

【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23年10月13日(2011.10.13)

【公表番号】特表2010-538066(P2010-538066A)

【公表日】平成22年12月9日(2010.12.9)

【年通号数】公開・登録公報2010-049

【出願番号】特願2010-524023(P2010-524023)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/7052 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/203 (2006.01)

A 6 1 K 31/192 (2006.01)

A 6 1 K 31/4436 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/7052

A 6 1 P 17/00

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 17/10

A 6 1 K 31/203

A 6 1 K 31/192

A 6 1 K 31/4436

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/48

A 6 1 P 31/04

【手続補正書】

【提出日】平成23年8月25日(2011.8.25)

【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】

アジスロマイシンを含む経口投与用の医薬製剤であつて、

前記製剤は、成人個体へ2週間以上の間毎日投与した場合、投与3時間後にアジスロマイシンの血漿レベルを3回若しくはそれ以上測定して、少なくとも10日間にわたって平均した(「1日平均量 C_{max} (average daily C_{max})」)場合に150ng/ml以下となるアジスロマイシンの1日の最大血漿濃度(C_{max})を提供するアジスロマイシン量を提供するものであり、

前記医薬製剤は皮膚疾患治療に有効なアジスロマイシン以外のいかなる薬剤も含まないものである。医薬製剤。

【請求項2】

請求項1記載の医薬製剤において、この医薬製剤は固形経口剤型である。

【請求項 3】

請求項2記載の医薬製剤において、この医薬製剤は錠剤またはカプセルの形態である。

【請求項 4】

アジスロマイシンを含む経口投与用の医薬製剤であって、

成人個体へ投与した場合に前記製剤は125mg以下の量のアジスロマイシンを提供するものであり、

前記医薬製剤は皮膚疾患治療に有効なアジスロマイシン以外のいかなる薬剤も含まないものである、医薬製剤。

【請求項 5】

請求項4記載の医薬製剤において、この医薬製剤は100mgまたはそれ以下の量のアジスロマイシンを提供するものである。

【請求項 6】

請求項4記載の医薬製剤において、この医薬製剤は80mgまたはそれ以下の量のアジスロマイシンを提供するものである。

【請求項 7】

請求項4記載の医薬製剤において、この医薬製剤は40mgまたはそれ以下の量のアジスロマイシンを提供するものである。

【請求項 8】

請求項4記載の医薬製剤において、この医薬製剤は固形経口製剤である。

【請求項 9】

請求項8記載の医薬製剤において、この医薬製剤は錠剤またはカプセルの形態である。

【請求項 10】

125mg以下の量のアジスロマイシンを含む経口投与用の医薬製剤であって、この医薬製剤は皮膚疾患治療に有効なアジスロマイシン以外のいかなる薬剤も含まないものである、医薬製剤。

【請求項 11】

請求項10記載の医薬製剤において、アジスロマイシンの量は100mgまたはそれ以下である。

【請求項 12】

請求項10記載の医薬製剤において、アジスロマイシンの量は80mgまたはそれ以下である。

【請求項 13】

請求項10記載の医薬製剤において、アジスロマイシンの量は40mgまたはそれ以下である。

【請求項 14】

請求項10記載の医薬製剤において、この医薬製剤は固形経口製剤である。

【請求項 15】

請求項14記載の医薬製剤において、この医薬製剤は錠剤またはカプセルの形態である。

【請求項 16】

アジスロマイシンによる治療に反応する皮膚疾患の治療用キットであって、

容器と、

容器中の非常に多くのアジスロマイシンの固形単位剤型であって、前記剤型は皮膚疾患治療において有効なアジスロマイシン以外のいかなる薬剤も含まないものである、前記アジスロマイシンの固形単位製剤と、

毎日または1日おきの投与計画での1若しくはそれ以上の固形単位製剤の投与の説明書と

を有し、

毎日の投与計画によって投与するアジスロマイシン量は125mg/日またはそれ以下であり、

1日おきの投与計画によって投与するアジスロマイシン量は200mg/日での投与またはそれ以下である。

治療用キット。

【請求項17】

請求項16記載のキットにおいて、前記固形単位製剤はカプセルまたは錠剤である。

【請求項18】

請求項17記載のキットにおいて、前記容器は単位用量パッケージを含むものである。

【請求項19】

請求項18記載のキットにおいて、前記容器はブリストー包装である。

【請求項20】

請求項16～19記載のいずれかのキットにおいて、前記皮膚疾患は座瘡である。

【請求項21】

皮膚疾患を治療するための固形剤型薬剤を製造するための、100mgまたはそれ以下の量のアジスロマイシンの使用。

【請求項22】

請求項21記載の使用において、前記量は80mgまたはそれ以下である。

【請求項23】

請求項21記載の使用において、前記量は40mgまたはそれ以下である。

【請求項24】

請求項21～23記載のいずれかの使用において、前記固形剤型薬剤はカプセルまたは錠剤である。

【請求項25】

請求項24記載の使用において、前記皮膚疾患は座瘡である。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0012

