【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1月28日(2010.1.28)

【公表番号】特表2009-542649(P2009-542649A)
【公表日】平成21年12月3日(2009.12.3)
【年通号数】公開・登録公報2009-048
【出願番号】特願2009-518094(P2009-518094)
【国際特許分類】
*Ａ６１Ｋ　31/58　　(2006.01)*
*Ａ６１Ｋ　31/573　　(2006.01)*
*Ａ６１Ｋ　31/56　　(2006.01)*
*Ａ６１Ｋ　 9/12　　(2006.01)*
*Ａ６１Ｋ　 9/72　　(2006.01)*
*Ａ６１Ｋ　47/40　　(2006.01)*
*Ａ６１Ｋ　 9/08　　(2006.01)*
*Ａ６１Ｋ　47/10　　(2006.01)*
*Ａ６１Ｋ　47/34　　(2006.01)*
*Ａ６１Ｋ　31/137　　(2006.01)*
*Ａ６１Ｋ　31/167　　(2006.01)*
*Ａ６１Ｐ　11/00　　(2006.01)*
【ＦＩ】
Ａ６１Ｋ　31/58
Ａ６１Ｋ　31/573
Ａ６１Ｋ　31/56
Ａ６１Ｋ　 9/12
Ａ６１Ｋ　 9/72
Ａ６１Ｋ　47/40
Ａ６１Ｋ　 9/08
Ａ６１Ｋ　47/10
Ａ６１Ｋ　47/34
Ａ６１Ｋ　31/137
Ａ６１Ｋ　31/167
Ａ６１Ｐ　11/00

【手続補正書】
【提出日】平成21年12月4日(2009.12.4)
【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】
被験者の気道の疾患または障害を治療するための医薬の製造における、水性液体担体、スルホアルキルエーテルシクロデキストリン、および製剤中に溶解したコルチコステロイドの１回用量を含む水性液体製剤の使用であって、ここで製剤は被験者に吸入によって投与され、そして製剤が同様の条件下に投与された懸濁液ベースの製剤にまさる薬物動態学的プロファイルの強化をもたらす、上記使用。
【請求項２】

リザーバを装備したネブライザー；ならびに水性液体担体、溶解促進剤、および１回用量のコルチコステロイドを含む水性液体製剤を含むシステムであって、ここで製剤の噴霧中、ネブライザーが、同様の条件下にネブライザーで噴霧する懸濁液ベースの製剤の濃度増加率に比べて、リザーバの製剤中のコルチコステロイドの濃度増加率の減少パーセントをもたらすシステム。

【請求項３】

コルチコステロイドの用量が、１６０～１６００ｐｇ*ｈ／ｍｌの平均血漿中$AUC_t$を与えるのに十分な量で存在し、そしてここでＳＡＥ－ＣＤ対コルチコステロイドのモル比が１０：１より大きい、請求項１に記載の使用。

【請求項４】

製剤が２５～４００μｇのコルチコステロイドを含み、そしてここで製剤がコルチコステロイドについて１５０～１６００ｐｇ*ｈ／ｍｌの血漿中$AUC_t$を与える、請求項１に記載の使用。

【請求項５】

製剤が少なくとも２５μｇのコルチコステロイドを含み、そしてここで製剤が少なくとも６（ｐｇ*ｈ／ｍｌ）／μｇのコルチコステロイドの、コルチコステロイドの用量で正規化した血漿中$AUC_t$を与える、請求項１に記載の使用。

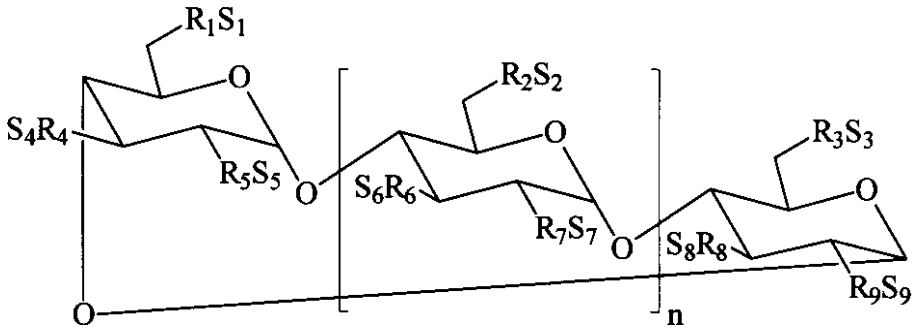
【請求項６】

製剤が少なくとも２５μｇのコルチコステロイドを含み、そしてここで製剤が少なくとも８（ｐｇ*ｈ／ｍｌ）／μｇのコルチコステロイドの、コルチコステロイドの用量で正規化した血漿中$AUC_i$を与える、請求項１に記載の使用。

