

【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23年11月4日(2011.11.4)

【公表番号】特表2010-540448(P2010-540448A)

【公表日】平成22年12月24日(2010.12.24)

【年通号数】公開・登録公報2010-051

【出願番号】特願2010-525983(P2010-525983)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/546	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 K	31/675	(2006.01)
A 6 1 K	47/12	(2006.01)
A 6 1 K	47/16	(2006.01)
A 6 1 K	47/22	(2006.01)
A 6 1 K	9/14	(2006.01)
A 6 1 K	9/08	(2006.01)
A 6 1 K	9/10	(2006.01)
A 6 1 K	47/04	(2006.01)
A 6 1 K	47/26	(2006.01)
A 6 1 P	31/04	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/546	
A 6 1 P	43/00	1 2 3
A 6 1 K	31/675	
A 6 1 K	47/12	
A 6 1 K	47/16	
A 6 1 K	47/22	
A 6 1 K	9/14	
A 6 1 K	9/08	
A 6 1 K	9/10	
A 6 1 K	47/04	
A 6 1 K	47/26	
A 6 1 P	31/04	

【手続補正書】

【提出日】平成23年9月12日(2011.9.12)

【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】

セフタロリンまたはその薬学的に許容される塩および／またはその溶媒和物および／またはそのプロドラッグおよび可溶化剤を含む製剤であって、前記製剤の水溶液中の前記可溶化剤のモル濃度が約0.1Mを超える製剤。

【請求項2】

前記可溶化剤のモル濃度が約0.5Mを超える、請求項1に記載の製剤。

【請求項3】

前記可溶化剤のモル濃度が約1.0Mを超える、請求項1に記載の製剤。

【請求項4】

セフタロリンフォサミルを含み、前記セフタロリンフォサミルがセフタロリンフォサミル-モノアセタート-水和物(USAN)またはセフタロリンフォサミル-無水アセタートフリー(INN)である、請求項1に記載の製剤。

【請求項5】

前記セフタロリンフォサミルが約40mg/mLを超える水溶解度を有する、請求項4に記載の製剤。

【請求項6】

前記セフタロリンフォサミルが約100mg/mLを超える水溶解度を有する、請求項4に記載の製剤。

【請求項7】

前記セフタロリンフォサミルが約200mg/mLを超える水溶解度を有する、請求項4に記載の製剤。

【請求項8】

前記可溶化剤がカルボン酸類およびアミノ酸類から選択される、請求項1に記載の製剤。

。

【請求項9】

前記可溶化剤が、ギ酸、酢酸、プロピオン酸、酪酸、吉草酸、カプロン酸、エナント酸、カブリル酸、ペラルゴン酸、カプリン酸、ラウリン酸、ステアリン酸、アクリル酸、ドコサヘキサエン酸、エイコサペンタエン酸、ピルビン酸、安息香酸、サリチル酸、アルダル酸、シウ酸、マロン酸、リンゴ酸、コハク酸、グルタル酸、アジピン酸、クエン酸、乳酸、アラニン、アルギニン、アスパラギン、アスパラギン酸、システイン、グルタミン、グリシン、ヒスチジン、イソロイシン、ロイシン、リジン、メチオニン、フェニルアラニン、プロリン、セリン、トレオニン、トリプトファン、チロシン、バリンおよびそれらの塩およびそれらの組み合わせからなる群から選択される、請求項1に記載の製剤。

【請求項10】

前記可溶化剤が、L-アルギニン、DL-アルギニン、クエン酸およびその塩、酢酸およびその塩、ヒスチジン、およびそれらの組み合わせから選択される、請求項9に記載の製剤。

【請求項11】

前記可溶化剤がL-アルギニンである、請求項10に記載の製剤。

【請求項12】

前記可溶化剤がクエン酸/クエン酸ナトリウムである、請求項10に記載の製剤。

【請求項13】

前記可溶化剤が酢酸/酢酸ナトリウムである、請求項10に記載の製剤。

【請求項14】

約223mg～約2005mgのセフタロリンフォサミルを含む製剤であって、前記製剤の単回非経口投与によって約10,650ng·hr/mLを超える平均AUC<sub>0~</sub>を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる製剤。

【請求項15】

前記製剤の単回筋肉内投与によって、

約39,500ng/mL未満の平均C<sub>max</sub>と、

約10,650ng·hr/mLの平均AUC<sub>0~</sub>と、

を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項14に記載の製剤。

【請求項16】

前記製剤の単回筋肉内投与によって、

約39,500ng/mL未満の平均C<sub>max</sub>と、

約10,650ng·hr/mLを超える平均AUC<sub>0~</sub>と、

約1時間以上の平均T<sub>max</sub>と、

を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 1 4 に記載の製剤。

【請求項 1 7】

223 mg のセフタロリンフォサミルを含み、前記製剤の単回非経口投与によって約 10, 650 ng · hr / mL を超える平均 AUC<sub>0 -</sub> を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 1 4 に記載の製剤。

