

【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4月11日(2013.4.11)

【公表番号】特表2011-505424(P2011-505424A)

【公表日】平成23年2月24日(2011.2.24)

【年通号数】公開・登録公報2011-008

【出願番号】特願2010-537028(P2010-537028)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/64 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/04 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/64

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/04

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 45/06

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 3/10

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/18

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 9/14

【手続補正書】

【提出日】平成25年2月6日(2013.2.6)

【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】

凍結乾燥されたグリベンクラミド粉末を含み、実質的に緩衝剤を含まない、固体薬学的組成物であって、一つ又はそれより多い実質的に薬学的に不活性な化合物及び一つ又はそれより多いアルカリ塩基を含み、グリベンクラミドの溶解度を高める他の薬剤を実質的に含まず、前記凍結乾燥されたグリベンクラミド粉末は約 1 % w / w 未満の緩衝剤を含み、実質的に薬学的に不活性な化合物の量は固体薬学的組成物中のグリベンクラミドの量の少なくとも約 10 倍を含む、固体薬学的組成物。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の固体薬学的組成物であって、ここで、一つ又はそれより多い実質的に薬学的に不活性な化合物は、糖又は塩から独立して選択される、固体薬学的組成物。

【請求項 3】

請求項 1 に記載の固体薬学的組成物であって、ここで、前記実質的に薬学的に不活性な化合物はグルコース、フルクトース、マンノース、ガラクトース、マンニトール、ソルビトール、ラクトース、トレハロース、スクロース、塩化ナトリウム及び塩化カリウムから独立して選択される、固体薬学的組成物。

【請求項 4】

請求項 1 に記載の固体薬学的組成物であって、ここで、アルカリ塩基は水酸化ナトリウム又は水酸化カリウムである、固体薬学的組成物。

【請求項 5】

請求項 1 に記載の固体薬学的組成物であって、ここで、実質的に薬学的に不活性な化合物はマンニトールであり、アルカリ塩基は水酸化ナトリウムである、固体薬学的組成物。

【請求項 6】

請求項 1 から 5 の何れか一つに記載の固体薬学的組成物であって、ここで、緩衝剤の量は約 0.1 % w / w 未満である、固体薬学的組成物。

【請求項 7】

請求項 1 に記載の固体薬学的組成物であって、ここで、実質的に薬学的に不活性な化合物の量は固体薬学的組成物中のグリベンクラミドの量の少なくとも約 30 倍を含む、固体薬学的組成物。

【請求項 8】

請求項 1 に記載の固体薬学的組成物であって、ここで、薬学的に不活性な化合物は単糖類及び二糖類からなる群から選択されるバルキング剤である、固体薬学的組成物。

【請求項 9】

請求項 1 に記載の固体薬学的組成物であって、ここで、実質的に薬学的に不活性な化合物の量は固体薬学的組成物中のグリベンクラミドの量の少なくとも約 100 倍を含む、固体薬学的組成物。

【請求項 10】

実質的に緩衝剤を含まない凍結乾燥された固体のグリベンクラミド組成物を提供するためにグリベンクラミドを凍結乾燥する方法であって：

- a) 緩衝剤の非存在下で該グリベンクラミドの水溶液を調製する工程、
 - b) バルキング剤として一つ又はそれより多い実質的に薬学的に不活性な化合物を溶液に添加する工程、
 - c) 溶液の pHを、グリベンクラミドの溶解度を上昇させるために有効な約 8 より大きく調節する工程、
 - d) 溶液にグリベンクラミドを添加する工程、及び
 - e) グリベンクラミド、及び約 1 % w / w 未満の緩衝剤、及び凍結乾燥された固体のグリベンクラミド組成物中のグリベンクラミドの量の少なくとも約 10 倍の実質的に薬学的に不活性な化合物を含む凍結乾燥された固体の組成物を提供するために、該溶液を凍結・乾燥する工程、
- を含む、方法。

【請求項 11】

請求項 10 に記載の方法であって、ここで、溶液の pH を調節する工程をさらに含む、

方法。

【請求項 1 2】

請求項 1 0 に記載の方法であって、ここで、前記 pH は約 1 0 より大きく調節される、方法。

【請求項 1 3】

請求項 1 0 に記載の方法であって、ここで、水溶液中のグリベンクラミドの濃度は約 0 . 5 m g / m L より大きい、方法。

【請求項 1 4】

請求項 1 0 に記載の方法であって、ここで、前記一つ又はそれより多い実質的に薬学的に不活性な化合物は、糖又は塩から独立して選択される、方法。

【請求項 1 5】

請求項 1 0 に記載の方法であって、ここで、実質的に薬学的に不活性な化合物の量は凍結乾燥された固体のグリベンクラミド組成物中のグリベンクラミドの量の少なくとも約 3 0 倍を含む、方法。

【請求項 1 6】

請求項 1 0 に記載の方法であって、ここで、実質的に薬学的に不活性な化合物の量は凍結乾燥された固体のグリベンクラミド組成物中のグリベンクラミドの量の少なくとも約 1 0 0 倍を含む、方法。

【請求項 1 7】

請求項 1 0 に記載の方法であって、ここで、前記一つ又はそれより多い実質的に薬学的に不活性な化合物はグルコース、フルクトース、マンノース、ガラクトース、マンニトール、ソルビトール、ラクトース、トレハロース、スクロース、塩化ナトリウム及び塩化カリウムから独立して選択される、方法。

【請求項 1 8】

請求項 1 0 に記載の方法であって、ここで、実質的に薬学的に不活性な化合物は、マンニトールである、方法。

【請求項 1 9】

請求項 1 0 に記載の方法であって、ここで、実質的に薬学的に不活性な化合物はマンニトールであり、マンニトールの量は凍結乾燥された固体のグリベンクラミド組成物中のグリベンクラミドの量の少なくとも約 3 0 倍を含む、方法。

【請求項 2 0】

請求項 1 0 に記載の方法であって、ここで、実質的に薬学的に不活性な化合物はマンニトールであり、マンニトールの量は凍結乾燥された固体のグリベンクラミド組成物中のグリベンクラミドの量の少なくとも約 1 0 0 倍を含む、方法。

【請求項 2 1】

請求項 1 0 に記載の方法であって、ここで、前記 pH の調節は、水酸化ナトリウム又は水酸化カリウムであるアルカリ塩基を溶液に添加することを含む、方法。

【請求項 2 2】

請求項 2 1 に記載の方法であって、ここで、実質的に薬学的に不活性な化合物の一つはマンニトールであり、アルカリ塩基は水酸化ナトリウムである、方法。

【請求項 2 3】

請求項 1 0 に記載の方法であって、ここで、前記凍結乾燥された固体のグリベンクラミド組成物は薬学的使用に適した固体薬学的組成物である、方法。

【請求項 2 4】

請求項 1 0 に記載の方法であって、ここで、前記凍結乾燥された固体のグリベンクラミド組成物はグリベンクラミドの溶解度を高める薬剤を実質的に含まない、方法。