

【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23年2月24日(2011.2.24)

【公表番号】特表2010-532745(P2010-532745A)

【公表日】平成22年10月14日(2010.10.14)

【年通号数】公開・登録公報2010-041

【出願番号】特願2009-544900(P2009-544900)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4535 (2006.01)

A 6 1 K 47/46 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/24 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/22 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/4535

A 6 1 K 47/46

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/24

A 6 1 K 47/12

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 29/00

A 6 1 K 9/22

【手続補正書】

【提出日】平成22年12月27日(2010.12.27)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0019

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0019】

カートリッジは、カートリッジ上の物理的鍵機能、光学的に検出される特徴またはパターン、カートリッジ上のバーコード、カートリッジ上の磁気タグ、カートリッジ上のRFIDタグ、カートリッジ上の電子マイクロチップ、またはそれらの組み合わせ、を備えるスマート・カートリッジ認識システムを提供することができる。

本発明は、例えば以下の項目を提供する。

(項目1)

対象に経口腔粘膜投与するための剤形であって、該剤形は、

約5から約100マイクログラム(mcg)までのスフェンタニルおよび生体接着性物質を備え、該生体接着性物質は該対象の該口腔粘膜への接着を提供し、30マイクロリットルより小さい容量または30mgより小さい質量を有する、  
剤形。

(項目2)

前記剤形は、5mcg、10mcg、15mcg、20mcg、30mcg、40mcg、50mcg、60mcg、70mcg、80mcgおよび100mcgからなる群から選択されるスフェンタニルの用量を含む、項目1に記載の薬物剤形。

(項目3)

前記剤形は、10mgより小さい質量または10μlより小さい容量を有する、項目1に記載の剤形。

(項目4)

前記経口腔粘膜投与は舌下投与である、項目1に記載の剤形。

(項目5)

前記経口腔粘膜投与は頬側投与である、項目1に記載の剤形。

(項目6)

前記剤形の侵食時間は、30秒から、5分、10分、15分および30分からなる群から選択される時間までである、項目1に記載の剤形。

(項目7)

前記剤形の侵食は、前記対象への舌下投与の、約6分後から約25分後に完了する、項目4に記載の薬物剤形。

(項目8)

前記剤形は、該剤形中のスフェンタニルの総量の少なくとも55%、少なくとも60%、少なくとも65%、少なくとも70%、少なくとも75%、少なくとも80%、少なくとも85%、少なくとも90%、少なくとも95%、少なくとも98%、または少なくとも99%を舌下経路によって送達するのに有効である、項目4に記載の薬物剤形。

(項目9)

前記剤形の対象への単回舌下投与は、50%より大きいバイオアベイラビリティをもたらす、項目4に記載の薬物剤形。

(項目10)

前記剤形の対象への単回舌下投与は、60%より大きいバイオアベイラビリティをもたらす、項目4に記載の薬物剤形。

(項目11)

前記剤形の対象への単回舌下投与は、70%より大きいバイオアベイラビリティをもたらす、項目4に記載の薬物剤形。

(項目12)

前記剤形の対象への単回舌下投与は、80%より大きくバイオアベイラビリティをもたらす、項目4に記載の薬物剤形。

(項目13)

前記剤形の対象への単回舌下投与は、変動係数が40%より小さいAUC<sub>infty</sub>をもたらす、項目4に記載の薬物剤形。

(項目14)

前記剤形の対象への単回舌下投与は、変動係数が40%より小さいT<sub>max</sub>をもたらす、項目4に記載の薬物剤形。

(項目15)

前記剤形の舌下投与後に、C<sub>max</sub>と該剤形中のスフェンタニルの量との間に線形関係がある、項目4に記載の薬物剤形。

(項目16)

前記剤形の舌下投与後に、AUC<sub>infty</sub>と該剤形中のスフェンタニルの量との間に線形関係がある、項目4に記載の薬物剤形。

(項目17)

前記剤形の対象への繰り返し舌下投与後のバイオアベイラビリティは、前記対象への単回舌下投与後のバイオアベイラビリティより大きい、項目4に記載の薬物剤形。

(項目18)

繰り返し舌下投与後のT<sub>max</sub>と前回の舌下投与時間との差が、前記対象への単回舌下投与後のT<sub>max</sub>より短い、項目4に記載の薬物剤形。

(項目19)

前記剤形の対象への繰り返し舌下投与は、変動係数が40%より小さいT<sub>max</sub>をもたらす、項目4に記載の薬物剤形。

らす、項目4に記載の薬物剤形。

(項目20)

前記剤形は、ロゼンジ、丸薬、錠剤、膜および細片からなる群から選択される、項目1に記載の製剤。

(項目21)

前記剤形は錠剤である、項目20に記載の剤形。

(項目22)

項目1に記載の剤形を含む、単回用量アプリケータ(SDA)。

(項目23)

項目9に記載の剤形を含む、単回用量アプリケータ(SDA)。

(項目24)

