

【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 19 年 9 月 13 日 (2007.9.13)

【公表番号】特表 2006-528152 (P2006-528152A)

【公表日】平成 18 年 12 月 14 日 (2006.12.14)

【年通号数】公開・登録公報 2006-049

【出願番号】特願 2006-520797 (P2006-520797)

【国際特許分類】

A 6 1 K 38/23 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/48 (2006.01)

A 6 1 K 35/60 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 K 9/28 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 37/30

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 19/10

A 6 1 K 47/48

A 6 1 K 35/60

A 6 1 K 47/18

A 6 1 K 9/28

【手続補正書】

【提出日】平成 19 年 7 月 20 日 (2007.7.20)

【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】

治療的有効量の遊離形または塩形のカルシトニンを含む、それを必要とする患者における骨関節症を予防および / または処置するための薬剤。

【請求項 2】

治療的有効量の遊離形または塩形のカルシトニンを含む、それを必要とする患者における軟骨下骨の再吸収を阻害するおよび / または代謝を正常化するための薬剤。

【請求項 3】

治療的有効量のカルシトニンを経口で送達する、請求項 1 または 2 に記載の薬剤。

【請求項 4】

カルシトニンおよびカルシトニンのための送達剤を含む、経口で送達する、請求項 1 または 2 に記載の薬剤。

【請求項 5】

ポリマー分子と結合したカルシトニンを含む、経口で送達する、請求項 1 または 2 に記載の薬剤。

【請求項 6】

カルシトニン、少なくとも 1 個の薬学的に許容される pH 低下剤、少なくとも 1 個の吸収促進剤および腸溶性コーティングを含む、経口で送達する、請求項 1 または 2 に記載の

薬剤。

【請求項 7】

カルシトニンがサケカルシトニンである、請求項 4 から 6 のいずれかに記載の薬剤。

【請求項 8】

該送達剤が、5 - C N A C、S N A D および S N A C からなる群から選択される、請求項 4 記載の薬剤。

【請求項 9】

該送達剤が、5 - C N A C の二ナトリウム塩、S N A D の二ナトリウム塩、および S N A C の二ナトリウム塩からなる群から選択される、請求項 4 記載の薬剤。

【請求項 10】

該薬剤が、微粉化された形の送達剤を含む、請求項 4 記載の薬剤。

【請求項 11】

カルシトニンを 1 個またはそれ以上の薬学的に許容される希釈剤または担体と共に含む、処置を必要とする患者における骨関節症の処置または / および予防に使用するための医薬組成物。

【請求項 12】

a) カルシトニンである第一剤、および

b) 骨再吸収阻害剤、骨形成剤または疼痛軽減剤である併用剤：

を含む、処置を必要とする患者における骨関節症の処置または / および予防に使用するための医薬的組み合わせ剤。

【請求項 13】

0.4 から 2.5 mg の間のカルシトニンを含む、医薬組成物。

【請求項 14】

0.4 から 2.5 mg の間のカルシトニンを含む、骨関節症の処置または / および予防に使用するための医薬組成物。

【請求項 15】

カルシトニンがサケカルシトニンである、請求項 11 から 14 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 16】

処置を必要とする患者における骨関節症の処置または / および予防用医薬の製造のための、カルシトニンの使用。

【請求項 17】

該カルシトニンがサケカルシトニンである、請求項 16 記載の使用。

【請求項 18】

該カルシトニンを経口で送達する、請求項 16 または 17 記載の使用。

【請求項 19】

該カルシトニンが、カルシトニンおよび 5 - C N A C、S N A D および S N A C からなる群から選択される送達剤を含む経口医薬組成物として送達される、請求項 16 または 17 記載の使用。

【請求項 20】

該カルシトニンが、ポリマー分子と結合したカルシトニンを含む経口医薬組成物として送達される、請求項 16 または 17 記載の使用。

【請求項 21】

該カルシトニンが、少なくとも 1 個の薬学的に許容される pH 低下剤、少なくとも 1 個の吸収促進剤および腸溶性コーティングを含む経口医薬組成物として送達される、請求項 16 または 17 に記載の使用。

【請求項 22】

カルシトニンが、0.4 から 2.5 mg の間の該カルシトニンを含む医薬組成物として提供されるものである、骨関節症の処置および / または予防のための医薬の製造のためのカルシトニンの使用。

