

【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24年6月28日(2012.6.28)

【公表番号】特表2010-528025(P2010-528025A)

【公表日】平成22年8月19日(2010.8.19)

【年通号数】公開・登録公報2010-033

【出願番号】特願2010-509457(P2010-509457)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/216	(2006.01)
A 6 1 K	47/10	(2006.01)
A 6 1 K	47/02	(2006.01)
A 6 1 K	47/12	(2006.01)
A 6 1 K	47/18	(2006.01)
A 6 1 K	47/26	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/216	
A 6 1 K	47/10	
A 6 1 K	47/02	
A 6 1 K	47/12	
A 6 1 K	47/18	
A 6 1 K	47/26	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	9/00	

【手続補正書】

【提出日】平成23年5月2日(2011.5.2)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0007

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0007】

(発明の要旨)

本発明の一態様では、濃縮エスマロール製剤が提供される。この濃縮エスマロール製剤は、約25～1000mg/mlのエスマロール(または薬学的に許容されるその塩)、約1～25体積%のベンジルアルコール、さらに場合により約0.005～約2モル濃度(M)の緩衝剤を含む。この組成物は、約3.5～約7.0の間にpH調整される。通常は保存剤として使用されるベンジルアルコールは、驚いたことに、本発明の濃縮エスマロール組成物を安定化することがわかった。

本発明は、例えば以下の項目を提供する。

(項目1)

a) 約25～1000mg/mlのエスマロール、および

b) 約1～25%w/vのベンジルアルコール

を含み、pHが約3および7である、濃縮されたエスマロール組成物。

(項目2)

緩衝剤をさらに含む、項目1に記載の組成物。

(項目3)

前記緩衝剤が、酢酸塩、グルタミン酸塩、クエン酸塩、酒石酸塩、安息香酸塩、乳酸塩、グルコン酸塩、リン酸塩、およびグリシン、ならびにこれらの共役酸のうち少なくとも1種を含む、項目2に記載の組成物。

(項目4)

前記緩衝剤が酢酸ナトリウムおよび酢酸を含む、項目3に記載の組成物。

(項目5)

前記緩衝剤が約0.005~2Mの量で存在する、項目2に記載の組成物。

(項目6)

- a) 約250mg/mlのエスマロール、
- b) 約10%w/vのベンジルアルコール、および
- c) 約0.1Mの酢酸塩

を含む、項目1に記載の組成物。

(項目7)

- a) 約50mg/mlのエスマロール、
- b) 約2%w/vのベンジルアルコール、
- c) 約0.1Mの酢酸塩

を含む、項目1に記載の組成物。

(項目8)

a) 約25~1000mg/mlのエスマロールおよび約1~25%w/vのベンジルアルコールを含み、pHが約3~7である、一定体積の第1の組成物を準備する方法、
b) 該体積の第1の組成物を、非経口投与用の薬学的に許容される希釈剤を含む、一定体積の第2の組成物で希釈する方法
によって作製した、エスマロールを含む使用準備済組成物。

(項目9)

前記第1の組成物が緩衝剤をさらに含む、項目8に記載の組成物。

(項目10)

前記緩衝剤が、酢酸塩、グルタミン酸塩、クエン酸塩、酒石酸塩、安息香酸塩、乳酸塩、グルコン酸塩、リン酸塩、およびグリシン、ならびにこれらの共役酸のうち少なくとも1種を含む、項目9に記載の組成物。

(項目11)

前記緩衝剤が酢酸ナトリウムおよび酢酸を含む、項目10に記載の組成物。

(項目12)

前記緩衝剤が約0.005~2Mの量で存在する、項目9に記載の組成物。

(項目13)

前記第2の組成物が、リン酸緩衝食塩水、食塩水、リンガー液、およびデキストロース溶液からなる群から選択される、項目8に記載の組成物。

(項目14)

a) 約25~1000mg/mlのエスマロールおよび約1~25%w/vのベンジルアルコールを含み、pHが約3~7である、一定体積の第1の組成物を準備するステップと、

b) 該体積の第1の組成物を、非経口投与用の薬学的に許容される希釈剤を含む、一定体積の第2の組成物で希釈して、使用準備済組成物を生成するステップと、
c) 該使用準備済組成物の体積を選択するステップと、
d) 患者に該体積の使用準備済組成物を投薬するステップと
を含む、患者へのエスマロール組成物の投薬方法。

