

【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25年3月7日 (2013.3.7)

【公表番号】特表2012-519694(P2012-519694A)

【公表日】平成24年8月30日 (2012.8.30)

【年通号数】公開・登録公報2012-034

【出願番号】特願2011-553071(P2011-553071)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/416 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 31/416

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 27/02

【手続補正書】

【提出日】平成25年1月15日 (2013.1.15)

【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】

眼の新生血管新生を処置するための水溶液であって、該水溶液は、以下：

0.01%～5%の量での水溶性に乏しい活性薬剤、水および15%～55%の量での少なくとも2000の分子量を有するポリエチレングリコールを含む水溶液。

【請求項 2】

前記活性薬剤が抗脈管形成薬剤、抗炎症薬剤、および抗血管透過性薬剤からなる群より選択される、請求項 1 に記載の水溶液。

【請求項 3】

前記活性薬剤が抗脈管形成薬剤である、請求項 2 に記載の水溶液。

【請求項 4】

前記抗脈管形成薬剤が複数標的のレセプターチロシンキナーゼ (RTK) 阻害剤である、請求項 3 に記載の水溶液。

【請求項 5】

前記 RTK 阻害剤が N - [4 - (3 - アミノ - 1 H - インダゾール - 4 - イル) フェニル] - N ' - (2 - フルオロ - 5 - メチルフェニル) 尿素である、請求項 4 に記載の水溶液。

【請求項 6】

前記抗脈管形成薬剤の濃度が 0.1%～3%である、請求項 5 に記載の水溶液。

【請求項 7】

前記 PEG が少なくとも 4000 の分子量を有する、請求項 6 に記載の水溶液。

【請求項 8】

調合物中における前記 PEG の濃度が 25% ~ 50% である、請求項 7 に記載の水溶液。

【請求項 9】

前記 PEG が PEG 6000、PEG 20000、および PEG 6000 と PEG 20000 との混合物からなる群より選択される、請求項 7 に記載の水溶液。

【請求項 10】

前記水溶液は、実質的にイオン種が存在しない、請求項 1 に記載の水溶液。

【請求項 11】

請求項 1 に記載の水溶液であって、

0.3% (w/v) 活性薬剤；

8% (w/v) PEG 400；

21% (w/v) PEG 6000；および

21% (w/v) PEG 20000；

を含み、

ここで該水溶液は、実質的にイオン種が存在しない、水溶液。

【請求項 12】

請求項 1 に記載の水溶液であって、

0.6% (w/v) 活性薬剤；

8% (w/v) PEG 400；

21% (w/v) PEG 6000；および

21% (w/v) PEG 20000；

を含み、

ここで該水溶液は、実質的にイオン種が存在しない、水溶液。

【請求項 13】

請求項 1 に記載の水溶液であって、

1.2% (w/v) 活性薬剤；

8% (w/v) PEG 400；

21% (w/v) PEG 6000；および

21% (w/v) PEG 20000；

を含み、

ここで該水溶液は、実質的にイオン種が存在しない、水溶液。

【請求項 14】

請求項 1 に記載の水溶液であって、

0.6% (w/v) 活性薬剤；および

41% (w/v) PEG 14000；

を含み、

ここで該水溶液は、実質的にイオン種が存在しない、水溶液。

【請求項 15】

1% の前記活性薬剤 N - [4 - (3 - アミノ - 1 H - インダゾール - 4 - イル) フェニル] - N ' - (2 - フルオロ - 5 - メチルフェニル) 尿素および 49% の PEG 14000 を含む、請求項 1 に記載の水溶液。

【請求項 16】

請求項 1 に記載の水溶液を含む、微小血管病変、増大した血管透過性または眼内の新生血管新生に関連する眼の障害を処置するための組成物であって、該組成物は、該眼の障害に苦しむ患者の眼に投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項 17】

前記眼の障害が、糖尿病網膜症、加齢性黄斑変性、黄斑浮腫、ブドウ膜炎、および地図状萎縮からなる群より選択される、請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 18】

前記組成物が請求項 11 に記載の水溶液を含む、請求項 17 に記載の組成物。

【請求項 19】

前記組成物が請求項 12 に記載の水溶液を含む、請求項 17 に記載の組成物。

【請求項 20】

前記組成物が請求項 13 に記載の水溶液を含む、請求項 17 に記載の組成物。

【請求項 21】

前記組成物が請求項 14 に記載の水溶液を含む、請求項 17 に記載の組成物。

【請求項 22】

前記組成物が請求項 15 に記載の水溶液を含む、請求項 17 に記載の組成物。

【請求項 23】

前記水溶液の注射後の前記患者の眼の組織への前記活性薬剤の送達の持続が少なくとも 2 ヶ月である、請求項 16 に記載の組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0014

