

【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21年3月26日(2009.3.26)

【公開番号】特開2007-182442(P2007-182442A)

【公開日】平成19年7月19日(2007.7.19)

【年通号数】公開・登録公報2007-027

【出願番号】特願2006-355363(P2006-355363)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/52 (2006.01)

A 6 1 L 31/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 31/196 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 9/52

A 6 1 L 31/00 Z

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 31/196

【手続補正書】

【提出日】平成21年2月9日(2009.2.9)

【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】

薬物含有の高分子組成物において、

少なくとも 1 種類の生体適合性のポリマーの中にカプセル化されている少なくとも 1 種類の治療用薬剤、

を含有しており、

前記組成物の中の前記治療用薬剤の少なくとも一部分は、結晶質である、

薬物含有の高分子組成物。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の薬物含有の高分子組成物において、

前記組成物の中の前記治療用薬剤の 10% 以上は、結晶質である、薬物含有の高分子組成物。

【請求項 3】

請求項 1 に記載の薬物含有の高分子組成物において、

前記組成物の中の前記治療用薬剤の 50% 以上は、結晶質である、薬物含有の高分子組成物。

【請求項 4】

請求項 1 に記載の薬物含有の高分子組成物において、

前記組成物の中の治療用薬剤の 90% 以上は、結晶質である、薬物含有の高分子組成物。

【請求項 5】

請求項 1 に記載の薬物含有の高分子組成物において、

前記少なくとも 1 種類の治療用薬剤は、ラパマイシン、ラパマイシンエステル、エベロリムス、ゾタロリムス、バイオリムス、タクロリムス、ピメクロリムス、ワートマニン、

タキサン、パクリタキセル、ドセタキセル、カンプトセシン、エストラジオール、パンゼム、モルヒネ、エポチロン、テトラサイクリン、クラドリビン、トラニラスト、サベルゾール、ならびに、これらの誘導体および類似体、からなる群から選択される、薬物含有の高分子組成物。

【請求項 6】

請求項 1 に記載の薬物含有の高分子組成物において、

前記少なくとも 1 種類の生体適合性のポリマーは、実質的に連続的な高分子の基材を形成しており、

前記高分子の基材は、前記高分子の基材の中にカプセル化されている前記少なくとも 1 種類の治療用薬剤を備えている、

薬物含有の高分子組成物。

【請求項 7】

請求項 1 に記載の薬物含有の高分子組成物において、

前記少なくとも 1 種類の生体適合性のポリマーは、高分子の粒子を形成しており、

前記高分子の粒子は、前記高分子の粒子の中にカプセル化されている前記少なくとも 1 種類の治療用薬剤を備えている、

薬物含有の高分子組成物。

【請求項 8】

請求項 1 に記載の薬物含有の高分子組成物において、

前記少なくとも 1 種類の治療用薬剤は、約 50 nm ~ 約 50 μ m の範囲の平均の粒度を有する結晶質の粒子を形成している、薬物含有の高分子組成物。

【請求項 9】

植え込み可能な医療装置において、

請求項 1 に記載の薬物含有の高分子組成物を含む、植え込み可能な医療装置。

【請求項 10】

請求項 9 に記載の植え込み可能な医療装置において、

ステント、ステントグラフト、吻合装置、脈管グラフト、脈管パッチ、AV シャント、カテーテル、ガイドワイヤ、バルーン、およびフィルタ、からなる群から選択される、植え込み可能な医療装置。

【請求項 11】

請求項 9 に記載の植え込み可能な医療装置において、

前記薬物含有の高分子組成物は、前記植え込み可能な医療装置の少なくとも一部分を形成している、植え込み可能な医療装置。

【請求項 12】

請求項 9 に記載の植え込み可能な医療装置において、

前記薬物含有の高分子組成物は、前記植え込み可能な医療装置の少なくとも一部分の上に、被膜を形成している、植え込み可能な医療装置。

【請求項 13】

薬物含有の高分子組成物を形成するための方法において、

少なくとも 1 種類の治療用薬剤の結晶質の粒子を形成する工程と、

前記結晶質の粒子を、少なくとも 1 種類の生体適合性のポリマーの中にカプセル化して、薬物含有の高分子組成物を形成する工程であって、前記結晶質の粒子の少なくとも一部分は、前記薬物含有の高分子組成物の中で、結晶質を維持している、工程と、