【請求項 1 8】

前記製剤の単回筋肉内投与によって、  
約 4, 900 ng / mL 未満の平均 C<sub>max</sub> と、  
約 10, 650 ng · hr / mL を超える平均 AUC<sub>0 -</sub> と、  
を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 1 7 に記載の製剤。

【請求項 1 9】

前記製剤の単回筋肉内投与によって、  
約 4, 900 ng / mL 未満の平均 C<sub>max</sub> と、  
約 10, 650 ng · hr / mL を超える平均 AUC<sub>0 -</sub> と、  
約 1 時間以上の平均 T<sub>max</sub> と、  
を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 1 7 に記載の製剤。

【請求項 2 0】

446 mg のセフタロリンフォサミルを含み、前記製剤の単回非経口投与によって約 21, 350 ng · hr / mL を超える平均 AUC<sub>0 -</sub> を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 1 4 に記載の製剤。

【請求項 2 1】

前記製剤の単回筋肉内投与によって、  
約 9, 800 ng / mL 未満の平均 C<sub>max</sub> と、  
約 21, 350 ng · hr / mL を超える平均 AUC<sub>0 -</sub> と、  
を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 2 0 に記載の製剤。

【請求項 2 2】

前記製剤の単回筋肉内投与によって、  
約 9, 800 ng / mL 未満の平均 C<sub>max</sub> と、  
約 21, 350 ng · hr / mL を超える平均 AUC<sub>0 -</sub> と、  
約 1 時間以上の平均 T<sub>max</sub> と、  
を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 2 0 に記載の製剤。

【請求項 2 3】

557 mg のセフタロリンフォサミルを含み、前記製剤の単回非経口投与によって約 25, 800 ng · hr / mL を超える平均 AUC<sub>0 -</sub> を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 1 4 に記載の製剤。

【請求項 2 4】

前記製剤の単回筋肉内投与によって、  
約 11, 100 ng / mL 未満の平均 C<sub>max</sub> と、  
約 25, 800 ng · hr / mL を超える平均 AUC<sub>0 -</sub> と、  
を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 2 3 に記載の製剤。

【請求項 2 5】

前記製剤の単回筋肉内投与によって、  
約 11, 100 ng / mL 未満の平均 C<sub>max</sub> と、  
約 25, 800 ng · hr / mL を超える平均 AUC<sub>0 -</sub> と、  
約 1 時間以上の平均 T<sub>max</sub> と、  
を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 2 3 に記載の製剤。

【請求項 2 6】

668 mg のセフタロリンフォサミルを含み、前記製剤の単回非経口投与によって約 28, 800 ng · hr / mL を超える平均 AUC<sub>0 -</sub> を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 1 4 に記載の製剤。

**【請求項 27】**

前記製剤の単回筋肉内投与によって、  
約 12,000 ng / mL 未満の平均  $C_{max}$  と、  
約 28,800 ng · hr / mL を超える平均  $AUC_{0-\infty}$  と、

を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 26 に記載の製剤。

**【請求項 28】**

前記製剤の単回筋肉内投与によって、  
約 12,000 ng / mL 未満の平均  $C_{max}$  と、  
約 28,800 ng · hr / mL を超える平均  $AUC_{0-\infty}$  と、  
約 1 時間以上の平均  $T_{max}$  と、

を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 26 に記載の製剤。

**【請求項 29】**

891 mg のセフタロリンフォサミルを含み、前記製剤の単回非経口投与によって約 49,000 ng · hr / mL を超える平均  $AUC_{0-\infty}$  を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 14 に記載の製剤。

**【請求項 30】**

前記製剤の単回筋肉内投与によって、  
約 17,750 ng / mL 未満の平均  $C_{max}$  と、  
約 49,000 ng · hr / mL を超える平均  $AUC_{0-\infty}$  と、

を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 29 に記載の製剤。

**【請求項 31】**

前記製剤の単回筋肉内投与によって、  
約 17,750 ng / mL 未満の平均  $C_{max}$  と、  
約 49,000 ng · hr / mL を超える平均  $AUC_{0-\infty}$  と、  
約 1 時間以上の平均  $T_{max}$  と、

を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 29 に記載の製剤。

**【請求項 32】**

1114 mg のセフタロリンフォサミルを含み、前記製剤の単回非経口投与によって、  
約 66,000 ng · hr / mL を超える平均  $AUC_{0-\infty}$  を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 14 に記載の製剤。

