【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19年6月7日(2007.6.7)

【公表番号】特表2006-523695(P2006-523695A)
【公表日】平成18年10月19日(2006.10.19)
【年通号数】公開・登録公報2006-041
【出願番号】特願2006-509780(P2006-509780)
【国際特許分類】
Ａ６１Ｋ　31/431　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/7034　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/18　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/12　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/26　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/36　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　31/04　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　43/00　(2006.01)
【ＦＩ】
Ａ６１Ｋ　31/431
Ａ６１Ｋ　31/7034
Ａ６１Ｋ　47/18
Ａ６１Ｋ　47/12
Ａ６１Ｋ　47/26
Ａ６１Ｋ　47/36
Ａ６１Ｐ　31/04
Ａ６１Ｐ　43/00　１１１

【手続補正書】
【提出日】平成19年4月6日(2007.4.6)
【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】
非経口投与による細菌性感染症の治療または制御に有用な医薬組成物であって、有効量の（ａ）ピペラシリンまたはその医薬上許容される塩；（ｂ）タゾバクタムまたはその医薬上許容される塩；および（ｃ）アミノカルボン酸キレート剤またはその医薬上許容される塩を含む、医薬組成物。
【請求項２】
ｐＨを６．０～７．５の範囲に維持するために適合される緩衝剤をさらに含む請求項１記載の医薬組成物。
【請求項３】
緩衝剤がｐＨを実質的に６．５に維持するために適合されている請求項２記載の医薬組成物。
【請求項４】
緩衝剤がクエン酸塩である請求項２記載の医薬組成物。
【請求項５】
ピペラシリンナトリウム、タゾバクタムナトリウムおよびアミノカルボン酸キレート剤

のナトリウム塩を含有する請求項１記載の医薬組成物。
【請求項６】
緩衝剤としてクエン酸ナトリウムをさらに含む請求項５記載の医薬組成物。
【請求項７】
アミノカルボン酸キレート剤が、エチレンジアミン四酢酸（ＥＤＴＡ）、ジエチレントリアミン五酢酸（ＤＴＰＡ）、ヒドロキシエチレンジアミン三酢酸（ＨＥＤＴＡ）、ニトリロ三酢酸（ＮＴＡ）、Ｏ，Ｏ’－ビス（２－アミノエチル）エチレングリコール－Ｎ，Ｎ，Ｎ’，Ｎ’－四酢酸（ＥＧＴＡ）、トランス－１，２－ジアミノシクロヘキサン－Ｎ，Ｎ，Ｎ’，Ｎ’－四酢酸（ＣｙＤＴＡ）およびその医薬上許容される塩からなる群より選択される少なくとも１つの化合物である請求項１記載の医薬組成物。
【請求項８】
アミノカルボン酸キレート剤が、エチレンジアミン四酢酸（ＥＤＴＡ）、ジエチレントリアミン五酢酸（ＤＴＰＡ）、ヒドロキシエチレンジアミン三酢酸（ＨＥＤＴＡ）、ニトリロ三酢酸（ＮＴＡ）、Ｏ，Ｏ’－ビス（２－アミノエチル）エチレングリコール－Ｎ，Ｎ，Ｎ’，Ｎ’－四酢酸（ＥＧＴＡ）、トランス－１，２－ジアミノシクロヘキサン－Ｎ，Ｎ，Ｎ’，Ｎ’－四酢酸（ＣｙＤＴＡ）およびその医薬上許容される塩からなる群より選択される少なくとも１つの化合物である請求項６記載の医薬組成物。
【請求項９】
アミノカルボン酸キレート剤が、エチレンジアミン四酢酸（ＥＤＴＡ）およびその医薬上許容される塩より選択される請求項７記載の医薬組成物。
【請求項１０】
アミノカルボン酸キレート剤が、エチレンジアミン四酢酸（ＥＤＴＡ）およびその医薬上許容される塩より選択される請求項８記載の医薬組成物。
【請求項１１】
アミノグリコシドをさらに含む請求項１記載の医薬組成物。
【請求項１２】
アミノグリコシドが、アミカシンおよびトブラマイシンより選択される請求項１１記載の医薬組成物。
【請求項１３】
アミノグリコシドをさらに含む請求項８記載の医薬組成物。
【請求項１４】
アミノグリコシドが、アミカシンおよびトブラマイシンより選択される請求項１３記載の医薬組成物。
【請求項１５】
非経口投与の前に相溶性を有する復元用希釈液を添加することによって復元することのできる粉末の形態である請求項１記載の医薬組成物。
【請求項１６】
非経口投与の前に相溶性を有する復元用希釈液を添加することによって復元することのできる粉末の形態である請求項８記載の医薬組成物。
【請求項１７】
非経口投与の前に、解凍され、かつ、必要に応じて相溶性希釈液で希釈されるのに適合する凍結組成物の形態である請求項１記載の医薬組成物。
【請求項１８】
非経口投与の前に、解凍され、かつ、必要に応じて相溶性希釈液で希釈されるのに適合する凍結組成物の形態である請求項８記載の医薬組成物。
【請求項１９】
直ちに非経口投与できる形態である請求項１記載の医薬組成物。
【請求項２０】
直ちに非経口投与できる形態である請求項８記載の医薬組成物。
【請求項２１】

