

【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4月2日 (2010.4.2)

【公表番号】特表2009-528276(P2009-528276A)

【公表日】平成21年8月6日 (2009.8.6)

【年通号数】公開・登録公報2009-031

【出願番号】特願2008-554395(P2008-554395)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/436 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/14 (2006.01)

A 6 1 P 27/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 31/436

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/10

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 27/14

A 6 1 P 27/06

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 37/06

【手続補正書】

【提出日】平成22年2月8日 (2010.2.8)

【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】

イムノフィリン結合化合物、それらの医薬上許容されるプロドラッグ、それらの医薬上許容されるアナログ、それらの医薬上許容される塩、それらの医薬上許容される誘導体、およびそれらの医薬上許容されるエステルからなる群より選択される、活性物質を含む液体製剤であって、溶解ガス中に 20 % 以下の酸素 % を有する、液体製剤。

【請求項 2】

溶解ガス中に 17.5 % 以下の酸素 % を有する、請求項 1 に記載の液体製剤。

【請求項 3】

溶解ガス中に 16.5 % 以下の酸素 % を有する、請求項 2 に記載の液体製剤。

【請求項 4】

イムノフィリン結合化合物、それらの医薬上許容されるプロドラッグ、それらの医薬上許容されるアナログ、それらの医薬上許容される塩、それらの医薬上許容される誘導体、およびそれらの医薬上許容されるエステルからなる群より選択される、活性物質を含む液体

製剤を含む密封容器であって、該液体製剤は 20 % 以下の酸素を有するヘッドスペースガスと接触している、密封容器。

【請求項 5】

前記活性物質は、ラパマイシン、タクロリムス、エベロリムス、ピメクロリムス、CCI-779、AP23841、ABT-578、TAF A-93、AP23573、7-エピ-ラパマイシン、7-チオメチル-ラパマイシン、7-エピ-トリメトキシフェニル-ラパマイシン、7-エピ-チオメチル-ラパマイシン、7-デメトキシ-ラパマイシン、32-デメトキシ-ラパマイシン、2-デスメチル-ラパマイシン、ラパマイシンのモノエステル誘導体、ラパマイシンのジエステル誘導体、ラパマイシンの 27-オキシム；ラパマイシンの 42-オキソアナログ；二環式ラパマイシン；ラパマイシン二量体；ラパマイシンのシリルエーテル；ラパマイシンアリアルスルホン酸塩、ラパマイシンスルファミン酸塩、31位および42位でのモノエステル、31位および42位でのジエステル、30-デメトキシラパマイシン、ならびにそれらの医薬上許容されるプロドラッグ、アナログ、塩およびエステルからなる群より選択される、請求項 4 に記載の密封容器。

【請求項 6】

前記活性物質は、ラパマイシン、タクロリムス、エベロリムス、ピメクロリムス、CCI-779、AP23841、ABT-578、ならびにそれらの医薬上許容される塩およびエステルからなる群より選択される、請求項 4 に記載の密封容器。

【請求項 7】

前記活性物質は、ラパマイシンである、請求項 6 に記載の密封容器。

【請求項 8】

前記液体製剤は、10 % 以下の酸素ガスを有するヘッドスペースガスと接触している、請求項 4 に記載の密封容器。

【請求項 9】

前記液体製剤は、5 % 以下の酸素ガスを有するヘッドスペースガスと接触している、請求項 4 に記載の密封容器。

【請求項 10】

空気の 1 つ以上の成分に対して感受性である治療薬を含む眼に使用するための液体製剤であって、該治療薬の製剤濃度は、25 および相対湿度 60 % で少なくとも 2 週間にわたって少なくとも 80 % であり、該製剤は眼の 1 つ以上の組織に対して毒性である保存料を含有していない液体製剤。

