

【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2月17日 (2011.2.17)

【公表番号】特表2010-513320(P2010-513320A)

【公表日】平成22年4月30日 (2010.4.30)

【年通号数】公開・登録公報2010-017

【出願番号】特願2009-541645(P2009-541645)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4418 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/4418

A 6 1 K 9/48

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 13/08

A 6 1 P 17/02

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 29/00 1 0 1

【手続補正書】

【提出日】平成22年12月17日 (2010.12.17)

【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】

ピルフェニドン治療を患者に提供するための医薬組成物であって、該医薬組成物はピルフェニドンを含み、該組成物は、

第 1 の期間に、第 1 の 1 日投与量のピルフェニドンを該患者に第 1 の量で、

第 2 の期間に、第 2 の 1 日投与量のピルフェニドンを該患者に第 2 の量で、

第 3 の期間に、第 3 の 1 日投与量のピルフェニドンを該患者に第 3 の量で

提供するように投与され、該第 1 および該第 2 の期間の合計はそれぞれ、少なくとも約 7 日になることを特徴とする、医薬組成物。

【請求項 2】

前記第 1 の量が約 4 0 0 m g / 日 ~ 約 1 , 2 0 0 m g / 日の範囲である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

前記第 1 の量が約 700 mg / 日 ~ 約 900 mg / 日の範囲である、請求項 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

前記第 1 の量が約 780 mg / 日 ~ 約 820 mg / 日の範囲である、請求項 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

前記第 1 の量が約 801 mg / 日である、請求項 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

前記第 2 の量が約 1,200 mg / 日 ~ 約 2,000 mg / 日の範囲である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

前記第 2 の量が約 1,500 mg / 日 ~ 約 1,700 mg / 日の範囲である、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

前記第 2 の量が約 1,580 mg / 日 ~ 約 1,620 mg / 日の範囲である、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

前記第 2 の量が約 1,602 mg / 日である、請求項 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

前記第 3 の量が約 2,000 mg / 日 ~ 約 3,000 mg / 日の範囲である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

前記第 3 の量が約 2,300 mg / 日 ~ 約 2,400 mg / 日の範囲である、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

前記第 3 の量が約 2,380 mg / 日 ~ 約 2,420 mg / 日の範囲である、請求項 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

前記第 3 の量が約 2,403 mg / 日である、請求項 12 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

前記第 3 の期間が少なくとも 1 日である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

前記第 3 の期間が 1 日を超える、請求項 14 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

ピルフェニドン治療を患者に提供するための医薬組成物であって、該医薬組成物はピルフェニドンを含み、該組成物は、

1 日目 ~ 7 日目の過程にわたって、第 1 の 1 日投与量のピルフェニドンを該患者に 801 mg / 日の量で、

8 日目 ~ 14 日目の過程にわたって、第 2 の 1 日投与量のピルフェニドンを該患者に 1602 mg / 日の量で、

15 日目に始めて 15 日目より後、毎日、第 3 の 1 日投与量のピルフェニドンを該患者に 2403 mg / 日の量で、

提供するように投与されることを特徴とする、医薬組成物。

【請求項 17】

前記組成物は、

ピルフェニドン 267 mg を含み、該組成物は 1 日目 ~ 7 日目の過程にわたって、1 日 3 回投与されることを特徴とし、

ピルフェニドン 534 mg を含み、該組成物は 8 日目 ~ 14 日目の過程にわたって、1 日 3 回投与されることを特徴とし、かつ

ビルフェニドン 801mgを含み、該組成物は15日目およびその後の毎日、1日3回投与されることを特徴とし、15日目より後、前記治療は継続される、請求項16に記載の医薬組成物。

【請求項18】

第1のセットのコンパートメントであって、それぞれ、第1の定期的な1日投与量または第1の定期的な1日投与量未満のビルフェニドンに応じて第1の投与量のビルフェニドンを有するコンパートメントと、
少なくとも1つの追加のセットのコンパートメントであって、それぞれ、該第1の投与量のビルフェニドンより多く、より多い定期的な1日投与量またはより多い定期的な1日投与量未満のビルフェニドンに依る投与量のビルフェニドンを有するコンパートメントを含む、スターターパック。

【請求項19】

前記スターターパックは、前記第1の定期的な1日投与量が摂取される各日のためおよび前記より多い定期的な1日投与量が摂取される各日のための行、ならびに摂取される前記第1の定期的な1日投与量未満のそれぞれのためおよび摂取される前記より多い定期的な1日投与量未満のそれぞれのための別々の列を含み、前記第1のセットのコンパートメントが該行および列内に配置され、かつ前記の少なくとも1つの追加のセットのコンパートメントが該行および列内に配置されている、請求項18に記載のスターターパック。

