

【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31年2月14日 (2019.2.14)

【公表番号】特表2018-502856(P2018-502856A)

【公表日】平成30年2月1日 (2018.2.1)

【年通号数】公開・登録公報2018-004

【出願番号】特願2017-535877(P2017-535877)

【国際特許分類】

A 6 1 K 38/08 (2019.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 33/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

C 0 7 K 7/06 (2006.01)

C 0 7 K 7/52 (2006.01)

C 0 7 K 14/575 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 38/08

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 33/06

A 6 1 P 25/06

A 6 1 K 9/08

C 0 7 K 7/06 Z N A

C 0 7 K 7/52

C 0 7 K 14/575

【手続補正書】

【提出日】平成31年1月4日 (2019.1.4)

【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】

有効用量のオキシトシンペプチドおよびマグネシウム塩を含む、疼痛を処置するための組み合わせ物であって、ここで、該オキシトシンペプチドと該マグネシウム塩との同時投与は、相乗的な痛覚消失をもたらす、組み合わせ物。

【請求項 2】

前記オキシトシンペプチドが、前記マグネシウム塩と同時に投与されることを特徴とする、請求項 1 に記載の組み合わせ物。

【請求項 3】

前記オキシトシンペプチドが、前記マグネシウム塩の投与の前または後に投与されることを特徴とする、請求項 1 に記載の組み合わせ物。

【請求項 4】

前記オキシトシンペプチドが、頭蓋顔面粘膜投与を介して投与されることを特徴とする、請求項 1 ～ 3 のいずれか 1 項に記載の組み合わせ物。

【請求項 5】

前記オキシトシンペプチドが、鼻腔内投与を介して投与されることを特徴とする、請求項 4 に記載の組み合わせ物。

【請求項 6】

前記オキシトシンペプチドおよび前記マグネシウム塩が、鼻腔内投与を介して投与されることを特徴とする、請求項 5 に記載の組み合わせ物。

【請求項 7】

前記マグネシウム塩が、塩化マグネシウムを含む、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の組み合わせ物。

【請求項 8】

前記マグネシウム塩が、クエン酸マグネシウムを含む、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の組み合わせ物。

【請求項 9】

前記オキシトシンペプチドの有効用量が、約 $0.5 \mu\text{g}$ ~ 約 $2000 \mu\text{g}$ である、請求項 8 に記載の組み合わせ物。

【請求項 10】

前記マグネシウム塩の有効用量が、約 $50 \mu\text{g}$ ~ 約 68mg のマグネシウムを提供する、請求項 8 に記載の組み合わせ物。

【請求項 11】

約 $15 \mu\text{g}$ ~ 約 $120 \mu\text{g}$ の前記オキシトシンペプチドを含む前記オキシトシンペプチドおよび前記マグネシウム塩の有効用量が、約 1.1% ~ 約 1.6% (w/v) のマグネシウムを含む水溶液において投与されることを特徴とする、請求項 8 に記載の組み合わせ物。

【請求項 12】

約 $66 \mu\text{g}$ の前記オキシトシンペプチドを含む前記オキシトシンペプチドおよび前記マグネシウム塩の有効用量が、約 1.36% のマグネシウムを含む水溶液において投与されることを特徴とする、請求項 8 に記載の組み合わせ物。

【請求項 13】

前記疼痛が、慢性疼痛である、請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の組み合わせ物。

【請求項 14】

前記疼痛が、急性疼痛である、請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の組み合わせ物。

【請求項 15】

前記疼痛が、偶発性疼痛である、請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の組み合わせ物。

【請求項 16】

前記疼痛が、頭痛または顔面痛である、請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の組み合わせ物。

【請求項 17】

前記疼痛が、三叉神経関連の疼痛である、請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の組み合わせ物。

【請求項 18】

前記疼痛が、片頭痛である、請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の組み合わせ物。

【請求項 19】

前記疼痛が、頸部痛、肩部痛または上肢痛である、請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の組み合わせ物。

【請求項 20】

前記疼痛が、頸神経関連の疼痛である、請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の組み合わせ物。

【請求項 21】

前記オキシトシンペプチドが、ヒトオキシトシン（配列番号 1）である、請求項 1 ~ 20 のいずれか 1 項に記載の組み合わせ物。

【請求項 22】

オキシトシンペプチドおよびマグネシウム塩を含む組成物であって、該オキシトシンペプチドおよび該マグネシウム塩は、疼痛の処置において使用されたとき相乗的な痛覚消失をもたらす量で存在する、組成物。

【請求項 23】

前記オキシトシンペプチドが、ヒトオキシトシン（配列番号 1）である、請求項 22 に記載の組成物。

【請求項 24】

前記マグネシウム塩が、クエン酸マグネシウムおよび / または塩化マグネシウムを含む、請求項 22 または 23 に記載の組成物。

【請求項 25】

前記マグネシウム塩が、塩化マグネシウムおよびクエン酸マグネシウムを含む、請求項 24 に記載の組成物。

【請求項 26】

前記組成物が、約 0.01 mg/mL ~ 約 16 mg/mL の前記オキシトシンペプチドを含む液体製剤である、請求項 22 ~ 25 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 27】

