

【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29年9月7日(2017.9.7)

【公開番号】特開2017-128569(P2017-128569A)

【公開日】平成29年7月27日(2017.7.27)

【年通号数】公開・登録公報2017-028

【出願番号】特願2017-9474(P2017-9474)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/64 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/04 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2017.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/06 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/64

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 47/04

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/18

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 45/06

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 31/04

【手続補正書】

【提出日】平成29年5月29日(2017.5.29)

【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) グリベンクラミド、
- b) 一つ又はそれより多い薬学的に不活性な化合物、及び
- c) 一つ又はそれより多い塩基、

を含む凍結乾燥された薬学的組成物であって、

約 0.2 mg/mL から約 1.0 mg/mL の濃度で脱イオン水中に再構成された時の凍結乾燥された薬学的組成物の pH は約 8 よりも大きい、凍結乾燥された薬学的組成物。

【請求項 2】

約 0.1 % w/w 未満のグリベンクラミドの溶解度を高める一つ又はそれより多い薬剤をさらに含む、請求項 1 に記載の凍結乾燥された薬学的組成物。

【請求項 3】

約 0.4 mg/mL から約 8 mg/mL のグリベンクラミド及び 1 % w/v よりも多くの前記薬学的に不活性な化合物を含む溶液から調製される、請求項 1 又は 2 に記載の凍結乾燥された薬学的組成物。

【請求項 4】

一つ又はそれより多い薬学的に不活性な化合物が、独立して糖及び塩から選択される、請求項 1 から 3 の何れか一項に記載の凍結乾燥された薬学的組成物。

【請求項 5】

一つ又はそれより多い薬学的に不活性な化合物が、独立してグルコース、フルクトース、マンノース、ガラクトース、マンニトール、ソルビトール、ラクトース、スクロース、トレハロース、他の糖、塩化ナトリウム及び塩化カリウムからなる群から選択される、請求項 1 から 3 の何れか一項に記載の凍結乾燥された薬学的組成物。

【請求項 6】

薬学的に不活性な化合物がマンニトールである、請求項 1 から 3 の何れか一項に記載の凍結乾燥された薬学的組成物。

【請求項 7】

塩基が水酸化ナトリウム又は水酸化カリウムである、請求項 1 から 6 の何れか一項に記載の凍結乾燥された薬学的組成物。

【請求項 8】

薬学的に不活性な化合物の一つがマンニトールであり、塩基が水酸化ナトリウムである、請求項 1 から 3 の何れか一項に記載の凍結乾燥された薬学的組成物。

【請求項 9】

グリベンクラミドが薬学的に受容可能な塩基性塩である、請求項 1 から 8 の何れか一項に記載の凍結乾燥された薬学的組成物。

【請求項 10】

薬学的に受容可能な塩基性塩が、アルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩、アンモニア塩、および式  $NW_4^+$  (ここで、W は  $C_1 - C_4$  アルキルである) を有する化合物の塩からなる群から選択される、請求項 9 に記載の凍結乾燥された薬学的組成物。

【請求項 11】

薬学的に受容可能な塩基性塩がアルカリ金属塩である、請求項 10 に記載の凍結乾燥された薬学的組成物。

【請求項 12】

アルカリ金属塩がナトリウム塩又はカリウム塩である、請求項 11 に記載の凍結乾燥された薬学的組成物。

【請求項 13】

a) 請求項 1 から 12 の何れか一項に記載の凍結乾燥された薬学的組成物

b) 薬学的に受容可能な液体

を含む水性の薬学的組成物であって、薬学的に不活性な化合物はマンニトールであり、塩基は水酸化ナトリウムである、水性の薬学的組成物。

【請求項 14】

薬学的に受容可能な液体が注射用蒸留水又は生理食塩水である、請求項 13 に記載の水

性の薬学的組成物。

【請求項 15】

- a) 約 0.4 mg/mL から約 8 mg/mL のグリベンクラミド及び 1% w/v よりも多くの一つまたはそれより多い薬学的に不活性な化合物を含む水溶液を調製すること、
- b) グリベンクラミドの溶解度を上昇させるために pH を 8 以上に調節すること、
- c) 凍結乾燥されたグリベンクラミド組成物を提供するために水溶液を凍結乾燥すること、

を含む、凍結乾燥されたグリベンクラミドの薬学的組成物を調製する方法。

【請求項 16】

水溶液が約 0.1% w/v 未満のグリベンクラミドの溶解度を高める一つ又はそれより多い薬剤をさらに含む、請求項 15 に記載の方法。

【請求項 17】

一つ又はそれより多い薬学的に不活性な化合物が、独立して糖及び塩から選択される、請求項 15 又は 16 に記載の方法。

【請求項 18】

一つ又はそれより多い薬学的に不活性な化合物が、独立してグルコース、フルクトース、マンノース、ガラクトース、マンニトール、ソルビトール、ラクトース、スクロース、トレハロース、他の糖、塩化ナトリウム及び塩化カリウムからなる群から選択される、請求項 15 又は 16 に記載の方法。

【請求項 19】

薬学的に不活性な化合物がマンニトールである、請求項 15 又は 16 に記載の方法。

【請求項 20】

pH が水酸化ナトリウム又は水酸化カリウムを用いて調節される、請求項 15 から 19 の何れか一項に記載の方法。

【請求項 21】

pH がアルカリ金属塩基、アルカリ土類金属塩基、アンモニア、および式  $NW_4^+$  (ここで、W は  $C_1 \sim C_4$  アルキルである) を有する化合物からなる群から選択される薬学的に受容可能な塩基を用いて調節される、請求項 15 から 19 の何れか一項に記載の方法。

【請求項 22】

pH が薬学的に受容可能なアルカリ金属塩基を用いて調節される、請求項 15 から 19 の何れか一項に記載の方法。