

【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19年5月31日(2007.5.31)

【公表番号】特表2006-522819(P2006-522819A)

【公表日】平成18年10月5日(2006.10.5)

【年通号数】公開・登録公報2006-039

【出願番号】特願2006-509866(P2006-509866)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/06 (2006.01)

A 6 1 P 1/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/485 (2006.01)

A 6 1 K 9/02 (2006.01)

A 6 1 K 9/10 (2006.01)

A 6 1 K 9/28 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

A 6 1 K 9/16 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 9/06 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 489/02 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/06

A 6 1 P 1/10

A 6 1 K 31/485

A 6 1 K 9/02

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 9/28

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 9/06

A 6 1 P 43/00 1 2 1

C 0 7 D 489/02

【手続補正書】

【提出日】平成19年4月6日(2007.4.6)

【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】

末梢オピオイドアンタゴニストならびに緩下薬および/または便柔軟剤を含有する製剤。

【請求項2】

a) 末梢オピオイドアンタゴニストならびに緩下薬および/または便柔軟剤が座剤として処方され、任意に末梢オピオイドアンタゴニストが座剤の核を形成しているか、座剤の全体に分散している；

b) 末梢オピオイドアンタゴニストが薬学的に許容し得る担体によって被覆されている；

および / または

c) 末梢オピオイドアンタゴニストが粒子を含み、任意に薬学的に許容し得る担体によって被覆されている；

請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 3】

製剤が経口製剤であり、任意に

a) 製剤が液体、半固体または固体である；

b) 末梢オピオイドアンタゴニストが経口製剤の核を形成する；

c) 末梢オピオイドアンタゴニストが経口製剤の全体に分散している；

d) 末梢オピオイドアンタゴニストの少なくとも一部が薬学的に許容し得る担体によって被覆され、任意に薬学的に許容し得る担体が腸溶性の被覆および / または持続放出型性被覆であり、および緩下薬および / または便柔軟剤が、任意に腸溶性の被覆を受けていない；または

e) 緩下薬および / または便柔軟剤の少なくとも一部が薬学的に許容し得る担体によって被覆され、任意に薬学的に許容し得る担体が腸溶性の被覆および / または持続放出型性被覆であり、および末梢オピオイドアンタゴニストが、任意に腸溶性の被覆を受けていない；

請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 4】

製剤が：

a) 末梢オピオイドアンタゴニストを：

i) 胃、小腸および大腸に；

i i) 小腸および大腸のみに；

i i i) 小腸のみに；もしくは

i v) 大腸のみに；または

b) 即時に、実質的にすべての末梢オピオイドアンタゴニストを胃に

放出するように構成され設計されている、請求項 3 に記載の製剤。

【請求項 5】

a) 末梢オピオイドアンタゴニストが持続放出型性物質ならびに緩下薬および / または便柔軟剤中にあるか、もしくは持続放出型性物質ならびに緩下薬および / または便柔軟剤によって被覆されており、任意に持続放出型性物質中にある；

b) 末梢オピオイドアンタゴニストが腸溶性の被覆を受けた持続放出型性物質中にある；

c) 緩下薬および / または便柔軟剤が持続放出型性物質および末梢オピオイドアンタゴニスト中にあるか、もしくは持続放出型性物質および末梢オピオイドアンタゴニストによって被覆されており、任意に持続放出型性物質中にある；または

d) 緩下薬および / または便柔軟剤が腸溶性の被覆を受けた持続放出型性物質中にあり；任意に持続放出型性物質がマトリクスまたは膜である、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 6】

末梢オピオイドアンタゴニストがノルオキシモルホンの第四級誘導体、任意にメチルナルトレクソンであり、任意にメチルナルトレクソンが 50 ~ 250 mg の範囲で存在する、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の製剤。

【請求項 7】

さらにオピオイドを含む、請求項 1 ~ 6 のいずれかに記載の製剤。

【請求項 8】

治療に用いるための、請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載の製剤。

【請求項 9】

緩下薬および / または便柔軟剤による処置を要求する状態の処置に用いる医薬を製造するための緩下薬および / または便柔軟剤の使用であって、前記緩下薬および / または便柔軟剤が末梢オピオイドアンタゴニストとともに投与される、前記使用。

【請求項 10】

緩下薬および／または便柔軟剤による処置を要求する状態の処置に用いる医薬を製造するための末梢オピオイドアンタゴニストの使用であって、前記末梢オピオイドアンタゴニストが緩下薬および／または便柔軟剤とともに投与される、前記使用。

【請求項 1 1】

前記医薬が請求項 1 ～ 7 に記載の製剤である、請求項 9 または 1 0 に記載の使用。

【請求項 1 2】

a) 前記状態が便秘である；

b) 患者が緩下薬療法および／または便柔軟剤療法に難治性である；および／または

c) 前記処置がさらに患者に対するオピオイド、任意にモルヒネの投与を含み、任意にオピオイドが慢性的に投与される；

請求項 9 ～ 1 1 のいずれかに記載の使用。

【請求項 1 3】

患者が末期患者、癌患者、または手術後患者であるか、または進行した内科的疾患または慢性疼痛を有する、請求項 9 ～ 1 2 のいずれかに記載の使用。

【請求項 1 4】

末梢オピオイドアンタゴニストがノルオキシモルホンの第四級誘導体、任意にメチルナルトレクソンである、請求項 9 ～ 1 3 のいずれかに記載の使用。

【請求項 1 5】

患者が末梢オピオイドアンタゴニストを  $0.001 \sim 1.0 \text{ mg/kg}$ 、 $0.1 \sim 0.45 \text{ mg/kg}$  または  $0.1 \sim 0.3 \text{ mg/kg}$  の範囲の量で、非経口的、任意に経静脈、皮下のまたは無針注射によって投与される、請求項 9 ～ 1 4 のいずれかに記載の使用。

【請求項 1 6】

患者が末梢オピオイドアンタゴニストを経口投与または経腸投与され、任意に腸溶性の被覆を受けた製剤においておよび／または  $10 \sim 500 \text{ mg/kg}$ 、 $50 \sim 250 \text{ mg/kg}$  または  $75 \sim 225 \text{ mg/kg}$  の範囲で投与される、請求項 9 ～ 1 4 のいずれかに記載の使用。

【請求項 1 7】

末梢オピオイドアンタゴニストならびに緩下薬および／または便柔軟剤の製剤を含む包装体を含み、任意に：

a) 製剤が請求項 1 ～ 6 のいずれかに記載の製剤である；または

b) 末梢オピオイドアンタゴニストが第 1 の容器内にあり、緩下薬および／または便柔軟剤は前記第 1 の容器とは異なる容器内にある、

キット。