

【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22年9月24日 (2010.9.24)

【公表番号】特表2010-500404(P2010-500404A)

【公表日】平成22年1月7日 (2010.1.7)

【年通号数】公開・登録公報2010-001

【出願番号】特願2009-524621(P2009-524621)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/337 (2006.01)

A 6 1 K 31/436 (2006.01)

A 6 1 L 31/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 7/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 13/02 (2006.01)

A 6 1 K 39/395 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/337

A 6 1 K 31/436

A 6 1 L 31/00 B

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 9/10 1 0 1

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 7/04

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 13/02

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 39/395 A

A 6 1 K 39/395 N

A 6 1 P 21/00

A 6 1 K 9/14

【手続補正書】

【提出日】平成22年8月3日 (2010.8.3)

【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】

治療有効量のゾタロリムス又はその誘導体、プロドラッグ若しくは塩、及び治療有効量のパクリタキセル又はその誘導体、プロドラッグ若しくは塩を含む医薬組成物であって、ゾタロリムス又はその誘導体、プロドラッグ若しくは塩と、パクリタキセル又はその誘導体、プロドラッグ若しくは塩との重量比が、 $10:7$ $10:0.01$ であり、組成物が対象の体内の管に投与された場合、体内の管中の新生内膜過形成が、減少、阻害又は防止される組成物。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の組成物を含むキット。

【請求項 3】

対象の体内の管中に移植された場合、体内の管中の新生内膜過形成が、減少、阻害又は防止される、治療有効量のゾタロリムス又はその誘導体、プロドラッグ若しくは塩、及び治療有効量のパクリタキセル又はその誘導体、プロドラッグ若しくは塩を含有する組成物を含む、薬物送達システム。

【請求項 4】

ゾタロリムス又はその誘導体、プロドラッグ若しくは塩、及びパクリタキセル又はその誘導体、プロドラッグ若しくは塩の制御放出を提供する、請求項 3 に記載の薬物送達システム。

【請求項 5】

ゾタロリムス及びパクリタキセル又はその誘導体、プロドラッグ若しくは塩が、局所に送達された場合、効果及び/又は作用を互いに補完する、請求項 3 に記載の薬物送達システム。

【請求項 6】

新生内膜過形成が、対照システムと比較した場合 10% 減少又は阻害される、請求項 3 に記載の薬物送達システム。

【請求項 7】

新生内膜過形成が、前記対照システムと比較した場合 20% 減少又は阻害される、請求項 6 に記載の薬物送達システム。

【請求項 8】

新生内膜過形成の減少又は阻害が、新生内膜面積測定、新生内膜の厚さ測定及び面積狭窄率測定から選択される少なくとも 1 つの測定方法によって測定される、請求項 6 に記載の薬物送達システム。

【請求項 9】

ゾタロリムス及びパクリタキセル又はその誘導体、プロドラッグ若しくは塩が、相加効果を及ぼすゾタロリムスとパクリタキセル（又はその誘導体、プロドラッグ若しくは塩）との比（ ）で存在する、請求項 3 に記載の薬物送達システム。

【請求項 10】

ゾタロリムス又はその誘導体、プロドラッグ若しくは塩と、パクリタキセル又はその誘導体、プロドラッグ若しくは塩との重量比が、 $10:7$ $10:0.01$ である、請求項 3 に記載の薬物送達システム。

【請求項 11】

$= 10:1$ である、請求項 10 に記載の薬物送達システム。

【請求項 12】

支持構造をさらに含む、請求項 3 に記載の薬物送達システム。

【請求項 13】

前記支持構造が、少なくとも 1 種の薬学的に許容される担体又は賦形剤を含有する、請求項 12 に記載の薬物送達システム。

【請求項 14】

前記支持構造が、ステント、移植片、ステント移植片、カテーテル、リード、電極、クリップ、シャント、閉鎖装置、弁、及び粒子から選択される医療装置である、請求項 12

に記載の薬物送達システム。

【請求項 15】

前記組成物が前記医療装置と結合する、請求項 14 に記載の薬物送達システム。

【請求項 16】

前記医療装置がステントである、請求項 14 に記載の薬物送達システム。

【請求項 17】

少なくとも 1 つのコーティングが前記ステントの上に配置され、前記組成物を含む、請求項 16 に記載の薬物送達システム。

【請求項 18】

前記少なくとも 1 つのコーティングがポリマーである、請求項 17 に記載の薬物送達システム。

【請求項 19】

前記少なくとも 1 つのコーティングが、約 10 ミクロンの厚さを有し、約 12 カ月以内に完全又は実質的に完全に分解される、請求項 18 に記載の薬物送達システム。

