

【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5月22日 (2008.5.22)

【公表番号】特表2007-532577(P2007-532577A)
 【公表日】平成19年11月15日 (2007.11.15)
 【年通号数】公開・登録公報2007-044
 【出願番号】特願2007-507560(P2007-507560)
 【国際特許分類】

A 6 1 K 9/70 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 9/70 4 0 1

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/18

【手続補正書】

【提出日】平成20年4月7日 (2008.4.7)

【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】

体表面を通して活性物質を投与するための経皮デリバリー・システムであって、以下の

：
 (a) 活性物質のリザーバー及び皮膚接触粘着層の両方の役割を果たすポリマー製のマトリックス、ここで当該マトリックスは、ポリイソブチレン・ゴムと、約 $1\ \mu\text{m}$ (ミクロン) ～ $300\ \mu\text{m}$ (ミクロン) の範囲の粒子サイズを有する粉末形態の不溶性親水性ポリマーとの実質的に均一な混合物を含み、

(b) 治療有効量の活性物質、フラックスを増大するのに有効な量の塩基性浸透促進組成物、及び医薬として許容される水性ビヒクルを含む上記ポリマー製マトリックス中に吸着された医薬製剤

(c) 使用される装置の外側表面としての役割を果たすポリマー製マトリックスに積層された裏打ち層

を含む、前記デリバリー・システム。

【請求項 2】

前記ポリイソブチレン・ゴムが：

(a) 活性物質の投与の間、皮膚へのデリバリーシステムの付着を保証するために十分な粘着性を、前記ポリマー製マトリックスに与えるように選ばれる分子量を有するか、

(b) 活性物質の投与の間、皮膚へのデリバリーシステムの付着を保証するために十分な粘着性を、前記ポリマー製マトリックスに与えるように選ばれる添加剤と混合することにより改変されるか、或いは

(c) (a) 及び (b) の両方である、請求項 1 に記載のシステム。

【請求項 3】

前記添加剤が、ポリブテンを含む、請求項 2 に記載のシステム。

【請求項 4】

前記ポリマー製マトリックスが、活性物質の投与の間、皮膚へのデリバリーシステムの

付着を保証するために十分な粘着性を当該ポリマー製マトリックスに与えるために十分な量の吸水性ポリマー；及び乳化剤のうちの少なくとも1つをさらに含む、請求項1～3のいずれか一項に記載のシステム。

【請求項5】

前記吸水性ポリマーが、ポリアルキレン・オキシドであり、そして前記乳化剤が脂肪酸又は脂肪性アルコールである、請求項4に記載のシステム。

【請求項6】

前記不溶性親水性ポリマーが、約 $10\text{ }\mu\text{m}$ (ミクロン) ～ $200\text{ }\mu\text{m}$ (ミクロン) の範囲内の粒子サイズを有する、請求項1に記載のシステム。

【請求項7】

前記不溶性親水性ポリマーが、約 $20\text{ }\mu\text{m}$ (ミクロン) ～ $150\text{ }\mu\text{m}$ (ミクロン) の範囲内の粒子サイズを有する、請求項6に記載のシステム。

【請求項8】

前記不溶性親水性ポリマーが、約 $40\text{ }\mu\text{m}$ (ミクロン) ～ $90\text{ }\mu\text{m}$ (ミクロン) の範囲内の粒子サイズを有する、請求項7に記載のシステム。

【請求項9】

前記不溶性親水性ポリマーが、約 $0.1\text{ g/cm}^3 \sim 0.5\text{ g/cm}^3$ の範囲内のかさ密度を有する、請求項1に記載のシステム。

【請求項10】

前記不溶性親水性ポリマーが、約 $0.2\text{ g/cm}^3 \sim 0.4\text{ g/cm}^3$ の範囲内のかさ密度を有する、請求項9に記載のシステム。

【請求項11】

前記不溶性親水性ポリマーが、軽く架橋されている、請求項1に記載のシステム。

【請求項12】

前記不溶性親水性ポリマーが、架橋されていない、請求項1に記載のシステム。

【請求項13】

前記不溶性親水性ポリマーが、架橋及び非架橋ポリマーの混合物を含む、請求項1に記載のシステム。

【請求項14】

前記不溶性親水性ポリマーが、以下の：ポリビニルポリピロリドン；ポリ(N-ビニル-2-カプロラクタム)；ポリ(N-ビニル-2-バレロラクタム)；カルボキシメチルセルロース・ナトリウム；デンプンのポリ(アクリルアミド-アクリル酸)ナトリウム塩；及びポリアクリル酸ナトリウムから選ばれる、請求項1に記載のシステム。

【請求項15】

前記塩基性浸透促進組成物が、無機塩基、有機塩基、及びそれらの混合物から選ばれる塩基性浸透促進剤を含む、請求項1に記載のシステム。

【請求項16】

前記塩基性浸透促進組成物が、無機塩基を含む、請求項15に記載のシステム。

【請求項17】

前記無機塩基が、無機水酸化物である、請求項16に記載のシステム。

【請求項18】

前記無機水酸化物が、水酸化アンモニウム、アルカリ金属水酸化物、アルカリ土類金属水酸化物、及びそれらの組合せから選ばれる、請求項17に記載のシステム。

【請求項19】

前記無機水酸化物が、アルカリ金属水酸化物である、請求項18に記載のシステム。

【請求項20】

前記アルカリ金属水酸化物が、水酸化ナトリウムである、請求項19に記載のシステム。

【請求項21】

前記塩基性浸透促進組成物が、少なくとも1の無機水酸化物及び少なくとも1の窒素含

有塩基を含む、請求項 15 に記載のシステム。

【請求項 22】

前記無機水酸化物が、水酸化アンモニウム、アルカリ金属水酸化物、アルカリ土類金属水酸化物、及びそれらの組合せから選ばれ、そして前記窒素含有塩基が尿素及びアミノアルコールから選ばれる、請求項 21 に記載のシステム。

