

【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24年6月7日(2012.6.7)

【公表番号】特表2011-530540(P2011-530540A)

【公表日】平成23年12月22日(2011.12.22)

【年通号数】公開・登録公報2011-051

【出願番号】特願2011-522346(P2011-522346)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 P 13/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 47/20

A 6 1 P 13/00

【手続補正書】

【提出日】平成24年4月12日(2012.4.12)

【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】

テトラヒドロビオブテリン又はその代謝前駆体を含有する医薬剤形であって、テトラヒドロビオブテリン又はその代謝前駆体と酸化防止剤との水溶液を調合容器中に含み、且つ調合した水溶液を投与するための投与手段を含むことを特徴とする医薬剤形。

【請求項2】

酸化防止剤がスルフヒドリル化合物であることを特徴とする請求項1に記載の医薬剤形。

【請求項3】

スルフヒドリル化合物がシステイン化合物であり、特にシステイン及びそれから誘導される化合物（特にN-アセチルシステイン、ホモシステイン、N-アセチルホモシステイン、システインメチルエステル、システインエチルエステル、ホモシステインメチルエステル、及びホモシステインエチルエステルからなる群から選ばれる化合物）からなる群から選ばれ、または2種又は数種の異なるスルフヒドリル化合物の混合物であり、任意に塩（特に塩酸塩）の形であることを特徴とする請求項2に記載の医薬剤形。

【請求項4】

テトラヒドロビオブテリン又はその代謝前駆体の濃度が0.5重量%～50重量%、特に2重量%～20重量%、特に5重量%～15重量%であることを特徴とする請求項1～3のいずれか一項に記載の医薬剤形。

【請求項5】

テトラヒドロビオブテリン又はその代謝前駆体と酸化防止剤とのモル比が1.5：1～1：4、特に1：1～1：1.5を含むことを特徴とする請求項1～4のいずれか一項に記載の医薬剤形。

【請求項6】

水溶液の pH が 5 以下、特に 2 以下であることを特徴とする請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬剤形。

【請求項 7】

投与手段によって $100 \mu l$ ~ $2000 \mu l$ の範囲で水溶液のアリコートが分注 (dispensation) されることを特徴とする請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の医薬剤形。

【請求項 8】

投与手段が調合容器に堅固に接続されていることを特徴とする請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の医薬剤形。

【請求項 9】

調合容器中の水溶液と投与手段とが互いに分離した状態で 1 つのパッケージ中にまとめられたキットを含むことを特徴とする請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の医薬剤形。

【請求項 10】

テトラヒドロビオブテリン又はその代謝前駆体の水溶液を少なくとも 1 ヶ月（特に 2、3、4、5、6、9、又は 12 ヶ月）の保存期間にわたって安定化するための、酸化防止剤（特にスルフヒドリル化合物、特にシステイン）の使用であって、特に前記テトラヒドロビオブテリン又はその代謝前駆体と前記酸化防止剤とのモル比が約 1.5 : 1 ~ 1 : 4、特に 1 : 1 ~ 1 : 1.5 を含むことを特徴とする使用。

【請求項 11】

テトラヒドロビオブテリン又はその代謝前駆体が、 40 ± 2 で相対湿度 $75 \pm 5\%$ の条件下及び / 又は 25 ± 2 で相対湿度 $60 \pm 5\%$ の条件下で安定であり、特にテトラヒドロビオブテリン又はその代謝前駆体の初期濃度の 95%（特に 96%、97%、97.5%、98%、又は 99%）が少なくとも 1 ヶ月（特に 2、3、4、5、6、9、又は 12 ヶ月）保存しても維持されることを特徴とする請求項 10 に記載の使用。

【請求項 12】

請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の医薬剤形であって、テトラヒドロビオブテリン又はその代謝前駆体を小児又は幼児に（特にミルク又はベビーフードと組み合わせて）投与することによって、テトラヒドロビオブテリン欠損による変異型フェニルケトン尿症（特に高フェニルアラニン血症）を治療するための医薬剤形。