

【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 24 年 9 月 27 日 (2012.9.27)

【公開番号】特開 2012-82195 (P2012-82195A)

【公開日】平成 24 年 4 月 26 日 (2012.4.26)

【年通号数】公開・登録公報 2012-017

【出願番号】特願 2011-222079 (P2011-222079)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4458 (2006.01)

A 6 1 K 9/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/4458

A 6 1 K 9/24

A 6 1 P 25/14

【手続補正書】

【提出日】平成 24 年 7 月 25 日 (2012.7.25)

【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】

(a) 薬物の一部を含む第一層、該薬物の残りを含む第二層、および押出層を含む第三層を含む三層を含む、長手方向に圧縮した錠剤コア；

(b) 長手方向に圧縮した該錠剤コアを取り巻く半透壁であって、それにより、浸透性勾配を有するコンパートメントを形成し、流体を該半透壁に接する外部流体環境から該コンパートメント内へと押し流す半透壁；

(c) 該第一層に隣接した位置で、該半透壁を通して、長手方向に圧縮した該錠剤コアへと形成されるオリフィスであって、薬物が該コンパートメント内から該外部流体環境へと放出されることを可能とするオリフィス；

を含む浸透性投薬形態であって、該投薬形態が、投与後 2.5 時間から 5.5 時間の期間にわたり該薬物の実質的に上昇する血漿濃度を提供する、投薬形態。

【請求項 2】

該薬物を、該第一層から、次いで該第二層から、連続して放出する、請求項 1 に記載の投薬形態。

【請求項 3】

さらに、該浸透性投薬形態の外表面上へのコーティングとして適用する薬物の即時放出用量を含む、請求項 1 に記載の投薬形態。

【請求項 4】

投与後 4 時間の血漿が、該即時放出コーティングからの薬物を含まない、請求項 3 に記載の投薬形態。

【請求項 5】

投与後 1.5 時間から 5.5 時間の期間にわたり実質的に該薬物の上昇する血漿濃度を提供し、請求項 1 に記載の投薬形態。

【請求項 6】

投与後 4 時間よりも投与後約 8 時間に高い薬物血漿濃度を提供する、請求項 1 に記載の

投薬形態。

【請求項 7】

投与後 4 時間よりも投与後約 6.5 時間に高い薬物血漿濃度を提供する、請求項 1 に記載の投薬形態。

【請求項 8】

薬物が中枢神経作用薬である、請求項 1 に記載の投薬形態。

【請求項 9】

中枢神経作用薬がメチルフェニデート、d - トレオ - メチルフェニデート、アンフェタミン、デキストロアンフェタミン、メタンフェタミン、フェニルイソプロピルアミンおよびペモリンから成る群から選択される中枢神経系刺激薬である、請求項 8 に記載の投薬形態。

【請求項 10】

中枢神経系刺激薬がメチルフェニデートである、請求項 9 に記載の投薬形態。

【請求項 11】

さらに、該浸透性投薬形態の外表面上へのコーティングとして適用するメチルフェニデートの即時放出用量を含む、請求項 10 に記載の投薬形態。

【請求項 12】

コーティングが抗分解剤を含む、請求項 11 に記載の投薬形態。

【請求項 13】

半透膜が酢酸セルロースおよび流動促進剤を含む、請求項 12 に記載の投薬形態。

【請求項 14】

流動促進剤が酸化エチレンと酸化プロピレンとのコポリマーである、請求項 13 に記載の投薬形態。

【請求項 15】

(a) 少なくとも 1 個の薬物含有層および押出層を含む長手方向に圧縮した浸透性により活性な錠剤コアであって、その長さより短い円周幅を有し、かつ円筒型の先細った端を有し、その端の一方が薬物含有層を有し、他方の端が押出層を含む、錠剤コア；
(b) コンパートメントを形成するために該錠剤コアを取り巻く半透膜；および
(c) 流体の該錠剤コア内への浸透圧性移動に応答して薬物がコンパートメント内から外部流体環境に放出されることを可能にするための、少なくとも 1 個の薬物層に隣接した位置で該半透膜を通して、該錠剤コアへと形成されるオリフィスを含む投薬形態であって、該投薬形態が、投与後 2.5 時間から 5.5 時間の期間にわたり該薬物の実質的に上昇する血漿濃度を提供する、投薬形態。

