

【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】令和 2 年 6 月 25 日 (2020.6.25)

【公表番号】特表 2019-521178 (P2019-521178A)

【公表日】令和 1 年 7 月 25 日 (2019.7.25)

【年通号数】公開・登録公報 2019-030

【出願番号】特願 2019-515760 (P2019-515760)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/43 (2006.01)

A 6 1 K 31/352 (2006.01)

A 6 1 K 31/424 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/44 (2017.01)

A 6 1 K 9/16 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 13/10 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/08 (2006.01)

A 6 1 P 27/16 (2006.01)

A 6 1 P 1/02 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/43

A 6 1 K 31/352

A 6 1 K 31/424

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 47/44

A 6 1 K 9/16

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 13/10

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 19/08

A 6 1 P 27/16

A 6 1 P 1/02

A 6 1 P 15/00

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 5 月 15 日 (2020.5.15)

【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】

シネオールとアモキシシリンと薬学的に許容される油とを含む、又は実質的にそれらからなる粉末形態の医薬製剤。

【請求項 2】

前記製剤は、  
- ラクタマーゼ阻害剤、好ましくはクラブラン酸も含む、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 3】

前記薬学的に許容される油は植物油である、請求項 1 又は 2 に記載の製剤。

【請求項 4】

前記製剤は、粉末のグラムあたり約 5 mg ~ 約 100 mg のシネオールを含む、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の製剤。

【請求項 5】

前記製剤は、粉末のグラムあたり約 20 mg ~ 約 500 mg のアモキシシリンを含む、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の製剤。

【請求項 6】

前記製剤は、粉末のグラムあたり約 2 mg ~ 約 50 mg の油を含む、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の製剤。

【請求項 7】

前記製剤は、粉末のグラムあたり約 1 mg ~ 約 100 mg のクラブラン酸を含む、請求項 2 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の製剤。

【請求項 8】

アモキシシリン / シネオールの質量比は 2 ~ 8、好ましくは 3 ~ 7、より好ましくは 4 ~ 6 である、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の製剤。

【請求項 9】

アモキシシリン / 油の質量比は 5 ~ 15、好ましくは 7 ~ 13、より好ましくは 8 ~ 12 である、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の製剤。

【請求項 10】

シネオール / 油の質量比は 0.1 ~ 5、好ましくは 0.5 ~ 4、より好ましくは 1 ~ 3 である、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の製剤。

【請求項 11】

アモキシシリン /  
- ラクタマーゼ阻害剤の質量比は 5 ~ 11、好ましくは 6 ~ 10、より好ましくは 7 ~ 9 である、請求項 2 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の製剤。

【請求項 12】

前記製剤は、好ましくは水性溶媒に懸濁後、経口で投与するために用いられる、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の製剤。

【請求項 13】

前記製剤は、単一用量容器、好ましくは約 1 g ~ 約 150 g の粉末、より好ましくは約 1 g ~ 約 50 g の粉末、さらにより好ましくは約 1 g ~ 約 10 g の粉末を含む単一用量容器に包装される、請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の製剤。

【請求項 14】

前記製剤は、好ましくは甘味料、香料、固化防止剤、潤滑剤、崩壊剤、及びそれらの混合物からなる群より選択される、少なくとも 1 つの薬学的に許容される賦形剤又は担体も含む、請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の製剤。

【請求項 15】

個体の感染症状の処置に使用される、請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の製剤。

【請求項 16】

前記症状は細菌由来の感染症状である、請求項 15 に記載の使用のための製剤。

【請求項 17】

前記症状は、  
- ラクタム系ファミリーの抗生物質に耐性のある細菌に起因する感染症状である、請求項 15 又は 16 に記載の使用のための製剤。

【請求項 18】

前記製剤は、1日～4週の期間にわたって、1回以上の投与量摂取で1日あたり3グラム～30グラムの量で前記個体に投与するために用いられる、請求項15～17のいずれか1項に記載の使用のための製剤。

【請求項19】

請求項1～14のいずれか1項に記載の医薬製剤の製造プロセスであって、

- シネオールと薬学的に許容される油とを混合することによって湿潤化溶液を作製することと、
- 前記湿潤化溶液でアモキシシリンを含む粉末を湿潤化させて、アモキシシリンとシネオールと前記油とを含む粉末調製物を得ることとを含み、
- 任意的に、前記プロセスは、アモキシシリンとシネオールと前記油とを含む前記粉末調製物を、
  - ラクターゼ阻害剤、好ましくはクラブラン酸を含む粉末と混合すること、並びに/又は、
  - 任意的に、甘味料、香料、及び/若しくは潤滑剤を添加して、均質な粉末を得るようにそれらを混合すること、並びに/又は、
  - 任意的に、そのようにして得られた前記粉末をスクリーニングすること、並びに/又は、
  - 任意的に、スクリーニングした前記粉末を単一用量容器に包装することも含む、プロセス。

