

【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28年7月14日(2016.7.14)

【公表番号】特表2015-518873(P2015-518873A)

【公表日】平成27年7月6日(2015.7.6)

【年通号数】公開・登録公報2015-043

【出願番号】特願2015-515528(P2015-515528)

【国際特許分類】

A 6 1 K	38/00	(2006.01)
A 6 1 K	9/06	(2006.01)
A 6 1 K	47/34	(2006.01)
A 6 1 K	47/10	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	37/02	
A 6 1 K	9/06	
A 6 1 K	47/34	
A 6 1 K	47/10	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	43/00	1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成28年5月24日(2016.5.24)

【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】

水性医薬組成物であつて：

- 活性成分としてのペプチド A c - A r g - c ( C y s - D - A l a - H i s - D - P h e - A r g - T r p - C y s ) - N H<sub>2</sub> 又は医薬的に許容可能なこれらの塩、及び  
- 1種以上の水可溶性又は水分散性ゲル化剤

を含み、

前記ゲル化剤は、組成物の総重量に対して10～50重量%の範囲の濃度で存在する、該組成物。

【請求項2】

請求項1に記載の組成物であつて、前記ペプチドが塩形態である該組成物。

【請求項3】

請求項1又は2に記載の組成物であつて、前記ペプチドの医薬的に許容可能な塩が、酢酸塩又はヘプタン酸塩、及び好ましくは酢酸塩である該組成物。

【請求項4】

請求項1～3のいずれか1項に記載の組成物であつて、前記ペプチド又はこれらの塩は、組成物の総重量に対して0.1～25重量%、好ましくは0.1～10重量%の範囲の濃度で存在する該組成物。

【請求項5】

請求項1～4のいずれか1項に記載の組成物であつて、前記ゲル化剤がポリエーテル及

びポリオールから選択される該組成物。

【請求項 6】

請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の組成物であって、ゲル化剤が、組成物の総重量に対して 15 ~ 40 重量 % の範囲の濃度で存在する該組成物。

【請求項 7】

請求項 5 に記載の組成物であって、前記ポリエーテルが、ポリエチレングリコール及び好ましくは PEG 400 から選択される該組成物。

【請求項 8】

請求項 7 に記載の組成物であって、前記ポリエーテルが、組成物の総重量に対して 15 ~ 40 重量 % 及び好ましくは 20 ~ 35 重量 % の範囲の濃度で存在する PEG 400 である該組成物。

【請求項 9】

請求項 5 に記載の組成物であって、前記ポリオールがグリセロールである該組成物。

【請求項 10】

請求項 9 に記載の組成物であって、前記ポリオールが、組成物の総重量に対して 15 ~ 40 重量 % 及び好ましくは 25 ~ 40 重量 % の範囲の濃度で存在するグリセロールである該組成物。

【請求項 11】

請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の組成物であって、前記ペプチドが、それを必要とする患者内で長期間にわたって放出される該組成物。

【請求項 12】

請求項 5 に記載の組成物であって、前記化合物の前記放出が、以下の時間持続する該組成物：少なくとも 2 時間、好ましくは少なくとも 6 時間、更に好ましくは少なくとも 8 時間、更に好ましくは少なくとも 10 時間、及び更に少なくとも 12 時間。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0214

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0214】

配合物 2 と同様に、配合物 4 は、2 倍を超える C<sub>max</sub> 減少、及び、2 倍分の T<sub>max</sub> 増加を示した。

一側面において、本発明は以下の発明を包含する。

(発明 1)

水性医薬組成物であって：

- 活性成分としてのペプチド、及び  
- 1 種以上の水可溶性又は水分散性ゲル化剤  
を含み、

前記ペプチドは以下から選択され：1 種以上のメラノコルチン受容体 (MC-R) のリガンド又は医薬的に許容可能なこれらの塩、及び

前記ゲル化剤は、組成物の総重量に対して 10 ~ 50 重量 % の範囲の濃度で存在する、該組成物。

(発明 2)

発明 1 に記載の組成物であって、前記ペプチドは、メラノコルチン MC4 受容体のリガンドである該組成物。

(発明 3)

発明 1 又は 2 に記載の組成物であって、前記ペプチドが、Ac - Arg - c (Cys - D - Ala - His - D - Phe - Arg - Trp - Cys) - NH<sub>2</sub> 又は医薬的に許容可能なこれらの塩である該組成物。

(発明 4)

発明 1 ~ 3 のいずれか 1 つに記載の組成物であって、前記ペプチドが塩形態である該組成物。

(発明 5 )

発明 1 ~ 4 のいずれか 1 つに記載の組成物であって、前記ペプチドの医薬的に許容可能な塩が、酢酸塩又はヘプタン酸塩、及び好ましくは酢酸塩である該組成物。

(発明 6 )

発明 1 ~ 5 のいずれか 1 つに記載の組成物であって、前記ペプチド又はこれらの塩は、組成物の総重量に対して 0 . 1 ~ 2 5 重量 %、好ましくは 0 . 1 ~ 1 0 重量 % の範囲の濃度で存在する該組成物。

(発明 7 )

発明 1 ~ 6 のいずれか 1 つに記載の組成物であって、前記ゲル化剤がポリエーテル及びポリオールから選択される該組成物。

(発明 8 )

発明 1 ~ 7 のいずれか 1 つに記載の組成物であって、ゲル化剤が、組成物の総重量に対して 1 5 ~ 4 0 重量 % の範囲の濃度で存在する該組成物。

(発明 9 )

発明 7 に記載の組成物であって、前記ポリエーテルが、ポリエチレングリコール及び好ましくは P E G 4 0 0 から選択される該組成物。

(発明 1 0 )

発明 9 に記載の組成物であって、前記ポリエーテルが、組成物の総重量に対して 1 5 ~ 4 0 重量 % 及び好ましくは 2 0 ~ 3 5 重量 % の範囲の濃度で存在する P E G 4 0 0 である該組成物。

(発明 1 1 )

発明 7 に記載の組成物であって、前記ポリオールがグリセロールである該組成物。

(発明 1 2 )

発明 1 1 に記載の組成物であって、前記ポリオールが、組成物の総重量に対して 1 5 ~ 4 0 重量 % 及び好ましくは 2 5 ~ 4 0 重量 % の範囲の濃度で存在するグリセロールである該組成物。

(発明 1 3 )

発明 1 ~ 1 2 のいずれか 1 つに記載の組成物であって、前記ペプチドが、それを必要とする患者内で長期間にわたって放出される該組成物。

(発明 1 4 )

発明 7 に記載の組成物であって、前記化合物の前記放出が、以下の時間持続する該組成物：少なくとも 2 時間、好ましくは少なくとも 6 時間、更に好ましくは少なくとも 8 時間、更に好ましくは少なくとも 1 0 時間、及び更に少なくとも 1 2 時間。