

【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27年4月9日 (2015.4.9)

【公表番号】特表2014-505736(P2014-505736A)

【公表日】平成26年3月6日 (2014.3.6)

【年通号数】公開・登録公報2014-012

【出願番号】特願2013-554661(P2013-554661)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/485 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 K 31/522 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/485

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/18

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 31/522

【手続補正書】

【提出日】平成27年2月16日 (2015.2.16)

【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) 1 つまたは複数の乱用性薬物、および

(b) 1 つまたは複数の乱用抑止構成成分であって、各乱用抑止構成成分は、

(i) 1 つまたは複数の粘度上昇剤

(i i) 1 つまたは複数のアルカリ化剤、および

(i i i) 任意選択でコーティング

を含む、乱用抑止構成成分

を含む乱用抵抗性薬学的処方物であって、該 1 つまたは複数の乱用抑止構成成分は、該処方物からの該 1 つまたは複数の乱用性薬物の水性またはアルコール性液体による抽出を、遅くするか、低減させるか、または遅くし、かつ低減させ、

該乱用抑止構成成分中のアルカリ化剤の総量が、該乱用抑止構成成分中の粘度上昇剤の

総量に対して約 40 : 60 w / w から約 80 : 20 w / w の比にあり、

該粘度上昇剤は、ポリアクリル酸、ポリアルコールのアリルエーテルで架橋したアクリル酸、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース：ヒドロキシプロピルセルロース混合物、ポリビニルピロリドン、ポリエチレンオキシド、メチルセルロース、キサンタンガム、グアーガム、ポリエチレングリコール、メタクリル酸コポリマー、コロイド状二酸化ケイ素、セルロースガム、デンプン、デンプングリコール酸ナトリウム、アルギン酸ナトリウム、およびこれらの組合せからなる群より選択される、

乱用抵抗性薬学的処方物。

【請求項 2】

前記 1 つまたは複数の乱用性薬物が、1 つまたは複数の水溶性の乱用性薬物を含む、請求項 1 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

【請求項 3】

前記 1 つまたは複数の乱用性薬物が、1 つまたは複数のオピオイドを含む、請求項 1 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

【請求項 4】

前記 1 つまたは複数のオピオイドが、モルヒネおよびオキシコドンを含む、請求項 3 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

【請求項 5】

前記 1 つまたは複数の乱用抑止構成成分が、ペレット、ビーズ、ビーズレット、顆粒、粉末、またはこれらの組合せからなる群より選択される形態にある、請求項 1 に記載の乱用抵抗性処方物。

【請求項 6】

前記処方物中の乱用抑止構成成分の総量が、前記処方物の残りに対して約 1 : 1 w / w から約 1 : 5 w / w の比にある、請求項 1 に記載の乱用抵抗性処方物。

【請求項 7】

前記処方物中の 1 つまたは複数の粘度上昇剤の総量が、前記処方物中の乱用性薬物の総量に対して約 1 : 1 w / w から約 1 : 10 w / w の比にある、請求項 1 に記載の乱用抵抗性処方物。

【請求項 8】

前記 1 つまたは複数の粘度上昇剤が、ポリアルコールのアリルエーテルで架橋されたアクリル酸である、請求項 1 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

【請求項 9】

前記ポリアルコールのアリルエーテルで架橋されたアクリル酸がカルボマーである、請求項 8 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

【請求項 10】

前記コーティングが、メタクリル酸コポリマー分散物、酢酸コハク酸ヒプロメロース、および酢酸フタル酸セルロースを含む、請求項 1 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

【請求項 11】

前記 1 つまたは複数のアルカリ化剤が、ポリプラスドン XL、タルク、メグルミン、 NaHCO_3 、およびポリビニルピロリドンからなる群より選択される、請求項 1 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

【請求項 12】

前記 1 つまたは複数のアルカリ化剤がメグルミンを含む、請求項 11 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

【請求項 13】

前記 1 つまたは複数のアルカリ化剤が、ペレット、ビーズ、ビーズレット、顆粒、粉末、またはこれらの組合せからなる群より選択される形態にある、請求項 11 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

【請求項 14】

可塑剤をさらに含む、請求項 1 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

【請求項 15】

即時放出性、制御放出性、またはこれらの組合せである、請求項 1 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

【請求項 16】

前記乱用抑止構成成分中のアルカリ化剤の総量が、該乱用抑止構成成分中の粘度上昇剤の総量に対して約 60 : 40 w / w から約 70 : 30 w / w の比にある、請求項 1 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

【請求項 17】

乱用性薬物を含む薬学的処方物から水性またはアルコール性液体により抽出することのできる該乱用性薬物の量を低減させる方法であって、該乱用性薬物と 1 つまたは複数の乱用抑止構成成分とを混合するステップを含み、各乱用抑止構成成分は、(a) 1 つまたは複数の粘度上昇剤、(b) 1 つまたは複数のアルカリ化剤、および (c) 任意選択でコーティングを含み、

