

【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23年5月12日(2011.5.12)

【公表番号】特表2011-508789(P2011-508789A)

【公表日】平成23年3月17日(2011.3.17)

【年通号数】公開・登録公報2011-011

【出願番号】特願2010-542438(P2010-542438)

【国際特許分類】

A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/02	(2006.01)
A 6 1 K	9/20	(2006.01)
A 6 1 K	47/34	(2006.01)
A 6 1 K	31/137	(2006.01)
A 6 1 K	31/4168	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	45/00	
A 6 1 P	43/00	1 0 5
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	25/02	1 0 5
A 6 1 K	9/20	
A 6 1 K	47/34	
A 6 1 K	31/137	
A 6 1 K	31/4168	

【手続補正書】

【提出日】平成23年3月25日(2011.3.25)

【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】

変性円板及び／又は椎間関節からの疼痛及び／又は炎症を抑制、予防、又は治療するような治療を必要とする患者においてそれをするのに有用な埋込型薬物デポー剤であり、治療有効量の アドレナリン作動性アゴニストを含んでなり、変性円板及び／又は椎間関節からの疼痛及び／又は炎症を抑制、予防、又は治療するために変性円板及び／又は椎間関節又はその付近に埋め込み可能であり、ここで有効量の アドレナリン作動性アゴニストを少なくとも1日の期間にわたり放出することが可能である、前記埋込型薬物デポー剤。

【請求項2】

アドレナリン作動性アゴニストを3日～12ヶ月の期間にわたり放出して、変性円板は椎間板ヘルニアを含む、請求項1に記載の埋込型薬物デポー剤。

【請求項3】

アドレナリン作動性アゴニストが 2アドレナリン作動性アゴニストを含む、請求項1または2に記載の埋込型薬物デポー剤。

**【請求項 4】**

2アドレナリン作動性アゴニストが、L-ノルエピネフリン、クロニジン、デクスマトデミジン、アラクロニジン、チザニジン、ブリモニジン、キシロメタゾリン、テトラヒドロゾリン、オキシメタゾリン、グアンファシン、グアナベンツ、キシラジン、モキソニジン、メデトミド、リルメニジン、U K 14,304、B-HT 933、B-HT 920、ミバゼロール、オクトパミン、チザニジン、又はこれらの組合せを含む、請求項3に記載の埋込型薬物デポー剤。

**【請求項 5】**

ポリ(ラクチド-コ-グリコリド)(PLGA)、ポリラクチド(PLA)、ポリグリコリド(PGA)、D-ラクチド、D,L-ラクチド、L-ラクチド、D,L-ラクチド-コ-カプロラクトン、D,L-ラクチド-コ-グリコリド-コ-カプロラクトン、又はこれらの組合せの1以上を含んでなる少なくとも1つの生分解性ポリマーを含む、請求項1ないし4のいずれか1項に記載の埋込型薬物デポー剤。

**【請求項 6】**

(i) ボーラス用量のアドレナリン作動性アゴニストを変性円板又はその付近で3日間までの期間にわたり、そして(ii)有効量のアドレナリン作動性アゴニストを12ヶ月までの期間にわたり放出する、請求項1ないし5のいずれか1項に記載の埋込型薬物デポー剤。

**【請求項 7】**

その中に負荷したアドレナリン作動性アゴニストの全量に対して約20%～約99%のアドレナリン作動性アゴニストを、それを変性円板及び/又は椎間関節又はその付近へ投与した後の3日～12ヶ月の期間にわたり放出する、請求項1ないし6のいずれか1項に記載の埋込型薬物デポー剤。

**【請求項 8】**

変性円板及び/又は椎間関節からの疼痛及び炎症を抑制、治療、又は予防するために、0.1mg～100mgの2アドレナリン作動性アゴニストを少なくとも3日の期間の間に24～48時間にわたり放出する、請求項3に記載の埋込型薬物デポー剤。

**【請求項 9】**

その全重量に基づいて約5重量%～約15重量%のクロニジンと少なくとも80重量%の生分解性ポリマーを含み、有効量のクロニジンを少なくとも150日の期間にわたり放出するように適用される、請求項4に記載の埋込型薬物デポー剤。

**【請求項 10】**

椎間板ヘルニアの5cm以内に埋め込まれて、クロニジンは、椎間板ヘルニアからの疼痛及び/又は炎症を抑制する、請求項4に記載の埋込型薬物デポー剤。

**【請求項 11】**

変性円板及び/又は椎間関節からの疼痛及び/又は炎症を治療するような治療を必要とする患者においてそれをするのに有用な生分解性薬物デポー剤であって、治療有効量のアドレナリン作動性アゴニストを含んでなり、該薬物デポー剤は変性円板及び/又は椎間関節又はその付近に投与される、ここで該薬物デポー剤は有効量のアドレナリン作動性アゴニストを少なくとも1日の期間にわたり放出して、そしてここで薬物デポー剤は、ポリ(ラクチド-コ-グリコリド)(PLGA)、ポリラクチド(PLA)、ポリグリコリド(PGA)、D-ラクチド、D,L-ラクチド、L-ラクチド、D,L-ラクチド-カプロラクトン、D,L-ラクチド-グリコリド-カプロラクトン、又はこれらの組合せを含んでなるポリマーを含む、前記生分解性薬物デポー剤。

**【請求項 12】**

疼痛及び炎症を抑制、治療、又は予防するために、薬物デポー剤が0.1mg～100mgのアドレナリン作動性アゴニストを少なくとも3日の期間の間に24～48時間にわたり放出する、請求項11に記載の生分解性薬物デポー剤。

**【請求項 13】**

薬物デポー剤が(i)ボーラス用量のアドレナリン作動性アゴニストを変性円板又は

その付近で 3 日～14 日までの期間にわたり、そして( i i ) 有効量の アドレナリン作動性アゴニストを 150 日までの期間にわたり放出する、請求項 11 または 12 に記載の 生分解性薬物デポー剤。

【請求項 14】

変性円板及び／又は椎間関節からの疼痛及び／又は炎症を抑制するような治療を必要とする患者においてそれをするのに有用な生分解性薬物デポー剤であって、治療有効量の 2 アドレナリン作動性アゴニストを含んでなり、該薬物デポー剤は該患者の変性円板及び／又は椎間関節又はその付近へ送達される、ここで薬物デポー剤は有効量の 2 アドレナリン作動性アゴニストを少なくとも 1 日の期間にわたり放出する、前記生分解性薬物デポー剤。

【請求項 15】

変性円板及び／又は椎間関節からの疼痛及び／又は炎症を患者において抑制、予防、又は治療するのに有用な埋込型薬物デポー剤であり、治療有効量の 2 アドレナリン作動性アゴニストとポリマーを含んでなり；ここで、疼痛及び／又は炎症を抑制、予防、又は治療するために変性円板及び／又は椎間関節又はその付近に埋め込み可能であり、そして( i ) 72 時間までの第一期間にわたり、それに負荷した 2 アドレナリン作動性アゴニストの全量に対して約 5 %～約 20 % の 2 アドレナリン作動性アゴニストを、そして( i i ) 12 ヶ月までの後続期間にわたり、それに負荷した 2 アドレナリン作動性アゴニストの全量に対して約 21 %～約 99 % の 2 アドレナリン作動性アゴニストを放出することが可能である、前記埋込型薬物デポー剤。