

【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3月4日 (2010.3.4)

【公表番号】特表2009-523798(P2009-523798A)

【公表日】平成21年6月25日 (2009.6.25)

【年通号数】公開・登録公報2009-025

【出願番号】特願2008-551315(P2008-551315)

【国際特許分類】

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 K 38/04 (2006.01)

A 6 1 K 9/06 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 9/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/48 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/22 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 37/02

A 6 1 K 37/43

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 47/48

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/22

【手続補正書】

【提出日】平成22年1月15日 (2010.1.15)

【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】

a) 塩酸、臭化水素酸、ヨウ化水素酸、硫酸、硝酸、クロム酸、メタンスルホン酸、トリフルオロメタンスルホン酸、トリクロロ酢酸、ジクロロ酢酸、ブロモ酢酸、クロロ酢酸、シアノ酢酸、2-クロロプロパン酸、2-オキシブタン酸、2-クロロブタン酸、4-シアノブタン酸、過塩素酸、及びリン酸からなる群から選択される強酸を用いて形成された、ペプチド剤の塩；

b) 生分解性ポリマー；

c) 該生分解性ポリマーを溶解し、水性又は生物学的流体と混和性であるか、又はこれに分散し得る、製薬上許容される有機溶媒；及び

d) 場合により1又はそれ以上の製薬上許容される賦形剤、を含むことを特徴とする、注入可能なポリマー組成物。

【請求項2】

前記ペプチド剤が、少なくとも一つの塩基性アミノ基を含む、請求項1記載の注入可能なポリマー組成物。

【請求項3】

前記ペプチド剤が、オキシトシン、バソプレシン、副腎皮質刺激ホルモン(ACTH)、上皮増殖因子(EGF)、血小板由来増殖因子(PDGF)、プロラクチン、黄体形成ホルモン、黄体形成ホルモン放出ホルモン(LHRH)、LHRHアゴニスト、LHRHアンタゴニスト、成長ホルモン、成長ホルモン放出因子、インシュリン、エリスロポエチン、ソマトスタチン、グルカゴン、インターロイキン、インターフェロン- α 、インターフェロン- β 、インターフェロン- γ 、ガストリン、テトラガストリン、ペンタガストリン、ウロガストロン、セクレチン、カルシトニン、エンケファリン、エンドルフィン、アンギオテンシン、甲状腺刺激ホルモン放出ホルモン(TRH)、腫瘍壊死因子(TNF)、副甲状腺ホルモン(PTH)、神経成長因子(NGF)、顆粒球コロニー刺激因子(G-CSF)、顆粒球マクロファージコロニー刺激因子(GM-CSF)、マクロファージコロニー刺激因子(M-CSF)、ヘパリナーゼ、血管内皮成長因子(VEGF)、骨形態形成タンパク質(BMP)、hANP、グルカゴン様ペプチド(GLP-1)、エキセナチド、ペプチドYY(PYY)、レニン、ブラジキニン、バシトラシン、ポリミキシン、コリスチン、チロシジン、グラミシジン、シクロスポリン、酵素、サイトカイン、抗体、ワクチン、抗生物質、抗体、糖タンパク質、卵胞刺激ホルモン、キョートルフィン、タフトシン、チモポイエチン、チモシン、チモスチムリン、胸腺体液性因子、血清胸腺因子、コロニー刺激因子、モチリン、ボンベシン、ダイノルフィン、ニューロテンシン、セルレイン、ウロキナーゼ、カリクレイン、物質P類似体及びアンタゴニスト、アンギオテンシンII、血液凝固因子VII及びIX、グラミシジン、メラノサイト刺激ホルモン、甲状腺ホルモン放出ホルモン、甲状腺刺激ホルモン、パンクレオチミン、コレシストキニン、ヒト胎盤性ラクタゲン、ヒト絨毛性ゴナドトロピン、タンパク質合成刺激ペプチド、胃抑制性ペプチド、血管作用性腸ペプチド、血小板由来増殖因子、及びこれらの合成類似体及び変性体並びに薬理的に活性なそのフラグメントからなる群から選択される、請求項1記載の注入可能なポリマー組成物。

【請求項4】

親水性部分で共有結合的に修飾された、N-末端一級アミン及び/又は側鎖一級アミンを前記ペプチド剤が持つ、請求項1記載の注入可能なポリマー組成物。

【請求項5】

親油性部分で共有結合的に修飾された、N-末端一級アミン及び/又は側鎖一級アミンを前記ペプチド剤が持つ、請求項1記載の注入可能なポリマー組成物。

【請求項6】

前記生分解性ポリマーが、ポリラクチド、ポリグリコリド、ポリ(ラクチド-co-グリコリド)、ポリカプロラクトン、ポリジオキサノン、ポリカーボネート、ポリヒドロキシブチレート、ポリアルキレンオキサレート、ポリ無水物、ポリエステルアミド、ポリウレタン、ポリアセタール、ポリオルトカーボネート、ポリホスファゼン、ポリヒドロキシバレレート、ポリアルキレンサクシネート、ポリオルトエステル及びコポリマー、ブロックコポリマー、分岐コポリマー、ターポリマー及びこれらの組み合わせ及び混合物からなる群から選択される、請求項1記載の注入可能なポリマー組成物。

【請求項7】

- a) LHRHアゴニスト又はアンタゴニストの塩酸塩又はメシレート塩；
- b) ポリ(ラクチド-co-グリコリド)コポリマー、ここで該コポリマーのラクチド対グリコリド比は、50:50～約100:0なる範囲内にある；
- c) N-メチル-2-ピロリドン(NMP)；及び
- d) トリグリセライド及び/又はビタミンE又はその誘導体、を含むことを特徴とする、注入可能なポリマー組成物。

【請求項 8】

液状媒体中にペプチド剤の遊離塩基を溶解して、溶液を調製する工程、及び該溶液を、強酸の水性溶液と混合して、該ペプチド剤の塩を形成する工程を含むことを特徴とする、ペプチド剤の塩の製造方法。

【請求項 9】

a) 適当な液状媒体中に、揮発性の弱酸と共に、ペプチド剤の第一の塩を溶解して、溶液を調製する工程、b) 該溶液を、強酸の水性溶液と混合して、混合物を生成する工程；c) 該溶媒を該混合物から除去する工程；及びd) 該弱酸を除去して、該ペプチド剤の第二の塩を生成する工程、を含むことを特徴とする、ペプチド剤の塩の製造方法。