**【請求項 33】**

前記製剤の単回筋肉内投与によって、  
約 22,500 ng / mL 未満の平均  $C_{max}$  と、  
約 66,000 ng · hr / mL を超える平均  $AUC_{0-\infty}$  と、

を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 32 に記載の製剤。

**【請求項 34】**

前記製剤の単回筋肉内投与によって、  
約 22,500 ng / mL 未満の平均  $C_{max}$  と、  
約 66,000 ng · hr / mL を超える平均  $AUC_{0-\infty}$  と、  
約 1 時間以上の平均  $T_{max}$  と、

を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 32 に記載の製剤。

**【請求項 35】**

1337 mg のセフタロリンフォサミルを含み、前記製剤の単回非経口投与によって約 79,500 ng · hr / mL を超える平均  $AUC_{0-\infty}$  を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 14 に記載の製剤。

**【請求項 36】**

前記製剤の単回筋肉内投与によって、  
約 26,500 ng / mL 未満の平均  $C_{max}$  と、  
約 79,500 ng · hr / mL を超える平均  $AUC_{0-\infty}$  と、

を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 35 に記載の製剤。

**【請求項 37】**

前記製剤の単回筋肉内投与によって、  
約 26,500 ng / mL 未満の平均  $C_{max}$  と、  
約 79,500 ng · hr / mL を超える平均  $AUC_{0-\infty}$  と、  
約 1 時間以上の平均  $T_{max}$  と、  
を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 35 に記載の製剤。

**【請求項 38】**

2005 mg のセフタロリンフォサミルを含み、前記製剤の単回非経口投与によって約 126,000 ng · hr / mL を超える平均  $AUC_{0-\infty}$  を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 14 に記載の製剤。

**【請求項 39】**

前記製剤の単回筋肉内投与によって、  
約 39,500 ng / mL 未満の平均  $C_{max}$  と、  
約 126,000 ng · hr / mL を超える平均  $AUC_{0-\infty}$  と、  
を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 38 に記載の製剤。

**【請求項 40】**

前記製剤の単回筋肉内投与によって、  
約 39,500 ng / mL 未満の平均  $C_{max}$  と、  
約 126,000 ng · hr / mL を超える平均  $AUC_{0-\infty}$  と、  
約 1 時間以上の平均  $T_{max}$  と、  
を含むセフタロリンの生体内血漿プロファイルが得られる、請求項 38 に記載の製剤。

**【請求項 41】**

約 668 mg のセフタロリンフォサミルおよび約 400 mg の L - アルギニンを含み、  
前記セフタロリンフォサミルが約 100 mg / mL を超える水溶解度を有する製剤。

**【請求項 42】**

約 668 mg のセフタロリンフォサミルおよび約 348 mg の L - アルギニンを含み、  
前記セフタロリンフォサミルが約 100 mg / mL を超える水溶解度を有する製剤。

**【請求項 43】**

約 668 mg のセフタロリンフォサミルおよび約 174 mg の L - アルギニンを含み、  
前記セフタロリンフォサミルが約 100 mg / mL を超える水溶解度を有する製剤。

**【請求項 44】**

約 446 mg のセフタロリンフォサミルおよび約 267 mg の L - アルギニンを含み、  
前記セフタロリンフォサミルが約 100 mg / mL を超える水溶解度を有する製剤。

**【請求項 45】**

約 446 mg のセフタロリンフォサミルおよび約 230 mg の L - アルギニンを含み、  
前記セフタロリンフォサミルが約 100 mg / mL を超える水溶解度を有する製剤。

**【請求項 46】**

約 446 mg のセフタロリンフォサミルおよび約 116 mg の L - アルギニンを含み、  
前記セフタロリンフォサミルが約 100 mg / mL を超える水溶解度を有する製剤。

**【請求項 47】**

粉末の形態の請求項 1 のいずれかに記載の製剤。

**【請求項 48】**

溶液の形態または溶媒中の懸濁液の形態の請求項 1 のいずれかに記載の製剤。

**【請求項 49】**

前記溶媒が、水、生理食塩水、約 5 ~ 10 % のグルコースまたはデキストロース溶液、  
およびそれらの組み合わせから選択される、請求項 45 に記載の製剤。

**【請求項 50】**

細菌感染の治療方法であって、細菌感染の治療を必要とする患者に請求項 48 に記載の  
製剤の有効量を投与することを含む方法。

**【請求項 51】**

前記製剤が筋肉内投与される、請求項5\_0に記載の方法。

【請求項 5\_2】

前記製剤が静脈内投与される、請求項5\_0に記載の方法。