

【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30年11月8日(2018.11.8)

【公表番号】特表2017-530196(P2017-530196A)

【公表日】平成29年10月12日(2017.10.12)

【年通号数】公開・登録公報2017-039

【出願番号】特願2017-538156(P2017-538156)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/715 (2006.01)

A 6 1 K 31/727 (2006.01)

A 6 1 K 31/728 (2006.01)

A 6 1 K 31/737 (2006.01)

A 6 1 K 31/724 (2006.01)

A 6 1 K 31/734 (2006.01)

A 6 1 K 31/722 (2006.01)

A 6 1 K 31/711 (2006.01)

A 6 1 K 31/713 (2006.01)

A 6 1 K 31/7105 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 47/22 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/715

A 6 1 K 31/727

A 6 1 K 31/728

A 6 1 K 31/737

A 6 1 K 31/724

A 6 1 K 31/734

A 6 1 K 31/722

A 6 1 K 31/711

A 6 1 K 31/713

A 6 1 K 31/7105

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 47/22

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/20

【手続補正書】

【提出日】平成30年9月26日(2018.9.26)

【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】

注射のための液体薬学的調合薬において、

(i) 1 つ以上の多糖および / または核酸と、

- (i i) 1 つ以上の粘度低下物質と、
(i i i) 薬学的に許容可能な溶媒と、
を含み、

前記液体薬学的調合薬は、注射に適切な体積であるとき、円錐平板粘度計または微小流体粘度計を用いて測定した場合に、25 で約 1 c P ~ 約 50 c P の絶対的粘度を有し、前記液体薬学的調合薬の前記絶対的粘度は、前記 1 つ以上の多糖および / または核酸ならびに前記薬学的に許容可能な溶媒を含むが前記 1 つ以上の粘度低下物質がない液体薬学的調合薬の絶対的粘度より低く、

前記絶対的粘度は、外挿ゼロ剪断粘度である、液体薬学的調合薬。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の液体薬学的調合薬において、

前記 1 つ以上の多糖は、約 0.5 k D a ~ 約 2,000 k D a の分子量を有し、

前記 1 つ以上の核酸は、約 1 k D a ~ 約 5,000 k D a の分子量を有する、液体薬学的調合薬。

【請求項 3】

請求項 1 または 2 に記載の液体薬学的調合薬において、

前記 1 つ以上の核酸は、線形 DNA、円形 DNA、一本鎖 DNA、二本鎖 DNA、DNA アプタマー、DNA ザイム、RNA、RNA i、siRNA、shRNA、miRNA、mRNA、lincRNA、リボザイム、モルフォリノ、またはこれらの任意の組み合わせを含む、液体薬学的調合薬。

【請求項 4】

請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の液体薬学的調合薬において、

前記 1 つ以上の多糖は、ヘパリンもしくはヘパリン誘導体、多糖ワクチン、ヒアルロン酸、デルマタン硫酸、コンドロイチン 4 スルフェート、コンドロイチン 6 スルフェート、ケラタン硫酸、ヘパラン硫酸、硫酸カードラン、シクロデキストリン、アルジネート、キトサン、またはこれらの組み合わせを含む、液体薬学的調合薬。

【請求項 5】

請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の液体薬学的調合薬において、

前記 1 つ以上の多糖および / または核酸は、1 mL 当たり約 100 mg ~ 約 2,000 mg (mg / mL) の総量で存在する、液体薬学的調合薬。

【請求項 6】

請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の液体薬学的調合薬において、

前記 1 つ以上の多糖は、約 200 mg / mL ~ 約 300 mg / mL の総量で存在する、液体薬学的調合薬。

【請求項 7】

請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の液体薬学的調合薬において、

前記液体薬学的調合薬は、水性であり、約 4.0 ~ 約 8.0 の pH を有する、液体薬学的調合薬。

【請求項 8】

請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の液体薬学的調合薬において、

前記 1 つ以上の粘度低下物質は、約 0.01 M ~ 約 1.0 M の濃度で存在する、液体薬学的調合薬。

【請求項 9】

請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の液体薬学的調合薬において、

前記 1 つ以上の粘度低下物質は、約 0.01 M ~ 約 0.25 M の濃度で存在する、液体薬学的調合薬。

【請求項 10】

請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の液体薬学的調合薬において、

皮下 (S C) または筋内 (I M) 注射のための 1 つ以上の薬学的に許容可能な賦形剤をさらに含み、前記 1 つ以上の薬学的に許容可能な賦形剤は、糖、糖アルコール、緩衝剤、