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0012】

皮膚疾患治療のためのアジスロマイシンの投与量の最近の傾向は、パルス投与計画においてより高い用量が提供されるようになってきている。2006年12月に開始して現在も進行中のファイザーの臨床試験No.NCT00392223は、8週間にわたって週1回に2グラムのアジスロマイシンを投与するパルス投与計画でのアジスロマイシンによる座瘡治療の効能を試験している。

テトラサイクリンは、30Sリボソーム・ユニットへの結合によるタンパク質合成阻害によって抗菌作用を提供する広域抗生物質である。Ashleyの米国特許第7,211,267号明細書は、テトラサイクリン、ミノサイクリン、オキシテトラサイクリン、およびデオキシサイクリン等のテトラサイクリン化合物投与による座瘡治療方法を開示している。Ashleyは、化合物が細菌に対して有効である量以下で投与した場合ですら、周知の抗生物質であるテトラサイクリン化合物が座瘡治療において有効であることを開示している。Ashleyは、低量のテトラサイクリンによる治療では、望ましくない副作用をテトラサイクリンの従来の用量で起こるよりも少なくできると提案している。

アジスロマイシンは抗生物質のマクロライド・ファミリーの一員である。テトラサイクリンとは対照的に、アジスロマイシンおよび、エリスロマイシン等の他のマクロライドは、50Sリボソーム・ユニットへの可逆的結合によるRNA依存的タンパク質合成阻害によってその効果を示す。P.acnes等の座瘡に関連する細菌に対する最小限の阻害的血漿中濃度を提供する用量以下の用量で、アジスロマイシンが座瘡または他の皮膚疾患の治療に有効であることは未だ示されていない。

【先行技術文献】

【特許文献】

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0013

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0013】

【特許文献1】米国特許第7,211,267号

【特許文献2】米国特許第5,543,417号

【特許文献3】米国特許出願第2006/0280789号

【特許文献4】米国特許出願第2005/0239723号

【特許文献5】米国特許出願第2007/0105788号

【特許文献6】米国特許第7,704,959号

【特許文献7】米国特許第6,365,623号

【非特許文献】

【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0014

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0014】

【非特許文献1】AMIN K, et al, "Common and alternate oral antibiotic therapies for acne vulgaris: a review," *Journal of Drugs in Dermatology*, 6(9):873-880 (2007)【非特許文献2】BASTA-JUZBASIC A, et al, "A dose-finding study of azithromycin in the treatment of acne vulgaris," *Acta Dermatovenerol Croat*, 15(3):141-147 (2007)【非特許文献3】BERINGER P, et al, "Absolute bioavailability and intracellular pharmacokinetics of azithromycin in . . .," *Antimicrobial Agents and chemotherapy*, 49(12):5013-5017 (2005)【非特許文献4】ELEWSKI BE, "A novel treatment for acne vulgaris and rosacea," *European Academy of Dermatology and Venereology*, 14:422-430 (2000)【非特許文献5】FERNANDEZ-OBREGON AF, "Azithromycin for the treatment of acne," *International Journal of Dermatology*, 39:45-50 (2000)【非特許文献6】GRUBER F, et al, "Azithromycin compared with minocycline in the treatment of acne comedonica and papulo-pustulosa," *Journal of Chemotherapy*, 10(6):469-473 (1998)【非特許文献7】KAPADIA N, et al, "Acne treated successfully with azithromycin," *International Journal of Dermatology*, 43:766-767 (2004)

【非特許文献8】 KUNYNETZ, R, "Systemic antibiotic therapy for acne: a review," *Skin Therapy Letter*, 7(5):3-8 (2002)

【非特許文献9】 KUS, S, et al, "Comparison of efficacy of azithromycin vs. doxycycline in the treatment of acne vulgaris," *Clinical and Experimental Dermatology*, 30:215-220 (2005)

【非特許文献10】 NEU, HC, "Clinical microbiology of azithromycin," *American Journal of Medicine*, 91(suppl 3A):12S-18S (1991)

【非特許文献11】 RIDDLE, C, et al, "A review of azithromycin for the treatment of acne vulgaris," *Cosmetic Dermatology*, 20(5):299-302 (2007)

【非特許文献12】 PFIZER, "ZITHROMAX," (Revised 2007)

【発明の概要】

【課題を解決するための手段】