

【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11月24日(2011.11.24)

【公表番号】特表2009-515993(P2009-515993A)

【公表日】平成21年4月16日(2009.4.16)

【年通号数】公開・登録公報2009-015

【出願番号】特願2008-541365(P2008-541365)

【国際特許分類】

A 6 1 K 38/23 (2006.01)
A 6 1 K 9/20 (2006.01)
A 6 1 K 47/32 (2006.01)
A 6 1 K 47/16 (2006.01)
A 6 1 K 47/38 (2006.01)
A 6 1 K 47/12 (2006.01)
A 6 1 P 5/06 (2006.01)
A 6 1 P 19/10 (2006.01)
A 6 1 P 19/08 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 37/30
A 6 1 K 9/20
A 6 1 K 47/32
A 6 1 K 47/16
A 6 1 K 47/38
A 6 1 K 47/12
A 6 1 P 5/06
A 6 1 P 19/10
A 6 1 P 19/08

【誤訳訂正書】

【提出日】平成23年10月5日(2011.10.5)

【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】

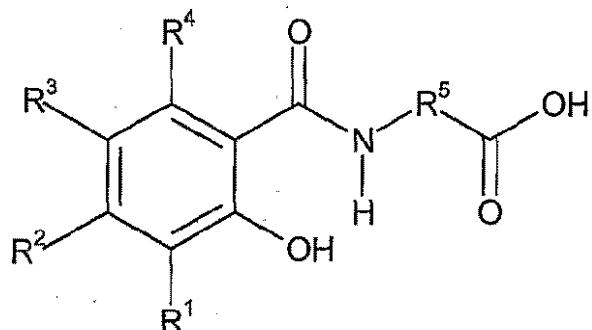
【特許請求の範囲】

【請求項1】

(i)副甲状腺ホルモン(PTH)または少なくとも1-28位のアミノ酸を含むそのフラグメント；

(ii)式1：

【化1】



【式中、

R¹、R²、R³およびR⁴は、独立して、水素、-OH、-NR⁶R⁷、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、またはC₁-C₄アルコキシであり；R⁵は、置換または非置換C₂-C₁₆アルキレン、置換または非置換C₂-C₁₆アルケニレン、置換または非置換C₁-C₁₂アルキル(アリーレン)、または置換または非置換アリール(C₁-C₁₂アルキレン)であり；そしてR⁶およびR⁷は、独立して、水素、酸素、またはC₁-C₄アルキルである】で示される化合物またはその水和物もしくはアルコール溶媒和物である送達剤；(iii)崩壊剤；および(iv)希釈剤を含み、6分以下の崩壊時間および20分で90%を越える溶解性を有する、錠剤形態の経口医薬組成物。

【請求項2】

2分以下の崩壊時間を有する、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

崩壊剤が超崩壊剤である、請求項1または2のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項4】

5 Kpから15 Kpの硬度を有する、請求項1から3のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項5】

PTHがPTH(1-34)である、請求項1から4のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項6】

送達剤がN-(5-クロロサリチロイル)-8-アミノカプリル酸(5-CNAC)またはその塩である、請求項1から5のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項7】

送達剤が5-CNACの二ナトリウム塩である、請求項6に記載の組成物。

【請求項8】

希釈剤が微結晶性セルロースである、請求項1から7のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項9】

錠剤が腸溶性コーティングされていない、請求項1から8のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項10】

