチルスルホキシド、および N - メチルピロリドンからなる群から選択される塩形態可溶化剤をさらに含む、請求項 1 から 6 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 8】

15 % w / w までの前記塩形態可溶化剤を含む、請求項 7 に記載の組成物。

【請求項 9】

脂肪酸エステル、ジカルボン酸エステル、グリセロールエステル、ラクテート、脂肪アルコール、ソルビタンモノラウレート、ソルビタンモノオレエート、乳酸ラウリル、プロピレングリコールモノラウレート、コハク酸ジメチル、ラウリルアルコール、およびオレイルアルコールからなる群から選択される中性形態可溶化剤をさらに含む、請求項 1 から 8 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 10】

20 % w / w までの前記中性形態可溶化剤を含む、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 11】

ジカルボン酸エステル、アジピン酸エステル、セバシン酸エステル、マレイン酸エステル、トリカルボン酸エステル、クエン酸トリエチル、クエン酸トリブチル、グリセロールエステル、およびトリアセチンからなる群から選択される可塑剤をさらに含む、請求項 1 から 10 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 12】

20 % w / w までの前記可塑剤を含む、請求項 11 に記載の組成物。

【請求項 13】

クロスボリドンおよびコロイド状二酸化ケイ素からなる群から選択される添加剤をさらに含む、請求項 1 から 12 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 14】

前記組成物が、25 % w / w までの前記添加剤を含む、請求項 13 に記載の組成物。

【請求項 15】

アクリレート、ポリイソブチレン、シリコーン粘着剤、およびスチレンブロックコポリマー系粘着剤からなる群から選択される粘着剤を含む、請求項 1 から 14 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 16】

前記粘着剤が、前記組成物の 65 % w / w までを構成する、請求項 15 に記載の組成物。

【請求項 17】

第 1 の薬物リザーバとして請求項 1 から 16 のいずれか一項に記載の組成物と、バックキング層とを含む経皮パッチ。

【請求項 18】

前記バックキング層が、閉塞性ポリマーフィルムである、請求項 17 に記載の経皮パッチ。

【請求項 19】

アクリレート、ポリイソブチレン、シリコーン粘着剤、およびスチレンブロックコポリマー系粘着剤からなる群から選択される粘着剤から構成される接触用粘着剤層をさらに含む、請求項 17 または請求項 18 に記載の経皮パッチ。

【請求項 20】

前記薬物リザーバと前記接触用粘着剤層との間に、不織タイ層をさらに含む、請求項 17 から 19 のいずれかに記載の経皮パッチ。

【請求項 21】

前記薬物リザーバと前記接触用粘着剤層との間に、速度制御膜をさらに含む、請求項 1

7 から 20 のいずれかに記載の経皮パッチ。

【請求項 22】

前記パッチが、請求項 1 から 15 のいずれかに記載の組成物から構成される第 2 の薬物リザーバを含む、請求項 17 から 21 のいずれかに記載の経皮パッチ。

【請求項 23】

前記第 1 の薬物リザーバおよび第 2 の薬物リザーバが、不織タイ層によって分離されている、請求項 22 に記載の経皮パッチ。

【請求項 24】

前記第 1 の薬物リザーバおよび第 2 の薬物リザーバが、速度制御膜によって分離されている、請求項 22 または請求項 23 に記載の経皮パッチ。

【請求項 25】

活性剤を経皮投与することを必要とする患者に対して活性剤を経皮投与するための、請求項 1 から 16 のいずれかに記載の組成物または請求項 17 から 24 のいずれかに記載の経皮パッチ。

【請求項 26】

患者におけるアルツハイマー病、パーキンソン病、下肢静止不能症候群、注意欠陥多動性障害、ナルコレプシー、うつ病、不安障害、強迫性障害、良性前立腺肥大症、急性尿閉、オピオイド依存、オピオイド非耐性個体における中等度急性疼痛、または中等度慢性疼痛を処置するための、請求項 1 から 16 のいずれかに記載の組成物または請求項 17 から 24 のいずれかに記載の経皮パッチ。

【請求項 27】

前記組成物または経皮パッチが、前記患者の皮膚に対してさらに投与されることまたはそれが投与されるようにさらに指示されることを特徴とする、請求項 25 または 26 に記載の組成物または経皮パッチ。

【請求項 28】

前記投与が、前記活性剤の治療有効血中濃度を達成する、請求項 25 から 27 のいずれかに記載の組成物または経皮パッチ。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0139

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0139】

本明細書において言及されるすべての特許、特許出願、特許公開、および他の刊行物は、それらの全体がここに参照により援用される。特許、出願、または刊行物が特別な定義を含んでいる場合、別途指示のない限り、それらの定義は、それらが見出される援用される特許、出願、または刊行物に対して当てはまるものであり、本出願に対して当てはまるものではないことが理解されるべきである。

本発明は、例えば、以下の項目を提供する。

(項目 1)

アミン塩形態の活性剤および両性無機塩基化合物を含む薬物リザーバを含む、経皮送達のための組成物であって、

前記両性無機塩基化合物の pK_a が、前記アミン塩形態の前記活性剤のものよりも低い、組成物。

(項目 2)

粘着剤、アミン塩形態の活性剤、および両性無機塩基化合物を含む、経皮送達のための組成物であって、

前記両性無機塩基化合物の pK_a が、前記アミン塩形態の前記活性剤のものよりも低い、

組成物。

(項目 3)

