

【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26年9月18日(2014.9.18)

【公表番号】特表2013-538845(P2013-538845A)

【公表日】平成25年10月17日(2013.10.17)

【年通号数】公開・登録公報2013-057

【出願番号】特願2013-530795(P2013-530795)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4196 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/10 (2006.01)

A 6 1 K 9/12 (2006.01)

A 6 1 K 9/06 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/4196

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 9/12

A 6 1 K 9/06

A 6 1 K 45/00

【手続補正書】

【提出日】平成26年8月1日(2014.8.1)

【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】

粒子の形態のデフェラシロクスを含む医薬組成物であって、該粒子が約2000nm以下の平均粒径を有する、前記医薬組成物。

【請求項2】

前記粒子が約1000nm以下の平均粒径を有する、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項3】

表面安定剤、粘度付与剤及びポリマーのうちの少なくとも1種を含む群から選択される少なくとも1種の賦形剤を含む、請求項1又は2記載の医薬組成物。

【請求項4】

前記表面安定剤が界面活性剤であり、任意に、該界面活性剤が、両性、非イオン性、カチオン性、若しくはアニオン性、又はそれらの組み合わせである、請求項3記載の医薬組成物。

【請求項5】

前記界面活性剤が以下の1種以上を含む、請求項4記載の医薬組成物：

ポリソルベート；ドデシル硫酸ナトリウム(ラウリル硫酸ナトリウム)；ラウリルジメチルアミノオキシド；ドキュセートナトリウム；臭化セチルトリメチルアンモニウム(CTAB)；ポリエトキシ化アルコール；ポリオキシエチレンソルビタン；オクトキシノール；N,N-ジメチルドデシルアミン-N-オキシド；臭化ヘキサデシルトリメチルアンモニウム、ポリオキシシロラウリルエーテル、ブリジ、胆汁酸塩(デオキシコール酸ナトリウム又はコール酸ナトリウムなど)；ポリオキシシルヒマシ油；ノニルフェノールエトキシレート；シクロデキストリン；レシチン；塩化メチルベンゼトニウム；カルボン酸塩；スルホン酸塩；石油スルホン酸塩；アルキルベンゼンスルホン酸塩；ナフタレンスルホン酸塩；及びオレフィンスルホン酸塩；硫酸塩界面活性剤；アルキル硫酸塩；硫酸化天然油若しくは脂；硫酸化エステル；硫酸化アルカノールアミド；任意にエトキシ化及び硫酸化されたアルキルフェノール；エトキシ化脂肪族アルコール；ポリオキシエチレン；カルボン酸エステル；ポリエチレングリコールエステル；無水ソルビトールエステル又はそのエトキシ化誘導体；脂肪酸のグリコールエステル；カルボン酸アミド；モノアルカノールアミン縮合物；ポリオキシエチレン脂肪酸アミド；第4級アンモニウム塩；アミド結合を有するアミン；ポリオキシエチレンアルキルアミン；ポリオキシエチレン脂環式アミン；N,N,N,N-テトラキス置換エチレンジアミン；2-アルキル-1-ヒドロキシエチル-2-イミダゾリン；N-ココ-3-アミノプロピオン酸又はそのナトリウム塩；N-タロウ-3-イミノジプロピオン酸二ナトリウム塩；N-カルボキシメチル-n-ジメチル-n-9オクタデセニル水酸化アンモニウム；n-ココアミドエチル-n-ヒドロキシエチルグリシンナトリウム塩；又はそれらの混合物。

【請求項6】

前記粘度付与剤が、ラクトース；スクロース；サッカロース；加水分解デンプン(マルトデキストリンなど)；又は、これらの混合物である、請求項3記載の医薬組成物。

【請求項7】

前記ポリマーが、ヒドロキシプロピルセルロース；ヒドロキシメチルセルロース；ヒドロキシプロピルメチルセルロース；メチルセルロースポリマー；ヒドロキシエチルセルロース；カルボキシメチルセルロースナトリウム；カルボキシメチレンヒドロキシエチルセルロース及び/又はカルボキシメチルヒドロキシエチルセルロース；アクリルポリマー(アクリル酸、アクリルアミドなど)、及び無水マレイン酸ポリマー及びコポリマー；又は、それらの混合物である、請求項3記載の医薬組成物。

