

【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22年2月25日(2010.2.25)

【公表番号】特表2009-523770(P2009-523770A)  
 【公表日】平成21年6月25日(2009.6.25)  
 【年通号数】公開・登録公報2009-025  
 【出願番号】特願2008-550785(P2008-550785)  
 【国際特許分類】

A 6 1 K 31/337 (2006.01)  
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)  
 A 6 1 K 9/08 (2006.01)  
 A 6 1 K 47/46 (2006.01)  
 A 6 1 K 47/32 (2006.01)  
 A 6 1 K 47/36 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/337  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 K 9/08  
 A 6 1 K 47/46  
 A 6 1 K 47/32  
 A 6 1 K 47/36

【手続補正書】

【提出日】平成22年1月6日(2010.1.6)

【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】

哺乳動物、好ましくはヒトに投与するためのタキサンの医薬製剤であって、投与前に混合される2つの組成物を含んでなり、沈殿のない透明な溶液を形成する医薬製剤：  
 ここで、

- a) 前記組成物の一方は、凍結乾燥されたタキサンの固体組成物であり、界面活性剤を含まず、凍結乾燥有機溶媒およびタキサンを含んでなる溶液における凍結乾燥により得られ、  
 b) 他方は、少なくとも1の界面活性剤を含んでなる前記凍結乾燥されたタキサンの固体組成物の可溶化組成物である。

【請求項2】

請求項1に記載の製剤であって、前記固体組成物は、界面活性剤、油、ポリマー、溶解性増強剤、保存剤および賦形剤を含まない製剤。

【請求項3】

請求項1または2に記載の製剤であって、前記固体組成物は0.1g/ml未満の見かけ密度を有する製剤。

【請求項4】

請求項1～3のいずれか1項に記載の製剤であって、前記固体組成物は残存する凍結乾燥有機溶媒の濃度が8%未満である製剤。

【請求項5】

請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の製剤であって、前記凍結乾燥有機溶媒は、ジオキサン、酢酸、ジメチルスルホキシドまたはそれらの混合物を含んでなる群より選択される製剤。

【請求項 6】

請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の製剤であって、前記タキサンは前記溶液において 0.1 ~ 50 重量%の濃度である製剤。

【請求項 7】

請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の製剤であって、前記溶液は、界面活性剤、油、ポリマー、溶解性増強剤、保存剤および賦形剤の非存在下で、前記有機溶媒および前記タキサンのみを含んでなる製剤。

【請求項 8】

請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の製剤であって、前記タキサンは、バッカチンIII誘導體、10-デアセチルバッカチンIIIに由来する誘導體ならびにそれらの接合体、塩、水和物および溶媒和物を含んでなる群より選択される製剤。

【請求項 9】

請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の製剤であって、前記タキサンは、ドセタキセルもしくはパクリタキセル、その塩、水和物または溶媒和物である製剤。

【請求項 10】

請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の製剤であって、前記可溶化組成物は、有機溶媒の非存在下で高分子界面活性剤および水を含んでなる製剤。

【請求項 11】

請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の製剤であって、前記可溶化組成物は 1 ~ 100 重量%の濃度で界面活性剤を含んでなる製剤。

【請求項 12】

請求項 10 または 11 に記載の製剤であって、前記界面活性剤は高分子であり、マクロゴールヒドロキシステアレート、ポロキサマー、ポリビニルピロリドンまたはそれらの混合物からなる群より選択される製剤。

【請求項 13】

請求項 12 に記載の製剤であって、前記界面活性剤はソルトール（登録商標）HS15 である製剤。

【請求項 14】

請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の製剤であって、前記可溶化組成物は、10 ~ 50 %のソルトールHS15 および 50 % ~ 90 %の水（P/P%）を含んでなる製剤。

【請求項 15】

請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の製剤であって、ポリソルベート80を含まない製剤。

【請求項 16】

請求項 1 ~ 15 のいずれか 1 項に記載の製剤であって、ポリオキシエチル化ヒマシ油を含まない製剤。

【請求項 17】

哺乳動物、特にヒトに対する医薬製剤の調製に適したタキサンの固体組成物であって、凍結乾燥されたタキサンを含んでなり、界面活性剤、油、ポリマー、溶解性増強剤、保存剤および賦形剤を含まない固体組成物。