防腐剤、キャリア、酸化防止剤、キレート化剤、天然ポリマー、合成ポリマー、凍結保護物質、凍結保護剤、界面活性剤、増量剤、安定化剤、またはこれらの任意の組み合わせを含む、液体薬学的調合薬。

【請求項 1 1】

請求項 1 0 に記載の液体薬学的調合薬において、

前記賦形剤のうち 1 つ以上は、ポリソルベート、ポロキサマー 1 8 8、ラウリル硫酸ナトリウム、ポリオール、ポリ（エチレングリコール）、グリセロール、プロピレングリコール、またはポリ（ビニルアルコール）である、液体薬学的調合薬。

【請求項 1 2】

請求項 1 0 に記載の液体薬学的調合薬において、

前記糖アルコールは、ソルビトール、またはマンニトールである、液体薬学的調合薬。

【請求項 1 3】

請求項 1 ～ 1 2 のいずれか 1 項に記載の液体薬学的調合薬において、

前記液体薬学的調合薬の前記絶対的粘度は、前記 1 つ以上の多糖および / または核酸ならびに前記薬学的に許容可能な溶媒を含むが前記 1 つ以上の粘度低下物質がない液体薬学的調合薬の絶対的粘度より少なくとも約 3 0 % 低い、液体薬学的調合薬。