【請求項20】

前記アモキシシリンを含む粉末、及び/又は、前記

- ラクターゼ阻害剤、好ましくはクラブラン酸を含む粉末は、崩壊剤及び/又は固化防止剤をさらに含む、請求項19に記載の製造プロセス。

【請求項21】

線状又は環状に組織化されるとともに非共有結合によって互いに相互作用する2つを超えるアモキシシリン分子を含む分子複合体。

【請求項22】

前記複合体は、少なくとも3つのアモキシシリン分子、好ましくは3～6つのアモキシシリン分子から形成される、請求項21に記載の分子複合体。

【請求項23】

水性溶媒内のシネオールの存在下且つ界面活性剤の非存在下で溶液にアモキシシリンを存在させることで得られる、又は得ることができる、請求項21又は22に記載の分子複合体。

【請求項24】

個体の細菌感染症の処置に使用されるシネオールとアモキシシリンとを含む、又は実質的にそれらからなる治療用の組合せ。

【請求項25】

前記組合せは、

- ラクターゼ阻害剤、好ましくはクラブラン酸をさらに含む、請求項24に記載の使用のための組合せ。

【請求項26】

前記細菌感染症は、抗生物質、好ましくは

- ラクトム系ファミリーの抗生物質に耐性のある細菌に起因する、請求項24又は25に記載の使用のための組合せ。

【請求項27】

シネオールと、アモキシシリンと、任意的に

- ラクターゼ阻害剤とは、経口で投与するために用いられる、請求項24～26のいずれか1項に記載の使用のための組合せ。

【請求項28】

アモキシシリンと

- ラクターゼ阻害剤とは、好ましくはアモキシシリンと
  - ラクターゼ阻害剤とを含む医薬組成物を使用して、前記個体に共に投与するために用いられる、請求項24～27のいずれか1項に記載の使用のための組合せ。

【請求項29】

シネオールは、アモキシシリン、及び/又は任意的に

- ラクターゼ阻害剤に対して

、連続的に又は個別に、好ましくは連続的に投与するために用いられる、請求項 2 4 ~ 2 8 のいずれか 1 項に記載の使用のための組合せ。

【請求項 3 0】

個体の細菌感染症を処置するためのキットであって、

( a ) シネオールを含む、若しくは実質的にそれからなる医薬組成物、及びアモキシシリンを含む、若しくは実質的にそれからなる医薬組成物、

( b ) シネオールを含む、若しくは実質的にそれからなる医薬組成物、及びアモキシシリンと - ラクタマーゼ阻害剤、好ましくはクラブラン酸とを含む、若しくは実質的にそれらからなる医薬組成物、

( c ) アモキシシリンを含む、若しくは実質的にそれからなる医薬組成物、及びシネオールと - ラクタマーゼ阻害剤、好ましくはクラブラン酸とを含む、若しくは実質的にそれらからなる医薬組成物、

( d ) - ラクタマーゼ阻害剤、好ましくはクラブラン酸を含む、若しくは実質的にそれらからなる医薬組成物、及びシネオールとアモキシシリンとを含む、若しくは実質的にそれらからなる医薬組成物、又は

( e ) シネオールを含む、若しくは実質的にそれからなる医薬組成物、アモキシシリンを含む、若しくは実質的にそれからなる医薬組成物、及び - ラクタマーゼ阻害剤、好ましくはクラブラン酸を含む、又は実質的にそれからなる医薬組成物、並びに、

( f ) 任意的に、そうしたキットを使用するための指示を含む指導書を包含する、キット。

【請求項 3 1】

個体の細菌感染症、好ましくは抗生物質耐性細菌に起因する細菌感染症の処置に使用される、請求項 3 0 に記載のキット。

【請求項 3 2】

前記細菌感染症は、膀胱炎、特に再発性急性膀胱炎、細菌性副鼻腔炎、特に急性上顎洞炎、耳炎、特に急性中耳炎、気管支炎、特に慢性気管支炎及び / 又は急性気管支炎、気管支肺疾患、特に慢性気管支肺疾患及び / 又は急性気管支肺疾患、腎盂腎炎、上部生殖管感染症、歯周炎、重度口腔感染症、特に膿瘍、蜂窩織炎及び蜂巣炎、動物の咬傷、骨及び関節の感染症、特に骨髓炎からなる群から選択され、好ましくは、前記細菌感染症は膀胱炎である、請求項 1 6 ~ 1 8 のいずれか 1 項に記載の使用のための製剤、請求項 2 4 ~ 2 9 のいずれか 1 項に記載の使用のための組合せ、請求項 3 1 に記載の使用のためのキット。

【請求項 3 3】

前記細菌感染症は、 - ラクタム系ファミリーの抗生物質に耐性のある細菌に起因する膀胱炎である、請求項 1 6 ~ 1 8 のいずれか 1 項に記載の使用のための製剤、請求項 2 4 ~ 2 9 のいずれか 1 項に記載の使用のための組合せ、請求項 3 1 に記載の使用のためのキット。