前記両性無機塩基化合物が、炭酸水素ナトリウムである、項目 1 または項目 2 に記載の組成物。

(項目 4)

前記活性剤が、ドネペジル、メマンチン、フェンタニル、オキシブチニン、ロチゴチン、ロビニロール、リバスチグミン、タムスロシン、メチルフェニデート、またはブプレノルフィンである、項目 1 から 3 のいずれかに記載の組成物。

(項目 5)

前記粘着剤マトリックスが、約 5 ~ 35 % w / w の前記活性剤を含む、先行する項目のいずれかに記載の組成物。

(項目 6)

約 0.5 ~ 35 % w / w の前記炭酸水素ナトリウムを含む、先行する項目のいずれかに記載の組成物。

(項目 7)

水、アルコール、グリセロール、プロピレングリコール、エチレングリコール、ジメチルスルホキシド、および N - メチルピロリドンからなる群から選択される塩形態可溶化剤をさらに含む、先行する項目のいずれかに記載の組成物。

(項目 8)

15 % w / w までの前記塩形態可溶化剤を含む、項目 7 に記載の組成物。

(項目 9)

脂肪酸エステル、ジカルボン酸エステル、グリセロールエステル、ラクテート、脂肪アルコール、ソルビタンモノラウレート、ソルビタンモノオレエート、乳酸ラウリル、プロピレングリコールモノラウレート、コハク酸ジメチル、ラウリルアルコール、およびオレイルアルコールからなる群から選択される中性形態可溶化剤をさらに含む、先行する項目のいずれかに記載の組成物。

(項目 10)

20 % w / w までの前記中性形態可溶化剤を含む、項目 9 に記載の組成物。

(項目 11)

ジカルボン酸エステル、アジピン酸エステル、セバシン酸エステル、マレイン酸エステル、トリカルボン酸エステル、クエン酸トリエチル、クエン酸トリブチル、グリセロールエステル、およびトリアセチンからなる群から選択される可塑剤をさらに含む、先行する項目のいずれかに記載の組成物。

(項目 12)

20 % w / w までの前記可塑剤を含む、項目 11 に記載の組成物。

(項目 13)

クロスポビドンおよびコロイド状二酸化ケイ素からなる群から選択される添加剤をさらに含む、先行する項目のいずれかに記載の組成物。

(項目 14)

前記組成物が、25 % w / w までの前記添加剤を含む、項目 13 に記載の組成物。

(項目 15)

アクリレート、ポリイソブチレン、シリコーン粘着剤、およびスチレンブロックコポリマー系粘着剤からなる群から選択される粘着剤を含む、先行する項目のいずれかに記載の組成物。

(項目 16)

前記粘着剤が、前記組成物の 65 % w / w までを構成する、項目 15 に記載の組成物。

(項目 17)

第 1 の薬物リザーバとしての先行する項目のいずれか一項に記載の組成物と、バッキング層とを含む経皮パッチ。

(項目 18)

前記バックング層が、閉塞性ポリマーフィルムである、項目 17 に記載の経皮パッチ。
(項目 19)

アクリレート、ポリイソブチレン、シリコーン粘着剤、およびスチレンブロックコポリマー系粘着剤からなる群から選択される粘着剤から構成される接触用粘着剤層をさらに含む、項目 17 または項目 18 に記載の経皮パッチ。

(項目 20)

前記薬物リザーバと前記接触用粘着剤層との間に、不織タイ層をさらに含む、項目 17 から 19 のいずれかに記載の経皮パッチ。

(項目 21)

前記薬物リザーバと前記接触用粘着剤層との間に、速度制御膜をさらに含む、項目 17 から 20 のいずれかに記載の経皮パッチ。

(項目 22)

前記パッチが、項目 1 から 15 のいずれかに記載の組成物から構成される第 2 の薬物リザーバを含む、項目 17 から 21 のいずれかに記載の経皮パッチ。

(項目 23)

前記第 1 の薬物リザーバおよび第 2 の薬物リザーバが、不織タイ層によって分離されている、項目 22 に記載の経皮パッチ。

(項目 24)

前記第 1 の薬物リザーバおよび第 2 の薬物リザーバが、速度制御膜によって分離されている、項目 22 または項目 23 に記載の経皮パッチ。

(項目 25)

活性剤を経皮投与することを必要とする患者に対して活性剤を経皮投与する方法であって、それを必要とする患者に対して、項目 1 から 16 のいずれかに記載の組成物または項目 17 から 24 のいずれかに記載の経皮パッチを提供することを含む、方法。

(項目 26)

アルツハイマー病、パーキンソン病、下肢静止不能症候群、注意欠陥多動性障害、ナルコレプシー、うつ病、不安障害、強迫性障害、良性前立腺肥大症、急性尿閉、オピオイド依存、オピオイド非耐性個体における中等度急性疼痛、または中等度慢性疼痛を処置するための方法であって、それを必要とする患者に対して、項目 1 から 16 のいずれかに記載の組成物または項目 17 から 24 のいずれかに記載の経皮パッチを提供することを含む、方法。

(項目 27)

前記患者の皮膚に対して、前記組成物または経皮パッチを投与することまたはそれを投与するように指示することをさらに含む、項目 25 または 26 に記載の方法。

(項目 28)

前記投与することが、前記活性剤の治療有効血中濃度を達成する、項目 25 から 27 のいずれかに記載の方法。