

【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26年12月18日 (2014.12.18)

【公表番号】特表2014-500258(P2014-500258A)

【公表日】平成26年1月9日 (2014.1.9)

【年通号数】公開・登録公報2014-001

【出願番号】特願2013-539955(P2013-539955)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/167 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 P 1/02 (2006.01)

A 6 1 K 9/06 (2006.01)

A 6 1 K 9/12 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 9/68 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/70 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/28 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/167

A 6 1 K 47/10

A 6 1 P 1/02

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 9/12

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 9/68

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 9/70

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/28

【手続補正書】

【提出日】平成26年10月28日 (2014.10.28)

【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】

少なくとも 1 つの粘膜付着材料；少なくとも有効量の少なくとも 1 つのレチニド組成物又はその医薬的に許容される塩；及び、プロピレングリコール（PG）、メントール、及びテルペン又はテルペノイド組成物の 1 以上より選択される少なくとも 1 つの経粘膜浸透促進剤；並びに、任意選択的に、少なくとも 1 つの可溶化剤、を含んでなる製剤。

【請求項 2】

レチニド組成物がフェンレチニドを含む、請求項 1 の製剤。

【請求項 3】

フェンレチニドが約 0.1 重量%～約 5 重量%で存在する、請求項 2 の製剤。

【請求項 4】

経粘膜浸透促進剤が約 1 重量%～約 2.5 重量%の PG と 1 重量%～約 5 重量%のメントールを含む、請求項 1 の製剤。

【請求項 5】

医薬的に活性なレチニド組成物と少なくとも 1 つの浸透促進剤が少なくとも共通の粘膜上で接触するように適用される、請求項 1 の製剤。

【請求項 6】

粘膜が頬側粘膜である、請求項 5 の製剤。

【請求項 7】

練り歯磨き剤、口腔洗浄剤又は洗口剤、ゲル又はペースト剤、スプレー剤、チューインガム剤、及び / 又は口内錠剤のような口腔用製品として提示される、請求項 1 の製剤。

【請求項 8】

10 µg、15 µg、25 µg、50 µg、100 µg、500 µg、1 mg、2 mg、3 mg、4 mg、5 mg、6 mg、7 mg、8 mg、9 mg、及び 10 mg からなる群より選択される量での所定量の医薬的に活性なレチニド組成物と付着材料を含有し、付着材料は、被検者の口腔粘膜への付着を提供する、請求項 1 の製剤。

【請求項 9】

口腔粘膜より吸収される医薬的に活性なレチニドの量が、剤形中の薬物の少なくとも 35%、少なくとも 40%、少なくとも 45%、少なくとも 50%、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%、及び少なくとも 99% からなる群より選択される、請求項 1 の製剤。

【請求項 10】

請求項 1 の製剤より構成される少なくとも 1 つの薬物放出層、少なくとも 1 つの付着層、及び少なくとも 1 つの支持層を含んでなる、経粘膜薬物送達システム。

【請求項 11】

少なくとも有効量の医薬的に活性なレチニド組成物又はその医薬的に許容される塩と、プロピレングリコール (PG) 及びメントールより選択される少なくとも 1 つの経粘膜浸透促進剤を含んでなる製剤；並びに、

医薬剤形の口腔粘膜への付着を提供する付着材料、
を含んでなる、経口経粘膜投与用の医薬剤形。

【請求項 12】

疾患又は障害の治療及び予防のための、請求項 1 の製剤。

【請求項 13】

疾患又は障害が癌状態又は前癌状態である、請求項 12 の製剤。

【請求項 14】

疾患又は障害が、口腔扁平上皮癌、口腔内異形成病変、頭頸部扁平上皮癌の 1 以上を含む、請求項 12 の製剤。

【請求項 15】

頭頸部扁平上皮癌細胞を含んでなる腫瘍の増殖を阻害するための、及び / 又は頭頸部扁平上皮癌細胞を含んでなる腫瘍のサイズを減少させるための、請求項 1 の製剤。

【請求項 16】

日射性口唇炎を含む光線誘発性の前癌病変を改善するための、請求項 1 の製剤。

【請求項 17】

口腔癌又は前癌状態の化学予防のための請求項 1 の製剤であって、そのような化学予防の必要な被検者へ局所投与される、製剤。

【請求項 18】

被検者の口腔の内部へ投与される、請求項 17 の製剤。

【請求項 19】

被検者への単回又は反復の経口経粘膜投与が70%より大きいか、75%より大きいか、80%より大きいか、90%より大きいか、又は94%より大きいバイオアベイラビリティをもたらす、請求項18の製剤。

【請求項 20】

被検者への単回又は反復の経口経粘膜投与が、変動係数が30%未満、又は40%未満であるバイオアベイラビリティをもたらす、請求項18の製剤。

【請求項 21】

被検者への薬物剤形の単回の経口経粘膜投与が約6時間～約8時間、又は約6時間～約12時間の T_{max} をもたらす、請求項18の製剤。

【請求項 22】

請求項1の製剤を含んでなる経粘膜システムであって、

被検者の粘膜へ適用され；

該粘膜と療法上有効な期間接触させられ；そして

任意選択的に、所望される治療効果が達成されたときに除去される、経粘膜システム。

【請求項 23】

付着材料を含む、請求項22の経粘膜システム。

【請求項 24】

製剤と付着材料が別々のコンパートメントに存在する、請求項23の経粘膜システム。

【請求項 25】

粘膜が頬側粘膜である、請求項22の経粘膜システム。

【請求項 26】

i) 請求項1の製剤からなる薬物放出層を製造すること；

ii) 付着層を製造すること；及び、

iii) 該薬物層と該付着層を支持層の上へ構築すること、
を含んでなる、頬側薬物送達システムを作製するための方法。

【請求項 27】

i) プロピレングリコール及びメントールの1以上を含んでなる浸透促進剤とレチニド組成物を混合すること、及び

ii) この混合物を薬物放出層に成形すること、
を含んでなる、薬物放出層からレチニド組成物の必要な被検者の粘膜中へのその浸透を高めるための方法。

【請求項 28】

i) 一定量の少なくとも1つの可溶化剤、少なくとも1つの粘膜付着ポリマー、及び少なくとも1つの浸透促進剤を溶媒中で混合して溶媒混合物を形成させること；

ii) 工程i)の溶媒混合物へ一定量のレチニドを加えること；及び、任意選択的に、その容量を、工程i)の溶媒混合物で10mLへ調整すること；

iii) 工程ii)のレチニド混合物の層を形成させること；並びに、

iv) 工程iii)の層を乾燥させること、
を含んでなる、請求項1の製剤を作製するための方法。

【請求項 29】

可溶化剤が、非イオン性界面活性剤である Tween（登録商標）80、ポリエトキシ化ソルビタン及びオレイン酸より誘導される乳化剤、並びにデオキシコール酸ナトリウムの1以上を含む、請求項28の方法。

【請求項 30】

浸透促進剤がプロピレングリコール及びメントールを含む、請求項28の方法。