【請求項20】

前記第1のセットのコンパートメントおよび前記少なくとも1つの追加のセットのコンパートメントがそれぞれ、ビルフェニドンが摂取される各日のための3つの列を含む、請求項19に記載のスターターパック。

【請求項21】

1日目、2日目、3日目、4日目、5日目、6日目、7日目、8日目、9日目、10日目、11日目、12日目、13日目、および14日目のための別々の行を含む、請求項20に記載のスターターパック。

【請求項22】

前記第1のセットのコンパートメントが、1日目、2日目、3日目、4日目、5日目、6日目、および7日目のための前記第1の投与量のビルフェニドンを投与するためのものであり、該第1のセットのコンパートメント中の各コンパートメントがビルフェニドン267mgの丸剤1個を含む、請求項21に記載のスターターパック。

【請求項23】

前記少なくとも1つの追加のセットのコンパートメントが、前記第1の投与量より多い第2の投与量のビルフェニドンを投与するため、かつ8日目、9日目、10日目、11日目、12日目、13日目、および14日目のための第2のセットのコンパートメントを含み、前記第2のセットのコンパートメント中の各コンパートメントがビルフェニドン267mgの丸剤2個を含む、請求項22に記載のスターターパック。

【請求項24】

15日目、16日目、17日目、18日目、19日目、20日目、および21日目のための別々の行を含む、請求項23に記載のスターターパック。

【請求項25】

前記少なくとも1つの追加のセットのコンパートメントが、前記第2の投与量より多い第3の投与量のビルフェニドンを投与するため、かつ15日目、16日目、17日目、18日目、19日目、20日目、および21日目のための第3のセットのコンパートメントを含み、前記第3のセットのコンパートメント中の各コンパートメントが、ビルフェニドン267mgの丸剤3個を含む、請求項24に記載のスターターパック。

【請求項26】

前記第1のセットのコンパートメントを有する第1のパネル、および前記少なくとも1つの追加のセットのコンパートメントのそれぞれのための追加のパネルをさらに含み、前記第1のパネルおよび追加のパネルのそれぞれが、等しい数のコンパートメントを含む、

請求項 1 8 に記載のスターターパック。

【請求項 2 7】

前記コンパートメントがプリスターである、請求項 1 8 に記載のスターターパック。

【請求項 2 8】

少なくとも 2 枚のパネル、および 2 枚のパネルを分ける少なくとも 1 つの折り畳み部分を含み、第 1 のパネルが、第 1 の期間のための投与量を含み、第 2 のパネルが、第 2 の期間のための投与量を含む、請求項 1 8 に記載のスターターパック。

【請求項 2 9】

いくつかの容器を保持するためのケーシングをさらに含み、各容器が、前記第 1 のセットのコンパートメントの 1 つまたは前記少なくとも 1 つの追加のセットのコンパートメントの 1 つを有するパネルを含む、請求項 1 8 に記載のスターターパック。

【請求項 3 0】

最初の投与量、第 2 の投与量、および第 3 の投与量のビルフェニドンと、
1 日投与量のビルフェニドンに応じて前記最初、第 2、および第 3 の投与量を分ける複数のコンパートメントとを含み、
前記コンパートメントが列および行に形成され、前記コンパートメントは、前記スターターパックの使用者が、

1 日目～7 日目の過程にわたって、8 0 1 m g / 日の量の最初の 1 日投与量のビルフェニドンを摂取し、ここで、前記最初の投与量は、前記ビルフェニドン 2 6 7 m g を含むカプセル剤 1 個として 1 日 3 回摂取され、

8 日目～1 4 日目の過程にわたって、1 6 0 2 m g / 日の量の第 2 の 1 日投与量のビルフェニドンを摂取し、ここで、前記第 2 の投与量は、それぞれ前記ビルフェニドン 2 6 7 m g を含むカプセル剤 2 個として 1 日 3 回摂取され、かつ

1 5 日目で始まりおよび 1 5 日目より後、毎日、2 4 0 3 m g / 日の量の第 3 の 1 日投与量のビルフェニドンを摂取し、ここで、前記第 3 の投与量は、それぞれ前記ビルフェニドン 2 6 7 m g を含むカプセル剤 3 個として 1 日 3 回摂取されるように指示されるように
配置されるスターターパック。

