

【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】令和 2 年 7 月 2 日 (2020.7.2)

【公表番号】特表 2018-516889 (P2018-516889A)

【公表日】平成 30 年 6 月 28 日 (2018.6.28)

【年通号数】公開・登録公報 2018-024

【出願番号】特願 2017-558678 (P2017-558678)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/06 (2006.01)

A 6 1 P 5/24 (2006.01)

A 6 1 P 15/18 (2006.01)

A 6 1 P 15/12 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/565 (2006.01)

A 6 1 K 31/57 (2006.01)

A 6 1 K 31/567 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2017.01)

A 6 1 K 9/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 F 6/08 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 45/06

A 6 1 P 5/24

A 6 1 P 15/18

A 6 1 P 15/12

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 31/565

A 6 1 K 31/57

A 6 1 K 31/567

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 9/02

A 6 1 K 47/32

A 6 1 F 6/08

【誤訳訂正書】

【提出日】令和 2 年 5 月 25 日 (2020.5.25)

【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 6 4

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 6 4 】

膜材料は、コア区分材料と同じもの、異なるものであり得、本発明の状況において、材料が異なっている場合、膜と同じようにマトリックス（コア区分）への薬物の溶解性が高いことが好ましい。異なるとは、膜ポリマーを異なる化合物クラスから選択することを必ずしも意味しておらず、むしろ、選択されたポリマーを例えば、3, 3, 3 - トリフルオロプロピルメチル基などの官能基をケイ素エラストマーに添加することによって変性する

ことによって材料の疎水性を変えることで十分である。様々なポリマーへの薬物の溶解性は、上記のように求めることができる。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0067

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0067】

置換基が低級アルキル、好ましくは1～6個の炭素原子からなるアルキル基、またはフェニル基であるポリ(二置換)シロキサン(前記アルキルまたはフェニルは置換または非置換であり得る)は、コア区分および膜材料として好ましい。この種類の広く使用される好ましいポリマーは、ポリ(ジメチルシロキサン)(PDMS)である。その他の好ましいポリマーは、シロキサン単位(フルオロ変性ポリシロキサン)のケイ素原子と結合した3,3,3トリフルオロプロピル基またはポリ(アルキレンオキシド)基のいずれかを含むシロキサン系ポリマーであり、この際、前記ポリ(アルキレンオキシド)基は、ケイ素-炭素結合によって前記ポリシロキサン単位と結合したアルコキシ末端グラフトまたはブロックあるいはこれらの形態の混合物として存在する。ポリシロキサンおよび変性ポリシロキサンポリマーは、例えば欧州特許第0652738(B1)号、国際公開第00/29464号および国際公開第00/00550号に記載されている。中でもポリ(アルキレンオキシド)基を含むシロキサン系ポリマー、ポリエチレンオキシドブロック-ポリジメチルシロキサン共重合体(PEO-b-PDMS)が好ましい。

【誤訳訂正 3】

【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】

2つの薬学的に活性な薬物を含有する植込剤またはIUDの放出特性を変更するための方法であって、前記方法が、以下の：

(i) ポリマーマトリックス材料の個々のコア区分を作製する段階であって、前記個々のコア区分が、初期放出の低下した植込剤またはIUDを調製するための活性薬物(A)、活性薬物(B)または薬物(A)と(B)の薬物混合物のいずれかを含む、段階および

(ii) 前記個々のコア区分を、A/B/AまたはA/AB/Aの順番に構築する段階であって、前記薬物Bは、薬物Aよりも前記選択されたポリマーマトリックスに良好に溶ける、段階および

(iii) 前記コア区分をシリコン系の膜で覆う段階

を含むプロセスによって前記植込剤またはIUDを調製することを含む、方法。

【請求項 2】

溶解性の高い薬物(B)がエストロゲンであり、溶解性の低い薬物(A)がプロゲステンである、請求項1に記載の方法。

【請求項 3】

前記エストロゲンがエチニルエストラジオール(EE)であり、前記プロゲステンがレボノルゲストレル(LNG)である、請求項2に記載の方法。

【請求項 4】

薬物(A)を含有する2つのコア区分に取り囲まれている前記コア区分が、薬物混合物ABを含み、前記AB区分の前記薬物Aが隣接するコア区分の薬物Aと同じであることを特徴とする、請求項1に記載の方法。

【請求項 5】

薬物Aがプロゲステンであり、薬物Bがエストロゲンであり、区分AB中のプロゲステン

ンと前記エストロゲンの比が $5 / 95 \text{ w / w } \% \sim 30 / 70 \text{ w / w } \%$ の範囲内である、請求項 4 に記載の方法。

【請求項 6】

前記コア区分がシリコンエラストマー材料で作製されることを特徴とする、請求項 1 ～ 5 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 7】

前記シリコン系の膜が、P D M S、フルオロ変性ポリシロキサンまたはポリ（アルキレンオキシド）変性ポリシロキサンから成り、前記ポリ（アルキレンオキシド）基が、ケイ素 - 炭素結合によって前記ポリシロキサン単位と結合したアルコキシ末端グラフトまたはブロックあるいはこれらの形態の混合物として存在することを特徴とする、請求項 1 ～ 6 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 8】

前記シリコン系の膜が、ポリエチレンオキシドブロック - ポリジメチルシロキサン共重合体（P E O - b - P D M S）であることを特徴とする、請求項 7 に記載の方法。

【請求項 9】

コア区分 A' が薬物 A を含み、コア区分 B' が薬物 A と比較して前記コア区分材料への溶解性の高い薬物 B を含む、薬物を含有するコア区分 A' および B' から構築された、初期バーストの減少した植込剤または I U D であって、

a) 前記コア区分材料への溶解性の高い前記薬物 B が、溶解性の低い前記薬物 A を含有する 2 つのコア区分の間に配置されており、および

b) 薬物 A がプロゲスチンであり、薬物 B がエストロゲンであることを特徴とする

前記植込剤または I U D。

【請求項 10】

植込剤または I U D を調製するための方法であって、前記植込剤または I U Dが以下の：

（i）ポリマーマトリックス材料の個々のコア区分を作製する段階であって、前記個々の区分が、初期放出の低下した植込剤または I U Dを調製するための活性薬物（A）、活性薬物（B）または薬物（A）と（B）の薬物混合物のいずれかを含む、段階および

（i i）前記個々のコア区分を、A / B / A または A / A B / A の順番に構築する段階であって、前記薬物 B が、薬物 A よりも前記選択されたポリマーマトリックスに良好に溶ける、段階

を含むプロセスによって製造される、前記方法。