【請求項 1 4】

請求項 1 ～ 1 3 のいずれか 1 項に記載の液体薬学的調合薬において、

単位用量バイアル、カートリッジ、またはプレフィルドシリンジに入っている、液体薬学的調合薬。

【請求項 1 5】

請求項 1 ～ 1 4 のいずれか 1 項に記載の液体薬学的調合薬において、

前記液体薬学的調合薬は、凍結乾燥組成物から復元されている、液体薬学的調合薬。

【請求項 1 6】

請求項 1 ～ 1 5 のいずれか 1 項に記載の液体薬学的調合薬において、

前記液体薬学的調合薬の体積は、皮下注射で約 1 . 5 m L 未満であり、筋内注射で約 3 m L 未満である、液体薬学的調合薬。

【請求項 1 7】

請求項 1 ～ 1 6 のいずれか 1 項に記載の液体薬学的調合薬において、

前記液体薬学的調合薬は、ヒト血清と等張である、液体薬学的調合薬。

【請求項 1 8】

請求項 1 ～ 1 7 のいずれか 1 項に記載の液体薬学的調合薬において、

前記液体薬学的調合薬の前記絶対的粘度は、円錐平板粘度計を使用して測定される場合、少なくとも約 0.5 s^{-1} の剪断率で測定される、液体薬学的調合薬。

【請求項 1 9】

請求項 1 ～ 1 7 のいずれか 1 項に記載の液体薬学的調合薬において、

前記液体薬学的調合薬の前記絶対的粘度は、微小流体粘度計を使用して測定される場合、少なくとも約 1.0 s^{-1} の剪断率で測定される、液体薬学的調合薬。

【請求項 2 0】

請求項 1 ～ 1 9 のいずれか 1 項に記載の液体薬学的調合薬において、

前記液体薬学的調合薬は、被験者に投与され、前記投与は、皮下注射または筋内注射を含むことを特徴とする、液体薬学的調合薬。

【請求項 2 1】

請求項 2 0 に記載の液体薬学的調合薬において、

前記注射は、シリンジを用いて実行される、液体薬学的調合薬。

【請求項 2 2】

請求項 2 1 に記載の液体薬学的調合薬において、

前記シリンジは、加熱されるシリンジ、自己混合シリンジ、自動注射装置、プレフィルドシリンジ、またはこれらの組み合わせである、液体薬学的調合薬。

【請求項 2 3】

請求項 2 1 または 2 2 に記載の液体薬学的調合薬において、

前記シリンジは、加熱されるシリンジであり、前記液体薬学的調合薬は、2 5 ~ 4 0 の温度を有する、液体薬学的調合薬。

【請求項 2 4】

請求項 2 0 ~ 2 3 のいずれか 1 項に記載の液体薬学的調合薬において、

前記液体薬学的調合薬は、ドレイズ評価システムを用いて評価された場合に、3 未満の一次刺激指数をもたらす、液体薬学的調合薬。

【請求項 2 5】

請求項 2 0 ~ 2 4 のいずれか 1 項に記載の液体薬学的調合薬において、

前記液体薬学的調合薬は、前記 1 つ以上の多糖および / または核酸ならびに前記薬学的に許容可能な溶媒を含むが前記 1 つ以上の粘度低下物質がない液体薬学的調合薬の注射力より少なくとも 1 0 % 低い注射力によって注射される、液体薬学的調合薬。

【請求項 2 6】

請求項 2 0 ~ 2 4 のいずれか 1 項に記載の液体薬学的調合薬において、

前記液体薬学的調合薬は、前記 1 つ以上の多糖および / または核酸ならびに前記薬学的に許容可能な溶媒を含むが前記 1 つ以上の粘度低下物質がない液体薬学的調合薬の注射力より少なくとも 2 0 % 低い注射力によって注射される、液体薬学的調合薬。

【請求項 2 7】

請求項 2 0 ~ 2 6 のいずれか 1 項に記載の液体薬学的調合薬において、

前記注射は、直径が 2 7 ~ 3 1 ゲージの針で実行され、注射力は、2 7 ゲージの針では 3 0 N 未満である、液体薬学的調合薬。

【請求項 2 8】

請求項 2 0 ~ 2 7 のいずれか 1 項に記載の液体薬学的調合薬において、

前記液体薬学的調合薬の体積は、皮下注射で約 1 . 5 m L 未満であり、筋内注射で約 3 m L 未満である、液体薬学的調合薬。

【請求項 2 9】

請求項 1 ~ 2 8 のいずれか 1 項に記載の液体薬学的調合薬を調製する方法において、

前記 1 つ以上の多糖および / または核酸、前記薬学的に許容可能な溶媒、ならびに前記 1 つ以上の粘度低下物質を組み合わせる工程を含む、方法。

【請求項 3 0】

凍結乾燥組成物において、

(i) 1 つ以上の多糖および / または核酸と、

(i i) 1 つ以上の粘度低下物質と、

(i i i) 薬学的に許容可能な溶媒と、

を含む、凍結乾燥組成物。

【請求項 3 1】

請求項 3 0 に記載の凍結乾燥組成物において、

いったん復元されると、前記 1 つ以上の多糖および / または核酸は、少なくとも 2 0 0 m g / m L の濃度を有する、凍結乾燥組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 2 1 6

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 2 1 6】

他の粘度低下物質は、トロパン N 複素環、例えばアトロピン、ヒヨスチアミン、もしくはスコポラミン、またはそれらの塩、ならびにチオトロピウムおよびイブラトロピウム塩、チアミン、アリチアミン、プロスルチアミン、フルスルチアミン、ベンフォチアミン、スルブチアミン、クオタニウム 1 5 ; 1 (3 アミノプロピル) 2 メチル 1 H - イミダゾールジヒドロクロリド ; クレアチニン ; ビオチン、シメチジン、ピペロカイン

、シクロメチルカイン、グラニセトロン、モキシフロキサシン、クロロキン、メピバカイン、レベチラセタム、プピバカイン、シンコカイン、もしくはクリンダマイシン、またはそれらの薬学的に許容可能な塩を含む。チアミンは特に好適な粘度低下物質である。