

【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12月8日 (2011.12.8)

【公表番号】特表2010-511713(P2010-511713A)

【公表日】平成22年4月15日 (2010.4.15)

【年通号数】公開・登録公報2010-015

【出願番号】特願2009-540276(P2009-540276)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/48 (2006.01)

C 0 8 L 101/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 9/10 (2006.01)

A 6 1 K 9/107 (2006.01)

A 6 1 K 9/06 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 K 31/196 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 47/48

C 0 8 L 101/00

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 37/02

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 9/107

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 9/14

A 6 1 P 25/18

A 6 1 K 31/196

A 6 1 P 29/00

【手続補正書】

【提出日】平成22年12月3日 (2010.12.3)

【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】

医薬製剤において、

(a) (i) 結晶化可能側鎖ポリマー (C Y S C ポリマー) と、 (i i) 当該 C Y S C ポ

リマーと結合した薬物とを含み、

(b) 油を含有せず、

前記 C Y S C ポリマーが

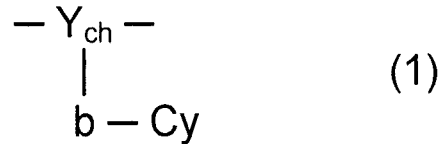
(A) (i) 式

b C y

を有し；

(i i) (a) 前記ポリマーのポリマー骨格の少なくとも一部を提供し；

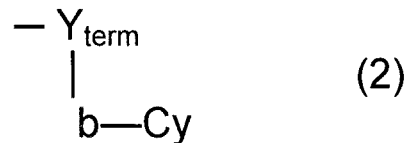
(b) 下記の式 (1) を有する；



反復単位の一部を形成し；及び／又は

(i i i) (a) 前記ポリマー骨格の末端単位であり；

(b) 下記の式 (2) を有する；



末端単位の一部を形成する；

複数の部分を含み、ここで、

式 (1) 中、Y_{ch} は、C Y S C ポリマーの骨格の三価性部分形成部であり、

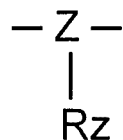
式 (2) 中、Y_{term} は、C Y S C ポリマーの骨格の末端における二価性部分であ

り、

式 (1) 及び (2) 中、b は、無水物結合でなく、前記 C y 部分を前記ポリマー骨格に連結させる結合又は二価性部分であり、

C y は、12 から 50 個の実質的に直鎖状の炭素原子を含み、前記 C Y S C ポリマー中の他の C y 部分、及び、選択的に前記 C Y S C ポリマーの部分でない組成物中の C y 部分に結合して、前記 C Y S C ポリマーに結晶性を提供する一価性部分であり；

(B) 式



で表す反復単位を含み、

ここで、Z はポリマー骨格の一部を形成する部分であり、Rz は、(i) - b - C y 部分でなく、(i i) 窒素含有側鎖、酸素含有側鎖、フッ素含有側鎖、リン含有側鎖、ケイ素含有側鎖、および標的レセプター部位に結合するリガンド基、から選択される；一価性部分であり；

(C) 22 乃至 70 の結晶融解温度 T_p と、(T_p - T_o) が 15 未満となる融解開始温度 T_o とを有し、ここで T_p と T_o は示差走査熱量計 (D S C) で測定され；

(D) C y 部分の結合に起因する少なくとも 5 J / g の融解熱を有し、ここで、融解熱は示差走査熱量計で測定され、

(E) 1 , 0 0 0 乃至 2 0 , 0 0 0 ダルトンの数平均分子量 M_n を有し、

- (F) 架橋されておらず ;
- (G) 熱可塑性エラストマーでない ;

ことを特徴とする医薬製剤。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の医薬製剤において、前記 C Y S C ポリマーが、(i) 1 0 , 0 0 0 未満の数平均分子量を有し、(i i) 少なくとも 1 0 J / g の融解熱を有し、(i i i) ポリアクリレート、ポリメタクリレート、ポリエステル、あるいはポリカーボネートであることを特徴とする医薬製剤。

【請求項 3】

請求項 1 又は 2 に記載の医薬製剤において、(i) C y が 1 6 - 2 2 個の直鎖状炭素原子を有し、選択的にポリオキシアルキレン部分を含み、(i i) R z がカルボキシル基またはヒドロキシル基を含む部分であることを特徴とする医薬製剤。

【請求項 4】

請求項 1 乃至 3 のいずれか 1 項に記載の医薬製剤において、(i) 前記薬物が少なくとも 5 重量% 存在し、抗精神病薬、タンパク、あるいはペプチドであり、(i i) 前記医薬製剤がインビトロ (1 L の P B S 、 p H 7 . 2 に 3 7 で溶出、1 0 0 r p m で攪拌) で試験した際に、以下の特徴のうち :

- (a) 溶出の最初の 1 6 8 時間中の任意の 2 4 時間の期間にわたって平均された 1 日当たり 5 0 ミリグラム以下の平均放出速度で放出する ;
 - (b) 溶出開始後の 1 2 時間から 1 6 8 時間までの期間中の任意の 2 4 時間にわたって平均された 1 日当たり 2 5 ミリグラム以下の平均速度で放出する ;
 - (c) 少なくとも 3 0 日の期間にわたって 1 日当たり 1 ミリグラムから 6 0 ミリグラムの間の薬物を連続して放出する ;
 - (d) 溶出開始後の 1 2 時間から 1 6 8 時間までの期間中の任意の 2 4 時間にわたって平均された 1 日当たり 1 ミリグラムから 6 0 ミリグラムの薬物を連続的に放出する ;
 - (e) 2 4 時間にわたって、前記医薬製剤中に存在する薬物の 1 0 重量% 以下を放出する ;
 - (f) 少なくとも 3 0 日の期間にわたって治療的用量の薬物を連続して放出し、2 4 時間の平均薬物放出速度が、3 0 日平均の 1 標準偏差内であるように放出する ;
- 1 またはそれ以上の有する方法で前記薬物を放出することを特徴とする医薬製剤。

【請求項 5】

請求項 1 乃至 4 のいずれか 1 項に記載の医薬製剤を製造する方法において :

- (A) C Y S C ポリマーを融解するステップと ;
 - (B) 溶媒がない状態で前記薬物を前記融解したポリマーと混合するステップと ;
 - (C) 当該混合物をその融点より下に冷却して製剤の結晶化及び凝固を引き起こすステップと ;
- を具えることを特徴とする医薬製剤。