【請求項 11】

前記治療薬の製剤濃度は、25 および相対湿度 60 % で少なくとも 2 週間にわたって少なくとも 90 % である、請求項 10 に記載の液体製剤。

【請求項 12】

前記治療薬の製剤濃度は、25 および相対湿度 60 % で少なくとも 1 カ月間にわたって少なくとも 90 % である、請求項 11 に記載の液体製剤。

【請求項 13】

前記治療薬の製剤濃度は、25 および相対湿度 60 % で少なくとも 2 カ月間にわたって少なくとも 90 % である、請求項 11 に記載の液体製剤。

【請求項 14】

前記治療薬の製剤濃度は、25 および相対湿度 60 % で少なくとも 3 カ月間にわたって少なくとも 90 % である、請求項 11 に記載の液体製剤。

【請求項 15】

前記治療薬の製剤濃度は、5 で少なくとも 3 カ月間にわたって少なくとも 90 % である、請求項 10 に記載の液体製剤。

【請求項 16】

前記治療薬の製剤濃度は、5 で少なくとも約 1 年間にわたって少なくとも 90 % である、請求項 15 に記載の液体製剤。

【請求項 17】

前記治療薬の製剤濃度は、5 で少なくとも2年間にわたって少なくとも90%である、請求項15に記載の液体製剤。

【請求項18】

前記製剤は、保存料を含有していない、請求項10に記載の液体製剤。

【請求項19】

前記製剤は、酸化防止剤を含有していない、請求項15に記載の液体製剤。

【請求項20】

前記活性物質は、イムノフィリン結合化合物、それらの医薬上許容されるプロドラッグ、それらの医薬上許容されるアナログ、それらの医薬上許容される塩、それらの医薬上許容される誘導体、およびそれらの医薬上許容されるエステルからなる群より選択される、請求項15または17のいずれかに記載の液体製剤。

【請求項21】

前記活性物質は、ラパマイシン、タクロリムス、エベロリムス、ピメクロリムス、CCI-779、AP23841、ABT-578、シクロフィリン、FK506結合タンパク質(FKBP)、TAF A-93、AP23573、7-エピ-ラパマイシン、7-チオメチル-ラパマイシン、7-エピ-トリメトキシフェニル-ラパマイシン、7-エピ-チオメチル-ラパマイシン、7-デメトキシ-ラパマイシン、32-デメトキシ-ラパマイシン、2-デスメチル-ラパマイシン、ラパマイシンのモノエステル誘導体、ラパマイシンのジエステル誘導体、ラパマイシンの27-オキシム；ラパマイシンの42-オキシアナログ；二環式ラパマイシン；ラパマイシン二量体；ラパマイシンのシリルエーテル；ラパマイシンアリールスルホン酸塩、ラパマイシンスルファミン酸塩、31位および42位でのモノエステル、31位および42位でのジエステル、30-デメトキシラパマイシン、ならびにそれらの医薬上許容されるプロドラッグ、アナログ、塩およびエステルからなる群より選択される、請求項15または17のいずれかに記載の液体製剤。

【請求項22】

前記活性物質は、ラパマイシン、タクロリムス、エベロリムス、ピメクロリムス、CCI-779、AP23841、ABT-578、ならびにそれらの医薬上許容される塩およびエステルからなる群より選択される、請求項2に記載の液体製剤。

【請求項23】

前記活性物質は、ラパマイシンである、請求項15に記載の液体製剤。

【請求項24】

前記ヘッドスペース容積対液体製剤容積の比は、1.5以下である、請求項11、17、または23のいずれかに記載の液体製剤。

【請求項25】

前記ヘッドスペース容積対液体製剤容積の比は、1.5以下である、請求項21に記載の液体製剤。

【請求項26】

前記ヘッドスペース容積対液体製剤容積の比は、0.5以下である、請求項25に記載の液体製剤。

【請求項27】

前記ヘッドスペース内に前記液体製剤中の活性物質1mg当たり1μL以下の酸素を有している、請求項11、17、または23に記載の液体製剤。

【請求項28】

前記ヘッドスペース内に前記液体製剤中の活性物質1mg当たり1μL以下の酸素を有している、請求項21に記載の液体製剤。

【請求項29】

前記ヘッドスペース内に前記液体製剤中の活性物質1mg当たり0.5μL以下の酸素を有している、請求項27に記載の液体製剤。

【請求項30】

前記液体製剤は、該液体製剤が曝露される光線の量を減少させるための二次包装によって

取り囲まれている容器内にある、請求項 5、11 または 15 のいずれか一項に記載の液体製剤。

【請求項 31】

液体ポリエチレングリコールをさらに含む、請求項 23 に記載の液体製剤。

【請求項 32】

前記ラパマイシンは 2% (w/w) で存在し、前記液体ポリエチレングリコールは PEG 400 であり、該 PEG 400 は 94% (w/w) で存在しており、そして前記液体製剤は 4% (w/w) のエタノールをさらに含む、請求項 31 に記載の液体製剤。