【請求項 20】

ゾタロリムス又はその誘導体、プロドラッグ若しくは塩の濃度が、約 $10 \mu\text{g} / \text{mm}$ ステント長であり、パクリタキセル又はその誘導体、プロドラッグ若しくは塩の濃度が、約 $1 \mu\text{g} / \text{mm}$ ステント長である、請求項 17 に記載の薬物送達システム。

【請求項 21】

抗増殖性、抗腫瘍性、抗有糸分裂性、抗炎症性、抗血小板性、抗凝血性、抗ファブリン性、抗トロンビン性、抗血栓性、血栓溶解性、抗菌性、抗アレルギー性、及び抗酸化性の物質から選択される少なくとも 1 種のさらなる治療物質をさらに含む、請求項 3 に記載の薬物送達システム。

【請求項 22】

ゾタロリムス及びパクリタキセル又はその誘導体、プロドラッグ若しくは塩が、前記少なくとも 1 種のさらなる治療物質の効果及び / 又は作用を補完する、請求項 21 に記載の薬物送達システム。

【請求項 23】

前記少なくとも 1 種のさらなる治療物質が抗体を含む、請求項 21 に記載の薬物送達システム。

【請求項 24】

前記抗炎症性物質が、ステロイド性及び非ステロイド性抗炎症剤、デキサメタゾン、ヒドロコルチゾン、エストラジオール、アセトアミノフェン、イブプロフェン、ナプロキセン、フルチカゾン、モメタゾン、トリアムシノロン、クロベタゾール、アダリムマブ及びスリダクから選択される、請求項 21 に記載の薬物送達システム。

【請求項 25】

前記少なくとも 1 種のさらなる治療物質が、ドセタキセル、エストラジオール、一酸化窒素供与体、スーパーオキシドジスムターゼ、スーパーオキシドジスムターゼ模倣物、4 - アミノ - 2, 2, 6, 6 - テトラメチルピペリジン - 1 - オキシル (4 - アミノ - TEMPO)、タクロリムス、デキサメタゾン、ラパマイシン、ラパマイシン誘導体、40 - O - (2 - ヒドロキシ) エチル - ラパマイシン (エベロリムス)、40 - O - (2 - エトキシ) エチル - ラパマイシン (バイオリムス)、40 - O - (3 - ヒドロキシ) プロピル - ラパマイシン、40 - O - [2 - (2 - ヒドロキシ) エトキシ] エチル - ラパマイシン、40 - O - テトラゾール - ラパマイシン、ピメクロリムス、メシル酸イマチニブ、ミドスタウリン、クロベタゾール、前駆細胞捕捉抗体、治癒促進薬物、そのプロドラッグ、そのコドラッグ、及びこれらの組合せから選択される、請求項 21 に記載の薬物送達システム。

【請求項 26】

アテローム性動脈硬化症、血栓症、再狭窄、出血、血管解離、血管穿孔、血管動脈瘤、不安定プラーク、慢性完全閉塞、卵円孔開存、跛行、静脈及び人工移植片の吻合部増殖、

動静脈吻合、胆管閉塞症、尿管閉塞症並びに腫瘍閉鎖から選択される状態又は障害の治療又は予防に使用するための、請求項 3 に記載の薬物送達システム。

【請求項 27】

前記状態又は障害が、アテローム性動脈硬化症、血栓症、再狭窄及び不安定プラークから選択される、請求項 26 に記載の薬物送達システム。

【請求項 28】

請求項 3 に記載の薬物送達システムを含むキット。