

【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4月6日(2017.4.6)

【公表番号】特表2016-510765(P2016-510765A)

【公表日】平成28年4月11日(2016.4.11)

【年通号数】公開・登録公報2016-022

【出願番号】特願2015-561747(P2015-561747)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/56 (2006.01)

A 6 1 K 31/675 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/573 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/167 (2006.01)

A 6 1 K 31/445 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/56

A 6 1 K 31/675

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 31/573

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/167

A 6 1 K 31/445

【手続補正書】

【提出日】平成29年3月3日(2017.3.3)

【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

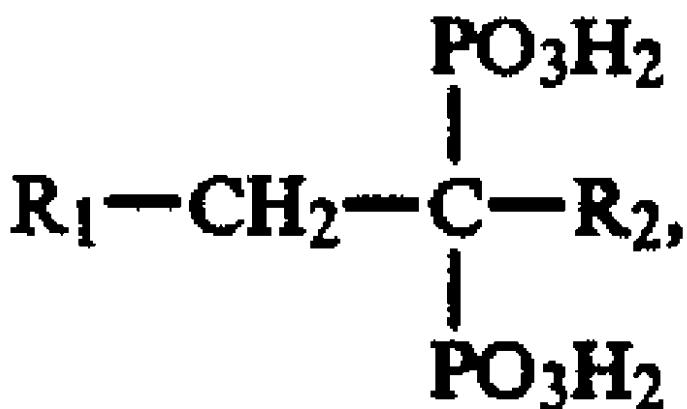
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

変形性関節症を治療または予防する医薬組成物であって、ステロイドと次式：

【化1】



(式中、R₁は、ヘテロ原子として、2～4個のN原子、または1もしくは2個のN原子と共に1個のOもしくはS原子を含有する5員のヘテロアリール基であって、前記5員のヘテロアリール基は、非置換であるか、あるいは低級アルキル、フェニル、または低級アルキル、低級アルコキシおよび/もしくはハロゲンで置換されているフェニルにより、または低級アルコキシ、ヒドロキシ、ジ-低級アルキルアミノ、低級アルキルチオおよび/もしくはハロゲンによりC置換されており、ならびに/あるいは低級アルキル、低級アルコキシおよび/もしくはハロゲンにより置換できるN原子においてN置換されており、R₂は、水素、ヒドロキシ、アミノ、低級アルキルチオまたはハロゲンであり、ここで、用語「低級」は1～7個の炭素原子を意味し、低級アルコキシはC_{1～4}アルコキシであり、ジ-低級アルキルアミノはジ-C_{1～4}アルキルアミノであり、低級アルキルチオはC_{1～4}アルキルチオであり、ハロゲンはフッ素、塩素または臭素である。)の化合物との組合せを含む、医薬組成物。

【請求項2】

式Iの前記化合物は、ゾレドロン酸である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項3】

ゾレドロン酸は、注入により、または皮下に、または経口で、または筋肉内による投与のために製剤化されている、請求項1または2に記載の医薬組成物。

【請求項4】

前記ステロイドは、経口で、静脈内に、皮下に、筋肉内に、吸入により、関節への注射により、または肛門座薬による投与のために製剤化されている、請求項1～3のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項5】

前記ステロイドの用量が、プレドニゾロン5mg～50mgの間と同等量である、請求項1～4のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項6】

静脈内投与用又は直接関節に投与するための薬学的に許容される溶液中にメチルプレドニゾロン、ゾレドロン酸、および麻酔剤を含む医薬組成物。

【請求項7】

前記溶液は、生理食塩水およびリン酸緩衝生理食塩水からなる群から選択される、請求項6に記載の医薬組成物。

【請求項8】

プレドニゾロンおよび前記ゾレドロン酸の合計量が、約9～55mgの間である、請求項6または7に記載の医薬組成物。

【請求項9】

変形性関節症を治療するための静脈内注入に用いられる前記医薬組成物であって、前記ゾレドロン酸4または5mg、および前記プレドニゾロン5～50mgを、生理食塩水中に含む、請求項6～8のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項10】

ステロイド、ゾレドロン酸、および直接関節に投与するための薬学的に許容される担体(carrier)の組合せを含む、関節において変形性関節症を治療する医薬組成物。

【請求項11】

麻酔剤をさらに含む、請求項10に記載の医薬組成物。

【請求項12】

前記ステロイドは、ヒドロコルチゾン、酢酸ヒドロコルチゾン、酢酸コルチゾン、チクソコルトールピバル酸エステル、プレドニゾロン、メチルプレドニゾロン、プレドニゾン、トリアムシノロンアセトニド、トリアムシノロンアルコール、モメタゾン、アムシノニド、ブデソニド、デソニド、フルオシノニド、フルオシノロンアセトニド、ハルシノニド

、ベタメタゾン、リン酸ベタメタゾンナトリウム、デキサメタゾン、リン酸デキサメタゾンナトリウム、フルオコルトロン、ヒドロコルチゾン-17-バレレート、アルクロメタゾンジプロピオン酸エステル、吉草酸ベタメタゾン、ジプロピオン酸ベタメタゾン、ブレドニカルベート、クロベタゾン-17-ブチレート、クロベタゾール-17-ブロピオネート、カプロン酸フルオコルトロン、ピバリン酸フルオコルトロン、および酢酸フルブレドニデン、ヒドロコルチゾン-17-ブチレート、17-アセポネート、17-ブテブレート、およびブレドニカルベート、または薬学的に許容されるそれらの塩からなる群から選択される、請求項10または11に記載の組成物。

