

【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8月8日 (2013.8.8)

【公表番号】特表2012-533554(P2012-533554A)

【公表日】平成24年12月27日 (2012.12.27)

【年通号数】公開・登録公報2012-055

【出願番号】特願2012-520770(P2012-520770)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/335 (2006.01)

A 6 1 K 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/335

A 6 1 K 9/12

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 37/08

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/18

【手続補正書】

【提出日】平成25年6月18日 (2013.6.18)

【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】

オロパタジン経鼻噴霧剤として使用するための組み合わせ物であって、該組み合わせ物は、第 1 の量のオロパタジンおよび第 2 の量のオロパタジンを含み、

該第 1 の量のオロパタジンが小児の鼻孔に第 1 の期間中に投与され、

該第 2 の量のオロパタジンが該小児の該鼻孔に第 2 の期間中に投与され、

i) 該第 1 の量及び該第 2 の量が各々少なくとも約 0 . 9 m g であるが約 1 . 5 m g 以下であり、

i i) 該第 1 の期間及び該第 2 の期間が 2 分間未満であり、

i i i) 該第 1 の期間と該第 2 の期間が、少なくとも 4 時間であるが 2 4 時間未満である中間期間によって分けられ、

i v) 該小児が少なくとも 2 歳であるが 1 2 歳未満である

ことを特徴とする、組み合わせ物。

【請求項 2】

前記第 1 の量及び前記第 2 の量が経鼻噴霧瓶から前記鼻孔に投与される、請求項 1 に記載の組み合わせ物。

【請求項 3】

前記第 1 の量及び前記第 2 の量が、各鼻孔において 1 回の噴霧によって前記経鼻噴霧瓶から前記小児の前記鼻孔に各々送達される、請求項 2 に記載の組み合わせ物。

【請求項 4】

前記第 1 の量と前記第 2 の量がどちらも少なくとも約 1 . 1 m g である、請求項 1、2 又は 3 に記載の組み合わせ物。

【請求項 5】

前記第 1 の量と前記第 2 の量がどちらも約 1 . 3 m g 以下である、請求項 1、2、3 又は 4 に記載の組み合わせ物。

【請求項 6】

前記中間期間が少なくとも約 8 時間である、請求項 1 から 5 のいずれかに記載の組み合わせ物。

【請求項 7】

前記中間期間が約 1 6 時間以下である、請求項 1 から 6 のいずれかに記載の組み合わせ物。

【請求項 8】

前記第 1 の量及び前記第 2 の量のオロパタジンが組成物の一部として投与され、該組成物が、

a) 0 . 5 4 ~ 0 . 6 2 % ( w / v ) オロパタジン遊離塩基又は当量の薬学的に許容されるオロパタジンの塩、

b) 0 . 2 ~ 0 . 8 % ( w / v ) リン酸水素二ナトリウムと当量のリン酸塩であって、リン酸二水素ナトリウム、リン酸水素二ナトリウム、リン酸三ナトリウム、リン酸二水素カリウム、リン酸水素二カリウム及びリン酸三カリウムからなる群から選択されるリン酸塩、

c) 0 . 3 ~ 0 . 6 % ( w / v ) N a C l、

d) 該組成物の p H を 3 . 6 ~ 3 . 8 にするのに十分な量の p H 調節剤、

e) 0 . 0 0 5 ~ 0 . 0 1 5 % ( w / v ) 塩化ベンザルコニウム、

f) 0 . 0 0 5 ~ 0 . 0 1 5 % ( w / v ) エデト酸二ナトリウム、及び

g) 水

から本質的になる、請求項 1 から 7 のいずれかに記載の組み合わせ物。

【請求項 9】

前記第 1 の量及び前記第 2 の量のオロパタジンが組成物の一部として投与され、該組成物が、

a) 0 . 6 % ( w / v ) オロパタジン遊離塩基又は当量の薬学的に許容されるオロパタジンの塩、

b) 0 . 4 ~ 0 . 6 % ( w / v ) リン酸水素二ナトリウム、

c) 0 . 3 5 ~ 0 . 4 5 % ( w / v ) N a C l、

d) 該組成物の p H を 3 . 6 ~ 3 . 8 にするのに十分な量の p H 調節剤であって、N a O H 及び H C l からなる群から選択される p H 調節剤、

e) 0 . 0 1 % ( w / v ) 塩化ベンザルコニウム、

f) 0 . 0 1 % ( w / v ) エデト酸二ナトリウム、及び

g) 水

から本質的になる、請求項 1 から 8 のいずれかに記載の組み合わせ物。

【請求項 10】

オロパタジン経鼻噴霧剤を含む経鼻噴霧器、及び

該経鼻噴霧器に備えられた、該経鼻噴霧剤を小児に投与するための説明書であって、該説明書に従って該経鼻噴霧剤を投与すると、以下のレジメンに従ってオロパタジンが投与される、説明書