(項目15)

前記第1の組成物が緩衝剤をさらに含む、項目14に記載の方法。

(項目16)

前記緩衝剤が約0.005~2Mの濃度で存在する、項目15に記載の方法。

(項目17)

前記緩衝剤が酢酸ナトリウムおよび酢酸を含む、項目19に記載の方法。

(項目18)

前記第1の組成物が、

- a) 約250mg/mlのエスマロール、
- b) 約10%w/vのベンジルアルコール、および
- c) 約0.1Mの酢酸塩

を含む、項目15に記載の方法。

(項目19)

前記第1の組成物が、約0.1Mの酢酸塩、

- a) 約50mg/mlのエスマロール、
- b) 約2%w/vのベンジルアルコール、および
- c) 約50mg/mlのエスマロール

を含む、項目15に記載の方法。

【手続補正2】

【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) 約25～約1000mg/mlのエスマロール、および
 - b) 約1～約25%w/vのベンジルアルコール
- を含み、pHが約3～約7である、濃縮されたエスマロール組成物。

【請求項2】

緩衝剤をさらに含む、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

前記緩衝剤が、酢酸塩、グルタミン酸塩、クエン酸塩、酒石酸塩、安息香酸塩、乳酸塩、グルコン酸塩、リン酸塩、およびグリシン、ならびにこれらの共役酸のうち少なくとも1種を含む、請求項2に記載の組成物。

【請求項4】

前記緩衝剤が酢酸ナトリウムおよび酢酸を含む、請求項3に記載の組成物。

【請求項5】

前記緩衝剤が約0.005～約2Mの量で存在する、請求項2に記載の組成物。

【請求項6】

- a) 約250mg/mlのエスマロール、
 - b) 約10%w/vのベンジルアルコール、および
 - c) 約0.1Mの酢酸塩
- を含む、請求項1に記載の組成物。

【請求項7】

- a) 約50mg/mlのエスマロール、
 - b) 約2%w/vのベンジルアルコール、および
 - c) 約0.1Mの酢酸塩
- を含む、請求項1に記載の組成物。

【請求項8】

a) 約25～約1000mg/mlのエスマロールおよび約1～約25%w/vのベンジルアルコールを含み、pHが約3～約7である、一定体積の第1の組成物を提供する方法、

b) 該体積の第1の組成物を、非経口投与用の薬学的に許容される希釈剤を含む、一定

体積の第 2 の組成物で希釈する方法

によって作製される、エスマロールを含む使用準備済組成物。

【請求項 9】

前記第 1 の組成物が緩衝剤をさらに含む、請求項 8 に記載の組成物。

【請求項 10】

前記緩衝剤が、酢酸塩、グルタミン酸塩、クエン酸塩、酒石酸塩、安息香酸塩、乳酸塩、グルコン酸塩、リン酸塩、およびグリシン、ならびにこれらの共役酸のうち少なくとも 1 種を含む、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 11】

前記緩衝剤が酢酸ナトリウムおよび酢酸を含む、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 12】

前記緩衝剤が約 0 . 0 0 5 ~ 約 2 M の量で存在する、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 13】

前記第 2 の組成物が、リン酸緩衝食塩水、食塩水、リンガー液、およびデキストロース溶液からなる群から選択される、請求項 8 に記載の組成物。

【請求項 14】

前記第 1 の組成物が、

- a) 約 2 5 0 m g / m l のエスマロール、
- b) 約 1 0 % w / v のベンジルアルコール、および
- c) 約 0 . 1 M の酢酸塩

を含む、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 15】

前記第 1 の組成物が、

- a) 約 0 . 1 M の酢酸塩、
- b) 約 5 0 m g / m l のエスマロール、
- c) 約 2 % w / v のベンジルアルコール、および
- d) 約 5 0 m g / m l のエスマロール

を含む、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 16】

- a) 約 2 5 ~ 約 1 0 0 0 m g / m l のエスマロール、

- b) 約 1 ~ 約 2 5 % w / v のベンジルアルコール、および

- c) 約 0 . 0 0 5 ~ 約 2 M の緩衝剤

からなり、p H が約 3 ~ 約 7 である、濃縮されたエスマロール組成物。