

【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27年4月9日(2015.4.9)

【公開番号】特開2015-34182(P2015-34182A)

【公開日】平成27年2月19日(2015.2.19)

【年通号数】公開・登録公報2015-011

【出願番号】特願2014-232639(P2014-232639)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/06 (2006.01)

A 6 1 P 1/08 (2006.01)

A 6 1 P 23/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/445 (2006.01)

A 6 1 K 31/167 (2006.01)

A 6 1 K 31/439 (2006.01)

A 6 1 K 31/4178 (2006.01)

A 6 1 K 31/46 (2006.01)

A 6 1 K 31/4168 (2006.01)

A 6 1 K 31/498 (2006.01)

A 6 1 K 31/4174 (2006.01)

A 6 1 K 31/4164 (2006.01)

A 6 1 K 31/7048 (2006.01)

A 6 1 K 31/166 (2006.01)

A 6 1 K 31/137 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 9/06

A 6 1 P 1/08

A 6 1 P 23/00

A 6 1 K 31/445

A 6 1 K 31/167

A 6 1 K 31/439

A 6 1 K 31/4178

A 6 1 K 31/46

A 6 1 K 31/4168

A 6 1 K 31/498

A 6 1 K 31/4174

A 6 1 K 31/4164

A 6 1 K 31/7048

A 6 1 K 31/166

A 6 1 K 31/137

【手続補正書】

【提出日】平成27年2月19日(2015.2.19)

【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】

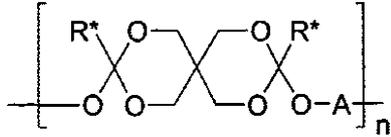
【請求項 1】

薬学的組成物であって、

(a) 半固体送達賦形剤であって：

(i) 式 I のポリオルトエステルであって

【化 1】



(I)

式中、

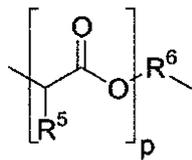
R^* は C_{1-4} アルキルであり；

n は少なくとも 5 の整数であり；

A は、 R^1 、 R^3 または R^4 であり、ここで

R^1 は：

【化 2】



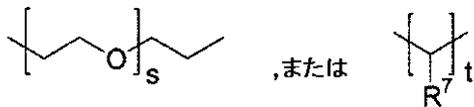
であり

p は 1 ~ 20 の整数であり；

R^5 は水素またはメチルであり；

R^6 は：

【化 3】



であり、

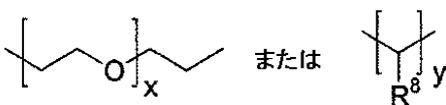
s は 0 ~ 10 の整数であり；

t は 2 ~ 30 の整数であり；

R^7 は水素またはメチルであり；

R^3 は：

【化 5】



であり；

x は 0 ~ 10 の整数であり

y は 2 ~ 30 の整数であり；

R^8 は水素またはメチルであり；

R^4 は、アミド基、イミド基、尿素基およびウレタン基から独立に選択される少なくとも

一つの官能基を含むジオールの残基であり；

ここで、A単位の少なくとも0.01モル%が、該式R¹である、ポリオルトエステル；
ならびに

(i i) 200から4000の間の分子量を有するポリエチレングリコールエーテル
誘導体、400から4000の間の分子量を有するポリエチレングリコールコポリマー、
C₂₋₁₉脂肪族カルボン酸のモノグリセリド、ジグリセリドまたはトリグリセリドまた
はこのような酸の混合物、アルコキシル化テトラヒドロフルフリルアルコールおよびこれ
らのC₁₋₄アルキルエーテルおよびC₂₋₁₉脂肪族カルボン酸エステル、および生体
適合性オイルから選択される、薬学的に許容可能な、ポリオルトエステル適合性液体補形
剤

を含む半固体送達賦形剤；ならびに

(b) グラニセトロン

を含む薬学的組成物。

【請求項2】

nが5~1000の整数であり、

前記ポリオルトエステルが1,000から20,000から、好ましくは1,000か
ら10,000から、より好ましくは1,000から8,000から選択される分子量を
有する、

