

【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31年2月14日 (2019.2.14)

【公表番号】特表2018-502872(P2018-502872A)

【公表日】平成30年2月1日 (2018.2.1)

【年通号数】公開・登録公報2018-004

【出願番号】特願2017-538226(P2017-538226)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/573 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/58 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/167 (2006.01)

A 6 1 K 31/445 (2006.01)

A 6 1 K 31/245 (2006.01)

A 6 1 K 47/22 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/16 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

C 0 7 J 5/00 (2006.01)

C 0 7 J 71/00 (2006.01)

C 0 7 D 211/60 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/573

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 31/58

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/10

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 25/04

A 6 1 K 31/167

A 6 1 K 31/445

A 6 1 K 31/245

A 6 1 K 47/22

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/16

A 6 1 K 47/18

C 0 7 J 5/00

C 0 7 J 71/00

C 0 7 D 211/60

【手続補正書】

【提出日】平成30年12月25日(2018.12.25)

【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】

デキサメタゾンの可溶性の塩及びエステルから選択される可溶性コルチコステロイド、
ならびに

少なくとも1つの粘度増強剤であって、前記少なくとも1つの粘度増強剤がヒアルロン
酸ナトリウムまたはヒアルロン酸であり、前記少なくとも1つの粘度増強剤の分子量は、
1.0MDa～2.5MDaであり、前記少なくとも1つの粘度増強剤の濃度は、1.0
%w/v～1.5%w/vである、少なくとも1つの粘度増強剤
を含む注射可能な水性医薬組成物であって、不溶性コルチコステロイドを実質的に含まな
い、注射可能な水性医薬組成物。

【請求項2】

前記可溶性コルチコステロイドが、デキサメタゾンリン酸ナトリウムである、請求項1
に記載の注射可能な水性医薬組成物。

【請求項3】

前記の少なくとも1つの粘度増強剤が、ヒアルロン酸である、請求項1に記載の注射可
能な水性医薬組成物。

【請求項4】

前記の少なくとも1つの粘度増強剤が、ヒアルロン酸ナトリウムである、請求項1に記
載の注射可能な水性医薬組成物。

【請求項5】

前記可溶性コルチコステロイドが、デキサメタゾンリン酸ナトリウムであり、前記少な
くとも1つの粘度増強剤が、ヒアルロン酸ナトリウムである、請求項1に記載の注射可能
な水性医薬組成物。

【請求項6】

前記可溶性コルチコステロイドが、デキサメタゾンリン酸ナトリウムであり、前記少な
くとも1つの粘度増強剤が、ヒアルロン酸である、請求項1に記載の注射可能な水性医薬
組成物。

【請求項7】

前記粘度増強剤の濃度が、約1.25%w/vである、請求項1～6のいずれか一項に
記載の注射可能な水性医薬組成物。

【請求項8】

前記可溶性コルチコステロイドが、デキサメタゾンリン酸ナトリウムであり、前記少な
くとも1つの粘度増強剤が、ヒアルロン酸ナトリウムであり、前記ヒアルロン酸ナトリウ
ムの分子量は、1.0MDa～2.0MDaであり、前記ヒアルロン酸ナトリウムの濃度
は、約1.25%w/vである、請求項1に記載の注射可能な水性医薬組成物。

【請求項9】

約6.58mg/mLの濃度でデキサメタゾンリン酸ナトリウムを含む、請求項8に記
載の注射可能な水性医薬組成物。

【請求項10】

さらに防腐剤及び/または麻酔剤を含む、請求項1～9のいずれか一項に記載の注射可
能な水性医薬組成物。

【請求項11】

前記少なくとも1つの粘度増強剤の分子量が、1.0MDa～2.0MDaである、請
求項1～7または10のいずれか一項に記載の注射可能な水性医薬組成物。

【請求項 1 2】

前記少なくとも 1 つの粘度増強剤の分子量が、 $1.2 \text{ MDa} \sim 1.8 \text{ MDa}$ である、請求項 1 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の注射可能な水性医薬組成物。

【請求項 1 3】

前記少なくとも 1 つの粘度増強剤の分子量が、 $1.2 \text{ MDa} \sim 2.0 \text{ MDa}$ である、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか一項に記載の注射可能な水性医薬組成物。

【請求項 1 4】

$1 \text{ k c P} \sim 200 \text{ k c P}$ の粘度を有する、請求項 1 ~ 1 3 のいずれか一項に記載の注射可能な水性医薬組成物。

【請求項 1 5】

$1 \text{ k c P} \sim 10 \text{ k c P}$ の粘度を有する、請求項 1 ~ 1 4 のいずれか一項に記載の注射可能な水性医薬組成物。

【請求項 1 6】

前記デキサメタゾンの可溶性の塩及びエステルが、約 5 mg/mL のデキサメタゾン濃度を達成するのに等しい重量で存在する、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の注射可能な水性医薬組成物。

【請求項 1 7】

炎症及び/または痛みを治療するための、請求項 1 ~ 1 6 のいずれか一項に記載の注射可能な水性医薬組成物であって、前記注射可能な水性医薬組成物が、それが必要な個体における硬膜外腔に注射を介して投与されることを特徴とする、注射可能な水性医薬組成物。

