

【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31年3月14日 (2019.3.14)

【公表番号】特表2018-504420(P2018-504420A)

【公表日】平成30年2月15日 (2018.2.15)

【年通号数】公開・登録公報2018-006

【出願番号】特願2017-540743(P2017-540743)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/57	(2006.01)
A 6 1 P	25/20	(2006.01)
A 6 1 P	9/06	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/08	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	23/00	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 K	47/40	(2006.01)
A 6 1 K	47/02	(2006.01)
A 6 1 K	47/26	(2006.01)
A 6 1 K	47/10	(2006.01)
A 6 1 K	47/28	(2006.01)
A 6 1 K	31/515	(2006.01)
A 6 1 K	31/505	(2006.01)
A 6 1 K	31/05	(2006.01)
A 6 1 K	31/55	(2006.01)
A 6 1 K	31/4535	(2006.01)
A 6 1 K	31/4015	(2006.01)
A 6 1 K	31/53	(2006.01)
A 6 1 K	31/197	(2006.01)
A 6 1 K	31/195	(2006.01)
A 6 1 K	31/4166	(2006.01)
A 6 1 K	9/08	(2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K	31/57	
A 6 1 P	25/20	
A 6 1 P	9/06	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	25/08	
A 6 1 P	43/00	1 2 1
A 6 1 P	23/00	
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 K	47/40	
A 6 1 K	47/02	
A 6 1 K	47/26	
A 6 1 K	47/10	
A 6 1 K	47/28	
A 6 1 K	31/515	
A 6 1 K	31/505	
A 6 1 K	31/05	

A 6 1 K 31/55  
A 6 1 K 31/4535  
A 6 1 K 31/4015  
A 6 1 K 31/53  
A 6 1 K 31/197  
A 6 1 K 31/195  
A 6 1 K 31/4166  
A 6 1 K 9/08

【手続補正書】

【提出日】平成31年1月31日(2019.1.31)

【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) 包接複合体中にガナキソロンおよびスルホブチルエーテル - シクロデキストリン; および

b) 水

を含有し、

前記ガナキソロンに対する前記スルホブチルエーテル - シクロデキストリンの w / w 比が、約 52 : 1 以上であることを特徴とする水性注射用ガナキソロン製剤。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の製剤であって、前記複合体は、1 つのスルホブチルエーテル - シクロデキストリン分子に対して 1 つのガナキソロン分子の比で含むことを特徴とする製剤。

【請求項 3】

請求項 1 または 2 に記載の製剤であって、前記ガナキソロンの濃度が、約 1.0 mg / mL ~ 約 10 mg / mL であることを特徴とする製剤。

【請求項 4】

請求項 1 から 3 のいずれか 1 項に記載の製剤であって、前記スルホブチルエーテル - シクロデキストリンが、30 % w / v で存在することを特徴とする製剤。

【請求項 5】

請求項 1 から 4 のいずれか 1 項に記載の製剤であって、さらに、pH が約 6.8 ~ 約 7.6 である緩衝液を含有することを特徴とする製剤。

【請求項 6】

請求項 1 に記載の製剤であって、

前記ガナキソロンの濃度が 2 mg / mL ~ 8 mg / mL であり、

前記ガナキソロンに対する前記スルホブチルエーテル - シクロデキストリンの w / w 比が、約 52 : 1 ~ 約 90 : 1 の範囲内であり;

前記製剤が、緩衝液を含有し、pH が 6.7 ~ 7.3 である;

ことを特徴とする製剤。

【請求項 7】

請求項 5 または 6 に記載の製剤であって、前記緩衝液が、リン酸緩衝液であることを特徴とする製剤。

【請求項 8】

請求項 5 から 7 のいずれか 1 項に記載の製剤であって、前記緩衝液が、一塩基性リン酸緩衝液と二塩基性リン酸緩衝液の組合せであって、ここで、それぞれのリン酸緩衝液の濃

度が、 $2\text{ mM} \sim 50\text{ mM}$ であることを特徴とする製剤。

【請求項 9】

請求項 1 に記載の製剤であって、

前記ガナキソロンの濃度が  $1\text{ mg/mL} \sim 5\text{ mg/mL}$  であり；

前記スルホブチルエーテル - シクロデキストリンの重量パーセントが  $25\% \sim 35\%$  であり；

前記製剤が、界面活性剤、エタノール、グリセリン、またはプロピレングリコールうちの少なくとも 1 つを  $5\text{ 重量}\% \sim 15\text{ 重量}\%$  含有する；

ことを特徴とする製剤。

【請求項 10】

請求項 1 から 7 のいずれか 1 項に記載の製剤であって、さらに、保存剤を含有することを特徴とする製剤。

【請求項 11】

請求項 10 に記載の製剤であって、前記保存剤が、ベンジルアルコール、クロロブタノール、2 - エトキシエタノール、パラベン（メチル、エチル、プロピル、ブチル、およびその組合せを含む）、安息香酸、ソルビン酸、クロルヘキシデン、フェノール、3 - クレゾール、チメロサル、またはフェニル第二水銀塩であることを特徴とする製剤。

【請求項 12】

ガナキソロンおよびスルホブチルエーテル - シクロデキストリンを含有する凍結乾燥ガナキソロン製剤であって、前記ガナキソロン製剤が、ガナキソロン  $1.0\% \sim 1.5\%$  であることを特徴とする凍結乾燥ガナキソロン製剤。

【請求項 13】

請求項 12 に記載の凍結乾燥ガナキソロン製剤であって、さらに、緩衝液を含有することを特徴とする凍結乾燥ガナキソロン製剤。

【請求項 14】

請求項 12 または 13 に記載の凍結乾燥ガナキソロン製剤であって、さらに、増量剤を含有することを特徴とする凍結乾燥ガナキソロン製剤。

【請求項 15】

請求項 14 に記載の凍結乾燥ガナキソロン製剤であって、前記増量剤が、マンニトール、ラクトース、スクロース、トレハロース、ソルビトール、グルコース、ラフィノース、グリシン、ヒスチジン、ポリエチレングリコール（PEG）、またはポリビニルピロリドン（PVP）であることを特徴とする凍結乾燥ガナキソロン製剤。

【請求項 16】

発作性障害、脳卒中、または外傷性脳損傷の治療のための、請求項 1 から 15 のいずれか 1 項に記載のガナキソロン製剤。

【請求項 17】

請求項 16 に記載のガナキソロン製剤であって、前記ガナキソロン製剤の 1 回のボラス用量が患者に投与されることを特徴とするガナキソロン製剤。

【請求項 18】

請求項 16 または 17 に記載のガナキソロン製剤であって、最初のボラス用量が投与され、または投与されずに、患者に前記ガナキソロン製剤の静脈内注入が施されることを特徴とするガナキソロン製剤。

【請求項 19】

請求項 16 から 18 のいずれか 1 項に記載のガナキソロン製剤であって、前記ガナキソロン製剤が、少なくとも 1 種の別の活性薬剤と同時にまたは連続して投与されることを特徴とするガナキソロン製剤。