前記液体製剤が、約 0.15 mg/mL ~ 約 1.5 mg/mL の前記オキシトシンペプチドを含む、請求項 26 に記載の組成物。

【請求項 28】

前記組成物が、約 3 mg/mL ~ 約 30 mg/mL のマグネシウムを提供する量で前記マグネシウム塩を含む液体製剤である、請求項 22 ~ 27 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 29】

前記液体製剤が、約 11 mg/mL ~ 約 15 mg/mL のマグネシウムを含む、請求項 28 に記載の組成物。

【請求項 30】

1 つまたはそれを超える賦形剤、ビヒクル、乳化剤、安定剤、保存剤、粘膜接着剤、抗菌剤、緩衝剤および / または他の添加物をさらに含む、請求項 22 ~ 29 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 31】

前記組成物が、約 4.5 の pH を有する、請求項 22 ~ 29 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 32】

前記組成物が、経鼻投与に適している、請求項 22 ~ 31 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 33】

さらに鼻腔内投与用のデバイスを含む、請求項 32 に記載の組成物。

【請求項 34】

鼻腔内投与用の前記デバイスが、鼻腔用ポンプ装置である、請求項 33 に記載の組成物。

【請求項 35】

前記鼻腔用ポンプ装置が、ポンプアクチュエータに取り付けられた貯蔵ボトルを備える、請求項 34 に記載の組成物。

【請求項 36】

前記ポンプアクチュエータが、約 50 μ L という特定体積を送達するように計量する、請求項 35 に記載の組成物。

【請求項 37】

前記鼻腔用ポンプ装置が、エアロゾライザに取り付けられた貯蔵ボトルを備える、請求項 34 に記載の組成物。

【請求項 38】

前記鼻腔用ポンプ装置が、以下：

- (i) 逆流を防止するためのフィルター、
- (i i) 無金属流路、および
- (i i i) ガンマ線に対して安定なプラスチック材料

のうちの1つ以上を備える、請求項34～37のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項39】

有効用量の請求項22～32のいずれか1項に記載の組成物および薬学的に許容され得るキャリアを含む、疼痛を処置するための組成物。

【請求項40】

請求項22～38のいずれか1項に記載の組成物および包装材を含む、キット。

【請求項41】

疼痛の処置を必要とする被験体に有効用量の請求項22～32のいずれか1項に記載の組成物および薬学的に許容され得るキャリアを投与する工程を含む、疼痛を処置するための方法において前記組成物を投与するための指示書をさらに含む、請求項40に記載のキット。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0017

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0017】

鼻腔用ポンプ装置などの鼻腔内投与用のデバイスに含められた本明細書中に記載されるマグネシウム含有オキシトシンペプチド製剤および好適な包装材を含むキットも提供される。そのキットは、マグネシウム含有オキシトシンペプチド製剤を必要とする被験体にマグネシウム含有オキシトシンペプチド製剤を投与するための指示書をさらに含み得る。

本発明の実施形態において、例えば以下の項目が提供される。

(項目1)

疼痛の処置を必要とする被験体に有効用量のオキシトシンペプチドおよびマグネシウム塩を投与する工程を含む、疼痛を処置するための方法であって、ここで、該オキシトシンペプチドと該マグネシウム塩との同時投与は、相乗的な痛覚消失をもたらす、方法。

(項目2)

前記オキシトシンペプチドが、前記マグネシウム塩と同時に投与される、項目1に記載の方法。

(項目3)

前記オキシトシンペプチドが、前記マグネシウム塩の投与の前または後に投与される、項目1に記載の方法。

(項目4)

前記オキシトシンペプチドが、頭蓋顔面粘膜投与を介して投与される、項目1～3のいずれか1項に記載の方法。

(項目5)

前記オキシトシンペプチドが、鼻腔内投与を介して投与される、項目4に記載の方法。

(項目6)

前記オキシトシンペプチドおよび前記マグネシウム塩が、鼻腔内投与を介して投与される、項目5に記載の方法。

(項目7)

前記マグネシウム塩が、塩化マグネシウムを含む、項目1～6のいずれか1項に記載の方法。

(項目8)

前記マグネシウム塩が、クエン酸マグネシウムを含む、項目1～7のいずれか1項に記載の方法。

(項目 9)

前記オキシトシンペプチドの有効用量が、約 $0.5 \mu\text{g}$ ~ 約 $2000 \mu\text{g}$ である、項目 8 に記載の方法。

(項目 10)

前記マグネシウム塩の有効用量が、約 $50 \mu\text{g}$ ~ 約 68mg のマグネシウムを提供する、項目 8 に記載の方法。

(項目 11)