【請求項 18】

請求項 17 に記載の固体組成物であって、見かけ密度は 0.001 g/ml ~ 0.1 g/ml である固体組成物。

【請求項 19】

請求項 17 または 18 に記載の固体組成物であって、残留凍結乾燥有機溶媒の濃度が 8 %未満である固体組成物。

【請求項 20】

請求項 17 ~ 19 のいずれか 1 項に記載の固体組成物であって、前記凍結乾燥有機溶媒は、ジオキサン、酢酸、ジメチルスルホキシドまたはそれらの混合物からなる群より選択される固体組成物。

【請求項 21】

請求項 17 ~ 20 のいずれか 1 項に記載の固体組成物であって、前記タキサンは、バッカチンIII誘導体、10-デアセチルバッカチンIII誘導体ならびにそれらの接合体、塩、水和物および溶媒和物を含んでなる群より選択される固体組成物。

【請求項 22】

請求項 17 ~ 21 のいずれか 1 項に記載の固体組成物であって、前記タキサンは、ドセタキセルもしくはパクリタキセル、その塩、その水和物または溶媒和物である固体組成物。

【請求項 23】

哺乳動物、主にヒトに対する医薬製剤を調製するのに適したタキサンの固体組成物の調製方法であって、

a) 界面活性剤、油、ポリマー、溶解性増強剤、保存剤および賦形剤の非存在下で、凍結乾燥有機溶媒に前記タキサンを溶解することと、

b) 凍結乾燥することと、

c) 任意に乾燥すること

を含んでなる方法。

【請求項 24】

請求項 23 に記載の方法であって、滅菌工程も含んでなる方法。

【請求項 25】

請求項 22 または 23 に記載の方法であって、前記タキサンは、バッカチンIII誘導体、10-デアセチルバッカチンIII誘導体、それらの接合体、塩、水和物および溶媒和物からなる群より選択される方法。

【請求項 26】

請求項 23 ~ 25 のいずれか 1 項に記載の方法であって、前記タキサンは、ドセタキセルもしくはパクリタキセル、その塩、その水和物およびその溶媒和物である方法。

【請求項 27】

哺乳動物、主にヒトに非経口的に注入するための注射可能な医薬製剤を調製するのに適したタキサンの固体組成物の可溶化組成物であって、少なくとも 1 の界面活性剤を含んでなり、有機溶媒を含まない可溶化組成物。

【請求項 28】

請求項 27 に記載の可溶化組成物であって、高分子非イオン性界面活性剤を 0.1% ~ 50% の濃度で含んでなる可溶化組成物。

【請求項 29】

請求項 27 または 28 に記載の可溶化組成物であって、前記界面活性剤はソルトール（登録商標）HS 15 である可溶化組成物。

【請求項 30】

生理食塩水またはデキストロス溶液中における 1 mg/ml 未満のタキサンを含有し、ソルトール（登録商標）を含み、有機溶媒、他の界面活性剤、油、他のポリマー、溶解性増強剤、保存剤および賦形剤を含まない薬学的な灌流溶液。

【請求項 31】

請求項 30 に記載の溶液であって、前記タキサンはドセタキセルである溶液。

【請求項 32】

注射可能なタキサンの製剤のためのキットであって、請求項 17 ~ 22 のいずれか 1 項に記載の凍結乾燥されたタキサンの固体組成物を含む第 1 の容器と、前記タキサンの固体組成物の可溶化組成物を含む第 2 の容器と、シリンジとを含んでなるキット。

【請求項 33】

請求項 32 に記載のキットであって、前記シリンジは予め充填され、前記第 1 の容器お

よび前記第 2 の容器を含んでなるキット。

【請求項 3 4】

哺乳動物、好ましくはヒトに対する非経口的な注入溶液を調製するのに適したタキサンの注射可能な製剤を調製するためのキットであって、請求項 1 7 ~ 2 2 のいずれか 1 項に記載の凍結乾燥されたタキサンの固体組成物、前記タキサンの固体組成物の可溶化組成物、およびシリンジを含んでなり、前記可溶化組成物と前記タキサンの固体組成物とを混合し、少なくとも 2 時間は沈殿を生じない、非経口的な輸液バッグに注入される少なくとも 4 m g / m l の濃度のタキサンの透明且つ安定な溶液を得るためのキット。