を含む、オロパタジン医薬製品：

i) 第 1 の量のオロパタジンの小児の鼻孔への第 1 の期間中の投与であって、該第 1 の期間は 2 分間未満であり、該小児は少なくとも 2 歳であるが 1 2 歳未満であり、該第 1 の量は少なくとも約 0 . 9 m g であるが約 1 . 5 m g 以下である、投与、及び

i i) 第 2 の量のオロパタジンの該小児の該鼻孔への第 2 の期間中の投与であって、該第 2 の期間は 2 分間未満であり、該第 1 の期間及び該第 2 の期間は、少なくとも 4 時間で

あるが 24 時間未満である中間期間によって分けられ、該第 2 の期間は 2 分間未満であり、該第 2 の量は少なくとも約 0.9 mg であるが約 1.5 mg 以下である、投与。

【請求項 11】

前記第 1 の量及び前記第 2 の量が、各鼻孔において 1 回の噴霧によって前記経鼻噴霧瓶から前記小児の前記鼻孔に各々送達される、請求項 10 に記載の製品。

【請求項 12】

前記第 1 の量と前記第 2 の量がどちらも少なくとも約 1.1 mg である、請求項 10 又は 11 に記載の製品。

【請求項 13】

前記第 1 の量と前記第 2 の量がどちらも約 1.3 mg 以下である、請求項 10、11 又は 12 に記載の製品。

【請求項 14】

前記中間期間が少なくとも約 8 時間である、請求項 10 から 13 のいずれかに記載の製品。

【請求項 15】

前記中間期間が約 16 時間以下である、請求項 10 から 14 のいずれかに記載の製品。

【請求項 16】

前記第 1 の量及び前記第 2 の量のオロパタジンが組成物の一部として投与され、該組成物が、

a) 0.54 ~ 0.62 % (w/v) オロパタジン遊離塩基又は当量の薬学的に許容されるオロパタジンの塩、

b) 0.2 ~ 0.8 % (w/v) リン酸水素二ナトリウムと当量のリン酸塩であって、リン酸二水素ナトリウム、リン酸水素二ナトリウム、リン酸三ナトリウム、リン酸二水素カリウム、リン酸水素二カリウム及びリン酸三カリウムからなる群から選択されるリン酸塩、

c) 0.3 ~ 0.6 % (w/v) NaCl、

d) 該組成物の pH を 3.6 ~ 3.8 にするのに十分な量の pH 調節剤、

e) 0.005 ~ 0.015 % (w/v) 塩化ベンザルコニウム、

f) 0.005 ~ 0.015 % (w/v) エデト酸二ナトリウム、及び

g) 水

から本質的になる、請求項 10 から 15 のいずれかに記載の製品。

【請求項 17】

前記第 1 の量及び前記第 2 の量のオロパタジンが組成物の一部として投与され、該組成物が、

a) 0.6 % (w/v) オロパタジン遊離塩基又は当量の薬学的に許容されるオロパタジンの塩、

b) 0.4 ~ 0.6 % (w/v) リン酸水素二ナトリウム、

c) 0.35 ~ 0.45 % (w/v) NaCl、

d) 該組成物の pH を 3.6 ~ 3.8 にするのに十分な量の pH 調節剤であって、NaOH 及び HCl からなる群から選択される pH 調節剤、

e) 0.01 % (w/v) 塩化ベンザルコニウム、

f) 0.01 % (w/v) エデト酸二ナトリウム、及び

g) 水

から本質的になる、請求項 10 から 16 のいずれかに記載の製品。

【請求項 18】

前記第 1 の量及び前記第 2 の量のオロパタジンが複数の日にわたって毎日各々繰り返し投与される、請求項 1 から 9 のいずれかに記載の組み合わせ物又は請求項 10 から 17 のいずれかに記載の製品。

【請求項 19】

前記小児が少なくとも 6 歳である、請求項 1 から 9 のいずれかに記載の組み合わせ物又

は請求項 10 から 18 のいずれかに記載の製品。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0018