【請求項 16】

押出層がさらに少なくとも 1 個の浸透剤を含む、請求項 15 に記載の投薬形態。

【請求項 17】

押出層の少なくとも 35 % が浸透剤を含む、請求項 16 に記載の投薬形態。

【請求項 18】

投薬形態がさらに即時放出薬物層保護膜を含む、請求項 13 に記載の投薬形態。

【請求項 19】

コーティングが抗分解剤を含む、請求項 18 に記載の投薬形態。

【請求項 20】

投与後 4 時間の血漿が、該即時放出保護膜からの薬物を含まない、請求項 18 に記載の投薬形態。

【請求項 21】

投与後 1.5 時間から 5.5 時間の期間にわたり実質的に該薬物の上昇する血漿濃度を提供する、請求項 15 に記載の投薬形態。

【請求項 22】

投与後 4 時間よりも投与後約 8 時間に高い薬物血漿濃度を提供する、請求項 15 に記載の投薬形態。

【請求項 23】

投与後 4 時間よりも投与後約 6.5 時間に高い薬物血漿濃度を提供する、請求項 15 に記載の投薬形態。

【請求項 24】

薬物が中枢神経作用薬である、請求項 15 に記載の投薬形態。

【請求項 25】

中枢神経作用薬がメチルフェニデート、d - トレオ - メチルフェニデート、アンフェタミン、デキストロアンフェタミン、メタンフェタミン、フェニルイソプロピルアミンおよびペモリンから成る群から選択される中枢神経系刺激薬である、請求項 24 に記載の投薬形態。

【請求項 26】

中枢神経系刺激薬がメチルフェニデートである、請求項 25 に記載の投薬形態。

【請求項 27】

さらに、該浸透性投薬形態の外表面上へのコーティングとして適用するメチルフェニデートの即時放出用量を含む、請求項 26 に記載の投薬形態。

【請求項 28】

少なくとも 1 個の薬物含有層と係合可能な押出層を含み、該薬物含有層は薬学的に許容され得る担体と混合した薬物を含む浸透性投薬形態であって；

ここで、該投薬形態は、該薬物を流体の該押出層への移動に応答して放出し、投与後 2.5 時間から 5.5 時間の期間にわたり該薬物の実質的に上昇する血漿濃度を提供する、投薬形態。

【請求項 29】

投与後 1.5 時間から 5.5 時間の期間にわたり実質的に該薬物の上昇する血漿濃度を提供する、請求項 28 に記載の投薬形態。

【請求項 30】

投与後 4 時間よりも投与後約 8 時間に高い薬物血漿濃度を提供する、請求項 28 に記載の投薬形態。

【請求項 31】

投与後 4 時間よりも投与後約 6.5 時間に高い薬物血漿濃度を提供する、請求項 28 に記載の投薬形態。

【請求項 32】

投薬形態がさらに即時放出薬物層保護膜を含む、請求項 28 に記載の投薬形態。

【請求項 33】

投与後 4 時間の血漿が、即時放出保護膜からの薬物を含まない、請求項 32 に記載の投薬形態。

【請求項 34】

薬物が中枢神経作用薬である、請求項 28 に記載の投薬形態。

【請求項 35】

中枢神経作用薬がメチルフェニデート、d - トレオ - メチルフェニデート、アンフェタミン、デキストロアンフェタミン、メタンフェタミン、フェニルイソプロピルアミンおよびペモリンから成る群から選択される中枢神経系刺激薬である、請求項 34 に記載の投薬形態。