溶液の形態であり、ピペラシリンが約８ｍｇ／ｍＬないし約５００ｍｇ／ｍＬの量で存在する請求項１記載の医薬組成物。
【請求項２２】
溶液の形態であり、ピペラシリンが約８ｍｇ／ｍＬないし約５００ｍｇ／ｍＬの量で存在する請求項９記載の医薬組成物。
【請求項２３】
溶液の形態であり、タゾバクタムが約０．１ｍｇ／ｍＬないし約１２５ｍｇ／ｍＬの量で存在する請求項１記載の医薬組成物。
【請求項２４】
溶液の形態であり、タゾバクタムが約０．１ｍｇ／ｍＬないし約１２５ｍｇ／ｍＬの量で存在する請求項９記載の医薬組成物。
【請求項２５】
溶液の形態であり、クエン酸塩緩衝剤が、約０．２５ｍｇ／ｍＬないし約２５ｍｇ／ｍＬの量で存在する請求項６記載の医薬組成物。
【請求項２６】
溶液の形態であり、クエン酸塩緩衝剤が、約０．２５ｍｇ／ｍＬないし約２５ｍｇ／ｍＬの量で存在する請求項８記載の医薬組成物。
【請求項２７】
溶液の形態であり、組成物を生理学的に等浸透圧性とするために有効な量のデキストロースをさらに含む請求項１記載の医薬組成物。
【請求項２８】
デキストロースの有効量が約５ｍｇ／ｍＬないし約１００ｍｇ／ｍＬである請求項２７記載の医薬組成物。
【請求項２９】
溶液の形態であり、アミカシンが約０．１ｍｇ／ｍＬないし約７５ｍｇ／ｍＬの量で存在する請求項１２記載の医薬組成物。
【請求項３０】
溶液の形態であり、トブラマイシンが約０．１ｍｇ／ｍＬないし約７５ｍｇ／ｍＬの量で存在する請求項１２記載の医薬組成物。
【請求項３１】
溶液の形態であり、アミノカルボン酸キレート剤が、約０．００２ｍｇ／ｍＬないし約１０ｍｇ／ｍＬの量で存在する請求項１記載の医薬組成物。
【請求項３２】
アミノカルボン酸キレート剤が、約０．００３ｍｇ／ｍＬないし約１ｍｇ／ｍＬの量で存在する請求項９記載の医薬組成物。
【請求項３３】
密封容器に入れられた単回投与用濃縮物であって、該容器が医薬組成物の濃縮溶液を形成するのに十分な容量の水性溶媒を導入するための十分な空間を有する、請求項１記載の医薬組成物。
【請求項３４】
密封容器に入れられた単回投与用濃縮物であって、該容器が医薬組成物の濃縮溶液を形成するのに十分な容量の水性溶媒を導入するための十分な空間を有する、請求項９記載の医薬組成物。
【請求項３５】
溶液の形態であり、静脈内投与のための静注用バッグまたは静注用ボトルに入れられている単位投薬である請求項１記載の医薬組成物。
【請求項３６】
溶液の形態であり、静脈内投与のための静注用バッグまたは静注用ボトルに入れられている単位投薬である請求項８記載の医薬組成物。
【請求項３７】