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0018】

a) 0.54 ~ 0.62 % (w/v) オロパタジン遊離塩基又は当量の薬学的に許容されるオロパタジンの塩、

b) 0.2 ~ 0.8 % (w/v) リン酸水素二ナトリウムと当量のリン酸塩であって、リン酸二水素ナトリウム、リン酸水素二ナトリウム、リン酸三ナトリウム、リン酸二水素カリウム、リン酸水素二カリウム及びリン酸三カリウムからなる群から選択されるリン酸塩、

c) 0.3 ~ 0.6 % (w/v) NaCl、

d) 組成物の pH を 3.6 ~ 3.8 にするのに十分な量の pH 調節剤、

e) 0.005 ~ 0.015 % (w/v) 塩化ベンザルコニウム、

f) 0.005 ~ 0.015 % (w/v) エデト酸二ナトリウム、及び

g) 水。

例えば、本発明は以下の項目を提供する。

(項目 1)

オロパタジン経鼻噴霧剤を投与方法であって、

第 1 の量のオロパタジンを小児の鼻孔に第 1 の期間中に投与する工程、及び

第 2 の量のオロパタジンを該小児の該鼻孔に第 2 の期間中に投与する工程

を含み、

i) 該第 1 の量及び該第 2 の量が各々少なくとも約 0.9 mg であるが約 1.5 mg 以下であり、

ii) 該第 1 の期間及び該第 2 の期間が 2 分間未満であり、

iii) 該第 1 の期間と該第 2 の期間が、少なくとも 4 時間であるが 24 時間未満である中間期間によって分けられ、

iv) 該小児が少なくとも 2 歳であるが 12 歳未満である、

方法。

(項目 2)

前記第 1 の量及び前記第 2 の量が経鼻噴霧瓶から前記鼻孔に投与される、項目 1 に記載の方法。

(項目 3)

前記第 1 の量及び前記第 2 の量が、各鼻孔において 1 回の噴霧によって前記経鼻噴霧瓶から前記小児の前記鼻孔に各々送達される、項目 2 に記載の方法。

(項目 4)

前記第 1 の量と前記第 2 の量がどちらも少なくとも約 1.1 mg である、項目 1、2 又は 3 に記載の方法。

(項目 5)

前記第 1 の量と前記第 2 の量がどちらも約 1.3 mg 以下である、項目 1、2、3 又は 4 に記載の方法。

(項目 6)

前記中間期間が少なくとも約 8 時間である、項目 1 から 5 のいずれかに記載の方法。

(項目 7)

前記中間期間が約 16 時間以下である、項目 1 から 6 のいずれかに記載の方法。

(項目 8)

前記第 1 の量及び前記第 2 の量のオロパタジンが組成物の一部として投与され、該組成物が、

a) 0.54 ~ 0.62 % (w/v) オロパタジン遊離塩基又は当量の薬学的に許容されるオロパタジンの塩、

b) 0.2 ~ 0.8 % (w/v) リン酸水素二ナトリウムと当量のリン酸塩であって、リン酸二水素ナトリウム、リン酸水素二ナトリウム、リン酸三ナトリウム、リン酸二水素カリウム、リン酸水素二カリウム及びリン酸三カリウムからなる群から選択されるリン酸塩、

c) 0.3 ~ 0.6 % (w/v) NaCl、

d) 該組成物の pH を 3.6 ~ 3.8 にするのに十分な量の pH 調節剤、

e) 0.005 ~ 0.015 % (w/v) 塩化ベンザルコニウム、

f) 0.005 ~ 0.015 % (w/v) エデト酸二ナトリウム、及び

g) 水

から本質的になる、項目 1 から 7 のいずれかに記載の方法。

(項目 9)

前記第 1 の量及び前記第 2 の量のオロパタジンが組成物の一部として投与され、該組成物が、

a) 0.6 % (w/v) オロパタジン遊離塩基又は当量の薬学的に許容されるオロパタジンの塩、

b) 0.4 ~ 0.6 % (w/v) リン酸水素二ナトリウム、

c) 0.35 ~ 0.45 % (w/v) NaCl、

d) 該組成物の pH を 3.6 ~ 3.8 にするのに十分な量の pH 調節剤であって、NaOH 及び HCl からなる群から選択される pH 調節剤、

e) 0.01 % (w/v) 塩化ベンザルコニウム、

f) 0.01 % (w/v) エデト酸二ナトリウム、及び

g) 水

から本質的になる、項目 1 から 8 のいずれかに記載の方法。

(項目 10)