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0014】

本発明の組成物は、好ましくは、後強膜近傍投与、硝子体内注射、または硝子体網膜療法を介して、新脈管形成もしくは増強された血管透過性に関連する眼の、または新生血管新生もしくは血管透過性によって特徴付けられる疾患に苦しむ患者の眼へ投与される。

例えば、本発明は以下の項目を提供する。

(項目 1)

眼の新生血管新生を処置するための水溶液であって、該組成物は、以下：

0.01% ~ 5% の量での水溶性に乏しい活性薬剤、水および 15% ~ 55% の量での少なくとも 2000 の分子量を有するポリエチレングリコールを含む水溶液。

(項目 2)

前記活性薬剤が抗脈管形成薬剤、抗炎症薬剤、および抗血管透過性薬剤からなる群より選択される、項目 1 に記載の水溶液。

(項目 3)

前記活性薬剤が抗脈管形成薬剤である、項目 3 に記載の水溶液。

(項目 4)

前記抗脈管形成薬剤が複数標的のレセプターチロシンキナーゼ (RTK) 阻害剤である、項目 3 に記載の水溶液。

(項目 5)

前記 RTK 阻害剤が N - [4 - (3 - アミノ - 1 H - インダゾール - 4 - イル) フェニル] - N ' - (2 - フルオロ - 5 - メチルフェニル) 尿素である、項目 4 に記載の水溶液。

(項目 6)

前記抗脈管形成薬剤の濃度が 0.1% ~ 3% である、項目 5 に記載の水溶液。

(項目 7)

前記 PEG が少なくとも 4000 の分子量を有する、項目 6 に記載の水溶液。

(項目 8)

調合物中における前記 PEG の濃度が 25% ~ 50% である、項目 7 に記載の水溶液。

(項目 9)

前記 PEG が PEG 6000、PEG 20000、および PEG 6000 と PEG 20000 との混合物からなる群より選択される、項目 7 に記載の水溶液。

(項目 10)

前記溶液が実質的にイオン種が存在しない、項目 1 に記載の水溶液。

(項目 11)

項目 1 に記載の水溶液であって、

0 . 3 % (w / v) 活性薬剤 ;
8 % (w / v) P E G 4 0 0 ;
2 1 % (w / v) P E G 6 0 0 0 ; および
2 1 % (w / v) P E G 2 0 0 0 0 ;
を含み、

ここで該溶液は、実質的にイオン種が存在しない、水溶液。

(項目 1 2)

項目 1 に記載の水溶液であって、
0 . 6 % (w / v) 活性薬剤 ;
8 % (w / v) P E G 4 0 0 ;
2 1 % (w / v) P E G 6 0 0 0 ; および
2 1 % (w / v) P E G 2 0 0 0 0 ;
を含み、

ここで該溶液は、実質的にイオン種が存在しない、水溶液。

(項目 1 3)

項目 1 に記載の水溶液であって、
1 . 2 % (w / v) 活性薬剤 ;
8 % (w / v) P E G 4 0 0 ;
2 1 % (w / v) P E G 6 0 0 0 ; および
2 1 % (w / v) P E G 2 0 0 0 0 ;
を含み、

ここで該溶液は、実質的にイオン種が存在しない、水溶液。

(項目 1 4)

項目 1 に記載の水溶液であって、
0 . 6 % (w / v) 活性薬剤 ; および
4 1 % (w / v) P E G 1 4 0 0 0 ;
を含み、

ここで該溶液は、実質的にイオン種が存在しない、水溶液。

(項目 1 5)

1 % の前記活性薬剤 N - [4 - (3 - アミノ - 1 H - インダゾール - 4 - イル) フェニル] - N ' - (2 - フルオロ - 5 - メチルフェニル) 尿素および 4 9 % の P E G 1 4 0 0 0
を含む、項目 1 に記載の水溶液。

(項目 1 6)

微小血管病変、増大した血管透過性または眼内の新生血管新生に関連する眼の障害を処置するための方法であって、該方法は、該眼の障害に苦しむ患者の眼に項目 1 に記載の水溶液を投与することを含む、方法。

(項目 1 7)

前記眼の障害が、糖尿病網膜症、加齢性黄斑変性、黄斑浮腫、ブドウ膜炎、および地図状萎縮からなる群より選択される、項目 1 6 に記載の方法。

(項目 1 8)

前記組成物が項目 1 1 に記載の組成物である、項目 1 7 に記載の方法。

(項目 1 9)

前記組成物が項目 1 2 に記載の組成物である、項目 1 7 に記載の方法。

(項目 2 0)

前記組成物が項目 1 3 に記載の組成物である、項目 1 7 に記載の方法。

(項目 2 1)

前記組成物が項目 1 4 に記載の組成物である、項目 1 7 に記載の方法。

(項目 2 2)

前記組成物が項目 1 5 に記載の組成物である、項目 1 7 に記載の方法。

(項目 2 3)

前記溶液の注射後の前記患者の眼の組織への前記活性薬剤の送達の持続が少なくとも２ヶ月である、項目１６に記載の方法。