該乱用抑止構成成分中のアルカリ化剤の総量が、該乱用抑止構成成分中の粘度上昇剤の総量に対して約 40 : 60 w / w から約 80 : 20 w / w の比にあり、

該粘度上昇剤は、ポリアクリル酸、ポリアルコールのアリルエーテルで架橋したアクリル酸、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース：ヒドロキシプロピルセルロース混合物、ポリビニルピロリドン、ポリエチレンオキシド、メチルセルロース、キサンタンガム、グアーガム、ポリエチレングリコール、メタクリル酸コポリマー、コロイド状二酸化ケイ素、セルロースガム、デンプン、デンプングリコール酸ナトリウム、アルギン酸ナトリウム、およびこれらの組合せからなる群より選択される、方法

。

【請求項 18】

乱用性薬物を含む薬学的処方物から水性またはアルコール性液体により該乱用性薬物を抽出し得る速度を低減させる方法であって、該乱用性薬物と 1 つまたは複数の乱用抑止構成成分とを混合するステップを含み、各乱用抑止構成成分は、(i) 1 つまたは複数の粘度上昇剤、(i i) 1 つまたは複数のアルカリ化剤、および (i i i) 任意選択でコーティングを含み、

該乱用抑止構成成分中のアルカリ化剤の総量が、該乱用抑止構成成分中の粘度上昇剤の総量に対して約 40 : 60 w / w から約 80 : 20 w / w の比にあり、

該粘度上昇剤は、ポリアクリル酸、ポリアルコールのアリルエーテルで架橋したアクリル酸、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース：ヒドロキシプロピルセルロース混合物、ポリビニルピロリドン、ポリエチレンオキシド、メチルセルロース、キサンタンガム、グアーガム、ポリエチレングリコール、メタクリル酸コポリマー、コロイド状二酸化ケイ素、セルロースガム、デンプン、デンプングリコール酸ナトリウム、アルギン酸ナトリウム、およびこれらの組合せからなる群より選択される、方法

。

【請求項 19】

前記 1 つまたは複数の乱用性薬物が、1 つまたは複数の水溶性の乱用性薬物を含む、請求項 17 または 18 に記載の方法。

【請求項 20】

前記 1 つまたは複数の乱用性薬物が、1 つまたは複数のオピオイドを含む、請求項 17 または 18 に記載の方法。

【請求項 21】

前記 1 つまたは複数のオピオイドが、モルヒネおよびオキシコドンを含む、請求項 20 に記載の方法。

【請求項 22】

前記 1 つまたは複数の乱用抑止構成成分が、ペレット、ビーズ、ビーズレット、顆粒、粉末、またはこれらの組合せからなる群より選択される形態にある、請求項 17 または 18 に記載の方法。

【請求項 23】

前記乱用性薬物と混合される前記処方物中の1つまたは複数の粘度上昇剤の総量が、該処方物中の乱用性薬物の総量に対して約1:1w/wから約1:10w/wの比にある、請求項17または18に記載の方法。

【請求項 24】

前記1つまたは複数の粘度上昇剤が、ポリアルコールのアリルエーテルで架橋されたアクリル酸である、請求項17または18に記載の方法。

【請求項 25】

前記ポリアルコールのアリルエーテルで架橋されたアクリル酸がカルボマーである、請求項24に記載の方法。

【請求項 26】

前記コーティングが、メタクリル酸コポリマー分散物、酢酸コハク酸ヒプロメロース、および酢酸フタル酸セルロースを含む、請求項17または18に記載の方法。

【請求項 27】

前記1つまたは複数のアルカリ化剤が、ポリブラスドンXL、タルク、メグルミン、NaHCO₃、およびポリビニルピロリドンからなる群より選択される、請求項17または18に記載の方法。

【請求項 28】

前記1つまたは複数のアルカリ化剤がメグルミンを含む、請求項27に記載の方法。

【請求項 29】

前記1つまたは複数のアルカリ化剤が、ペレット、ビーズ、ビーズレット、顆粒、粉末、またはこれらの組合せからなる群より選択される形態にある、請求項17または18に記載の方法。

【請求項 30】

前記乱用性薬物を可塑剤と混合させるステップをさらに含む、請求項17または18に記載の方法。

【請求項 31】

前記乱用抑止構成成分中のアルカリ化剤の総量が、該乱用抑止構成成分中の粘度上昇剤に対して約60:40w/wから約70:30w/wの比にある、請求項17または18に記載の方法。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0021

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0021】

本発明の実施形態は、1つまたは複数の乱用性薬物を含む薬学的処方物から、水性またはアルコール性の液体によって抽出することができる1つまたは複数の乱用性薬物の量を低減させる方法に関する。本発明の実施形態は、1つまたは複数の乱用性薬物を含む薬学的処方物から、水性またはアルコール性の液体によって乱用性薬物が抽出され得る速度を低減させる方法にも関する。ある実施形態では、方法は、(1つまたは複数の)乱用性薬物と、本発明の1つまたは複数の乱用抑止構成成分とを混合するステップを含む。いくつかの実施形態では、この混合は、処方物の調製中に生じる。

