

【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26年6月19日(2014.6.19)

【公表番号】特表2013-507430(P2013-507430A)

【公表日】平成25年3月4日(2013.3.4)

【年通号数】公開・登録公報2013-011

【出願番号】特願2012-533650(P2012-533650)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/56 (2006.01)

A 6 1 K 31/167 (2006.01)

A 6 1 K 31/352 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/72 (2006.01)

A 6 1 K 9/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/06 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/56

A 6 1 K 31/167

A 6 1 K 31/352

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 37/00

A 6 1 K 9/72

A 6 1 K 9/12

A 6 1 K 47/06

A 6 1 K 47/10

【誤訳訂正書】

【提出日】平成26年4月23日(2014.4.23)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

a) 微粒化フマル酸ホルモテロールもしくはその薬学的に許容し得る塩または誘導体と

b) 微粒化プロピオン酸フルチカゾンもしくはその薬学的に許容し得る塩また誘導体と

c) 準治療量のクロモリンナトリウムを含む水分捕捉賦形剤と、

d) H F A 噴射剤とを含み、

ここで(a)、(b)および(c)ならびにその各々の相対量は、これらが会合してH F A 噴射剤のものと実質的に同じ密度を有するフロキュールを形成するように選択されることを特徴とするM D I 投与用の医薬エアゾール懸濁液製剤。

【請求項2】

前記フロキユールの平均密度が、噴射剤の密度の $\pm 0.2 \text{ g / cm}^3$ 、好ましくは $\pm 0.1 \text{ g / cm}^3$ 、より好ましくは $\pm 0.05 \text{ g / cm}^3$ とほぼ同じである請求項 1 に記載の医薬エアゾール懸濁液製剤。

【請求項 3】

前記 H F A 噴射剤が H F A 2 2 7 である請求項 1 または 2 に記載の医薬エアゾール懸濁液製剤。

【請求項 4】

前記フマル酸ホルモテロールもしくはその薬学的に許容し得る塩または誘導体が、製剤の全重量に対し 0.003 ~ 0.04 重量%、好ましくは 0.004 ~ 0.03 重量%、さらに好ましくは 0.005 ~ 0.02 重量% の量で存在する請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の医薬エアゾール懸濁液製剤。

【請求項 5】

前記プロピオン酸フルチカゾンもしくはその薬学的に許容し得る塩または誘導体が、製剤の全重量に対し 0.01 ~ 0.6 重量%、好ましくは 0.02 ~ 0.5 重量%、さらに好ましくは 0.03 ~ 0.4 重量% の量で存在する請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の医薬エアゾール懸濁液製剤。

【請求項 6】

前記クロモリンナトリウムが、製剤の全重量に対し 0.01 ~ 0.1 重量%、好ましくは 0.016 ~ 0.09 重量%、さらに好ましくは 0.02 ~ 0.08 重量%、さらに好ましくは 0.025 ~ 0.07 重量%、さらに好ましくは 0.03 ~ 0.05 重量%、さらに好ましくは 0.03 ~ 0.04 重量% の量で存在する請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の医薬エアゾール懸濁液製剤。

【請求項 7】

湿潤剤をさらに含む請求項 1 ~ 6 のいずれかに記載の医薬エアゾール懸濁液製剤。

【請求項 8】

前記湿潤剤が無水アルコールである請求項 7 に記載の医薬エアゾール懸濁液製剤。

【請求項 9】

前記湿潤剤がエタノールである請求項 8 に記載の医薬エアゾール懸濁液製剤。

【請求項 10】

前記アルコールが、製剤の全重量に対し 0.01 ~ 3 重量%、好ましくは 0.05 ~ 2.5 重量%、さらに好ましくは 1.0 ~ 2.0 重量% の量で存在する請求項 8 または 9 に記載の医薬エアゾール懸濁液製剤。

【請求項 11】

a) 0.01 ~ 0.6 重量% の微粒化プロピオン酸フルチカゾンもしくはその薬学的に許容し得る塩または誘導体と、

b) 0.003 ~ 0.04 重量% の微粒化フマル酸ホルモテロール二水和物もしくはその薬学的に許容し得る塩または誘導体と、

c) 0.01 ~ 0.1 重量% のクロモリンナトリウムとを含む薬学組成物。

【請求項 12】

湿潤剤をさらに含む請求項 11 に記載の薬学組成物。

【請求項 13】

前記湿潤剤が無水アルコール、好ましくはエタノールであり、また製剤の全重量に対し 0.01 ~ 3 重量%、好ましくは 0.05 ~ 2.5 重量%、さらに好ましくは 1.0 ~ 2.0 重量% の量で存在する請求項 11 または 12 に記載の薬学組成物。