【請求項 33】

1 つ以上の空気の成分に対して感受性である 1 つ以上の成分を含む安定性製剤を調製する方法であって、該 1 つ以上の安定性製剤の成分の該 1 つ以上の空気の成分への曝露を減少させる工程を含み、眼の 1 つ以上の組織に対して毒性である保存料の添加を包含しない、方法。

【請求項 34】

不活性ガスを用いて前記液体製剤の 1 つ以上の成分をスパージする工程と、不活性ガスを用いて該液体製剤の 1 つ以上の成分を被覆する工程と、前記ヘッドスペース容積対液体製剤容積比を 1.5 以下にさせる工程と、および該ヘッドスペース内に該液体製剤中の前記活性物質 1 mg 当たり 1 μ L 以下の酸素にさせる工程とのうちのいずれか 1 つまたは複数を含む、請求項 33 に記載の方法。

【請求項 35】

前記安定性製剤の 1 つ以上の成分が感受性である前記空気の 1 つ以上の成分が酸素である、請求項 33 に記載の方法。

【請求項 36】

前記不活性ガスは、希ガスである、請求項 34 に記載の方法。

【請求項 37】

前記希ガスは、窒素である、請求項 36 に記載の方法。

【請求項 38】

前記不活性ガスを用いて前記液体製剤の 1 つ以上の成分を被覆する工程と、前記ヘッドスペース容積対液体製剤容積比を 1.5 以下にさせる工程と、を含む請求項 36 または 37 のいずれかに記載の方法。

【請求項 39】

前記活性物質は、ラパマイシン、タクロリムス、エベロリムス、ピメクロリムス、CCI-779、AP23841、ABT-578、シクロフィリン、FK506 結合タンパク質 (FKBP)、TAF A-93、AP23573、7-エピ-ラパマイシン、7-チオメチル-ラパマイシン、7-エピ-トリメトキシフェニル-ラパマイシン、7-エピ-チオメチル-ラパマイシン、7-デメトキシ-ラパマイシン、32-デメトキシ-ラパマイシン、2-デスメチル-ラパマイシン、ラパマイシンのモノエステル誘導体、ラパマイシンのジエステル誘導体、ラパマイシンの 27-オキシム；ラパマイシンの 42-オキソアナログ；二環式ラパマイシン；ラパマイシン二量体；ラパマイシンのシリルエーテル；ラパマイシンアリールスルホン酸塩、ラパマイシンスルファミン酸塩、31 位および 42 位でのモノエステル、31 位および 42 位でのジエステル、30-デメトキシラパマイシン、ならびにそれらの医薬上許容されるプロドラッグ、アナログ、塩およびエステルからなる群より選択される、請求項 36 または 37 のいずれかに記載の方法。

【請求項 40】

前記液体製剤は、ラパマイシンを含む、請求項 39 に記載の方法。

【請求項 41】

被験体における眼の疾患もしくは状態を治療する、予防する、または発生を遅延させるための方法であって、該被験体の眼に請求項 10、21、または 32 のいずれかに記載の液体製剤を投与する工程を含む方法。

【請求項 42】

前記眼の疾患もしくは状態は、脈絡膜血管新生、加齢性黄斑変性、ブドウ膜炎、アレルギー性結膜炎、ドライアイ、緑内障、色素性網膜炎、中心網膜静脈閉塞疾患、網膜血管疾患、黄斑浮腫、虹彩血管新生、糖尿病性網膜症、角膜血管新生、もしくは角膜移植拒絶反応である、請求項 4 1 に記載の方法。

【請求項 4 3】

前記密封容器は、予め充填されたシリンジである、請求項 5 ～ 8 のいずれか一項に記載の密封容器。