

【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 18 年 1 月 5 日 (2006.1.5)

【公表番号】特表 2005-521673 (P2005-521673A)

【公表日】平成 17 年 7 月 21 日 (2005.7.21)

【年通号数】公開・登録公報 2005-028

【出願番号】特願 2003-565449 (P2003-565449)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/568 (2006.01)

A 6 1 K 9/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/568

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/18

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/38

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 37/08

【手続補正書】

【提出日】平成 17 年 10 月 12 日 (2005.10.12)

【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

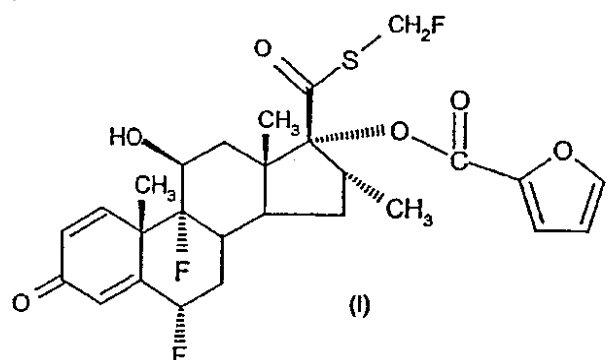
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)

【化 1】



の粒子状化合物またはその溶媒和物の水性懸濁物を含む医薬製剤。

【請求項 2】

1 種以上の懸濁化剤を含む、請求項 1 記載の医薬製剤。

【請求項 3】

懸濁化剤が、微晶質セルロースおよびカルボキシメチルセルロースナトリウムである、請求項 2 記載の医薬製剤。

【請求項 4】

懸濁化剤が、製剤の全重量に基づいて 0.1～5%（重量 / 重量）の量で存在する、請求項 2 または 3 記載の医薬製剤。

【請求項 5】

1 種以上の防腐剤を含む、請求項 1～4 のいずれか 1 項記載の医薬製剤。

【請求項 6】

防腐剤が塩化ベンザルコニウムを含む、請求項 5 記載の医薬製剤。

【請求項 7】

塩化ベンザルコニウムが、製剤の全重量に基づいて 0.001～1%（重量 / 重量）の量で製剤中に存在する、請求項 6 記載の医薬製剤。

【請求項 8】

防腐剤がエデト酸 2 ナトリウムを含む、請求項 5～7 のいずれか 1 項記載の医薬製剤。

【請求項 9】

1 種以上の湿潤剤を含む、請求項 1～8 のいずれか 1 項記載の医薬製剤。

【請求項 10】

湿潤剤がポリオキシエチレン(20)ソルビタンモノオレートを含む、請求項 9 記載の医薬製剤。

【請求項 11】

湿潤剤が、製剤の全重量に基づいて 0.001～0.05%（重量 / 重量）の量で製剤中に存在する、請求項 9 または 10 記載の医薬製剤。

【請求項 12】

1 種以上の等張性調節剤を含む、請求項 1～11 のいずれか 1 項記載の医薬製剤。

【請求項 13】

等張性調節剤がデキストロースを含む、請求項 12 記載の医薬製剤。

【請求項 14】

等張性調節剤が、製剤の全重量に基づいて 0.1～10%（重量 / 重量）の量で製剤中に存在する、請求項 12 または 13 記載の医薬製剤。

【請求項 15】

鼻腔の流体と等張であることを特徴とする、請求項 1～14 のいずれか 1 項記載の医薬製剤。

【請求項 16】

pH が 5～7 に調整されている、請求項 1～15 のいずれか 1 項記載の医薬製剤。

【請求項 17】

塩酸および / または水酸化ナトリウムを用いて pH を調整する、請求項 16 記載の医薬製剤。

【請求項 18】

式(1)の化合物またはその溶媒和物が、製剤の全重量に基づいて 0.005～1%（重量 / 重量）の量で製剤中に存在する、請求項 1～17 のいずれか 1 項記載の医薬製剤。