【請求項 14】

a) 約 0.003 ~ 0.04 重量% のフマル酸ホルモテロール二水和物と、

b) 約 0.01 ~ 0.6 重量% のプロピオン酸フルチカゾンと、

c) 約 0.01 ~ 0.1 重量% のクロモリンナトリウムと、

d) 約 0.01 ~ 3 重量% の無水アルコールとを含む薬学懸濁液製剤。

【請求項 15】

炎症、特に喘息およびアレルギー性鼻炎の治療に同時、分離または連続的に使用する組

合せ調剤としてフマル酸ホルモテロール二水和物、プロピオン酸フルチカゾンおよびクロモリンナトリウムを含む製品。

【請求項 16】

H F A 噴射剤のものと実質的に同じ密度を有するフマル酸ホルモテロール二水和物、プロピオン酸フルチカゾンおよびクロモリンナトリウムのフロキュールを形成するためのフマル酸ホルモテロール二水和物と、プロピオン酸フルチカゾン微粒子とを含む H F A 噴射剤中の薬学懸濁液製剤の調製へのクロモリンナトリウムの使用。

【請求項 17】

H F A 噴射剤のものと実質的に同じ密度を有するフマル酸ホルモテロール二水和物、プロピオン酸フルチカゾンおよびクロモリンナトリウムのフロキュールを形成するための 0.003 ~ 0.004 % のフマル酸ホルモテロール二水和物と、0.01 ~ 0.6 % のプロピオン酸フルチカゾンとの微粒子とを含む H F A 噴射剤中の薬学懸濁液製剤の調製への 0.01 ~ 0.1 % のクロモリンナトリウムの使用。

【請求項 18】

前記フロキュールの平均密度が、噴射剤の密度の $\pm 0.2 \text{ g} / \text{cm}^3$ 、好ましくは $\pm 0.1 \text{ g} / \text{cm}^3$ 、より好ましくは $\pm 0.05 \text{ g} / \text{cm}^3$ とほぼ同じである請求項 16 または 17 に記載の使用。

【請求項 19】

前記薬学懸濁液製剤が、湿潤剤、好ましくは無水アルコール、より好ましくはエタノールをさらに含む請求項 16 ~ 18 のいずれかに記載の使用。

【請求項 20】

- a) 0.0071 w / w のフマル酸ホルモテロール二水和物と、
- b) 0.0357 w / w、0.0714 w / w、0.1784 w / w または 0.3570 w / w のプロピオン酸フルチカゾンと、
- c) 0.0343 w / w のクロモリンナトリウムと、
- d) 残余の H F A 227 噴射剤とを含む薬学組成物。

【請求項 21】

- a) 0.0142 w / w のフマル酸ホルモテロール二水和物と、
- b) 0.357 w / w のプロピオン酸フルチカゾンと、
- c) 0.0343 w / w または 0.0686 w / w のクロモリンナトリウムと、
- d) 残余の H F A 227 噴射剤とを含む薬学組成物。

【請求項 22】

1.43 w / w のエタノールをさらに含む請求項 20 または 21 に記載の薬学組成物。

【請求項 23】

H F A 噴射剤中の微粒子化フマル酸ホルモテロール二水和物および微粒子化プロピオン酸フルチカゾンの医薬エアゾール懸濁液製剤の安定性を長期間の保管わたり増大する方法において、準治療量のクロモリンナトリウムを添加することを備え、ここで微粒子化フマル酸ホルモテロール二水和物、微粒子化プロピオン酸フルチカゾンおよびクロモリンナトリウムの各々の相対量は、これらが会合して H F A 噴射剤のものと実質的に同じ密度を有するフロキュールを形成するように選択されることを特徴とする方法。

【請求項 24】

前記長期間の保管が 3、6、9、12 または 18 ヶ月である請求項 23 に記載の方法。

【請求項 25】

前記長期間保管後の懸濁液製剤の含水量が、500 p p m ~ 800 p p m、好ましくは 600 p p m ~ 700 p p m の範囲内である請求項 23 または 24 に記載の方法。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0063

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 6 3 】

本発明のさらなる一態様によれば、H F A 噴射剤のものと実質的に同じ密度を有するプロピオン酸フルチカゾン、フマル酸ホルモテロール二水和物およびクロモリンナトリウムのフロキュールを形成ための0.01~0.6%のプロピオン酸フルチカゾン微粒子と、0.003~0.04%のフマル酸ホルモテロール二水和物微粒子とを含むH F A 噴射剤中の薬学的懸濁液製剤の調製への0.01~0.1%のクロモリンナトリウムの使用を提供するものである。