本発明の好ましい実施形態において、例えば以下の項目が提供される。

(項目1)

(a) 1つまたは複数の乱用性薬物、および

(b) 1つまたは複数の乱用抑止構成成分であって、各乱用抑止構成成分は、

(i) 親水性および疎水性の両方である1つまたは複数の材料を含むコア、および

(ii) 任意選択でコーティング

を含む、乱用抑止構成成分

を含む乱用抵抗性薬学的処方物であって、該 1 つまたは複数の乱用抑止構成成分は、該処方物からの該 1 つまたは複数の乱用性薬物の水性またはアルコール性液体による抽出を、遅くするか、低減させるか、または遅くし、かつ低減させる、乱用抵抗性薬学的処方物。

(項目 2)

前記 1 つまたは複数の乱用性薬物が、1 つまたは複数の水溶性の乱用性薬物を含む、項目 1 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

(項目 3)

前記 1 つまたは複数の乱用性薬物が、1 つまたは複数のオピオイドを含む、項目 1 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

(項目 4)

前記 1 つまたは複数のオピオイドが、モルヒネおよびオキシコドンを含む、項目 3 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

(項目 5)

前記 1 つまたは複数の乱用抑止構成成分が、ペレット、ビーズ、ビーズレット、顆粒、粉末、またはこれらの組合せからなる群より選択される形態にある、項目 1 に記載の乱用抵抗性処方物。

(項目 6)

前記 1 つまたは複数の乱用抑止構成成分が、前記処方物の残りに対して約 1 : 1 w / w から約 1 : 5 w / w の比にある、項目 1 に記載の乱用抵抗性処方物。

(項目 7)

前記 1 つまたは複数の乱用抑止構成成分が、前記 1 つまたは複数の乱用性薬物に対して約 1 : 1 w / w から約 1 : 10 w / w の比にある、項目 1 に記載の乱用抵抗性処方物。

(項目 8)

親水性および疎水性の両方である前記材料が、ポリアクリル酸、ポリアルコールのアリルエーテルで架橋されたアクリル酸、ヒドロキシプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース混合物、ポリビニルピロリドン、ポリエチレンオキシド、メチルセルロース、キサンタンガム、グアーガム、ポリエチレングリコール、メタクリル酸コポリマー、コロイド状二酸化ケイ素、セルロースガム、デンプン、デンプングリコール酸ナトリウム、アルギン酸ナトリウム、およびこれらの組合せからなる群より選択される、項目 1 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

(項目 9)

親水性および疎水性の両方である前記材料が、ポリアルコールのアリルエーテルで架橋されたアクリル酸である、項目 8 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

(項目 10)

前記ポリアルコールのアリルエーテルで架橋されたアクリル酸がカルボマーである、項目 9 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

(項目 11)

pH 感受性コーティングが、メタクリル酸コポリマー分散物、酢酸コハク酸ヒプロメロース、および酢酸フタル酸セルロースを含む、項目 1 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

(項目 12)

アルカリ化剤をさらに含む、項目 1 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

(項目 13)

前記アルカリ化剤が、ポリブラスドン XL、タルク、メグルミン、NaHCO₃、およびポリビニルピロリドンからなる群より選択される、項目 12 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

(項目 14)

前記アルカリ化剤がメグルミンである、項目 13 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

(項目 15)

前記アルカリ化剤が、ペレット、ビーズ、ビーズレット、顆粒、粉末、またはこれらの

組合せからなる群より選択される形態にある、項目 1 2 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

(項目 1 6)

前記 1 つまたは複数のアルカリ化剤が、前記 1 つまたは複数の乱用抑止構成成分に対して約 4 0 : 6 0 w / w から約 8 0 : 2 0 w / w の比にある、項目 1 1 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

(項目 1 7)

可塑剤をさらに含む、項目 1 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

(項目 1 8)

即時放出性、制御放出性、またはこれらの組合せである、項目 1 に記載の乱用抵抗性薬学的処方物。

(項目 1 9)

乱用性薬物を含む薬学的処方物から水性またはアルコール性液体により抽出することのできる該乱用性薬物の量を低減させる方法であって、該乱用性薬物と 1 つまたは複数の乱用抑止構成成分とを混合するステップを含み、各乱用抑止構成成分は、(a) 親水性および疎水性の両方である 1 つまたは複数の材料を含むコア、および (b) 任意選択でコーティングを含む、方法。

(項目 2 0)

乱用性薬物を含む薬学的処方物から水性またはアルコール性液体により該乱用性薬物を抽出し得る速度を低減させる方法であって、該乱用性薬物と 1 つまたは複数の乱用抑止構成成分とを混合するステップを含み、各乱用抑止構成成分は、(a) 親水性および疎水性の両方である 1 つまたは複数の材料を含むコア、および (b) 任意選択でコーティングを含む、方法。