オロパタジン経鼻噴霧剤を含む経鼻噴霧器、及び

該経鼻噴霧器に備えられた、該経鼻噴霧剤を小児に投与するための説明書であって、該説明書に従って該経鼻噴霧剤を投与すると、以下のレジメンに従ってオロパタジンが投与される、説明書

を含む、オロパタジン医薬製品：

i) 第 1 の量のオロパタジンの小児の鼻孔への第 1 の期間中の投与であって、該第 1 の期間は 2 分間未満であり、該小児は少なくとも 2 歳であるが 12 歳未満であり、該第 1 の量は少なくとも約 0.9 mg であるが約 1.5 mg 以下である、投与、及び

ii) 第 2 の量のオロパタジンの該小児の該鼻孔への第 2 の期間中の投与であって、該第 2 の期間は 2 分間未満であり、該第 1 の期間及び該第 2 の期間は、少なくとも 4 時間であるが 24 時間未満である中間期間によって分けられ、該第 2 の期間は 2 分間未満であり、該第 2 の量は少なくとも約 0.9 mg であるが約 1.5 mg 以下である、投与。

(項目 11)

前記第 1 の量及び前記第 2 の量が、各鼻孔において 1 回の噴霧によって前記経鼻噴霧瓶から前記小児の前記鼻孔に各々送達される、項目 10 に記載の製品。

(項目 12)

前記第 1 の量と前記第 2 の量がどちらも少なくとも約 1.1 mg である、項目 10 又は 11 に記載の製品。

(項目 13)

前記第 1 の量と前記第 2 の量がどちらも約 1.3 mg 以下である、項目 10、11 又は 12 に記載の製品。

(項目 14)

前記中間期間が少なくとも約 8 時間である、項目 10 から 13 のいずれかに記載の製品

( 項目 1 5 )

前記中間期間が約 1 6 時間以下である、項目 1 0 から 1 4 のいずれかに記載の製品。

( 項目 1 6 )

前記第 1 の量及び前記第 2 の量のオロパタジンが組成物の一部として投与され、該組成物が、

a ) 0 . 5 4 ~ 0 . 6 2 % ( w / v ) オロパタジン遊離塩基又は当量の薬学的に許容されるオロパタジンの塩、

b ) 0 . 2 ~ 0 . 8 % ( w / v ) リン酸水素二ナトリウムと当量のリン酸塩であって、リン酸二水素ナトリウム、リン酸水素二ナトリウム、リン酸三ナトリウム、リン酸二水素カリウム、リン酸水素二カリウム及びリン酸三カリウムからなる群から選択されるリン酸塩、

c ) 0 . 3 ~ 0 . 6 % ( w / v ) N a C l 、

d ) 該組成物の p H を 3 . 6 ~ 3 . 8 にするのに十分な量の p H 調節剤、

e ) 0 . 0 0 5 ~ 0 . 0 1 5 % ( w / v ) 塩化ベンザルコニウム、

f ) 0 . 0 0 5 ~ 0 . 0 1 5 % ( w / v ) エデト酸二ナトリウム、及び

g ) 水

から本質的になる、項目 1 0 から 1 5 のいずれかに記載の製品。

( 項目 1 7 )

前記第 1 の量及び前記第 2 の量のオロパタジンが組成物の一部として投与され、該組成物が、

a ) 0 . 6 % ( w / v ) オロパタジン遊離塩基又は当量の薬学的に許容されるオロパタジンの塩、

b ) 0 . 4 ~ 0 . 6 % ( w / v ) リン酸水素二ナトリウム、

c ) 0 . 3 5 ~ 0 . 4 5 % ( w / v ) N a C l 、

d ) 該組成物の p H を 3 . 6 ~ 3 . 8 にするのに十分な量の p H 調節剤であって、N a O H 及び H C l からなる群から選択される p H 調節剤、

e ) 0 . 0 1 % ( w / v ) 塩化ベンザルコニウム、

f ) 0 . 0 1 % ( w / v ) エデト酸二ナトリウム、及び

g ) 水

から本質的になる、項目 1 0 から 1 6 のいずれかに記載の製品。

( 項目 1 8 )

前記第 1 の量及び前記第 2 の量のオロパタジンが複数の日にわたって毎日各々繰り返し投与される、前述の項目のいずれかに記載の方法又は製品。

( 項目 1 9 )

前記小児が少なくとも 6 歳である、前述の項目のいずれかに記載の方法又は製品。