を含む、方法。

【請求項 14】

請求項 13 に記載の方法において、

前記結晶質の粒子は、約 50 nm ~ 約 50 μ m の範囲の平均の粒度を有する、方法。

【請求項 15】

請求項 13 に記載の方法において、

前記結晶質の粒子は、高分子の溶液を使用する処理により、前記少なくとも 1 種類の生

体適合性のポリマーの中にカプセル化され、

前記高分子の溶液は、少なくとも１種類の溶媒を含有している溶媒系の中に溶けている少なくとも１種類の生体適合性のポリマーを含有しており、

前記少なくとも１種類の治療用薬剤の結晶質の粒子は、前記溶媒系の中において不溶性である、

方法。

【請求項１６】

請求項１３に記載の方法において、

前記少なくとも１種類の生体適合性のポリマーは、ポリ乳酸とポリグリコール酸とのコポリマー（ＰＬＧＡ）を含み、

前記少なくとも１種類の治療用薬剤は、トラニストを含み、

前記溶媒系は、少なくとも塩化メチレンを含む、

方法。

【請求項１７】

請求項１５に記載の方法において、

前記高分子の溶液を形成する工程と、

前記少なくとも１種類の治療用薬剤の前記結晶質の粒子を、前記高分子の溶液と混合して、混合物を形成する工程と、

前記混合物から、前記少なくとも１種類の溶媒を除去して、実質的に連続的な生体適合性の高分子の基材を形成する工程であって、前記高分子の基材は、前記高分子の基材の中にカプセル化されている前記結晶質の粒子を備えている、工程と、

を含む、方法。

【請求項１８】

請求項１７に記載の方法において、

前記混合物は、前記溶媒を除去する工程の前に、植え込み可能な医療装置の少なくとも一部分を形成するか、または被覆するために、用いられる、方法。

【請求項１９】

請求項１５に記載の方法において、

前記高分子の溶液を形成する工程と、

前記少なくとも１種類の治療用薬剤の前記結晶質の粒子を、前記高分子の溶液と混合して、混合物を形成する工程と、

前記混合物から、前記少なくとも１種類の溶媒を除去して、高分子の粒子を形成する工程であって、前記高分子の粒子は、前記高分子の粒子の中にカプセル化されている前記結晶質の粒子を備えている、工程と、

を含む、方法。

【請求項２０】

請求項１３に記載の方法において、

前記結晶質の粒子は、最初に、保護用の被膜材料により個々に被覆され、その後に、高分子の溶液を使用する処理により、前記少なくとも１種類の生体適合性のポリマーの中にカプセル化され、

前記高分子の溶液は、少なくとも１種類の溶媒を含有している溶媒系の中に溶けている少なくとも１種類の生体適合性のポリマーを含有しており、

前記保護用の被膜材料は、前記溶媒系の中において不溶性である、

方法。

【請求項２１】

請求項１３に記載の方法において、

前記少なくとも１種類の生体適合性のポリマーは、前記少なくとも１種類の治療用薬剤よりも低い溶融温度を有しており、

前記少なくとも１種類の治療用薬剤の結晶質の粒子は、前記少なくとも１種類の生体適合性のポリマーの中にカプセル化されており、

前記方法は、

前記少なくとも１種類の生体適合性のポリマーを溶融させる工程と、

前記溶融した生体適合性のポリマーを、前記結晶質の粒子と混合して、前記ポリマーの中に分散されている前記結晶質の粒子を備える、溶融した混合物を形成する工程と、

前記溶融した混合物を冷却して、実質的に連続的な生体適合性の高分子の基材を含む固化した構造体を形成する工程であって、前記高分子の基材は、前記高分子の基材の中にカプセル化されている前記結晶質の粒子を備える、工程と、

前記固化した構造体を処理して、高分子の粒子を形成する工程であって、前記高分子の粒子は、前記高分子の粒子の中にカプセル化されている前記結晶質の粒子を備える、工程と、