【請求項 23】

前記無機水酸化物が、アルカリ金属水酸化物であり、そして前記窒素含有塩基がアミノ・アルコールである、請求項 22 に記載のシステム。

【請求項 24】

前記アミノアルコールが、構造式： $\text{NR}^1\text{R}^2\text{R}^3$ [式中、 R^1 は、ヒドロキシ置換ヒドロカルビルであり、そして R^2 及び R^3 がH、ヒドロカルビル、及びヒドロキシ置換ヒドロカルビルから選ばれる]のアミノアルコールである、請求項 23 に記載のシステム。

【請求項 25】

R^1 が、1～12個の水酸基で置換される $\text{C}_1\text{-C}_{12}$ アルキルであり、そして R^2 及び R^3 は、H、 $\text{C}_1\text{-C}_{12}$ アルキル、及び1～12個の水酸基で置換される $\text{C}_1\text{-C}_{12}$ アルキルから選ばれる、請求項 24 に記載のシステム。

【請求項 26】

R^1 が、1～5個の水酸基で置換される $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキルであり、そして R^2 及び R^3 が、H、 $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキル、及び1～5個の水酸基で置換される $\text{C}_1\text{-C}_6$ アルキルから選ばれる、請求項 25 に記載のシステム。

【請求項 27】

R^1 、 R^2 、及び R^3 が、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ であり、その結果、前記アミノアルコールがトリエタノールアミンである、請求項 26 に記載のシステム。

【請求項 28】

R^1 及び R^2 が、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OH}$ であり、そして R^3 がHであり、その結果、前記アミノアルコールがジエタノールアミンである、請求項 26 に記載のシステム。

【請求項 29】

R^1 が、 $-\text{CH}_2\text{-}[\text{CH}(\text{OH})]_4\text{-CH}_2\text{OH}$ であり、 R^2 が CH_3 であり、そして R^3 がHであり、その結果、前記アミノアルコールがジエタノールアミンである、請求項 26 に記載のシステム。

【請求項 30】

前記活性物質の見かけの水溶性が、pHを増加させると共に増加する、請求項 1 に記載のシステム。

【請求項 31】

前記活性物質の見掛けの水溶性が、25℃で計測した場合、pH8.0で5mg/mlより大きい、請求項 30 に記載のシステム。

【請求項 32】

前記活性物質の見掛けの水溶性が、25℃で計測した場合、pH9.0で10mg/mlより大きい、請求項 31 に記載のシステム。

【請求項 33】

前記活性物質が、イオン性である、請求項 1 に記載のシステム。

【請求項 34】

前記活性物質が、塩基添加塩の形態の酸性物質である、請求項 33 に記載のシステム。

【請求項 35】

前記活性物質が、鎮痛薬、麻酔薬、抗狭心症薬、抗関節炎薬、抗不整脈薬、抗喘息薬、抗生物質、抗癌剤、抗コリン薬、抗凝血薬、抗痙攣薬、抗うつ薬、抗糖尿病薬、抗真菌薬、抗緑内障薬、抗通風薬、駆虫薬、抗ヒスタミン薬、抗高脂血症薬、降圧薬、抗炎症薬、抗マラリア薬、片頭痛薬、抗ムスカリン薬、制吐薬、抗肥満薬、抗骨粗鬆症薬、抗パニック薬、抗パーキンソン薬、抗原虫薬、鎮痒薬、抗精神病薬、解熱薬、抗結核薬、鎮咳薬、抗潰瘍薬、抗ウイルス薬、抗不安薬、食欲抑制薬、カルシウムチャンネル拮抗薬、心臓強心

薬、 β 遮断薬、骨密度調節薬、中枢神経系刺激薬、認知亢進薬、副腎皮質ステロイド、鬱血除去薬、利尿薬、胃腸薬、遺伝物質、ホルモノリティック(hormonolytics)、催眠薬、血糖降下薬、免疫抑制剤、角質溶解薬、ロイコトリエン阻害薬、マクロライド、有糸分裂阻害薬、筋弛緩剤、麻薬拮抗薬、神経遮断薬、ニコチン、副交感神経遮断薬、鎮静薬、性ホルモン、交感神経刺激薬、子宮収縮抑制薬、精神安定薬、血管拡張薬、ビタミン、及びそれらの組合せから選ばれる、請求項 1 に記載のシステム。

【請求項 36】

前記裏打ち層が、密封性である、請求項 1 に記載のシステム。

【請求項 37】

以下の：

(a) ポリイソブチレン・ゴム及び約 $1\ \mu\text{m}$ (ミクロン) $\sim 300\ \mu\text{m}$ (ミクロン) の範囲の粒子サイズを有する粉末形態の不溶性親水性ポリマーの実質的に均一な混合物を含むポリマー製マトリックス；

(b) 治療有効量の活性物質、フラックスを増大するのに有効な量の塩基性浸透促進組成物、及び医薬として許容される水性ビヒクルを含む、ポリマー製マトリックス中に吸着される医薬製剤

を含む活性物質リザーバー。