項目17に記載の剤形を含む、単回用量アプリケータ(SDA)。

(項目25)

項目18に記載の剤形を含む、単回用量アプリケータ(SDA)。

(項目26)

項目1に記載の剤形を含む、投薬デバイス。

(項目27)

前記投薬デバイスは、唾液または水分の進入を防ぐか、または遅らせる手段、およびロックアウト機能を有する、項目26に記載の投薬デバイス。

(項目28)

項目9に記載の剤形を含む、投薬デバイス。

(項目29)

前記投薬デバイスは、唾液または水分の進入を防ぐか、または遅らせる手段、およびロックアウト機能を有する、項目28に記載の投薬デバイス。

(項目30)

項目17に記載の剤形を含む、投薬デバイス。

(項目31)

前記投薬デバイスは、唾液または水分の進入を防ぐか、または遅らせる手段、およびロックアウト機能を有する、項目30に記載の投薬デバイス。

(項目32)

項目18に記載の剤形を含む、投薬デバイス。

(項目33)

前記投薬デバイスは、唾液または水分の進入を防ぐか、または遅らせる手段、およびロックアウト機能を有する、項目32に記載の投薬デバイス。

(項目34)

項目4に記載の薬物剤形を対象に投与することによって疼痛を処置する方法であって、該薬物剤形の舌下投与後に、 $C_{max}$ と前記薬物剤形中のスフェンタニル量との間に線形関係がある、方法。

(項目35)

項目4に記載の薬物剤形を対象に投与することによって疼痛を処置する方法であって、該対象へのスフェンタニルの単回舌下投与は、50%より大きいバイオアベイラビリティをもたらす、方法。

(項目36)

項目4に記載の薬物剤形を対象に投与することによって疼痛を処置する方法であって、該薬物剤形の該対象への単回舌下投与は、変動係数が40%より小さい $T_{max}$ をもたらす、方法。

(項目37)

項目4に記載の薬物剤形を対象に投与することによって疼痛を処置する方法であって、該薬物剤形の該対象への繰り返し舌下投与後のバイオアベイラビリティは、単回舌下投与後のバイオアベイラビリティより大きい、方法。

(項目38)

項目4に記載の薬物剤形を対象に投与することによって疼痛を処置する方法であって、繰り返し舌下投与後の $T_{max}$ と前回の舌下投与時間との差は、該対象への単回舌下投与後の $T_{max}$ より短い、方法。

(項目39)

項目4に記載の薬物剤形を対象に投与することによって疼痛を処置する方法であって、該薬物剤形の該対象への繰り返し舌下投与は、変動係数が40%より小さい $T_{max}$ をもたらす、方法。

(項目40)

項目1に記載の薬物剤形を口腔粘膜上に配置する工程を包含する、疼痛を処置する方法であって、前記薬物剤形は投薬デバイスを用いて配置される、方法。

(項目41)

前記口腔粘膜は舌下の空間内にある、項目40に記載の方法。

(項目42)

前記口腔粘膜は頬粘膜である、項目40に記載の方法。

(項目43)

前記投与デバイスはハンドヘルドである、項目40に記載の方法。

(項目44)

前記剤形の配置は患者によって制御される、項目40に記載の方法。

(項目45)

前記投与デバイスは、唾液の進入を防ぐか、または遅らせる手段を有する投薬端、およびロックアウト機能を備える、項目40に記載の方法

(項目46)

前記投与後に前記対象における疼痛の緩和が明らかである、項目35に記載の疼痛を処置する方法。

(項目47)

前記疼痛は、急性痛、突出痛または術後痛である、項目46に記載の方法。

(項目48)

前記投与後に前記対象における疼痛の緩和が明らかである、項目37に記載の疼痛を処置する方法。

(項目49)

前記疼痛は、急性痛、突出痛または術後痛である、項目48に記載の方法。

(項目50)

前記投与後に前記対象における疼痛の緩和が明らかである、項目38に記載の疼痛を処置する方法。

(項目51)

前記疼痛は、急性痛、突出痛または術後痛である、項目50に記載の方法。

(項目52)

前記投薬デバイスは、単回用量アプリケータ(SDA)である、項目40に記載の疼痛を処置する方法。

(項目53)

前記投薬デバイスは、単回用量アプリケータ(SDA)である、項目41に記載の疼痛を処置する方法。

(項目54)

生体接着性の薬物剤形を対象の舌下膜上に配置する方法であって、該方法は、

(a) 項目1に記載の薬物剤形を得る工程；および

(b) 該薬物剤形を該舌下膜上に配置する工程

を包含し、該薬物剤形は該膜に接着する、方法。

(項目55)

前記配置はデバイスなしに達成される、項目48に記載の方法。

(項目56)

前記配置はデバイスを用いて達成される、項目48に記載の方法。

(項目57)

前記デバイスは単回用量アプリケータである、項目50に記載の方法。

(項目58)

