

【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20年4月3日(2008.4.3)

【公表番号】特表2007-522223(P2007-522223A)

【公表日】平成19年8月9日(2007.8.9)

【年通号数】公開・登録公報2007-030

【出願番号】特願2006-553213(P2006-553213)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/22 (2006.01)

A 6 1 K 31/485 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 K 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 25/26 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/22

A 6 1 K 31/485

A 6 1 K 47/18

A 6 1 K 9/12

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 25/26

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 9/00

【手続補正書】

【提出日】平成20年2月8日(2008.2.8)

【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】

投薬時に線形吸収速度を示す経粘膜的に送達される制御放出水性組成物であって、前記組成物が、

(a) 治療効果のある量の薬学的に活性な成分、

(b) 有効量の制御放出キトサンポリマー、

を含むとともに、任意に

(c) 1 種以上の抗菌剤、

(d) 1 種以上の酸化防止剤、及び

(e) 水、

を含み、前記薬学的に活性な成分の前記制御放出キトサンポリマーに対する分子比が約 1 : 1 乃至約 1 0 0 , 0 0 0 : 1 である組成物。

【請求項 2】

前記薬学的に活性な成分の前記制御放出キトサンポリマーに対する分子比が約 5 , 0 0 0 : 1 乃至約 8 0 , 0 0 0 : 1 である請求項 1 記載の組成物。

【請求項 3】

前記薬学的に活性な成分がモルヒネである請求項 1 記載の組成物。

【請求項 4】

モルヒネの濃度が、約 1 8 . 7 5 mg/ml 乃至約 3 0 0 mg/ml である請求項 3 記載の組成物。

【請求項 5】

モルヒネの濃度が、約 3 7 . 5 mg/ml 乃至約 1 5 0 mg/ml である請求項 3 記載の組成物。

【請求項 6】

モルヒネが、精製モルヒネ塩基モノ水和物である請求項 3 記載の組成物。

【請求項 7】

キトサンポリマーの濃度が約 2 mg/ml 乃至約 7 mg/ml である請求項 1 記載の組成物。

【請求項 8】

キトサンポリマーの濃度が、約 4 mg/ml 乃至約 6 mg/ml である請求項 1 記載の組成物。

【請求項 9】

前記酸化防止剤が、メタンスルホン酸、クエン酸、クエン酸ナトリウム、アスコルビン酸、及びアスコルビン酸ナトリウムからなる群から選択される請求項 1 記載の組成物。

【請求項 10】

前記酸化防止剤が、クエン酸及びクエン酸ナトリウムであり、酸化防止剤の総量が、組成物の単位体積に対して約 2 0 乃至約 5 0 質量% 存在する請求項 9 記載の組成物。

【請求項 11】

前記酸化防止剤が、アスコルビン酸及びアスコルビン酸ナトリウムであり、酸化防止剤の総量が、組成物の単位体積に対して約 4 0 乃至約 7 0 質量% 存在する請求項 9 記載の組成物。

【請求項 12】

前記酸化防止剤が、メタンスルホン酸であり、酸化防止剤の量が、組成物の単位体積に対して約 1 0 乃至約 6 0 質量% 存在する請求項 9 記載の組成物。

【請求項 13】

前記抗菌剤が、塩化ベンザルコニウム、EDTA二ナトリウム、安息香酸ナトリウム、及びそれらの組合せからなる群から選択される請求項 1 記載の組成物。

【請求項 14】

前記抗菌剤の濃度が、組成物の単位体積に対して約 0 . 0 0 0 5 乃至約 0 . 5 質量% である請求項 1 2 記載の組成物。

【請求項 15】

前記抗菌剤の濃度が、組成物の単位体積に対して約 0 . 0 0 5 乃至約 0 . 5 質量% である請求項 1 2 記載の組成物。

【請求項 16】

前記経粘膜的送達が、経鼻、口腔、直腸、腔内、及び眼内投与からなる群から選択される請求項 1 記載の組成物。

【請求項 17】

前記系粘膜的送達が、経鼻投与である請求項 1 記載の組成物。

【請求項 18】

前記組成物が、窒素ガス雰囲気下で、以下の工程、

- (a) モルヒネ及び酸、ポリマー、及び抗菌剤を混合する工程であって、各成分が少なくとも 5 分間混合されて溶液となる工程、
 - (b) 酸化防止剤を添加する工程であって、pH が約 3.0 乃至約 5.0 である工程、
 - (c) 水を用いて最終バッチ体積を調整して最終溶液を形成する工程、及び
 - (d) 予め滅菌したマイクロサイズのフィルターで溶液をろ過する工程、
- により調製される請求項 1 記載の組成物。

【請求項 19】

前記予め滅菌したマイクロサイズのフィルターが約 0.2 μm フィルターである請求項 18 記載の組成物。

【請求項 20】

前記組成物が、100 μl の鼻腔用スプレーあたり約 18.75 μg 乃至約 300 μg の薬学的に効果のある薬剤を含む請求項 1 記載の組成物。

【請求項 21】

以下の成分(a)及び(b)並びに任意の成分(c)～(e)の、必要とする被検者に経粘膜的に投与される水性制御放出経粘膜的薬物の製造への使用。

- (a) 治療効果のある量の薬学的に活性な成分。
- (b) 有効量の制御放出キトサンポリマー。
- (c) 1 種以上の抗菌剤。
- (d) 1 種以上の酸化防止剤。
- (e) 水。

【請求項 22】

前記薬学的に活性な成分が、精製モルヒネ塩基モノ水和物である請求項 21 記載の使用。

【請求項 23】

前記被検者が、人である請求項 21 記載の使用。