

【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10月31日(2013.10.31)

【公表番号】特表2013-503907(P2013-503907A)

【公表日】平成25年2月4日(2013.2.4)

【年通号数】公開・登録公報2013-006

【出願番号】特願2012-528109(P2012-528109)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/5383 (2006.01)

A 6 1 K 9/12 (2006.01)

A 6 1 K 9/72 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/5383

A 6 1 K 9/12

A 6 1 K 9/72

A 6 1 K 47/02

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 31/04

【手続補正書】

【提出日】平成25年9月3日(2013.9.3)

【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】

ヒトにおける囊胞性線維症を治療するためのレボフロキサシン又はオフロキサシン及び二価又は三価陽イオンを含む溶液のエアロゾルあって、前記ヒトがP.エルギノーサを含む肺感染症を有し、前記ヒトの痰におけるP.エルギノーサ密度の少なくとも40%の低減を実現するために、前記エアロゾルがそれを必要とする前記ヒトに投与されることを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項2】

請求項1に記載の溶液のエアロゾルにおいて、前記ヒトの痰におけるP.エルギノーサ密度の痰1g当たり少なくとも0.25log₁₀CFUの低減が実現されることを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項3】

ヒトにおける囊胞性線維症を治療するためのレボフロキサシン又はオフロキサシン及び二価又は三価陽イオンを含む溶液のエアロゾルであって、少なくとも2%のFEV₁の増加及び少なくとも5%のFEF25-75の増加を実現するために、前記エアロゾルがそれを必要とする前記ヒトに投与されることを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項4】

請求項3に記載の溶液のエアロゾルにおいて、少なくとも0.05LのFEV₁の増加及び少なくとも0.05LのFEF25-75の増加が実現されることを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 5】

ヒトにおける囊胞性線維症を治療するためのレボフロキサシン又はオフロキサシン及び二価又は三価陽イオンを含む溶液のエアロゾルであって、1.0未満のハザード比を達成するために、前記エアロゾルがそれを必要とする前記ヒトに投与され、前記ハザード比が、他の抗シードモナス抗菌剤の必要性の減少を示すことを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 6】

ドルナーゼアルファ、アジスロマイシン、サルブタモール、パンクレリパーゼ、塩化ナトリウム、セレタイド、及びADEKのうちの1以上からなる群から選択される作用剤を吸入により投与されているヒトにおける、囊胞性線維症を治療するためのレボフロキサシン又はオフロキサシン及び二価又は三価陽イオンを含む溶液のエアロゾルであって、レボフロキサシン又はオフロキサシン及び二価又は三価陽イオンを含む溶液のエアロゾルが前記ヒトに投与されることを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 7】

請求項6に記載の溶液のエアロゾルにおいて、前記ヒトがP.エルギノーサを含む肺感染症を有することを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 8】

請求項7に記載の溶液のエアロゾルにおいて、前記ヒトの痰におけるP.エルギノーサ密度の痰1g当たり少なくとも0.25log₁₀CFUの低減が実現されることを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 9】

ヒトにおける囊胞性線維症を治療するためのレボフロキサシン又はオフロキサシン及び二価又は三価陽イオンを含む溶液のエアロゾルであって、前記ヒトがP.エルギノーサを含む肺感染症を有し、前記エアロゾルがそれを必要とする前記ヒトに繰り返して投与され、該繰り返しの投与によって、他のP.エルギノーサ菌株と比べて最小阻止濃度(MIC)が最も高い前記ヒトのP.エルギノーサ菌株において、MICの増加が16倍を超えないことを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 10】

ヒトにおける囊胞性線維症を治療するためのレボフロキサシン又はオフロキサシン及び二価又は三価陽イオンを含む溶液のエアロゾルであって、前記ヒトがP.エルギノーサを含む肺感染症を有し、1を超えるCFQ-R呼吸領域の増加を実現するために、前記エアロゾルがそれを必要とする前記ヒトに繰り返し投与されることを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 11】

ヒトにおける末梢気道抵抗性を減少させるためのレボフロキサシン又はオフロキサシン及び二価又は三価陽イオンを含む溶液のエアロゾルであって、少なくとも5%のFEF25-75の増加を実現するために、前記エアロゾルがそれを必要とする前記ヒトに投与されることを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 12】

請求項11に記載の溶液のエアロゾルにおいて、少なくとも0.05LのFEF25-75の増加が実現されることを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 13】

ヒトにレボフロキサシン又はオフロキサシンを投与するためのレボフロキサシン又はオフロキサシン及び二価又は三価陽イオンを含む溶液のエアロゾルであって、前記エアロゾルが前記ヒトに繰り返して投与され、該繰り返しの投与によって関節痛が発症しないことを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 14】

請求項13に記載の溶液のエアロゾルにおいて、前記投与が少なくとも14日間、1日1回繰り返され、好適には、前記投与が少なくとも14日間、1日2回繰り返されることを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 15】

ヒトにおける囊胞性線維症を治療するためのレボフロキサシン又はオフロキサシン及び二価又は三価陽イオンを含む溶液のエアロゾルであって、前記ヒトがP.エルギノーサを含む肺感染症を有し、前記ヒトの体表面積が1.5m²未満であり、1mg用量当たり少なくとも20(n g·h/L)の用量正規化血清AUCを実現するために、前記エアロゾルがそれを必要とする前記ヒトに投与されることを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 16】

請求項15に記載の溶液のエアロゾルにおいて、当該エアロゾルが少なくとも80mgのレボフロキサシン又はオフロキサシンを含み、該投与が少なくとも14日間、1日1回繰り返されることを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 17】

