

【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4月7日 (2011.4.7)

【公表番号】特表2008-513524(P2008-513524A)

【公表日】平成20年5月1日 (2008.5.1)

【年通号数】公開・登録公報2008-017

【出願番号】特願2007-532749(P2007-532749)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/50 (2006.01)

A 6 1 K 9/06 (2006.01)

A 6 1 K 9/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 31/381 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 9/50

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 9/00

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 31/381

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 25/16

【誤訳訂正書】

【提出日】平成23年2月17日 (2011.2.17)

【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

ドーパミン受容体アゴニスト、及び医薬として許容される生物分解性ポリマー補助剤を含む、パーキンソン病の治療のための長時間作用する持続放出製剤であり、ここで当該持続放出製剤中の前記ドーパミン受容体アゴニストの量が 5 ～ 50 重量%であり、及び前記医薬として許容されるポリマー補助剤の量が 50 ～ 95 重量%であり、前記医薬として許容されるポリマー補助剤中において前記ドーパミン受容体アゴニストが固溶体状態で存在する、前記製剤。

【請求項 2】

前記ドーパミン受容体アゴニストが、ロチゴチン、プラミペキソール、ロピニロール、ベルゴリド、テルグリド、キナゴリド、カベルゴリン、スマニロール、7 - [4 - メチル - 1 - ピペラジニル] - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オン (S L V - 3 0 8)、アドロゴリド (adrogolide) (A B T - 4 3 1)、ジナブソリン (Dinapsoline)、及び (5 R , 8 R , 1 0 R) - 6 - メチル - 8 - (1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル) エルゴリン (B A M - 1 1 1 0)、及びそれらの誘導体又は医薬として許容される塩、並びにそれらの複数の組み合わせからなる群より選択される、請求項 1 に記載の持続放出製剤。

【請求項 3】

前記医薬として許容される生物分解性補助剤が、ポリ(ラクチド-グリコリド)、ポリ乳酸、ポリグリコール酸、ポリ(3-ヒドロキシ-ブチラート)、ポリラクトン、ポリアンハイドライド、ポリ(ヒドロキシブチラート)-コ-(ヒドロキシ-バレラート)、ポリプロピレングルコース、ポリ(乳酸)-ポリグリコール、及びポリ(ヒドロキシ酢酸)-ポリグリコール、並びにそれらの複数の組み合わせから選択される、請求項1に記載の持続放出製剤。

【請求項4】

前記持続放出製剤が、注入可能なマイクロスフィア、注入可能なゲル、又は移植片である、請求項1に記載の持続放出製剤。

【請求項5】

前記医薬として許容される生物分解性ポリマー補助剤が、ポリ(ラクチド-グリコリド)、ポリ乳酸、及びポリアンハイドライド、又はそれらの複数の組み合わせから選択されるものである、請求項1～4のいずれか1項に記載の持続放出製剤。

【請求項6】

前記医薬として許容される生物分解性ポリマー補助剤が、ポリ(ラクチド-グリコリド)である、請求項1～4のいずれか1項に記載の持続放出製剤。

【請求項7】

前記ポリ(ラクチド-グリコリド)が、5,000～100,000ダルトンの分子量を有する、請求項6に記載の前記持続放出製剤。

【請求項8】

前記ポリ(ラクチド-グリコリド)におけるラクチド対グリコリドの重合比が、95:5～5:95である、請求項6又は7に記載の持続放出製剤。

【請求項9】

前記ポリ(ラクチド-グリコリド)におけるラクチド対グリコリドの重合比が、75:25～25:75である、請求項6に記載の前記持続放出製剤。

【請求項10】

前記持続放出製剤が、注入可能な持続放出マイクロスフィアであって、かつ50～200ミクロン内の粒径を有する、請求項1～4のいずれか1項に記載の持続放出製剤。

【請求項11】

前記持続放出製剤が、注入可能なゲル又は移植片であるとともに、前記医薬として許容されるポリマー補助剤が、ポリ(乳酸)又はポリアンハイドライドである、請求項1～4のいずれか1項に記載の持続放出製剤。

【請求項12】

前記ポリ(乳酸)又はポリアンハイドライドが、2,000～1,000,000ダルトンの分子量を有する、請求項11に記載の前記持続放出製剤。

【請求項13】

当該ドーパミン受容体アゴニストの医薬として許容される塩が、活性成分と、無機酸、有機酸又は酸性アミノ酸からなる、請求項1～12のいずれか1項に記載の持続放出製剤。

【請求項14】

前記無機酸が塩酸、硫酸、リン酸又は硝酸であり；前記有機酸がクエン酸、フマル酸、マレイン酸、酢酸、安息香酸、メタンスルホン酸、ナフタレンスルホン酸又はp-トルエンスルホン酸であり；そして前記酸性アミノ酸がグルタミン酸又はアスパラギン酸である、請求項13に記載の持続放出製剤。