R⁴は、1個または2個のアミド基、イミド基、尿素基またはウレタン基で割り込まれた
2個~20個の炭素原子、好ましくは2個~10個の炭素原子の脂肪族ジオールの残基で
あり；

AがR¹である単位の割合が、約0.01モル%~50モル%、好ましくは0.05モ
ル%~30モル%、より好ましくは0.1モル%~25モル%であり；そして

AがR⁴である単位の割合が、20%より少なく、好ましくは10%より少なく、特に
5%より少ない、

請求項1に記載の薬学的組成物。

【請求項3】

sが1~4の整数である、請求項2に記載の薬学的組成物。

【請求項4】

tが2~10の整数である、請求項2または3に記載の薬学的組成物。

【請求項5】

xが1~4の整数である、請求項2~4のいずれか1項に記載の薬学的組成物。

【請求項6】

yが2~10の整数である、請求項2~5のいずれか1項に記載の薬学的組成物。

【請求項7】

AがR¹である単位の割合が、約0.1モル%~25モル%である、請求項2~6のい
ずれか1項に記載の薬学的組成物。

【請求項8】

AがR⁴である単位の割合が、5%よりも少ない、請求項2~6のいずれか1項に記載
の薬学的組成物。

【請求項9】

sが1~4の整数であり；tが2~10の整数であり；xが1~4の整数であり；yが
2~10の整数であり；AがR¹である単位の割合が、約0.1モル%~25モル%であ
り、そしてAがR⁴である単位の割合が、5%よりも少ない、

請求項2に記載の薬学的組成物。

【請求項10】

1重量%から5重量%のグラニセトロンを含む、請求項1~9のいずれか1項に記載の
薬学的組成物。

【請求項11】

グラニセトロンの濃度が2重量%から3重量%の間である、請求項10に記載の薬学的

組成物。

【請求項 1 2】

前記薬学的に許容可能な、ポリオルトエステル適合性液体補形剤が 20 ~ 60 重量%の前記送達賦形剤を含む、請求項 1 ~ 1 1 のいずれか 1 項に記載の薬学的組成物。

【請求項 1 3】

前記ポリオルトエステルが、3, 9 - ジ(エチリデン) - 2, 4, 8, 10 - テトラオキサスピロ[5.5]ウンデカン(DETOSU)、トリエチレングリコール(TEG)、およびトリエチレングリコールジグリコリド(TEG-diGL)から調製される、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか 1 項に記載の薬学的組成物。

【請求項 1 4】

前記ポリオルトエステルが、DETOSU、TEGTEG-diGLから、DETOSU:TEG:TEG-diGLのモル比90:80:20で調製され、そして約6,500の分子量を有する、請求項 1 3 に記載の薬学的組成物。

【請求項 1 5】

約78.4重量%の前記ポリオルトエステル、約19.6重量%のポリエチレングリコールモノメチルエーテル550、および約2.0重量%のグラニセトロンを含む、請求項 1 4 に記載の薬学的組成物。

【請求項 1 6】

局所用、注射器使用可能または注射可能形態である、請求項 1 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の薬学的組成物。

【請求項 1 7】

さらに第2の制吐剤を含む、請求項 1 ~ 1 6 のいずれか 1 項に記載の薬学的組成物。

【請求項 1 8】

化学療法薬によって患者において誘起される嘔吐の予防のための方法における使用のための；あるいは、化学療法薬によって、放射能誘起性悪心および嘔吐によって、および/または手術後誘起性悪心および嘔吐によって患者において誘起される嘔吐の処置のための方法における使用のための、請求項 1 ~ 1 7 のいずれか 1 項に記載の薬学的組成物。

【請求項 1 9】

化学療法薬によって患者において誘起される嘔吐の予防における使用のための方法における使用のための；あるいは、化学療法薬によって、放射能誘起性悪心および嘔吐によって、および/または手術後誘起性悪心および嘔吐によって患者において誘起される嘔吐の処置のための方法における使用のための、薬品の製造のための請求項 1 ~ 1 7 のいずれか 1 項に記載の薬学的組成物の使用。