ヒトにおいて囊胞性線維症を治療するためのレボフロキサシン又はオフロキサシン及び二価又は三価陽イオンを含む溶液のエアロゾルであって、前記ヒトがP.エルギノーサを含む肺感染症を有し、前記ヒトの体表面積が1.5m²未満であり、1mg投与用量当たり2μg/Lを超える用量正規化血清C_{max}を達成するために、前記エアロゾルがそれを必要とする前記ヒトに投与されることを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 18】

請求項1、3、5、6、9、10、11、13、15、及び17のいずれか1項に記載の溶液のエアロゾルにおいて、前記溶液がレボフロキサシン又はオフロキサシン及び二価又は三価陽イオンから本質的になることを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 19】

請求項1、3、5、6、9、10、11、13、15、及び17のいずれか1項に記載の溶液のエアロゾルにおいて、前記溶液がラクトースを含まないことを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 20】

請求項1、3、5、6、9、10、11、13、15、及び17のいずれか1項に記載の溶液のエアロゾルにおいて、前記溶液の二価又は三価陽イオン濃度が約50mMないし約400mMであり、レボフロキサシン又はオフロキサシン濃度が約50mg/mlないし約200mg/mlであることを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 21】

請求項1、3、5、6、9、10、11、13、15、及び17のいずれか1項に記載の溶液のエアロゾルにおいて、前記溶液のオスモル濃度が約300mosmol/kgないし約500mosmol/kgであり、pHが約5ないし約8であることを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 22】

請求項1、3、5、6、9、10、11、13、15、及び17のいずれか1項に記載の溶液のエアロゾルにおいて、前記溶液が塩化マグネシウムを含むことを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 23】

請求項1、3、5、6、9、10、11、13、15、及び17のいずれか1項に記載の溶液のエアロゾルにおいて、前記溶液のレボフロキサシン又はオフロキサシン濃度が約90mg/mlないし約110mg/mlであり、塩化マグネシウム濃度が約175mMないし約225mMであり、pHが約5ないし約7であり、オスモル濃度が約300mosmol/kgないし約500mosmol/kgであり、ラクトースがないことを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 24】

請求項1、3、5、6、9、10、11、13、15、及び17のいずれか1項に記載の溶液のエアロゾルにおいて、当該エアロゾルの空気動力学的質量中央粒子径が約2.5ミクロン以下の幾何学的標準偏差で、約2ミクロンないし約5ミクロンであることを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 25】

請求項 1、3、5、6、9、10、11、13、15、及び 17 のいずれか 1 項に記載の溶液のエアロゾルにおいて、当該エアロゾルが振動メッシュ式噴霧器で生成されることを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 26】

請求項 1、3、5、6、9、10、11、13、15、及び 17 のいずれか 1 項に記載の溶液のエアロゾルにおいて、少なくとも約 20 mg のレボフロキサシン又はオフロキサシンが前記肺に投与されることを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 27】

請求項 1、3、5、6、9、10、11、13、15、及び 17 のいずれか 1 項に記載の溶液のエアロゾルにおいて、抗生素質、気管支拡張薬、抗コリン作用薬、グルココルチコイド、エイコサノイド阻害剤、及びそれらの組み合わせからなる群から選択される更なる活性剤が更に同時投与されることを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 28】

請求項 1、3、5、6、9、10、11、13、15、及び 17 のいずれか 1 項に記載の溶液のエアロゾルにおいて、当該エアロゾルが 1 日 1 回投与されることを特徴とする溶液のエアロゾル。

【請求項 29】

請求項 1、3、5、6、9、10、11、13、15、及び 17 のいずれか 1 項に記載の溶液のエアロゾルにおいて、前記肺感染症がシュードモナス・フルオレッセンス、シュードモナス・アシドボランス、シュードモナス・アルカリゲネス、及びシュードモナス・プチダ、ステノトロホモナス・マルトフィリア、エロモナス・ヒドロフィラ、大腸菌、シトロバクター・フロインディ、サルモネラ・チフィリウム、サルモネラ・チフィ、サルモネラ・パラチフィ、サルモネラ・エンテリティディス、志賀赤痢菌、シゲラ・フレックスネリ、シゲラ・ソネイ、エンテロバクター・クロアカ、エンテロバクター・エロゲネス、クレブシエラ・ニューモニエ、クレブシエラ・オキシトカ、セラチア・マルセセンス、モルガネラ・モルガニー、プロテウス・ミラビリス、プロテウス・ブルガリス、プロビデンシア・アルカリファシエンス、プロビデンシア・レットゲリ、プロビデンシア・スチュアルティ、アシネットバクター・カルコアセティカス、アシネットバクター・ヘモリチカス、エルシニア・エンテロコリチカ、エルシニア・ペスチス、エルシニア・シュードツベルクロシス、エルシニア・インターメディア、ボルデテラ・パータシス、ボルデテラ・パラパータシス、ボルデテラ・ブロンキセプチカ、ヘモフィルス・インフルエンザ、ヘモフィルス・パラインフルエンザ、ヘモフィルス・ヘモリチカス、ヘモフィルス・パラヘモリチカス、ヘモフィルス・デュクレイ、パスツレラ・マルトシダ、パスツレラ・ヘモリチカ、ヘリコバクター・ピロリ、カンピロバクター・フィタス、カンピロバクター・ジェジュニ、カンピロバクター・コリ、ボレリア・ブルグドルフェリ、ビブリオ・コレラ、ビブリオ・パラヘモリチカス、レジオネラ・ニューモフィラ、リストリア・モノサイトゲネス、ナイセリア・ゴノレア、ナイセリア・メニンギティディス、バクホルデリア・セパシア、フランシセラ・ツラレンシス、キングラ、及びモラクセラからなる群から選択される 1 以上の細菌を更に含むことを特徴とする溶液のエアロゾル。