【請求項15】

プラミペキソール、あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩が、プラミペキソールの遊離塩基又は二塩酸塩であり、ロピニロール、あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩が、ロピニロールの遊離塩基又は塩酸塩であり、ベルゴリド、あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩が、ベルゴリドの遊離塩基

又はメタンスルホン酸塩であり、

カベルゴリン、あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩が、カベルゴリンの遊離塩基又はニリン酸塩であり、

テルグリド、あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩が、テルグリドの遊離塩基又はマレイン酸塩であり、

キナゴリド、あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩が、キナゴリドの遊離塩基又は塩酸塩であり、

スマニロール、あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩が、スマニロールの遊離塩基又はマレイン酸塩であり、

7 - [4 - メチル - 1 - ピペラジニル] - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オン (S L V - 3 0 8) あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩が、7 - [4 - メチル - 1 - ピペラジニル] - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンの遊離塩基又は塩酸塩であり、

、
アドロゴリド (adrogolide) (A B T - 4 3 1) 、あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩が、アドロゴリド又はの塩酸塩、又はその形質転換体である A - 8 6 9 2 9 であり、

ジナプソリン (Dinapsoline) 、あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩が、ジナプソリン又はジナプソリン臭化水素酸塩であり、そして

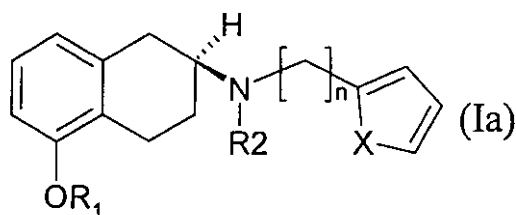
(5 R , 8 R , 1 0 R) - 6 - メチル - 8 - (1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル) エルゴリン (B A M - 1 1 1 0) 、あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩が、(5 R , 8 R , 1 0 R) - 6 - メチル - 8 - (1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル) エルゴリンの遊離塩基又はマレイン酸塩である、

請求項 1 4 に記載の持続放出製剤。

【請求項 1 6】

前記ドーパミン受容体アゴニストは一般式 (I a) に示されるロチゴチン、あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩であり、ここで当該一般式 (I a) は、以下の：

【化 1】



{ 式中、R₁ は、水素原子、C₁ ~ C₁₀ アルキルアシル又はアリールアシル表し、

R₂ は、水素原子、又は C₁ ~ C₁₀ アルキル表し、

X は、炭素原子又は窒素原子又は酸素原子又は硫黄原子を表し、

n は、1 ~ 10 より選択される整数である } であり、そして、前記それらの医薬として許容される塩が、塩酸、酢酸、リン酸、硫酸、乳酸又はクエン酸とからなる、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の持続放出製剤。

【請求項 1 7】

R₁ が、水素原子、C₂ ~ C₄ アルキルアシル又はアリールアシルである、請求項 1 6 に記載の持続放出製剤。

【請求項 1 8】

R₂ が、C₂ ~ C₄ アルキルである、請求項 1 6 又は 1 7 に記載の持続放出製剤。

【請求項 19】

n が、1～3の整数である、請求項 16～18のいずれか一項に記載の持続放出製剤。

【請求項 20】

前記ロチゴチン、あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩が、ロチゴチン、ロチゴチンホルマート、ロチゴチンアセテート、ロチゴチンベンゾエート、ロチゴチンブチラート、ロチゴチンイソブチラート又はそれらのヒドロクロリドである、請求項 16～19のいずれか一項に記載の持続放出製剤。

【請求項 21】

当該ドーパミン受容体アゴニストの量が、10～40重量%であり、前記医薬として許容されるポリマー補助剤が60～90重量%である、請求項 1～20のいずれか 1 項に記載の持続放出製剤。

【請求項 22】

前記ドーパミン受容体アゴニストがロチゴチン、あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩であり、前記持続放出製剤がマイクロスフィアである請求項 1～10、16～21のいずれか 1 項に記載の持続放出製剤。

【請求項 23】

当該ロチゴチン及び誘導体又はそれらの医薬として許容される塩の量が、10～30重量%であり、そして前記医薬として許容されるポリマー補助剤の量が、70～90重量%である、請求項 22 記載の持続放出製剤。