前記オキシトシンペプチドおよび前記マグネシウム塩の有効用量が、約 1.1% ~ 約 1.6% (w/v) のマグネシウムを含む水溶液において投与される約 $15 \mu\text{g}$ ~ 約 $120 \mu\text{g}$ の該オキシトシンペプチドを含む、項目 8 に記載の方法。

(項目 12)

前記オキシトシンペプチドおよび前記マグネシウム塩の有効用量が、約 1.36% のマグネシウムを含む水溶液において投与される約 $66 \mu\text{g}$ の該オキシトシンペプチドを含む、項目 8 に記載の方法。

(項目 13)

前記疼痛が、慢性疼痛である、項目 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 14)

前記疼痛が、急性疼痛である、項目 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 15)

前記疼痛が、偶発性疼痛である、項目 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 16)

前記疼痛が、頭痛または顔面痛である、項目 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 17)

前記疼痛が、三叉神経関連の疼痛である、項目 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 18)

前記疼痛が、片頭痛である、項目 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 19)

前記疼痛が、頸部痛、肩部痛または上肢痛である、項目 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 20)

前記疼痛が、頸神経関連の疼痛である、項目 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 21)

前記オキシトシンペプチドが、ヒトオキシトシン (配列番号 1) である、項目 1 ~ 20 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 22)

オキシトシンペプチドおよびマグネシウム塩を含む組成物であって、該オキシトシンペプチドおよび該マグネシウム塩は、疼痛の処置において使用されたとき相乗的な痛覚消失をもたらす量で存在する、組成物。

(項目 23)

前記オキシトシンペプチドが、ヒトオキシトシン (配列番号 1) である、項目 22 に記載の組成物。

(項目 24)

前記マグネシウム塩が、クエン酸マグネシウムおよび / または塩化マグネシウムを含む、項目 22 または 23 に記載の組成物。

(項目 25)

前記マグネシウム塩が、塩化マグネシウムおよびクエン酸マグネシウムを含む、項目 24 に記載の組成物。

(項目 26)

前記組成物が、約 0.01mg/mL ~ 約 16mg/mL の前記オキシトシンペプチドを含む液体製剤である、項目 22 ~ 25 のいずれか 1 項に記載の組成物。

(項目 2 7)

前記液体製剤が、約 0 . 1 5 m g / m L ~ 約 1 . 5 m g / m L の前記オキシトシンペプチドを含む、項目 2 6 に記載の組成物。

(項目 2 8)

前記組成物が、約 3 m g / m L ~ 約 3 0 m g / m L のマグネシウムを提供する量で前記マグネシウム塩を含む液体製剤である、項目 2 2 ~ 2 7 のいずれか 1 項に記載の組成物。

(項目 2 9)

前記液体製剤が、約 1 1 m g / m L ~ 約 1 5 m g / m L のマグネシウムを含む、項目 2 8 に記載の組成物。

(項目 3 0)

1 つまたはそれを超える賦形剤、ビヒクル、乳化剤、安定剤、保存剤、粘膜接着剤、抗菌剤、緩衝剤および / または他の添加物をさらに含む、項目 2 2 ~ 2 9 のいずれか 1 項に記載の組成物。

(項目 3 1)

前記組成物が、約 4 . 5 の p H を有する、項目 2 2 ~ 2 9 のいずれか 1 項に記載の組成物。

(項目 3 2)

前記組成物が、経鼻投与に適している、項目 2 2 ~ 3 1 のいずれか 1 項に記載の組成物。

(項目 3 3)

さらに鼻腔内投与用のデバイスを含む、項目 3 2 に記載の組成物。

(項目 3 4)

鼻腔内投与用の前記デバイスが、鼻腔用ポンプ装置である、項目 3 3 に記載の組成物。

(項目 3 5)

前記鼻腔用ポンプ装置が、ポンプアクチュエータに取り付けられた貯蔵ボトルを備える、項目 3 4 に記載の組成物。

(項目 3 6)

前記ポンプアクチュエータが、約 5 0 μ L という特定体積を送達するように計量する、項目 3 5 に記載の組成物。

(項目 3 7)

前記鼻腔用ポンプ装置が、エアロゾライザに取り付けられた貯蔵ボトルを備える、項目 3 4 に記載の組成物。

(項目 3 8)

前記鼻腔用ポンプ装置が、以下：

(i) 逆流を防止するためのフィルター、

(i i) 無金属流路、および

(i i i) ガンマ線に対して安定なプラスチック材料

のうちの 1 つ以上を備える、項目 3 4 ~ 3 7 のいずれか 1 項に記載の組成物。

(項目 3 9)

疼痛の処置を必要とする被験体に有効用量の項目 2 2 ~ 3 2 のいずれか 1 項に記載の組成物および薬学的に許容され得るキャリアを投与する工程を含む、疼痛を処置するための方法。

(項目 4 0)

項目 2 2 ~ 3 8 のいずれか 1 項に記載の組成物および包装材を含む、キット。

(項目 4 1)

項目 3 9 に記載の方法に従って前記組成物を投与するための指示書をさらに含む、項目 4 0 に記載のキット。