

【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8月21日(2008.8.21)

【公表番号】特表2008-512401(P2008-512401A)
 【公表日】平成20年4月24日(2008.4.24)
 【年通号数】公開・登録公報2008-016
 【出願番号】特願2007-530575(P2007-530575)
 【国際特許分類】

A 6 1 K 33/24 (2006.01)
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)
 A 6 1 K 9/02 (2006.01)
 A 6 1 K 47/42 (2006.01)
 A 6 1 K 47/10 (2006.01)
 A 6 1 K 47/26 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 33/24
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 K 9/02
 A 6 1 K 47/42
 A 6 1 K 47/10
 A 6 1 K 47/26

【手続補正書】

【提出日】平成20年7月4日(2008.7.4)

【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

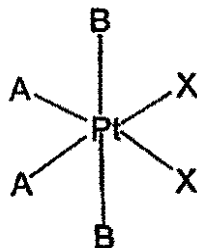
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

直腸投与又は膈投与のための薬学的組成物であって、活性物質として一般式I：

【化1】



(I)

(式中、

Aはそれぞれ独立して、-NH₃基又は炭素数1～18のアミノ基であり、

Bはそれぞれ独立して、ハロゲン原子、ヒドロキシ基又は-OC(O)R基(ここで、Rはそれぞれ独立して、水素原子又は炭素数1～10のアルキル基、アルケニル基、アリール基、アラルキル基、アルキルアミノ基若しくはアルコキシ基、或いはこれらの基の機能的誘導体である)であり、

Xはそれぞれ独立して、ハロゲン原子又は炭素数1～20のモノカルボキシレート基であるか、或いはXは共に炭素数2～20のジカルボキシレート基を形成する)

を有する白金錯体、並びにゼラチン、水及びグリセロールを含む親水性ゲル形成基剤を含有することを特徴とする、直腸又は腔投与のための薬学的組成物。

【請求項 2】

前記薬学的組成物が、少なくとも 1 つの単糖及び / 又は二糖及び / 又は多糖を含むことを特徴とする、請求項 1 に記載の直腸又は腔投与のための薬学的組成物。

【請求項 3】

前記活性物質が、該活性物質の粒子の 100% が 100 マイクロメートル以下の大きさであるように、好ましくは該活性物質の粒子の 80% が 50 マイクロメートル以下の大きさであるような粒子径分布を有することを特徴とする、請求項 1 又は 2 に記載の直腸又は腔投与のための薬学的組成物。

【請求項 4】

前記薬学的組成物が、前記活性物質 5 ~ 500 mg、好適には前記活性物質 20 ~ 200 mg を含む単位用量の形態であることを特徴とする、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の直腸又は腔投与のための薬学的組成物。

【請求項 5】

前記薬学的組成物が、直腸用坐剤又は腔用小球の形態であることを特徴とする、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の直腸又は腔投与のための薬学的組成物。

【請求項 6】

請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の薬学的組成物を製造する方法であって、前記活性物質を、ゼラチン、水及びグリセロールを含む熱的に液化された親水性ゲル形成基剤と混合し、得られた混合物を成形することを特徴とする、薬学的組成物を製造する方法。

【請求項 7】

前記活性物質と少なくとも 1 つの単糖及び / 又は二糖及び / 又は多糖との混合物を、熱的に液化された親水性ゲル形成基剤と混合し、該活性物質は、所望の粒子径を得るように予め粉碎されていることを特徴とする、請求項 6 に記載の薬学的組成物を製造する方法。

【請求項 8】

予め粉碎することが意図される前記活性物質との前記混合物中の少なくとも 1 つの単糖及び / 又は二糖及び / 又は多糖の含有量は、該活性物質の重量に基づいて、20 重量%以上、好ましくは 50 重量%までであることを特徴とする、請求項 7 に記載の薬学的組成物を製造する方法。

【請求項 9】

前記活性物質は、該活性物質の粒子の 100% が 100 マイクロメートル以下の大きさであるような、好ましくは該活性物質の粒子の 80% が 50 マイクロメートル以下の大きさであるような粒子径分布を得るように、少なくとも 1 つの単糖及び / 又は二糖及び / 又は多糖との混合物中で粉碎されることを特徴とする、請求項 7 又は 8 に記載の薬学的組成物を製造する方法。

【請求項 10】

前記活性物質と前記熱的に液化された親水性ゲル形成基剤との混合が、加工処理される混合物と接触する内部表面が不活性材料、好適にガラス又はセラミックで、或いはテフロンコーティングされた材料又は非金属的に変性された材料で作製されたミキサー中で実施されることを特徴とする、請求項 6 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の薬学的組成物を製造する方法。

【請求項 11】

前記活性物質を前記熱的に液化された親水性ゲル形成基剤と混合することにより得られる前記混合物を、直腸用坐剤又は腔用小球用の型へ注型した後、注型混合物を冷却するまで放置するか又は注型混合物を冷却することにより成形することを特徴とする、請求項 6 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の薬学的組成物を製造する方法。

【請求項 12】

前記活性物質を前記熱的に液化された親水性ゲル形成基剤と混合することにより得られる前記混合物を、直腸用坐剤又は腔用小球用の型へ注型することにより成形し、注型混合

物を冷却するまで放置した後、又は注型混合物の冷却後に、0.5 g ~ 6 g の重量を有する直腸用坐剤又は腔用小丸を提供することを特徴とする、請求項 11 に記載の薬学的組成物を製造する方法。

【請求項 13】

腫瘍疾患の治療用の薬剤として使用するための請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の薬学的組成物又は請求項 6 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の方法により調製される薬学的組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0008

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0008】

(式中、

A はそれぞれ独立して、 $-NH_3$ 基又は炭素数 1 ~ 18 のアミノ基であり、

B はそれぞれ独立して、ハロゲン原子、ヒドロキシ基又は $-OC(O)R$ 基（ここで、R はそれぞれ独立して、水素原子又は炭素数 1 ~ 10 のアルキル基、アルケニル基、アリール基、アラルキル基、アルキルアミノ基若しくはアルコキシ基、或いはこれらの基の機能的誘導体である）であり、

X はそれぞれ独立して、ハロゲン原子又は炭素数 1 ~ 20 のモノカルボキシレート基であるか、或いは X は共に炭素数 2 ~ 20 のジカルボキシレート基を形成する）

を有する白金錯体、並びにゼラチン、水及びグリセロールを含む親水性ゲル形成基剤を含有することを特徴とする。