溶液の形態であり、静脈内投与のための静注用バッグまたは静注用ボトルに入れられている単位投薬である請求項９記載の医薬組成物。
【請求項３８】
（ａ）ピペラシリン遊離酸換算で実質的に４．０ｇとなる量のピペラシリンまたはその医薬上許容される塩、（ｂ）タゾバクタム遊離酸換算で実質的に０．５ｇとなる量のタゾバクタムまたはその医薬上許容される塩、（ｃ）実質的に１ｍｇのＥＤＴＡまたは医薬上許容されるＥＤＴＡの塩、および（ｄ）注射用水を含有する請求項１記載の医薬組成物。
【請求項３９】
（ａ）ピペラシリンまたはその医薬上許容される塩が約４．０ｇのピペラシリン遊離酸としてのピペラシリンナトリウムであり、（ｂ）タゾバクタムまたはその医薬上許容される塩が約０．５ｇのタゾバクタム遊離酸としてのタゾバクタムナトリウムであり、（ｃ）約１ｍｇのＥＤＴＡ、および（ｄ）約１００ｍＬの注射用水である請求項３８記載の医薬組成物。
【請求項４０】
約０．２ｇのクエン酸ナトリウムをさらに含む請求項３８記載の医薬組成物。
【請求項４１】
約０．２ｇのクエン酸ナトリウムをさらに含む請求項３９記載の医薬組成物。
【請求項４２】
約２．０ｇのデキストロースをさらに含む請求項３８記載の医薬組成物。
【請求項４３】
アミノグリコシドをさらに含む請求項３８記載の医薬組成物。
【請求項４４】
アミノグリコシドがアミカシンであり、約５００ｍｇの量で存在する請求項４３記載の医薬組成物。
【請求項４５】
アミノグリコシドがトブラマイシンであり、約１６０ｍｇの量で存在する請求項４３記載の医薬組成物。
【請求項４６】
注射用水の量が約１００ｍＬである請求項３８記載の医薬組成物。
【請求項４７】
凍結していて、非経口投与の前に解凍することができ、かつ、必要に応じて相溶性希釈液で希釈される請求項３８記載の医薬組成物。
【請求項４８】
（ａ）有効量のピペラシリンまたはその医薬上許容される塩、タゾバクタムまたはその医薬上許容される塩、およびアミノカルボン酸キレート剤またはその医薬上許容される塩を水性溶媒に溶かし、溶液を形成させ；
（ｂ）該溶液のｐＨを約６．０ないし約７．５の範囲に調整し；および
（ｃ）復元可能な粉末を形成するために該溶液を凍結乾燥する
工程を含む、粉末の形態である復元可能な医薬組成物の製造方法。
【請求項４９】
工程（ａ）において、ピペラシリン、タゾバクタムおよびアミノカルボン酸キレート剤と共にアミノグリコシドを溶解させることをさらに含む、請求項４８記載の方法。
【請求項５０】
アミノグリコシドが、アミカシンおよびトブラマイシンより選択される請求項４９記載の方法。
【請求項５１】
アミノグリコシドがアミカシンであり、約０．１ｍｇ／ｍＬないし約７５ｍｇ／ｍＬの量で存在する請求項５０記載の方法。
【請求項５２】
アミノグリコシドがタブラマイシンであり、約０．１ｍｇ／ｍＬないし約７５ｍｇ／ｍ