【請求項 3 1】

ビルフェニドン治療を患者に与えるための医薬組成物であって、該医薬組成物はビルフェニドンを含み、該組成物は、
前もって決めた第 1 の 1 日投与量のビルフェニドンを前記患者に、そして
前もって決めた最終の 1 日投与量のビルフェニドンとなる増加した投与量を前記患者に
提供するように投与され、前記増加期間が前記最初の第 1 の投与量から測定して、約 7 ～
約 2 0 日であることを特徴とする医薬組成物。

【請求項 3 2】

前記増加期間が 1 3 日または 1 4 日である、請求項 3 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 3】

前記第 1 の投与量が約 8 0 1 m g / 日である、請求項 3 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 4】

前記最終の投与量が約 2 , 4 0 3 m g / 日である、請求項 3 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 5】

前記組成物が、それぞれの 1 日投与量を与えるように 1 日 3 回経口投与される、請求項 3 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 6】

それぞれ第 1 の期間に第 1 の 1 日投与量のビルフェニドンを患者に第 1 の量で提供する複数のコンパートメントを有する第 1 のパネルと、
それぞれ第 2 の期間に第 2 の 1 日投与量のビルフェニドンを患者に第 2 の量で提供する複数のコンパートメントを有する第 2 のパネルと、
第 3 の期間に第 3 の 1 日投与量のビルフェニドンを患者に第 3 の量で提供する複数のコンパートメントを有する第 3 のパネルとを含み、前記第 1 および第 2 の期間はそれぞれ、合

計すると少なくとも約 7 日になるスターターパック。

【請求項 37】

前記第 1 の 1 日投与量が約 700 mg / 日 ~ 約 900 mg / 日の範囲である、請求項 36 に記載のスターターパック。

【請求項 38】

前記第 2 の 1 日投与量が約 1,500 mg / 日 ~ 約 1,700 mg / 日の範囲である、請求項 36 に記載のスターターパック。

【請求項 39】

前記第 3 の 1 日投与量が約 2,300 mg / 日 ~ 約 2,400 mg / 日の範囲である、請求項 36 に記載のスターターパック。

【請求項 40】

前記第 1 の期間が約 3 日 ~ 約 10 日の範囲である、請求項 36 に記載のスターターパック。

【請求項 41】

前記第 2 の期間が約 3 日 ~ 約 10 日の範囲である、請求項 36 に記載のスターターパック。

【請求項 42】

前記第 3 の期間が 1 日を超える、請求項 36 に記載のスターターパック。

【請求項 43】

前記患者が特発性肺線維症 (IPF) を有する、請求項 1 ~ 17 または 31 ~ 35 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0015

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0015】

本明細書に開示する投与計画に従うピルフェニドンの投与を含む線維症状態の処置のための医薬品の調製におけるピルフェニドンの使用も意図される。

本発明の好ましい実施形態では、例えば以下が提供される：

(項目 1)

ピルフェニドン治療を患者に提供する方法であって、
第 1 の期間に、第 1 の 1 日投与量のピルフェニドンを該患者に第 1 の量で提供することと

第 2 の期間に、第 2 の 1 日投与量のピルフェニドンを該患者に第 2 の量で提供することと

第 3 の期間に、第 3 の 1 日投与量のピルフェニドンを該患者に第 3 の量で提供することと
を含み、該第 1 および該第 2 の期間を合計すると、少なくとも約 7 日になる、方法。

(項目 2)

前記第 1 の量が約 400 mg / 日 ~ 約 1,200 mg / 日の範囲である、項目 1 に記載の方法。

(項目 3)

前記第 1 の量が約 700 mg / 日 ~ 約 900 mg / 日の範囲である、項目 2 に記載の方法。

(項目 4)

前記第 1 の量が約 780 mg / 日 ~ 約 820 mg / 日の範囲である、項目 3 に記載の方法。

(項目 5)

前記第 1 の量が約 801 mg / 日である、項目 4 に記載の方法。

(項目 6)

前記第2の量が約1,200mg/日～約2,000mg/日の範囲である、項目1に記載の方法。

(項目7)

前記第2の量が約1,500mg/日～約1,700mg/日の範囲である、項目6に記載の方法。

(項目8)

前記第2の量が約1,580mg/日～約1,620mg/日の範囲である、項目7に記載の方法。

(項目9)

前記第2の量が約1,602mg/日である、項目8に記載の方法。

(項目10)

前記第3の量が約2,000mg/日～約3,000mg/日の範囲である、項目1に記載の方法。

(項目11)

前記第3の量が約2,300mg/日～約2,400mg/日の範囲である、項目10に記載の方法。

(項目12)