【請求項13】

前記麻酔剤は、リドカイン、マーカイン、薬学的に許容されるその塩、またはそれらの混合物である、請求項11または12に記載の組成物。

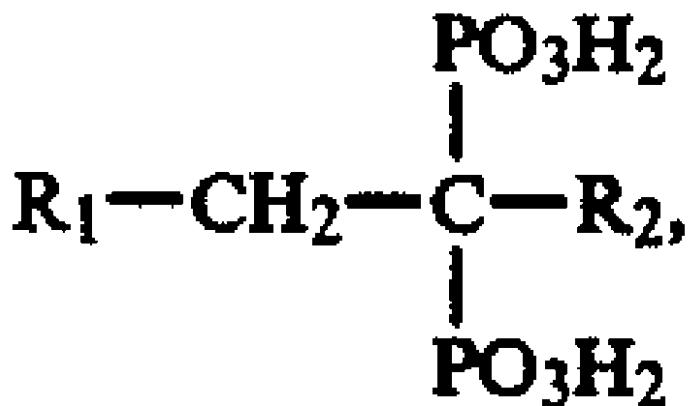
【請求項14】

前記麻酔剤は、テトラカイン、オキシブロカイン、ベンゾカイン、ブタンベン、ジブカイン、プラモキシン、プロパラカイン、プロキシメタカイン、コカイン、デクスマデトミジンおよびプロポフォールからなる群から選択される、請求項11または12に記載の組成物。

【請求項15】

変形性関節症を治療または予防するための医薬組成物であって、ステロイドと次式：

【化2】



(式中、R₁は、ヘテロ原子として、2~4個のN原子、または1もしくは2個のN原子と共に1個のOもしくはS原子を含有する5員のヘテロアリール基であって、前記5員のヘテロアリール基は、非置換であるか、あるいは低級アルキル、フェニル、または低級アルキル、低級アルコキシおよび/もしくはハロゲンで置換されているフェニルにより、または低級アルコキシ、ヒドロキシ、ジ-低級アルキルアミノ、低級アルキルチオおよび/もしくはハロゲンによりC置換されており、ならびに/あるいは低級アルキル、低級アルコキシおよび/もしくはハロゲンにより置換できるN原子においてN置換されており、R₂は、水素、ヒドロキシ、アミノ、低級アルキルチオまたはハロゲンであり、

ここで、用語「低級」は1~7個の炭素原子を意味し、

低級アルコキシはC_{1~4}アルコキシであり、

ジ-低級アルキルアミノはジ-C_{1~4}アルキルアミノであり、

低級アルキルチオはC_{1~4}アルキルチオであり、

ハロゲンはフッ素、塩素または臭素である。)

の化合物との組合せを含む、医薬組成物を製造するための使用。

【請求項16】

式Iの前記化合物は、ゾレドロン酸である、請求項15に記載の使用。

【請求項17】

ゾレドロン酸が、注入により、または皮下に、または経口で、または筋肉内による投与

のために製剤化されている、および／または、前記ステロイドが、経口で、静脈内に、皮下に、筋肉内に、吸入により、関節への注射により、または肛門座薬による投与のために製剤化されている、請求項15または16に記載の使用。

【請求項18】

前記ステロイドの用量が、プレドニゾロン5mg～50mgの間と同等量である、請求項15～17のいずれか一項に記載の使用。

【請求項19】

前記医薬組成物は麻酔剤をさらに含む、請求項15～18のいずれか一項に記載の使用。

【請求項20】

前記ステロイドはプレドニゾロンであり、かつ、前記プレドニゾロンおよび前記ゾレドロン酸の合計量が、約9～55mgの間である、請求項15～19のいずれか一項に記載の使用。

【請求項21】

前記組成物は、ゾレドロン酸4または5mg、およびプレドニゾロン5～50mgを、生理食塩水中に含む、請求項15～20のいずれか一項に記載の使用。

【請求項22】

前記麻酔剤は、リドカイン、マーカイン、薬学的に許容されるその塩、またはそれらの混合物である、請求項19に記載の使用。

【請求項23】

前記麻酔剤は、テトラカイン、オキシブロカイン、ベンゾカイン、ブタンベン、ジブカイン、プラモキシン、プロパラカイン、プロキシメタカイン、コカイン、デクスマデトミジンおよびプロポフォールからなる群から選択される、請求項19に記載の使用。

【請求項24】

前記ステロイドは、ヒドロコルチゾン、酢酸ヒドロコルチゾン、酢酸コルチゾン、チクソコルトールピバル酸エステル、プレドニゾロン、メチルプレドニゾロン、プレドニゾン、トリアムシノロンアセトニド、トリアムシノロンアルコール、モメタゾン、アムシノニド、ブデソニド、デソニド、フルオシノニド、フルオシノロンアセトニド、ハルシノニド、ベタメタゾン、リン酸ベタメタゾンナトリウム、デキサメタゾン、リン酸デキサメタゾンナトリウム、フルオコルトロン、ヒドロコルチゾン-17-バレート、アルクロメタゾンジプロピオン酸エステル、吉草酸ベタメタゾン、ジプロピオン酸ベタメタゾン、プレドニカルベート、クロベタゾン-17-ブチレート、クロベタゾール-17-プロピオネート、カプロン酸フルオコルトロン、ピバリン酸フルオコルトロン、および酢酸フルプレドニデン、ヒドロコルチゾン-17-ブチレート、17-アセポネート、17-ブテブレート、およびプレドニカルベート、または薬学的に許容されるそれらの塩からなる群から選択される、請求項15～23のいずれか一項に記載の使用。