を含む、

方法。

【請求項 2 2】

請求項 2 1 に記載の方法において、

前記少なくとも１種類の生体適合性のポリマーは、ポリカプロラクトンを含み、

前記少なくとも１種類の治療用薬剤は、ラパマイシンを含む、

方法。

【請求項 2 3】

請求項 2 1 に記載の方法において、

前記少なくとも１種類の生体適合性のポリマーは、ポリジオキサノンを含み、

前記少なくとも１種類の治療用薬剤は、トラニラストを含む、

方法。

【請求項 2 4】

請求項 2 1 に記載の方法において、

前記少なくとも１種類の生体適合性のポリマーは、約 65 / 35 のグリコリド対カプロラクトンの比率を有する、ポリ（グリコリド - カプロラクトン）コポリマーを含み、

前記少なくとも１種類の治療用薬剤は、クラドリピンを含む、

方法。

【請求項 2 5】

請求項 2 1 に記載の方法において、

前記少なくとも１種類の生体適合性のポリマーは、約 95 / 5 のカプロラクトン対ジオキサノンの比率を有する、ポリ（カプロラクトン - ジオキサノン）コポリマーを含み、

前記少なくとも１種類の治療用薬剤は、サベルゾールを含む、

方法。

【請求項 2 6】

請求項 2 1 に記載の方法において、

前記高分子の粒子は、前記固化した構造体の、押しつぶし、切り刻み、刻み、粉碎、ミル粉碎、球形化、および／または、粉末化により、形成される、方法。

【請求項 2 7】

薬物含有の高分子組成物を形成するための方法において、

少なくとも１種類の生体適合性のポリマーの中にカプセル化されている少なくとも１種類の治療用薬剤を含有している前駆体組成物を形成する工程であって、前記前駆体組成物の中の治療用薬剤は、非晶質である、工程と、

前記前駆体組成物をアニールすること、あるいは、室温または高められた温度において、前記前駆体組成物の中に逆溶剤を添加すること、のいずれかにより、前記前駆体組成物を処理する工程と、

前記前駆体組成物を徐々に冷却して、前記非晶質の治療用薬剤の少なくとも一部分を、結晶質の相に変える工程と、

を含む、方法。

【請求項 2 8】

請求項 27 に記載の方法において、

前記前駆体組成物は、少なくとも 1 種類の生体適合性のポリマー、および少なくとも 1 種類の治療用薬剤、を含有している高分子の溶液から形成され、

前記生体適合性のポリマー、および前記治療用薬剤はいずれも、少なくとも 1 種類の溶媒を含有している溶媒系の中に溶けている、

方法。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0066

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0066】

〔実施の態様〕

(1) 薬物含有の高分子組成物において、

少なくとも 1 種類の生体適合性のポリマーの中にカプセル化されている少なくとも 1 種類の治療用薬剤、

を含有しており、

前記組成物の中の前記治療用薬剤の少なくとも一部分は、結晶質である、

薬物含有の高分子組成物。

(2) 実施態様 1 に記載の薬物含有の高分子組成物において、

前記組成物の中の前記治療用薬剤の 10% 以上は、結晶質である、薬物含有の高分子組成物。

(3) 実施態様 1 に記載の薬物含有の高分子組成物において、

前記組成物の中の前記治療用薬剤の 50% 以上は、結晶質である、薬物含有の高分子組成物。

(4) 実施態様 1 に記載の薬物含有の高分子組成物において、

前記組成物の中の治療用薬剤の 90% 以上は、結晶質である、薬物含有の高分子組成物。

。

(5) 実施態様 1 に記載の薬物含有の高分子組成物において、

前記少なくとも 1 種類の治療用薬剤は、ラパマイシン (rapamycin)、ラパマイシンエステル、エベロリムス (everolimus)、ゾタロリムス (zotarolimus)、バイオリムス (biolimus)、タクロリムス (tacrolimus)、ピメクロリムス (pimecrolimus)、ワートマニン (wortmannin)、タキサン (taxanes)、パクリタキセル、ドセタキセル (docetaxel)、カンプトセシン (camptothecin)、エストラジオール、パンゼム (Panzem)、モルヒネ、エポチロン (epothilone)、テトラサイクリン、クラドリビン (cladribine)、トラニラスト (tranilast)、サベルゾール (sabeluzole)、ならびに、これらの誘導体および類似体、からなる群から選択される、薬物含有の高分子組成物。