固体薬物剤形として対象に舌下投与するための生体接着性スフェンタニル含有製剤であって、該製剤は、

(a) 医薬活性量の秩序化していない薬物の混合物、および

(b) 生体接着性物質であって、該生体接着性物質は該対象の口腔粘膜への接着をもたらす、生体接着性物質

を含み、該薬物剤形の溶解はpHに依存しない、

製剤。

(項目59)

前記薬物剤形の溶解は、約4から8のpH範囲にわたってpHに依存しない、項目52に記載の製剤。

(項目60)

前記製剤はステアリン酸をさらに含む、項目52に記載の製剤。

(項目61)

前記薬物剤形は、ロゼンジ、丸薬、錠剤、膜および細片からなる群から選択される、項目52に記載の製剤。

(項目62)

前記薬物剤形は錠剤である、項目55に記載の製剤。

(項目63)

前記製剤は、約0.0004%から約0.04%までのスフェンタニル、例えば、0.005%、0.001%、0.002%、0.003%、0.004%、0.006%、0.008%、0.01%、0.012%、0.014%または0.016%のスフェンタニルを含む、項目52に記載の製剤。

## 【手続補正2】

【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】

対象に経口腔粘膜投与するための剤形であって、該剤形は、  
約5から約100マイクログラム(mcg)までのスフェンタニルおよび生体接着性物質を備え、該生体接着性物質は該対象の該口腔粘膜への接着を提供し、該剤形は、30マイクロリットルより小さい容量または30mgより小さい質量を有する、剤形。

【請求項2】

前記剤形は、5mcg、10mcg、15mcg、20mcg、30mcg、40mcg、50mcg、60mcg、70mcg、80mcgおよび100mcgからなる群から選択されるスフェンタニルの用量を含む、請求項1に記載の薬物剤形。

【請求項3】

前記剤形は、10mgより小さい質量または10μlより小さい容量を有する、請求項1または2に記載の剤形。

【請求項4】

前記経口腔粘膜投与は舌下投与または頬側投与である、請求項1～3のいずれか一項に

記載の剤形。

【請求項 5】

前記剤形の侵食時間は、30秒から、5分、10分、15分および30分からなる群から選択される時間までである、請求項1～4のいずれか一項に記載の剤形。

【請求項 6】

前記剤形は、該剤形中のスフェンタニルの総量の少なくとも55%、少なくとも60%、少なくとも65%、少なくとも70%、少なくとも75%、少なくとも80%、少なくとも85%、少なくとも90%、少なくとも95%、少なくとも98%、または少なくとも99%を舌下経路によって送達するのに有効である、請求項4または5に記載の薬物剤形。

【請求項 7】

前記剤形の対象への単回舌下投与は、50%より大きいバイオアベイラビリティをもたらす、請求項4、5または6に記載の薬物剤形。

【請求項 8】

前記剤形の対象への単回舌下投与は、60%より大きいバイオアベイラビリティをもたらす、請求項4、5または6に記載の薬物剤形。

【請求項 9】

前記剤形の対象への単回舌下投与は、70%より大きいバイオアベイラビリティをもたらす、請求項4、5または6に記載の薬物剤形。

【請求項 10】

前記剤形の対象への単回舌下投与は、変動係数が40%より小さい $T_{max}$ をもたらす、請求項4～9のいずれか一項に記載の薬物剤形。

【請求項 11】

前記剤形の対象への繰り返し舌下投与後のバイオアベイラビリティは、前記剤形の対象への単回舌下投与後のバイオアベイラビリティより大きい、請求項4～10のいずれか一項に記載の薬物剤形。

【請求項 12】

繰り返し舌下投与後の $T_{max}$ と前回の舌下投与時間との差が、前記対象への単回舌下投与後の $T_{max}$ より短い、請求項4～11のいずれか一項に記載の薬物剤形。

【請求項 13】

前記剤形の対象への繰り返し舌下投与は、変動係数が40%より小さい $T_{max}$ をもたらす、請求項4～12のいずれか一項に記載の薬物剤形。

【請求項 14】

前記剤形は、ロゼンジ、丸薬、錠剤、膜および細片からなる群から選択される、請求項1～13のいずれか一項に記載の薬物剤形。

【請求項 15】

前記剤形は錠剤である、請求項14に記載の薬物剤形。

【請求項 16】

請求項1～15のいずれか一項に記載の薬物剤形を含む、単回用量アプリケータ(SDA)。

【請求項 17】

疼痛の処置のための、請求項1～15のいずれか一項に記載の薬物剤形を送達するための、単回用量アプリケータ(SDA)。

【請求項 18】

前記疼痛が、急性痛、突出痛または術後痛である、請求項17に記載の単回用量アプリケータ。

【請求項 19】

前記疼痛が、入院患者の急性痛である、請求項18に記載の単回用量アプリケータ。

【請求項 20】

前記疼痛が、術後痛である、請求項18に記載の単回用量アプリケータ。