前記第3の量が約2,380mg/日～約2,420mg/日の範囲である、項目11に記載の方法。

(項目13)

前記第3の量が約2,403mg/日である、項目12に記載の方法。

(項目14)

前記第1の期間が約3日～約10日の範囲である、項目1に記載の方法。

(項目15)

前記第1の期間が約7日である、項目14に記載の方法。

(項目16)

前記第2の期間が約3日～約10日の範囲である、項目1に記載の方法。

(項目17)

前記第2の期間が約7日である、項目16に記載の方法。

(項目18)

前記第3の期間が少なくとも1日である、項目1に記載の方法。

(項目19)

前記第3の期間が1日を超える、項目18に記載の方法。

(項目20)

ビルフェニドン治療を患者に提供する方法であって、

1日目～7日目の過程にわたって、第1の1日投与量のビルフェニドンを該患者に801mg/日の量で提供することと、

8日目～14日目の過程にわたって、第2の1日投与量のビルフェニドンを該患者に1602mg/日の量で提供することと、

15日目の始めに、第3の1日投与量のビルフェニドンを該患者に2403mg/日の量で提供し、15日目より後、毎日該2403mg/日の投与量で継続することとを含む方法。

(項目21)

1日目～7日目の過程にわたって、ビルフェニドン267mgを含むカプセル剤1個を1日3回前記患者に投与し、

8日目～14日目の過程にわたって、ビルフェニドン267mgを含むカプセル剤2個を1日3回前記患者に投与し、かつ

15日目およびその後の毎日、ビルフェニドン267mgを含むカプセル剤3個を1日3回前記患者に投与し、15日目より後、前記治療は継続される、

項目20に記載の方法。

(項目 2 2)

第 1 のセットのコンパートメントであって、それぞれ、第 1 の定期的な 1 日投与量または第 1 の定期的な 1 日投与量未満のビルフェニドンに依りて第 1 の投与量のビルフェニドンを有するコンパートメントと、

少なくとも 1 つの追加のセットのコンパートメントであって、それぞれ、該第 1 の投与量のビルフェニドンより多く、より多い定期的な 1 日投与量またはより多い定期的な 1 日投与量未満のビルフェニドンに依りて投与量のビルフェニドンを有するコンパートメントを含む、スターターパック。

(項目 2 3)

前記スターターパックは、前記第 1 の定期的な 1 日投与量が摂取される各日のためおよび前記より多い定期的な 1 日投与量が摂取される各日のための行、ならびに摂取される前記第 1 の定期的な 1 日投与量未満のそれぞれのためおよび摂取される前記より多い定期的な 1 日投与量未満のそれぞれのための別々の列を含み、前記第 1 のセットのコンパートメントが該行および列内に配置され、かつ前記の少なくとも 1 つの追加のセットのコンパートメントが該行および列内に配置されている、項目 2 2 に記載のスターターパック。

(項目 2 4)

前記第 1 のセットのコンパートメントおよび前記少なくとも 1 つの追加のセットのコンパートメントがそれぞれ、ビルフェニドンが摂取される各日のための 3 つの列を含む、項目 2 3 に記載のスターターパック。

(項目 2 5)

1 日目、2 日目、3 日目、4 日目、5 日目、6 日目、7 日目、8 日目、9 日目、10 日目、11 日目、12 日目、13 日目、および 14 日目のための別々の行を含む、項目 2 4 に記載のスターターパック。

(項目 2 6)

前記第 1 のセットのコンパートメントが、1 日目、2 日目、3 日目、4 日目、5 日目、6 日目、および 7 日目のための前記第 1 の投与量のビルフェニドンを投与するためのものであり、該第 1 のセットのコンパートメント中の各コンパートメントがビルフェニドン 267 mg の丸剤 1 個を含む、項目 2 5 に記載のスターターパック。

(項目 2 7)

前記少なくとも 1 つの追加のセットのコンパートメントが、前記第 1 の投与量より多い第 2 の投与量のビルフェニドンを投与するため、かつ 8 日目、9 日目、10 日目、11 日目、12 日目、13 日目、および 14 日目のための第 2 のセットのコンパートメントを含み、前記第 2 のセットのコンパートメント中の各コンパートメントがビルフェニドン 267 mg の丸剤 2 個を含む、項目 2 5 に記載のスターターパック。

(項目 2 8)

15 日目、16 日目、17 日目、18 日目、19 日目、20 日目、および 21 日目のための別々の行を含む、項目 2 7 に記載のスターターパック。

(項目 2 9)