【請求項 1 8】

27 N 未満の力を使用して、前記注射可能な水性医薬組成物が前記硬膜外腔に注射される、請求項 1 7 に記載の注射可能な水性医薬組成物。

【請求項 1 9】

1 ~ 1 2 週ごとに 1 回、前記注射可能な水性医薬組成物が注射されることを特徴とする、請求項 1 7 に記載の注射可能な水性医薬組成物。

【請求項 2 0】

前記個体が、リウマチ性関節炎、変形性関節症、腰痛、脊椎管狭窄症、椎間板ヘルニア、脊髄神経根炎または慢性椎間板性腰痛のうちの 1 つ以上を有する、請求項 1 7 ~ 1 9 のいずれか一項に記載の注射可能な水性医薬組成物。

【請求項 2 1】

前記個体が、腰痛、脊椎管狭窄症、椎間板ヘルニア、脊髄神経根炎または慢性椎間板性腰痛のうちの 1 つ以上を有する、請求項 1 7 ~ 1 9 のいずれか一項に記載の注射可能な水性医薬組成物。

【請求項 2 2】

前記個体が、慢性椎間板性腰痛を有する、請求項 1 7 ~ 1 9 のいずれか一項に記載の注射可能な水性医薬組成物。

【請求項 2 3】

前記個体が脊椎分離を有する、請求項 1 7 ~ 1 9 のいずれか一項に記載の注射可能な水性医薬組成物。

【請求項 2 4】

前記注射は経椎弓間注射であることを特徴とする、請求項 1 7 ~ 2 3 のいずれか一項に記載の注射可能な水性医薬組成物。

【請求項 2 5】

前記注射は仙骨注射であることを特徴とする、請求項 1 7 ~ 2 3 のいずれか一項に記載の注射可能な水性医薬組成物。

【請求項 2 6】

前記注射は経椎間孔注射であることを特徴とする、請求項 1 7 ~ 2 3 のいずれか一項に記載の注射可能な水性医薬組成物。

【請求項 27】

請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の注射可能な水性医薬組成物を含むシリンジ。

【請求項 28】

注射可能な水性医薬組成物を含むシリンジであって、前記注射可能な水性医薬組成物は

デキサメタゾンリン酸ナトリウムである可溶性コルチコステロイド、及び
ヒアルロン酸ナトリウムまたはヒアルロン酸である少なくとも1つの粘度増強剤
を含み、前記注射可能な水性医薬組成物は、1 k c P ~ 2 0 0 k c P の粘度を有し、
前記注射可能な水性医薬組成物は、不溶性コルチコステロイドを実質的に含まない、シ
リンジ。

【請求項 29】

前記少なくとも1つの粘度増強剤の分子量が、1 . 0 M D a ~ 2 . 5 M D a または 1 .
2 M D a ~ 1 . 8 M D a である、請求項 28 に記載のシリンジ。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 1 8

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 1 8】

さらにもう1つの態様では、本出願が、本明細書に開示された水性医薬組成物を含むシリンジを提供する。

本発明は、例えば、以下の項目を提供する。

(項目 1)

可溶性コルチコステロイド及び少なくとも1つの粘度増強剤を含み、粘度が1 k c P ~
2 0 0 k c P である水性医薬組成物。

(項目 2)

前記可溶性コルチコステロイドが、デキサメタゾン、メチルプレドニゾロン、プレドニ
ゾロン、及びトリウムシノロンアセトニドからなる群の塩及びエステルから選択される、
項目 1 に記載の水性医薬組成物。

(項目 3)

前記可溶性コルチコステロイドが、デキサメタゾンリン酸ナトリウム、メチルプレドニ
ゾロンコハク酸ナトリウム、プレドニゾロンコハク酸ナトリウム、及びトリウムシノロン
アセトニドリン酸エステルからなる群から選択される、項目 2 に記載の水性医薬組成物。

(項目 4)

前記可溶性コルチコステロイドが、デキサメタゾンリン酸ナトリウムである、項目 3 に
記載の水性医薬組成物。

(項目 5)

前記の少なくとも1つの粘度増強剤が、ヒアルロン酸ナトリウム、ヒアルロン酸、架橋
結合ヒアルロン酸、ポリビニルピロリドン、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ヒド
ロキシプロピルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、及びグリセロールからなる群
から選択される、項目 1 に記載の水性医薬組成物。

(項目 6)

前記の少なくとも1つの粘度増強剤が、ヒアルロン酸ナトリウムである、項目 5 に記載
の水性医薬組成物。

(項目 7)

前記可溶性コルチコステロイドが、デキサメタゾンリン酸ナトリウムであり、前記少な
くとも1つの粘度増強剤が、ヒアルロン酸ナトリウムである、項目 1 に記載の水性医薬組
成物。

(項目 8)

前記粘度増強剤が、2 % w / v 未満である、項目 1 に記載の水性医薬組成物。

(項目 9)

さらに防腐剤及び / または麻酔剤を含む、項目 1 に記載の水性医薬組成物。

(項目 1 0)

治療が必要な個体の炎症及び / または痛みを治療する方法であって、水性医薬組成物を前記個体に注射することを含み、前記製剤が、可溶性コルチコステロイド、及び少なくとも 1 つの粘度増強剤を含み、前記医薬組成物の粘度が 1 k c P ~ 2 0 0 k c P である、前記方法。

(項目 1 1)

前記水性医薬組成物が、硬膜外腔に注射される、項目 1 0 に記載の方法。

(項目 1 2)

約 0 . 5 " / 分の速度で前記硬膜外腔に前記水性医薬組成物を注射するために 2 0 N 未満の力が用いられる、項目 1 0 に記載の方法。

(項目 1 3)

1 ~ 1 2 週ごとに 1 回、前記水性医薬組成物が前記個体に注射される、項目 1 0 に記載の方法。

(項目 1 4)

項目 1 に記載の水性医薬組成物を含むシリンジ。