

【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8月17日 (2017.8.17)

【公表番号】特表2016-531901(P2016-531901A)

【公表日】平成28年10月13日 (2016.10.13)

【年通号数】公開・登録公報2016-059

【出願番号】特願2016-525821(P2016-525821)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/77 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 39/395 (2006.01)

A 6 1 K 48/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/7088 (2006.01)

A 6 1 K 38/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

C 1 2 N 15/115 (2010.01)

【F I】

A 6 1 K 31/77 Z N A

A 6 1 P 27/02

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 39/395 N

A 6 1 K 48/00

A 6 1 K 31/7088

A 6 1 K 37/43

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 9/00

C 1 2 N 15/00 H

【手続補正書】

【提出日】平成29年7月10日 (2017.7.10)

【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】

a) アンタゴニスト A または別のその医薬的に許容され得る塩、および  
b) 医薬的に許容され得る賦形剤、緩衝剤、水性担体、またはそれらの組み合わせ  
を含む組成物であって、

該組成物は、約 5 . 0 から約 8 . 0 の pH を有し、

アンタゴニスト A または別のその医薬的に許容され得る塩の少なくとも約 50 % は、約

2.0 から約 8.0 の温度に少なくとも約 12 週間保管された時に、新しい化学成分の形成をもたらす分解または修飾のサインを示さず、

該組成物は、硝子体内注射に好適である、  
前記組成物。

【請求項 2】

水性担体、塩化ナトリウム、一塩基性リン酸ナトリウム一水和物、二塩基性リン酸ナトリウム七水和物、またはそれらの組み合わせを含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

pH が約 7.5 である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 4】

塩酸または水酸化ナトリウムで緩衝化されている、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 5】

アンタゴニスト A または別のその医薬的に許容され得る塩の少なくとも約 90 % が、約 2.0 から約 8.0 の温度に少なくとも約 12 週間保管された時に、新しい化学成分の形成をもたらす分解または修飾のサインを示さない、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 6】

a) 約 3 % (w/v) のアンタゴニスト A または別のその医薬的に許容され得る塩、  
b) 約 0.9 % (w/v) の塩化ナトリウム、  
c) 約 0.03 % (w/v) の一塩基性リン酸ナトリウム一水和物、  
d) 約 0.2 % (w/v) の二塩基性リン酸ナトリウム七水和物、および  
e) 水性担体、  
を含む組成物。

【請求項 7】

約 5.0 から約 8.0、好ましくは約 7.5、の pH を有する、請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 8】

約 95.9 % (w/v) の水性担体を含む、請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 9】

請求項 6 に記載の組成物であって、該組成物は、

a) 約 0.003 mg ~ 5.0 mg、好ましくは約 0.03 mg ~ 3.0 mg、のアンタゴニスト A または別のその医薬的に許容され得る塩を含み、  
b) 硝子体内投与に好適であり、好ましくは硝子体内投与は 27 ~ 30 ゲージの針によってなされる、  
前記組成物。

【請求項 10】

a) アンタゴニスト A または別のその医薬的に許容され得る塩、および  
b) 医薬的に許容され得る賦形剤、緩衝剤、水性担体、またはそれらの組み合わせを含む組成物であって、

該組成物は、約 5.0 から約 8.0 の pH を有し、

(788) Particulate Matter in Injections, Revised Bulletin, Official 2011 年 10 月 1 日、米国薬局方協会に記載の顕微鏡粒子計数法によって測定される、約 2.0 から約 8.0 の温度に少なくとも約 12 週間保管後の該組成物中に検出される粒子の平均数は、約 50 粒子/mL を超えず、ここで粒子の直径は > 約 10  $\mu$ m であり、

該組成物は、硝子体内注射に好適である、  
前記組成物。

【請求項 11】

請求項 10 に記載の組成物であって、

a) 該組成物は、水性担体、塩化ナトリウム、一塩基性リン酸ナトリウム一水和物、二塩基性リン酸ナトリウム七水和物、またはそれらの組み合わせを含み、

b) pHは約7.5であり、

c) 塩酸または水酸化ナトリウムで緩衝化されており、および/または

d) (788) Particulate Matter in Injections, Revised Bulletin, Official 2011年10月1日、米国薬局方協会に記載の顕微鏡粒子計数法によって測定される、約2.0 から約8.0 の温度に少なくとも約12週間保管後の該組成物中に検出される粒子の平均数は、2粒子/mLを超えず、ここで粒子の直径は $> 50\ \mu\text{m}$ である、

前記組成物。

【請求項12】

請求項1、6、および10のいずれか一項に記載の組成物であって、該組成物中のアンタゴニストAまたは別のその医薬的に許容され得る塩の濃度が、約5 mg/mLから約50 mg/mL、好ましくは約30 mg/mLである、前記組成物。

【請求項13】

請求項1、6、および10のいずれか一項に記載の組成物であって、該組成物におけるアンタゴニストAの投与量が、0.03 mLから0.15 mLの体積中で約1.5 mgである、前記組成物。

【請求項14】

請求項1、6、および10のいずれか一項に記載の組成物であって、該組成物は、単一の分割されていない容器内に収容されている、前記組成物。

【請求項15】

請求項1、6、および10のいずれか一項に記載の組成物であって、該組成物は、一単位剤形中にある、前記組成物。