Ｌの量で存在する請求項５０記載の方法。
【請求項５３】
工程（ｂ）において、有効量の緩衝剤によってｐＨが約６．５に調整されることをさらに含む、請求項４８記載の方法。
【請求項５４】
緩衝剤がクエン酸塩である請求項５３記載の方法。
【請求項５５】
緩衝剤がクエン酸ナトリウムである請求項５３記載の方法。
【請求項５６】
（ａ）有効量のクエン酸ナトリウム二水和物を水性溶媒に溶かし、溶液を形成させ；
（ｂ）有効量のピペラシリンおよびタゾバクタムを添加し；
（ｃ）ｐＨを約６．５に調整し；および
（ｄ）有効量のＥＤＴＡを添加する
工程を含む、医薬組成物を調製する方法。
【請求項５７】
工程（ｂ）において、有効量のピペラシリンおよびタゾバクタムと共に有効量のアミノグリコシドを添加することをさらに含む請求項５６記載の方法。
【請求項５８】
アミノグリコシドが、アミカシンおよびタブラマイシンより選択される請求項５７記載の方法。
【請求項５９】
アミノグリコシドがアミカシンであり、約０．１ｍｇ／ｍＬないし約７５ｍｇ／ｍＬの量で存在する請求項５８記載の方法。
【請求項６０】
アミノグリコシドがタブラマイシンであり、約０．１ｍｇ／ｍＬないし約７５ｍｇ／ｍＬの量で存在する請求項５８記載の方法。
【請求項６１】
ＥＤＴＡが約０．００２ｍｇ／ｍＬないし約１０ｍｇ／ｍＬの量で存在する請求項５６記載の方法。
【請求項６２】
ＥＤＴＡが約０．００３ｍｇ／ｍＬないし約１ｍｇ／ｍＬの量で存在する請求項５６記載の方法。
【請求項６３】
（ｅ）組成物を形成するために凍結または凍結乾燥する工程をさらに含む請求項５６記載の方法。
【請求項６４】
（ａ）クエン酸ナトリウム二水和物、ＥＤＴＡ、ピペラシリン、およびタゾバクタムを水性溶媒に溶かし、溶液を形成させ、該溶液のｐＨを約６．５に調整し；
（ｂ）該溶液を凍結乾燥機中で－３７℃以下の温度まで冷却し；
（ｃ）該凍結乾燥機を約３００μＭ以下の圧力まで脱気し；
（ｄ）該凍結乾燥機を約５℃以上まで加熱し；
（ｅ）凍結乾燥固体を形成するために、その温度および圧力を該水性溶液から水を除去するのに十分な時間維持し、
（ｆ）該凍結乾燥組成物を形成するために、約４５℃以上で該凍結乾燥固体を乾燥させる
工程を含む、凍結乾燥医薬組成物を調製する方法。
【請求項６５】
工程（ａ）において、クエン酸ナトリウム二水和物、ＥＤＴＡ、ピペラシリンおよびタゾバクタムと共にアミノグリコシドを溶解させることをさらに含む請求項６４記載の方法。

【請求項６６】
アミノグリコシドが、アミカシンおよびタブラマイシンより選択される請求項６５記載の方法。
【請求項６７】
アミノグリコシドがアミカシンであり、約０．１ｍｇ／ｍＬないし約７５ｍｇ／ｍＬの量で存在する請求項６５記載の方法。
【請求項６８】
アミノグリコシドがタブラマイシンであり、約０．１ｍｇ／ｍＬないし約７５ｍｇ／ｍＬの量で存在する請求項６５記載の方法。
【請求項６９】
ＥＤＴＡが約０．００２ｍｇ／ｍＬないし約１０ｍｇ／ｍＬの量で存在する請求項６５記載の方法。
【請求項７０】
ＥＤＴＡが約０．００３ｍｇ／ｍＬないし約１ｍｇ／ｍＬの量で存在する請求項６５記載の方法。
【請求項７１】
（ａ）約８９％ピペラシリンまたはその医薬上許容される塩、（ｂ）約１１％タゾバクタムまたはその医薬上許容される塩；および（ｃ）約０．０２％のアミノカルボン酸キレート剤またはその医薬上許容される塩を含む医薬組成物。
【請求項７２】
（ａ）約８５％ピペラシリンまたはその医薬上許容される塩、（ｂ）約１１％タゾバクタムまたはその医薬上許容される塩；（ｃ）約０．０２％のアミノカルボン酸キレート剤またはその医薬上許容される塩；および（ｄ）約４％の緩衝剤を含む医薬組成物。
【請求項７３】
アミノカルボン酸キレート剤がＥＤＴＡである請求項７２記載の医薬組成物。
【請求項７４】
緩衝剤がクエン酸塩である請求項７３記載の医薬組成物。
【請求項７５】
非経口投与による哺乳動物の細菌性感染症を治療または制御のための薬剤の製造のための請求項１記載の医薬組成物の使用。
【請求項７６】
非経口投与による哺乳動物の細菌性感染症を治療または制御のための薬剤の製造のための請求項８記載の医薬組成物の使用。
【請求項７７】
非経口投与による哺乳動物の細菌性感染症を治療または制御のための薬剤の製造のための請求項１１記載の医薬組成物の使用。
【請求項７８】
非経口投与による哺乳動物の細菌性感染症を治療または制御のための薬剤の製造のための請求項１２記載の医薬組成物の使用。