【請求項７】

シクロデキストリンが、式１：

【化１】




式 1

［式中、

ｎは、４、５、または６であり、

$R_1$、$R_2$、$R_3$、$R_4$、$R_5$、$R_6$、$R_7$、$R_8$、および$R_9$は、それぞれ独立に－Ｏ－または－Ｏ－（$C_2$－$C_6$アルキレン）－$SO_3^-$基であり、ここで$R_1$～$R_9$の少なくとも１つは独立に－Ｏ－（$C_2$－$C_6$アルキレン）－$SO_3^-$基、－Ｏ－（$CH_2$）$_m$$SO_3^-$基であり、ここでｍは２～６、－$OCH_2CH_2CH_2SO_3^-$または－$OCH_2CH_2CH_2CH_2SO_3^-$であり、そして

$S_1$、$S_2$、$S_3$、$S_4$、$S_5$、$S_6$、$S_7$、$S_8$、および$S_9$は、それぞれ独立に薬剤として許容されるカチオンである］

の化合物である、請求項１、３～５、または６のいずれか１項に記載の使用。

【請求項８】

シクロデキストリンが、「ｘ」が１～１８の範囲である式IIの化合物（ＳＡＥｘ－α－ＣＤ）、「ｙ」が１～２１の範囲である式IIIの化合物（ＳＡＥｙ－β－ＣＤ）、または「ｚ」が１～２４の範囲である式IVの化合物（ＳＡＥｚ－γ－ＣＤ）であり、「ＳＡＥ」

がスルホアルキルエーテル置換基を表し、値「ｘ」、「ｙ」、および「ｚ」がＣＤ１分子当たりのスルホアルキルエーテル基の個数に関する平均置換度を表す、請求項１、３～６、または７のいずれか１項に記載の使用。
【請求項９】
製剤中のコルチコステロイドの用量が懸濁液剤中の用量よりも約２倍低い場合、コルチコステロイド製剤によって与えられたＣｍａｘが、懸濁液ベースの製剤によって与えられたＣｍａｘよりも少なくとも１．５倍高い、請求項１に記載の使用。
【請求項１０】
製剤が、用量非正規化に基づいて１６００～１８００の$C_{max}$（ｐｇ／ｍｌ）を与える、請求項１に記載の使用。
【請求項１１】
製剤及び懸濁液剤中のコルチコステロイドの用量がほぼ同じ場合、コルチコステロイドの正規化名目用量に基づき、コルチコステロイド製剤によって与えられた$C_{max}$が、懸濁液ベースの製剤によって与えられた$C_{max}$よりも少なくとも１．７倍高い、請求項１記載の使用。
【請求項１２】
製剤が、用量非正規化に基づいて２５０～２５００の$AUC_{inf}$（$pg^{*}h$／ｍｌ）を与える、請求項１に記載の使用。
【請求項１３】
製剤及び懸濁液剤中のコルチコステロイドの用量がほぼ同じ場合、コルチコステロイドの非正規化用量に基づき、コルチコステロイド製剤によって与えられた$AUC_{inf}$が、懸濁液ベースの製剤によって与えられた$AUC_{inf}$よりも１．５～３．５倍高い、請求項１に記載の使用。
【請求項１４】
製剤中のコルチコステロイドの用量が懸濁液剤中のその用量よりも約２倍低い場合、コルチコステロイド製剤によって与えられた$AUC_{inf}$が、懸濁液ベースの製剤によって与えられた$AUC_{inf}$よりも少なくとも１．５倍高い、請求項１に記載の使用。
【請求項１５】
製剤が、コルチコステロイドの用量非正規化に基づいて、２０００～３０００の$AUC_{0-8hr}$（$pg^{*}h$／ｍｌ）を与える、請求項１に記載の使用。
【請求項１６】
コルチコステロイドが、ブデソニドである請求項１、３～５または６のいずれか１項に記載の使用。
【請求項１７】
コルチコステロイドが、ジプロピオン酸ブクロメタゾン、モノプロピオン酸ベクロメタゾン、ブデソニド、シクレソニド、デスイソブチリル－シクレソニド、フルニソリド、プロピオン酸フルチカゾン、フランカルボン酸フルチカゾン、フランカルボン酸モメタゾン、イコメタゾンエンブテート、チキソコルトール２１－ピバレート、およびトリアムシノロンアセトニドからなる群から選択される、請求項１、３～５または６のいずれか１項に記載の使用。
【請求項１８】
製剤は、空気ジェット式ネブライザー、超音波ネブライザー、電子ネブライザー、振動膜ネブライザー、振動メッシュネブライザー、振動板ネブライザー、振動発生器および水性チャンバーを含むネブライザー、およびノズルアレイを含むネブライザーからなる群から選択されるネブライザーを用いて投与される、請求項１、３～５、または６のいずれか１項に記載の使用。
【請求項１９】
コルチコステロイド、ＳＡＥ－ＣＤ、および水性液体担体を高せん断混合することからなるコルチコステロイド製剤の調製方法であって、ここでＳＡＥ－ＣＤがコルチコステロイドを溶解するのに十分な量で存在する方法。

【請求項２０】
高せん断混合は、超音波発生装置、ナローゲージシリンジ、ミキサー／ホモジナイザー、回転子／固定子ミキサー、又は鋸歯ミキサーを用いて実施される、請求項１９に記載の方法。