【請求項 24】

前記持続放出製剤が、注入可能なマイクロスフィアであるとともに：
有機溶媒中に、前記ドーパミン受容体アゴニスト、及び医薬として許容される生物分解性ポリマー補助剤を溶解し；
当該有機溶媒相を、医薬として許容される水溶性ポリマーの連続水相に注入し、マイクロスフィアを形成させ；次いで、
当該有機溶媒を揮発させ；
ろ過し、当該持続放出マイクロスフィアを得る、
ことを含んでなる製法により製造され、
ここで、当該有機溶媒は、ジクロロメタン、クロロホルム、酢酸エチル、エチルエーテル、又はそれらの混合された溶媒から選択され、当該有機溶媒中の医薬として許容される生物分解性補助剤の量は、1～30% (w/v) であり、当該医薬として許容される水溶性ポリマーは、ポリビニルアルコール、ソジウムカルボキシメチルセルロース、ポリビニルピロリドン、ソジウムポリメタクリレート、ソジウムポリアクリレート、及びそれらの複数の混合物から選択され、そして、当該水相中のその量は、0.1～5% (w/v) である、請求項 1～23のいずれか 1 項に記載の持続放出製剤。

【請求項 25】

前記持続放出製剤が、注入可能なマイクロスフィアであるとともに：
有機溶媒中に、前記ドーパミン受容体アゴニスト、及び医薬として許容される生物分解性ポリマー補助剤を溶解し；
当該溶液をスプレー乾燥させマイクロスフィアを得る、
ことを含んでなる製法により製造され、
ここで、当該有機溶媒は、ジクロロメタン、クロロホルム、酢酸エチル、ジオキサン、エチルエーテル、アセトン、テトラヒドロフラン、氷酢酸、及びそれらの複数の混合物から選択される、請求項 1～23のいずれか 1 項に記載の持続放出製剤。

【請求項 26】

前記持続放出製剤が、注入可能なマイクロスフィアであるとともに：
有機溶媒中に、前記ドーパミン受容体アゴニスト、及び医薬として許容される生物分解性ポリマー補助剤を溶解して有機溶液とし；
得られた有機溶液を有機非溶媒中に噴霧して噴霧抽出し、マイクロスフィアを得る、
ことを含んでなる製法により製造され、

ここで、当該有機溶媒は、ジクロロメタン、クロロホルム、酢酸エチル、ジオキサン、アセトン、テトラヒドロフラン、氷酢酸、ベンゼン、トルエン又はそれらの複数の混合物から選択され、及び当該有機非溶媒は、メタノール、エタノール、イソプロパノール、プロパノール、ペトロレウムエーテル、アルカン、パラフィン又は複数の混合物から選択される、請求項 1 ~ 23 のいずれか 1 項に記載の持続放出製剤。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0022

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0022】

さらに具体的には、プラミペキソール、あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩は、プラミペキソールの遊離塩基又はプラミペキソール二塩酸塩などであり；ロビニロール、あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩は、ロビニロールの遊離塩基又はロビニロール塩酸塩などであり；ペルゴリド、あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩は、ペルゴリドの遊離塩基又はペルゴリドメタンスルホン酸塩などであり；カベルゴリン、あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩は、カベルゴリンの遊離塩基又はカベルゴリンニリン酸塩などであり；テルグリド、あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩は、テルグリドの遊離塩基又はテルグリドマレイン酸塩などであり；キナゴリド、あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩は、キナゴリドの遊離塩基又はキナゴリド塩酸塩などであり；スマニロール、あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩は、スマニロールの遊離塩基又はスマニロールマレイン酸塩などであり；7-[4-メチル-1-ピペラジニル]-ベンゾオキサゾール-2(3H)-オン(SLV-308)あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩は、SLV-308の遊離塩基又はSLV-308の塩酸塩などであり；アドロゴリド(adrogolide)、あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩は、アドロゴリド、アドロゴリド塩酸塩又はその形質転換体であるA-86929などであり；ジナプソリン(Dinapsoline)、あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩は、ジナプソリン又はジナプソリン臭化水素酸塩などであり；そして、(5R, 8R, 10R)-6-メチル-8-(1, 2, 4-トリアゾール-1-イルメチル)エルゴリン(BAM-1110)、あるいはその誘導体又は医薬として許容される塩は、BAM-1110又はBAM-1110のマレイン酸塩などである。

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0031

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0031】

本発明において、プラミペキソール又はその誘導体あるいはそれら医薬として許容される塩は、欧州特許第EP186087号、及び米国特許第US4886812号に開示されるような関連化合物であり、他の文献に開示されるような他の改良された化合物又は医薬として許容される塩は、好ましくは、プラミペキソールの遊離塩基又はプラミペキソール二塩酸塩などである。