前記少なくとも 1 つの追加のセットのコンパートメントが、前記第 2 の投与量より多い第 3 の投与量のビルフェニドンを投与するため、かつ 15 日目、16 日目、17 日目、18 日目、19 日目、20 日目、および 21 日目のための第 3 のセットのコンパートメントを含み、前記第 3 のセットのコンパートメント中の各コンパートメントが、ビルフェニドン 267 mg の丸剤 3 個を含む、項目 2 8 に記載のスターターパック。

(項目 3 0)

前記第 1 のセットのコンパートメントを有する第 1 のパネル、および前記少なくとも 1 つの追加のセットのコンパートメントのそれぞれのための追加のパネルをさらに含み、前記第 1 のパネルおよび追加のパネルのそれぞれが、等しい数のコンパートメントを含む、項目 2 2 に記載のスターターパック。

(項目 3 1)

前記コンパートメントがブリスターである、項目 2 2 に記載のスターターパック。

(項目 3 2)

少なくとも 2 枚のパネル、および 2 枚のパネルを分ける少なくとも 1 つの折り畳み部分を含み、第 1 のパネルが、第 1 の期間のための投与量を含み、第 2 のパネルが、第 2 の期間のための投与量を含む、項目 2 2 に記載のスターターパック。

(項目 3 3)

いくつかの容器を保持するためのケーシングをさらに含み、各容器が、前記第 1 のセットのコンパートメントの 1 つまたは前記少なくとも 1 つの追加のセットのコンパートメントの 1 つを有するパネルを含む、項目 2 2 に記載のスターターパック。

(項目 3 4)

最初の投与量、第 2 の投与量、および第 3 の投与量のビルフェニドンと、1 日投与量のビルフェニドンに応じて前記最初、第 2、および第 3 の投与量を分ける複数のコンパートメントとを含み、前記コンパートメントが列および行に形成され、前記コンパートメントは、前記スターターパックの使用者が項目 2 1 によって開示された方法に従って前記ビルフェニドンを摂取するように指示されるように配置されるスターターパック。

(項目 3 5)

ビルフェニドン治療を患者に与える方法であって、前もって決めた第 1 の 1 日投与量のビルフェニドンを前記患者に投与することと、前記患者に投与する前記投与量を前もって決めた最終の 1 日投与量のビルフェニドンに増加させることとを含み、前記増加期間が前記最初の第 1 の投与量から測定して、約 7 ~ 約 2 0 日である方法。

(項目 3 6)

前記増加期間が 1 3 日または 1 4 日である、項目 3 5 に記載の方法。

(項目 3 7)

前記第 1 の投与量が約 8 0 1 m g / 日である、項目 3 6 に記載の方法。

(項目 3 8)

前記最終の投与量が約 2 , 4 0 3 m g / 日である、項目 3 7 に記載の方法。

(項目 3 9)

1 日投与量がそれぞれ、1 日 3 回の経口投与に分けられる、項目 3 8 に記載の方法。

(項目 4 0)

それぞれ第 1 の期間に第 1 の 1 日投与量のビルフェニドンを患者に第 1 の量で提供する複数のコンパートメントを有する第 1 のパネルと、それぞれ第 2 の期間に第 2 の 1 日投与量のビルフェニドンを患者に第 2 の量で提供する複数のコンパートメントを有する第 2 のパネルと、第 3 の期間に第 3 の 1 日投与量のビルフェニドンを患者に第 3 の量で提供する複数のコンパートメントを有する第 3 のパネルとを含み、前記第 1 および第 2 の期間はそれぞれ、合計すると少なくとも約 7 日になるスターターパック。

(項目 4 1)

前記第 1 の 1 日投与量が約 7 0 0 m g / 日 ~ 約 9 0 0 m g / 日の範囲である、項目 4 0 に記載のスターターパック。

(項目 4 2)

前記第 2 の 1 日投与量が約 1 , 5 0 0 m g / 日 ~ 約 1 , 7 0 0 m g / 日の範囲である、項目 4 0 に記載のスターターパック。

(項目 4 3)

前記第 3 の 1 日投与量が約 2 , 3 0 0 m g / 日 ~ 約 2 , 4 0 0 m g / 日の範囲である、項目 4 0 に記載のスターターパック。

(項目 4 4)

前記第 1 の期間が約 3 日 ~ 約 1 0 日の範囲である、項目 4 0 に記載のスターターパック

(項目 4 5)

前記第 2 の期間が約 3 日 ~ 約 1 0 日の範囲である、項目 4 0 に記載のスターターバック

°

(項目 4 6)

前記第 3 の期間が 1 日を超える、項目 4 0 に記載のスターターバック。