【請求項 2 3】

カルシトニンがサケカルシトニンである、請求項 2 2 記載の使用。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 0 7

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 0 7】

1.4 患者に治療的有効量のカルシトニン、例えば遊離形もしくは塩形のサケカルシトニンを、好ましくは薬学的に許容される経口送達形で投与することを含む、それを必要とする患者における軟骨下骨の再吸収を阻害しかつ代謝を正常化する方法；

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 3 0

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 3 0】

1.1 から 1.1 0 の下に定義された通りのいずれかの方法の使用のための、好ましくは薬学的に許容される経口送達形のカルシトニン、例えば遊離形または塩形のサケカルシトニンの有用性は、動物試験法ならびに臨床で、例えば、実施例 B に後記の方法に従って証明できる。

【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 3 1

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 3 1】

薬理学的活性剤がサケカルシトニンであるとき、適当な投与量は、もちろん、例えば、宿主および処置する状態の性質および重症度に依存して変化するであろう。しかしながら、一般に、十分な結果が、約 $0.5 \mu\text{g}/\text{kg}$ から約 $10 \mu\text{g}/\text{kg}$ 、動物体重 kg 、好ましくは $1 \mu\text{g}/\text{kg}$ から約 $6 \mu\text{g}/\text{kg}$ 、動物体重 kg の一日量で全身的に得られる。カルシトニンの製剤、例えばカルシトニンの経口製剤において使用する薬学的に許容される不活性賦形剤は、例えば、本発明により意図される固体経口投与形態の製剤もしくは製造を助ける、または胃腸環境において固体経口組成物の放出を助け得るポリマーおよび不活性化化合物を含み得る。上記の薬学的不活性成分は、例えば所望により、すべてのクロスボビドンおよびポビドンであってよい、クロスボビドンおよびポビドンを含む。クロスボビドンは、 $1,000,000$ 以上の分子量を有する N - ビニル - 2 - ピロリドン (1 - エテニル - 2 - ピロリジノンとも呼ばれる) の合成架橋ホモポリマーである。市販のクロスボビドンは、ISP から入手可能な Polyplasdone XL、Polyplasdone XL-10、Polyplasdone INF-10、BASF Corporation から入手可能な Kollidon CL を含む。好ましいクロスボビドンは、Polyplasdone XL である。ポビドンは、一般的に $2,500$ から $3,000,000$ の間の分子量を有する、直鎖 1 - ビニル - 2 - ピロリジノン基から成る合成ポリマーである。市販のポビドンは、BASF Corporation から入手可能な Kollidon K-30、Kollidon K-90F および ISP から入手可能な Plasdone K-30 および Plasdone K-29/32 を含む。上記の通り、クロスボビドンおよびポビドンは市販されている。あるいは、それらを既知の方法で合成してよい。クロスボビドン、ポビドンまたはそれらの組み合わせは、一般的に、組成物中、全医薬組成物の総重量に対して 0.5 から 50 重量% の量で、好ましくは医薬組成物の総重量に対して 2 から 25 重量%、より好ましくは 5 から 20 重量% の量で存在する。

【手続補正 5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】 0 0 6 7

【補正方法】 変更

【補正の内容】

【 0 0 6 7 】

【表 1 1】

除外基準(表 5) :

-
- ・ 急性骨関節症に罹患し、試験の途中で関節形成術を必要とするまたは試験期間の数週間前もしくは試験期間中に関節固定を必要とする患者。
 - ・ 結晶沈着疾患に罹患してきるか、既知の遺伝的もしくは先天的欠損を有する患者。
 - ・ 臨床的に明らかな肝臓、腎臓、冠動脈、精神医学的、内分泌および／または血液学的疾患を有する患者。
 - ・ 治験担当医により、本プロトコールに適合しないと判断された何らかの他の全身性または局所性疾患を有する患者。
 - ・ 治験担当医が重大であると判断した臨床検査値異常がある患者。
 - ・ 試験開始前 8 週間以内にコルチコステロイドの何らかの関節内注射または全身投与を受けた患者。
 - ・ アルコールおよび／または薬物中毒の既知を病歴を有する患者または試験プロトコールに従って治験担当医と協調しそうにない患者。
-