

【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18年8月3日(2006.8.3)

【公表番号】特表2005-535644(P2005-535644A)

【公表日】平成17年11月24日(2005.11.24)

【年通号数】公開・登録公報2005-046

【出願番号】特願2004-518239(P2004-518239)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/42	(2006.01)
A 6 1 K	9/08	(2006.01)
A 6 1 K	47/04	(2006.01)
A 6 1 K	47/10	(2006.01)
A 6 1 K	47/16	(2006.01)
A 6 1 K	47/18	(2006.01)
A 6 1 K	47/22	(2006.01)
A 6 1 K	47/34	(2006.01)
A 6 1 P	1/02	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	7/02	(2006.01)
A 6 1 P	7/06	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/04	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/14	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	11/02	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	15/00	(2006.01)
A 6 1 P	15/06	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/02	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	17/10	(2006.01)
A 6 1 P	17/16	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	19/06	(2006.01)
A 6 1 P	19/10	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	21/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/06	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 P	27/06	(2006.01)
A 6 1 P	27/12	(2006.01)

A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	31/12	(2006.01)
A 6 1 P	35/04	(2006.01)
A 6 1 P	37/06	(2006.01)
A 6 1 P	41/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K	31/42	
A 6 1 K	9/08	
A 6 1 K	47/04	
A 6 1 K	47/10	
A 6 1 K	47/16	
A 6 1 K	47/18	
A 6 1 K	47/22	
A 6 1 K	47/34	
A 6 1 P	1/02	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	7/02	
A 6 1 P	7/06	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	9/04	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	9/14	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	11/02	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	15/00	
A 6 1 P	15/06	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	17/10	
A 6 1 P	17/16	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	19/06	
A 6 1 P	19/10	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	21/04	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	25/04	
A 6 1 P	25/06	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	27/06	
A 6 1 P	27/12	
A 6 1 P	29/00	

A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	31/12	
A 6 1 P	35/04	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	41/00	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	43/00	1 7 1

【手続補正書】

【提出日】平成18年6月15日(2006.6.15)

【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】

パレコキシブ成分を水溶解性のパレコキシブ塩の形態で含む、非経口的に送達可能な医薬組成物であって、前記パレコキシブ成分が、以下の：

(a) 水成分、

(b) パレコキシブの変換により形成するバルデコキシブを可溶化するために有効な非水性溶解剤成分であって、実質的にそのような変換に関して不活性である、前記非水性溶解剤成分、及び、

(c) パレコキシブ遊離酸の沈殿を阻害するために有効な、パレコキシブ塩安定剤成分、
、
を含む液体溶媒中に溶解及び／又は可溶化された形態であり；ここで、前記非水性溶解剤成分及びパレコキシブ塩安定剤成分が同じであるか又は異なり；ここで、55に保持された密閉容器中での14日間の上記組成物の貯蔵後に、パレコキシブが、パレコキシブ遊離酸当量として表して、上記組成物中のパレコキシブ及びバルデコキシブの総量の少なくとも約95%を構成する、前記医薬組成物。

【請求項2】

上記パレコキシブ塩がパレコキシブナトリウムである、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

上記パレコキシブ成分が、パレコキシブ遊離酸当量として表して、上記組成物の約1～約400mg/mlの量で存在する、請求項1又は2に記載の組成物。

【請求項4】

上記パレコキシブ成分が、パレコキシブ遊離酸当量として表して、上記組成物の約10～約50mg/mlの量で存在する、請求項1又は2に記載の組成物。

【請求項5】

上記非水性溶解剤成分が、ポリエチレングリコール、エタノール及びジメチルアセトアミドからなる群から選ばれる1以上の溶解剤を含む、請求項1～4のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項6】

上記液体溶媒がポリエチレングリコールを含む、請求項1～4のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項7】

上記ポリエチレングリコールが、上記液体溶媒の約20重量%～約80重量%の濃度である、請求項6に記載の組成物。

【請求項8】

上記ポリエチレングリコールが約400～約800の平均分子量を有する、請求項6又

は 7 に記載の組成物。

【請求項 9】

上記パレコキシブ塩安定剤成分が、pH緩衝剤、抗酸化剤、及び上記液体溶媒の約 50 重量 % 以上の濃度のポリエチレングリコールから成る群から選ばれる 1 以上の作用物質を含む、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 10】

上記パレコキシブ塩安定剤成分が、リン酸塩、2-アミノ-2-(ヒドロキシメチル)-1,3-プロパンジオール、アスコルビン酸塩及びマレイン酸塩緩衝剤からなる群から選ばれる 1 以上の pH 緩衝剤を含む、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 11】

上記パレコキシブ塩安定剤成分が、ブチル化ヒドロキシアニソール、アスコルビン酸塩及びメチオニンから成る群から選ばれる 1 以上の抗酸化剤を含む、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 12】

上記パレコキシブ塩安定剤成分が、上記液体溶媒の約 50 重量 % 以上の 濃度の ポリエチレングリコールを含む、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 13】

液体溶媒を含む非経口的に送達可能な医薬組成物であって、ここで、上記液体溶媒が、パレコキシブ遊離酸当量で、上記組成物の約 10 ~ 約 50 mg/ml の量でその中に溶解及び / 又は可溶化された水溶性のパレコキシブ塩を含み、ここで、上記液体溶媒が、以下の：

(a) 水；及び

(b) 上記液体溶媒の約 55 重量 % ~ 約 75 重量 % の量の、約 400 ~ 約 800 の平均分子量を有する、ポリエチレングリコール、
を含む、上記医薬組成物。

【請求項 14】

上記パレコキシブ塩が、パレコキシブ遊離酸当量で表して、上記組成物の約 40 mg/ml の量のパレコキシブナトリウムであり、そしてここで、上記液体溶媒が、約 600 の平均分子量のポリエチレングリコールを上記液体溶媒の約 65 重量 % の量で含む、請求項 13 に記載の組成物。

【請求項 15】

密閉容器中の請求項 1 に記載の組成物を含む、製造品。

【請求項 16】

上記容器が、上記組成物によって占有された充填容積及び酸素の制限された微小大気によって占有された上部空間容積を含む内部を有する、請求項 15 に記載の製造品。

【請求項 17】

上記上部空間容積が、約 5 % 以下の酸素圧を有する、請求項 16 に記載の製造品。

【請求項 18】

上記パレコキシブ塩が、さらに希釈せずに非経口投与するのに好適な濃度で存在する、請求項 15 に記載の製造品。

【請求項 19】

上記パレコキシブ塩が、1 ~ 約 30 単位用量に相当する量で存在する、請求項 15 に記載の製造品。

【請求項 20】

上記パレコキシブ塩が単一の単位用量に相当する量で存在する、請求項 15 に記載の製造品。

【請求項 21】

COX-2 阻害剤による治療の必要性が示される状態又は 障害の治療のための、請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の非経口送達可能な医薬組成物。