

【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】0 0 1 9

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 1 9】

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 R F I D 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 1 0 0 マイクログラム (m c g) までのスフエ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、3 0 マイクロリットルより小さい容量または 3 0 m g より小さい質量を有する、

剤形。

(項目 2)

前記剤形は、5 m c g、1 0 m c g、1 5 m c g、2 0 m c g、3 0 m c g、4 0 m c g、5 0 m c g、6 0 m c g、7 0 m c g、8 0 m c g および 1 0 0 m c g からなる群から選択されるスフエ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、 10 mg より小さい質量または $10\text{ }\mu\text{ l}$ 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_{inf} 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_{max} 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_{max} 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_{inf} 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_{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、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_{max} 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 2 0)

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 2 1)

前記剤形は錠剤である、項目 2 0 に記載の剤形。

(項目 2 2)

項目 1 に記載の剤形を含む、単回用量アプリケータ (S D A)。

(項目 2 3)

項目 9 に記載の剤形を含む、単回用量アプリケータ (S D A)。

(項目 2 4)

項目 1 7 に記載の剤形を含む、単回用量アプリケータ (S D A)。

(項目 2 5)

項目 1 8 に記載の剤形を含む、単回用量アプリケータ (S D A)。

(項目 2 6)

項目 1 に記載の剤形を含む、投薬デバイス。

(項目 2 7)

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 2 6 に記載の投薬デバイス。

(項目 2 8)

項目 9 に記載の剤形を含む、投薬デバイス。

(項目 2 9)

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 2 8 に記載の投薬デバイス。

(項目 3 0)

項目 1 7 に記載の剤形を含む、投薬デバイス。

(項目 3 1)

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 3 0 に記載の投薬デバイス。

(項目 3 2)

項目 1 8 に記載の剤形を含む、投薬デバイス。

(項目 3 3)

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 3 2 に記載の投薬デバイス。

(項目 3 4)

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 3 5)

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 3 6)

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 3 7)

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 3 8)

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 3 9)

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 4 0)

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 4 1)

前記口腔粘膜は舌下の空間内にある、項目 4 0 に記載の方法。

(項目 4 2)

前記口腔粘膜は頬粘膜である、項目 4 0 に記載の方法。

(項目 4 3)

前記投与デバイスはハンドヘルドである、項目 4 0 に記載の方法。

(項目 4 4)

前記剤形の配置は患者によって制御される、項目 4 0 に記載の方法。

(項目 4 5)

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 4 0 に記載の方法

(項目 4 6)

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 3 5 に記載の疼痛を処置する方法。

(項目 4 7)

前記疼痛は、急性痛、突出痛または術後痛である、項目 4 6 に記載の方法。

(項目 4 8)

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 3 7 に記載の疼痛を処置する方法。

(項目 4 9)

前記疼痛は、急性痛、突出痛または術後痛である、項目 4 8 に記載の方法。

(項目 5 0)

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 3 8 に記載の疼痛を処置する方法。

(項目 5 1)

前記疼痛は、急性痛、突出痛または術後痛である、項目 5 0 に記載の方法。

(項目 5 2)

前記投薬デバイスは、単回用量アプリケータ (S D A) である、項目 4 0 に記載の疼痛を処置する方法。

(項目 5 3)

前記投薬デバイスは、単回用量アプリケータ (S D A) である、項目 4 1 に記載の疼痛を処置する方法。

(項目 5 4)

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 5 5)

前記配置はデバイスなしに達成される、項目 4 8 に記載の方法。

(項目 5 6)

前記配置はデバイスを用いて達成される、項目 4 8 に記載の方法。

(項目 5 7)

前記デバイスは単回用量アプリケータである、項目 5 0 に記載の方法。

(項目 5 8)

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 p H に依存しない、製剤。

(項目 5 9)

前記薬物剤形の溶解は、約 4 から 8 の p H 範囲にわたって p H に依存しない、項目 5 2 に記載の製剤。

(項目 6 0)

前記製剤はステアリン酸をさらに含む、項目 5 2 に記載の製剤。

(項目 6 1)

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 5 2 に記載の製剤。

(項目 6 2)

前記薬物剤形は錠剤である、項目 5 5 に記載の製剤。

(項目 6 3)

前記製剤は、約 0 . 0 0 0 4 % から約 0 . 0 4 % までのスフェンタニル、例えば、0 . 0 0 0 5 % 、 0 . 0 0 1 % 、 0 . 0 0 2 % 、 0 . 0 0 3 % 、 0 . 0 0 4 % 、 0 . 0 0 6 % 、 0 . 0 0 8 % 、 0 . 0 1 % 、 0 . 0 1 2 % 、 0 . 0 1 4 % または 0 . 0 1 6 % のスフェンタニルを含む、項目 5 2 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 1 0 0 マイクログラム (m c g) 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、3 0 マイクロリットルより小さい容量または 3 0 m g より小さい質量を有する、
剤形。

【請求項 2】

前記剤形は、5 m c g 、 1 0 m c g 、 1 5 m c g 、 2 0 m c g 、 3 0 m c g 、 4 0 m c g 、 5 0 m c g 、 6 0 m c g 、 7 0 m c g 、 8 0 m c g および 1 0 0 m c g 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、1 0 m g より小さい質量または 1 0 μ l 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ション（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ション（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ション。

【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ション。

【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ション。