【誤訳訂正 4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0032

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0032】

ロビニロール又はその誘導体、あるいはそれらの医薬として許容される塩は、米国特許第US4452808号に開示されるような関連化合物、あるいは他の文献に開示される

ロピニロール誘導体又はそれらの医薬として許容される塩であり、好ましくはロピニロールの遊離塩基又はロピニロール塩酸塩などである。

【誤訳訂正 5】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0033

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0033】

ペルゴリド又はその誘導体、あるいはそれらの医薬として許容される塩は、米国特許第US4166182号に開示されるような関連化合物、あるいは他の文献に開示されるペルゴリド誘導体又はそれらの医薬として許容される塩から選択されるもの、好ましくはペルゴリドの遊離塩基又はペルゴリドメタンスルホン酸塩などである。

【誤訳訂正 6】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0034

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0034】

カベルゴリン又はその誘導体、あるいはそれらの医薬として許容される塩は、米国特許第US4526892号、及び欧州特許第EP888243号に開示されるような関連化合物、あるいは他の文献に開示されるカベルゴリン誘導体又はそれらの医薬として許容される塩から選択されるもの、好ましくはカベルゴリンの遊離塩基又はカベルゴリンニリン酸塩などである。

【誤訳訂正 7】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0035

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0035】

テルグリド又はその誘導体、あるいはそれらの医薬として許容される塩は、米国特許第US3953454号、及びDE3001752号に開示されるような関連化合物、あるいは他の文献に開示されるテルグリド誘導体又はそれらの医薬として許容される塩から選択されるもの、好ましくはテルグリドの遊離塩基又はテルグリドマレイン酸塩などである。

【誤訳訂正 8】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0036

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0036】

キナゴリド又はその誘導体、あるいはそれらの医薬として許容される塩は、米国特許第US4565818号、及び欧州特許第EP77754号に開示されるような関連化合物、あるいは他の文献に開示されるキナゴリド誘導体又はそれらの医薬として許容される塩から選択されるもの、好ましくはキナゴリドの遊離塩基又はキナゴリド塩酸塩などである。

【誤訳訂正 9】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0037

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 3 7 】

スマニロール又はその誘導体、あるいはそれらの医薬として許容される塩は、米国特許第US5478734号に開示されるような関連化合物、あるいは他の文献に開示されるスマニロール誘導体又はそれらの医薬として許容される塩から選択されるもの、好ましくはスマニロールの遊離塩基又はスマニロールマレイン酸塩などである。

【 誤訳訂正 1 0 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 3 8

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 3 8 】

7 - [4 - メチル - 1 - ピペラジニル] - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オン (S L V - 3 0 8) 又はその誘導体、あるいはそれらの医薬として許容される塩は、国際特許公開第WO00/29397号に開示されるような関連化合物、あるいは他の文献に開示されるSLV - 3 0 8誘導体又はそれらの医薬として許容される塩から選択されるもの、好ましくはSLV - 3 0 8の遊離塩基又はSLV - 3 0 8塩酸塩などである。

【 誤訳訂正 1 1 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 3 9

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 3 9 】

アドロゴリド (adrogolide) (A B T - 4 3 1) 又はその誘導体、あるいはそれらの医薬として許容される塩は、国際特許公開第WO94/22858号に開示されるような関連化合物、あるいは他の文献に開示されるアドロゴリド誘導体又はそれらの医薬として許容される塩から選択されるもの、好ましくはアドロゴリドの遊離塩基又はアドロゴリド塩酸塩又はアドロゴリドの形質転換体 A - 8 6 9 2 9 などである。

【 誤訳訂正 1 2 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 4 0

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 4 0 】

ジナブソリン (dinapsoline) 又はその誘導体、あるいはそれらの医薬として許容される塩は、国際特許公開第WO97/06799号に開示されるような関連化合物、あるいは他の文献に開示されるジナブソリン誘導体又はそれらの医薬として許容される塩から選択されるもの、好ましくはジナブソリンの遊離塩基又はジナブソリン臭化水素酸塩などである。

【 誤訳訂正 1 3 】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 4 1

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 4 1 】

(5 R , 8 R , 1 0 R) - 6 - メチル - 8 - (1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イルメチル) エルゴリン (B A M - 1 1 1 0) 又はその誘導体、あるいはそれらの医薬として許容される塩は、米国特許第US4713457号に開示されるような関連化合物、あるいは他の文献に開示されるBAM - 1 1 1 0誘導体又はそれらの医薬として許容される塩から選択されるもの、好ましくはBAM - 1 1 1 0又はBAM - 1 1 1 0マレイン酸塩の遊離塩基などである。