【請求項8】

実質的に全ての粒子が、1nmより大きい平均粒径を有する、請求項1～7のいずれか1項記載の医薬組成物。

【請求項9】

医薬として許容し得る担体を含み、任意に、前記粒子が該担体の表面に吸着される、請求項1～8のいずれか1項記載の医薬組成物。

【請求項10】

前記担体が、1種以上の希釈剤又は充填剤；1種以上の結合剤；1種以上の潤滑剤；1種以上の流動促進剤；1種以上の崩壊剤；1種以上の防腐剤；1種以上の保湿剤；1種以上の溶解遅延剤；1種以上の吸収促進剤；1種以上の湿潤剤；1種以上の吸着剤；1種以上の緩衝剤；又は、それらの混合物を含む、請求項9記載の医薬組成物。

【請求項11】

経口投与のためのものであり、任意に、固体経口剤形の形態である、請求項9又は10記載の医薬組成物。

【請求項12】

錠剤又は分散性錠剤の形態である、請求項11記載の医薬組成物。

【請求項13】

(1) デフェラシロクス及び少なくとも1種の賦形剤を均質化して、デフェラシロクスの均質化された分散物を製造する工程、及び、

(2) 該均質化された分散物を粉碎して、約2000nm以下の平均粒径を有するデフェラシ

ロクス粒子のスラリーを製造する工程、
を含む、医薬組成物の製造方法であって、

(3) 前記粉砕されたスラリーを医薬として許容し得る担体に吸着させて顆粒を形成し、
該顆粒を圧縮して錠剤を形成する工程、又は

(4) 前記スラリー (slurring) から、液体分散物、ゲル、又はエアロゾルを形成する
工程、

を任意にさらに含む、前記製造方法。

【請求項 14】

前記賦形剤が、請求項3～7のいずれか1項に規定されたものである、請求項13記載の方法。

【請求項 15】

慢性鉄過剰症を治療するための医薬の製造における、請求項1～12のいずれか1項記載の
医薬組成物の使用。

【請求項 16】

以下から選択される1種以上の活性成分をさらに含む、請求項1～12のいずれか1項記載
の医薬組成物：

ロイコトリエン、プロベネシド、インドメタシン、ペニシリンG、リトナビル、インディ
ナビル、サクイナビル、フロセミド、メトトレキサート、スルフィンピラゾン、インター
フェロン、リバビリン、ピラミジン、パロピシタビン、アロマターゼ阻害剤、抗エストロ
ゲン剤、抗アンドロゲン剤、ゴナドレリンアゴニスト、トポイソメラーゼI阻害剤、トポ
イソメラーゼII阻害剤、微小管活性剤、アルキル化剤、抗悪性腫瘍薬、代謝拮抗薬、白金
化合物、抗血管新生化合物、シクロオキシゲナーゼ阻害剤、ビスホスホネート、ヘパラナ
ーゼ阻害剤、テロメラーゼ阻害剤、プロテアーゼ阻害剤、マトリックスメタロプロテイナー
ゼ阻害剤、プロテアソーム阻害剤、ソマトスタチン受容体アンタゴニスト、抗白血病化
合物、リボヌクレオチドレダクターゼ阻害剤、S-アデノシルメチオニンデカルボキシラー
ゼ阻害剤；ACE阻害剤、抗生物質（例えば、ゲンタマイシン、アミカシン、トブラマイシ
ン、シプロフロキサシン、レボフロキサシン、セフトジジム、セフェピム、セフピロム、
ピペラシリン、チカルシリン、メロペネム、イミペネム、ポリミキシンB、コリスチン、
及びアズトレオナムなど）；シクロスポリンA、シクロスポリンG、ラパマイシン、又は、
それらの医薬として許容し得る塩、溶媒和物、互変異性体、誘導體、鏡像異性体、異性体
、水和物、プロドラッグ若しくは多形体。