【請求項 19】

式(1)の化合物の粒子が、0.5～10 μm の質量平均直径を有する、請求項 1～18 のいずれか 1 項記載の医薬製剤。

【請求項 20】

式(1)の化合物の粒子が、1～5 μm の質量平均直径を有する、請求項 19 記載の医薬製剤。

。

【請求項 2 1】

式(I)の化合物が、非溶媒和形態 1 多形体の形態である、請求項 1 ~ 2 0 のいずれか 1 項記載の医薬製剤。

【請求項 2 2】

式(I)の化合物の粒径が減ぜられた請求項 1 ~ 2 1 のいずれか 1 項記載の医薬組成物。

【請求項 2 3】

粒径が微粉化 (micronisation) によって減ぜられた、請求項 2 2 記載の医薬組成物。

【請求項 2 4】

粒径がミクロ流動化 (microfluidisation) によって減ぜられた、請求項 2 2 または 2 3 記載の医薬組成物。

【請求項 2 5】

式(I)の化合物が実質的に、粒径減少前に等方性 (equant) または実質的に等方性の粒子の形態であった、請求項 2 2 ~ 2 4 のいずれか 1 項記載の医薬製剤。

【請求項 2 6】

式(I)の化合物が実質的に、粒径減少前に正方晶系両錐体 (tetragonal bipyramidal) または実質的に正方晶系両錐体粒子の形態であった、請求項 2 2 記載の医薬製剤。

【請求項 2 7】

式(I)の化合物が実質的に針状 (acicular) 粒子の形態である、請求項 2 3 記載の医薬製剤。

【請求項 2 8】

(i) 1 種以上の懸濁化剤；
(ii) 1 種以上の防腐剤；
(iii) 1 種以上の湿潤剤；および
(iv) 1 種以上の等張性調節剤
を含む、請求項 1 ~ 2 7 のいずれか 1 項記載の医薬製剤。

【請求項 2 9】

懸濁化剤が微晶質セルロースおよびカルボキシメチルセルロースナトリウムであり、防腐剤が EDTA および塩化ベンザルコニウムであり、湿潤剤がポリオキシエチレン (20) ソルビタンモノオレートであり、等張性調節剤がデキストロースである、請求項 2 8 記載の医薬製剤。

【請求項 3 0】

別の治療的に活性な薬剤を含む、請求項 1 ~ 2 9 のいずれか 1 項記載の医薬製剤。

【請求項 3 1】

別の治療的に活性な薬剤が、抗ヒスタミン剤または抗アレルギー剤である、請求項 3 0 記載の医薬製剤。

【請求項 3 2】

鼻用スプレーの形態で送達するのに適当である、請求項 1 ~ 3 1 のいずれか 1 項記載の医薬製剤を含む容器。

【請求項 3 3】

請求項 3 0 記載の容器を含む、医薬製剤の鼻内送達のために適合された装置。

【請求項 3 4】

実質的に、等方性または実質的に等方性の粒子の形態の式(I)の化合物。

【請求項 3 5】

粒子が、正方晶系両錐体または実質的に正方晶系両錐体粒子の形態である、請求項 3 2 記載の化合物。

【請求項 3 6】

実質的に針状粒子の形態である、式(I)の化合物。

【請求項 3 7】

炎症および / またはアレルギー状態を有する患者の治療において、ヒトまたは獣医学の薬において使用するための、請求項 1 ~ 3 1 のいずれか 1 項記載の医薬製剤。

【請求項 38】

1日1回の治療において使用するための、請求項37記載の医薬製剤。

【請求項 39】

炎症および/またはアレルギー状態を有する患者の治療のための医薬の製造のための、請求項1～31のいずれか1項記載の製剤の使用。

【請求項 40】

1日1回の治療のための、請求項37記載の使用。

【請求項 41】

実質的に、等方性または実質的に等方性の粒子の形態の式(1)の化合物の製造方法であって、溶媒和する適当な溶媒中で式(1)の化合物を溶解させることおよび化合物を結晶化させることを含む、上記方法。

【請求項 42】

溶媒和する溶媒が、アセトン、プロパン-2-オール、酢酸エチルまたはテトラヒドロフランである、請求項41記載の方法。

【請求項 43】

溶媒和剤がアセトンまたはプロパン-2-オールである、請求項42記載の方法。

【請求項 44】

式(1)の化合物が実質的に正方晶系両錐体粒子の形態である、請求項41～43のいずれか1項記載の方法。