ペプチダーゼ阻害剤を含まない、請求項9に記載の組成物。

【請求項11】

崩壊剤がクロロスポビドンおよび/またはポビドンである、請求項1から10のいずれか1項に記載の組成物。

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0006

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0006】

副甲状腺ホルモンは、市販されているか、または当分野で十分に確立された方法で、組み換え、ペプチド合成、もしくはヒト体液からの抽出により取得し得る。

【誤訳訂正3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0008

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0008】

好ましい薬理学的活性剤は、薬理学的に活性なペプチド、特に、カルシトニンである。既知のクラスの薬理学的活性剤であるカルシトニンは、各種の医薬有用性を有し、通常は、例えば、ページエット病、高カルシウム血症および閉経後骨粗鬆症の処置に使用される。カルシトニン、例えば、サケ、(Asu1-7)-ウナギまたはヒトカルシトニンは、ほ乳類では甲状腺の傍濾胞細胞により、鳥類および魚類では後鰓体(ultimobranchial gland)により分泌される長鎖ポリペプチドホルモンである化合物である。サケ、ブタおよびウナギカルシトニンを含むさまざまなカルシトニンは、市販されており、通常は、例えば、ページエット病、悪性腫瘍における高カルシウム血症および骨粗鬆症の処置のために使用する。カルシトニンは、天然、合成またはその組み換え起源、および1,7-Asu-ウナギカルシトニンのようなカルシトニン誘導体を含む、任意のカルシトニンであり得る。組成物は、単一カルシトニンまたは2個またはそれ以上のカルシトニンの任意の組合せを含み得る。好ましいカルシトニンは、合成サケカルシトニンである。

【誤訳訂正4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0016

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0016】

新規製剤

ペプチドおよびタンパク質のようなポリ(アミノ酸)、例えば、ホルモンの吸収を促進する多くの試みがある。一般に、ペプチドおよびタンパク質は、多くのペプチダーゼが存在し、顕著な分解が起こり得る胃腸環境から保護される必要があると考えられている。腸溶性コーティングおよび医薬組成物へのペプチダーゼ阻害剤の添加は、経口投与によるタンパク質およびペプチドのようなポリ(アミノ酸)の吸収を改善するのに有効であることが証明されている。

【誤訳訂正5】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0028

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0028】

したがって、本発明はさらに、腸溶性コーティングまたはペプチダーゼ阻害剤の必要性なしに、経口投与によりペプチドまたはタンパク質を送達することができる医薬組成物を提供する。したがって、具体的には、本発明の組成物は、腸溶性コーティングまたはペプチダーゼ阻害剤、またはその両方がない。

【誤訳訂正6】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0075

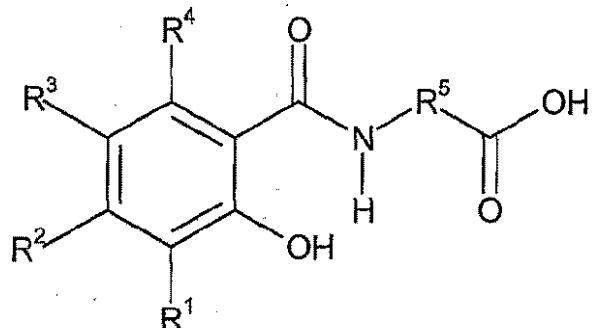
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0075】

さらに、送達剤は、上記に記載した修飾アミノ酸のいずれかのニナトリウム塩ならびにそのエタノール溶媒和物および水和物であり得る。適当な化合物は、下記の式I:

【化1】



式I

[式中、

R¹、R²、R³、およびR⁴は、独立して、水素、-OH、-NR⁶R⁷、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、またはC₁-C₄アルコキシであり；

R⁵は、置換または非置換C₂-C₁₆アルキレン、置換または非置換C₂-C₁₆アルケニレン、置換または非置換C₁-C₁₂アルキル(アリーレン)、または置換または非置換アリール(C₁-C₁₂アルキレン)であり；そして

R⁶およびR⁷は、独立して、水素、酸素、またはC₁-C₄アルキルである]

の化合物ならびにその水和物およびアルコール溶媒和物を含む。

【誤訳訂正7】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0089

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0089】

微粉化送達剤、例えば、5-CNACの平均粒子サイズを、粗5-CNACを粉碎し、定期的に、粒子サイズ測定に関してサンプリングし、いつ望む平均粒子サイズを達成するかを同定することにより測定し得る。5-CNACを微粉化する方法は、WO 2005/014031に記載されており、それを引用により本明細書の一部とする(特に、5-CNACの異なるサイズ粒子の効果を記載した10頁および実施例1を参照のこと)。