【請求項 36】

中枢神経系刺激薬がメチルフェニデートである、請求項 35 に記載の投薬形態。

【請求項 37】

さらに、該浸透性投薬形態の外表面上へのコーティングとして適用するメチルフェニデートの即時放出用量を含む、請求項 36 に記載の投薬形態。

【請求項 38】

(a) 薬物の一部を含む第一層、該薬物の残りを含む第二層、および押出層を含む第三層を含む三層を含む、長手方向に圧縮した錠剤コア；

(b) 長手方向に圧縮した該錠剤コアを取り巻く半透壁であって、それにより、浸透性勾配を有するコンパートメントを形成し、流体を該半透壁に接する外部流体環境から該コンパートメント内へと押し流す半透壁；

(c) 該第一層に隣接した位置で、該半透壁を通して、長手方向に圧縮した該錠剤コアへと形成されるオリフィスであって、薬物が該コンパートメント内から該外部流体環境へと放出されることを可能とするオリフィス；

を含む浸透性投薬形態であって、該投薬形態が、投与後 2.5 時間から始まり、投与後 5.5 時間まで続く期間にわたり該薬物の実質的に上昇する血漿濃度を提供する、投薬形態。

【請求項 39】

それぞれ 1 時間または 1.5 時間の長さを有する 1 回目、2 回目および 3 回目の連続的時間間隔を含む期間にわたり該薬物の実質的に上昇する血漿濃度を提供し、ここで、該投薬形態が 1 回目の間隔より高い 2 回目の投与間隔での薬物濃度を提供し、そして 2 回目の間隔より高い 3 回目の間隔での薬物濃度を提供する、請求項 38 に記載の投薬形態。

【請求項 40】

それぞれ 1 時間または 1.5 時間の長さを有する 1 回目、2 回目、3 回目および 4 回目の連続的時間間隔を含む期間にわたり該薬物の実質的に上昇する血漿濃度を提供し、ここで、該投薬形態が 3 回目の間隔より高い 4 回目の間隔での薬物濃度を提供する、請求項 39 に記載の投薬形態。

【請求項 41】

投薬形態がさらに即時放出薬物層保護膜を含む、請求項 38 に記載の投薬形態。

【請求項 42】

投与後 4 時間の血漿が、該即時放出保護膜からの薬物を含まない、請求項 41 に記載の投薬形態。

【請求項 43】

投与後 1.5 時間から 5.5 時間の期間にわたり実質的に該薬物の上昇する血漿濃度を提供する、請求項 38 に記載の投薬形態。

【請求項 44】

投与後 4 時間よりも投与後約 8 時間に高い薬物血漿濃度を提供する、請求項 38 に記載の投薬形態。

【請求項 45】

投与後 4 時間よりも投与後約 6.5 時間に高い薬物血漿濃度を提供する、請求項 38 に記載の投薬形態。

【請求項 46】

薬物が中枢神経作用薬である、請求項 38 に記載の投薬形態。

【請求項 47】

中枢神経作用薬がメチルフェニデート、d - トレオ - メチルフェニデート、アンフェタミン、デキストロアンフェタミン、メタンフェタミン、フェニルイソプロピルアミンおよびベモリンから成る群から選択される中枢神経系刺激薬である、請求項 46 に記載の投薬形態。

【請求項 48】

(a) 少なくとも 1 個の薬物含有層および押出層を含む長手方向に圧縮した浸透性により活性な錠剤コアであって、その長さより短い円周幅を有し、かつ円筒型の先細った端を有し、その端の一方が薬物含有層を有し、他方の端が押出層を含む、錠剤コア；

(b) コンパートメントを形成するために該錠剤コアを取り巻く半透膜；および

(c) 流体の該錠剤コア内への浸透圧性移動に応答して薬物がコンパートメント内から外部流体環境に放出されることを可能にするための、少なくとも 1 個の薬物層に隣接した位置で該半透膜を通して、該錠剤コアへと形成されるオリフィス

