

【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 17 年 12 月 22 日 (2005.12.22)

【公表番号】特表 2003-533467(P2003-533467A)  
 【公表日】平成 15 年 11 月 11 日 (2003.11.11)  
 【出願番号】特願 2001-583735(P2001-583735)  
 【国際特許分類第 7 版】

A 6 1 K 47/20  
 A 6 1 K 9/10  
 A 6 1 K 31/56  
 A 6 1 K 31/565  
 A 6 1 K 31/57  
 A 6 1 K 47/24  
 A 6 1 P 43/00

【F I】

A 6 1 K 47/20  
 A 6 1 K 9/10  
 A 6 1 K 31/56  
 A 6 1 K 31/565  
 A 6 1 K 31/57  
 A 6 1 K 47/24  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】  
 【提出日】平成 16 年 10 月 25 日 (2004.10.25)  
 【手続補正 1】  
 【補正対象書類名】明細書  
 【補正対象項目名】特許請求の範囲  
 【補正方法】変更  
 【補正の内容】  
 【特許請求の範囲】

【請求項 1】 生理活性化合物および L - メチオニンの pH 制御有効濃度を含有する、実質的に安定化された pH を有する非経口投与のための医薬水性懸濁液製剤。

【請求項 2】 L - メチオニンの pH 制御有効濃度が約 0 . 0 0 5 % w / v または w / w から約 5 % w / v または w / w である請求項 1 に記載の医薬製剤。

【請求項 3】 生理活性化合物、緩衝剤および pH 制御超付加効果を得るのに有効な濃度の L - メチオニンを含む実質的に安定化された pH を有する非経口投与のための医薬水性懸濁液製剤。

【請求項 4】 緩衝剤が 0 . 4 % w / v または w / w 未満の濃度のリン酸塩である請求項 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 5】 リン酸塩の濃度が 0 . 2 % w / v または w / w 未満である請求項 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】 製剤の pH 範囲が約 pH 3 . 0 から約 pH 8 . 0 である前記請求項のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 7】 生理活性化合物がステロイド化合物である請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】 生理活性ステロイド化合物がエキセメスタン、酢酸メドロキシプロゲステロンおよびエストラジオールシピオネート、または酢酸メドロキシプロゲステロンおよびエストラジオールシピオネートの混合物から選択される請求項 7 に記載の医薬組成物。

。

【請求項 9】 L - メチオニンの pH 制御有効濃度を添加することを特徴とする生理活性化合物の非経口投与のための実質的に安定化された pH を有する医薬水性懸濁液製剤の調製における L - メチオニンの使用。

【請求項 10】 生理活性化合物の非経口投与のための実質的に安定化された pH を有する医薬水性懸濁液製剤の調製における pH 制御超付加効果を得るために有効な濃度における L - メチオニンおよび緩衝剤の使用。

【請求項 11】 生理活性物質、約 0.005 % w / v から約 5 % w / v の L - メチオニンを含み、さらに界面活性剤、懸濁剤、濃厚化剤、金属キレート剤、抗酸化剤、チオール含有化合物、保存料、浸透圧調節剤および / または約 5 % から約 25 % の従来の緩衝剤のうち 1 つ以上を含んでいてもよい、pH 約 3.0 から約 8.0 である実質的に安定化された pH を有する非経口投与のための医薬水性懸濁液製剤。

【請求項 12】 約 0.01 % w / v から約 1.0 % w / v の L - メチオニンを含む請求項 11 に記載の製剤。

【請求項 13】 ポリビニルピロリドン、ポリエチレングリコールおよびそれらの混合物から選択される懸濁剤を含む請求項 11 に記載の製剤。

【請求項 14】 分子量約 300 から約 6000 のポリエチレングリコールを含む請求項 13 に記載の製剤。

【請求項 15】 分子量約 7000 から約 54000 のポリビニルピロリドンを含む請求項 13 に記載の製剤。

【請求項 16】 ポリビニルピロリドンが PVP K12 または K17 である請求項 15 に記載の製剤。

【請求項 17】 ポリビニルピロリドンが PVP K17 である請求項 16 に記載の製剤。

【請求項 18】 リン酸塩もしくはクエン酸塩緩衝剤から選択される従来の緩衝剤を含む請求項 11 に記載の製剤。

【請求項 19】 緩衝剤が少なくとも 0.4 % w / w または w / v のリン酸塩である請求項 18 に記載の製剤。

【請求項 20】 リン酸塩を少なくとも 0.2 % w / w または w / v 含む請求項 19 に記載の製剤。

【請求項 21】 緩衝剤がリン酸ナトリウムである請求項 18 に記載の製剤。

【請求項 22】 pH が約 3.0 から約 7.5 である請求項 11 に記載の製剤。

【請求項 23】 pH が約 4.0 から約 7.0 である請求項 22 に記載の製剤。

【請求項 24】 生理活性化合物がステロイド化合物である請求項 11 に記載の製剤。

。

【請求項 25】 ステロイド化合物が粉状形態または微粉碎形態である請求項 24 に記載の製剤。

【請求項 26】 生理活性ステロイド化合物が酢酸メドロキシプロゲステロン、エキセメスタン、エストラジオールシピオネート、酢酸メチルプレドニゾロン、オキサボロンシピオネート、酢酸クロステボルおよびテストステロンシピオネートから選択される請求項 24 に記載の製剤。

【請求項 27】 生理活性ステロイド化合物が酢酸メドロキシプロゲステロン、エキセメスタン、エストラジオールシピオネートおよびこれらの 2 以上の組み合わせから選択される請求項 26 に記載の製剤。

【請求項 28】 生理活性ステロイド化合物が酢酸メドロキシプロゲステロンであり、約 1 % w / v から約 40 % w / v 含まれる請求項 27 に記載の製剤。

【請求項 29】 約 3 % w / v から約 30 % w / v の酢酸メドロキシプロゲステロンを含む請求項 28 に記載の製剤。

【請求項 30】 生理活性ステロイド化合物がエストラジオールシピオネートであり、約 0.1 % w / v から約 5 % w / v 含まれる請求項 27 に記載の製剤。

【請求項 3 1】 エストラジオールシピオネートが約 0 . 2 5 % w / v から約 2 . 5 % w / v 含まれる請求項 3 0 に記載の製剤。

【請求項 3 2】 酢酸メドロキシプロゲステロンが約 3 % w / v から約 3 0 % w / v 含まれ、エストラジオールシピオネートが約 0 . 1 % w / v から約 5 % w / v 含まれる請求項 2 7 に記載の製剤。

【請求項 3 3】 生理活性ステロイド化合物がエキセメスタンであり、約 1 % w / v から約 2 5 % w / v 含まれる請求項 2 7 に記載の製剤。

【請求項 3 4】 エキセメスタンが約 5 % w / v から約 2 0 % w / v 含まれる請求項 3 3 に記載の製剤。

【請求項 3 5】 筋肉内投与または皮下投与に適した請求項 1 1 に記載の製剤。

【請求項 3 6】 特許請求の範囲に実質的に記載された請求項 1 から 3 5 のいずれかに記載された製剤。

【請求項 3 7】 上部空間に窒素ブランケットオーバーレイを有する、請求項 1 から 3 6 のいずれかに記載の製剤を含むバイアル。