を含む投薬形態であって、該投薬形態が、投与後 2.5 時間から始まり、投与後 5.5 時間まで続く期間にわたり該薬物の実質的に上昇する血漿濃度を提供する、投薬形態。

【請求項 49】

それぞれ 1 時間または 1.5 時間の長さを有する 1 回目、2 回目および 3 回目の連続的時間間隔を含む期間にわたり該薬物の実質的に上昇する血漿濃度を提供し、ここで、該投薬形態が 1 回目の間隔より高い 2 回目の投与間隔での薬物濃度を提供し、そして 2 回目の間隔より高い 3 回目の間隔での薬物濃度を提供する、請求項 48 に記載の投薬形態。

【請求項 50】

それぞれ 1 時間または 1.5 時間の長さを有する 1 回目、2 回目、3 回目および 4 回目の時間間隔を含む期間にわたり該薬物の実質的に上昇する血漿濃度を提供し、ここで、該投薬形態が 3 回目の間隔より高い 4 回目の間隔での薬物濃度を提供する、請求項 49 に記載の投薬形態。

【請求項 51】

投薬形態がさらに即時放出薬物層保護膜を含む、請求項 48 に記載の投薬形態。

【請求項 52】

投与後 4 時間の血漿が、該即時放出保護膜からの薬物を含まない、請求項 51 に記載の投薬形態。

【請求項 53】

投与後 1.5 時間から 5.5 時間の期間にわたり実質的に該薬物の上昇する血漿濃度を提供する、請求項 48 に記載の投薬形態。

【請求項 54】

投与後 4 時間よりも投与後約 8 時間に高い薬物血漿濃度を提供する、請求項 48 に記載の投薬形態。

【請求項 55】

投与後 4 時間よりも投与後約 6.5 時間に高い薬物血漿濃度を提供する、請求項 48 に記載の投薬形態。

【請求項 56】

薬物が中枢神経作用薬である、請求項 48 に記載の投薬形態。

【請求項 57】

中枢神経作用薬がメチルフェニデート、d - トレオ - メチルフェニデート、アンフェタミン、デキストロアンフェタミン、メタンフェタミン、フェニルイソプロピルアミンおよびペモリンから成る群から選択される中枢神経系刺激薬である、請求項 56 に記載の投薬形態。

【請求項 58】

メチルフェニデートまたはその薬学的に有効な塩の即時放出部分；およびメチルフェニデートまたはその薬学的に有効な塩と薬学的に許容され得る担体を含む遅延放出部分

を含む経口投与形態であって、

ここで、(i) 該投与形態は投与後 2.5 時間から 5.5 時間の期間にわたりメチルフェニデートまたはその薬学的に有効な塩の実質的に上昇する血漿濃度を提供し、かつ(ii) 実質的に上昇する血漿濃度は、該期間中の連続的な 1 時間または 1.5 時間の血漿濃度の増加を含む、投薬形態。

【請求項 59】

該即時放出部分および遅延放出部分が各々塩酸メチルフェニデートを含む、請求項 58 に記載の投薬形態。

【請求項 60】

投与後 1.5 時間から 5.5 時間の期間にわたり実質的にメチルフェニデートまたはその薬学的に有効な塩の上昇する血漿濃度を提供する、請求項 58 に記載の投薬形態。

【請求項 61】

投与後 4 時間よりも投与後約 7.5 時間に高いメチルフェニデートまたはその薬学的に有効な塩の血漿濃度を提供する、請求項 58 に記載の投薬形態。

【請求項 62】

投与後 2.5 時間よりも投与後約 7.5 時間に高いメチルフェニデートまたはその薬学的

に有効な塩の血漿濃度を提供する、請求項 5 8 に記載の投薬形態。

【請求項 6 3】

浸透性投薬形態である、請求項 5 8 に記載の投薬形態。