

【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25年4月18日(2013.4.18)

【公表番号】特表2012-513412(P2012-513412A)

【公表日】平成24年6月14日(2012.6.14)

【年通号数】公開・登録公報2012-023

【出願番号】特願2011-542586(P2011-542586)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/403 (2006.01)

A 6 1 K 31/4045 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 31/404 (2006.01)

A 6 1 K 31/422 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/403

A 6 1 K 31/4045

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 31/422

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/18

【手続補正書】

【提出日】平成24年3月30日(2012.3.30)

【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】

以下のものを含む組成物：

a) スマトリブタン、ナトリブタン、エトリブタン、フロバトリブタン、アルモトリブタン、ゾルミトリブタン、それらの塩、またはそれらの組み合わせから選択されるトリブタン類似体の治療的有効量；および

b) アルキルサッカリド。

【請求項2】

アルキルサッカリド濃度が約0.05%～2%または約0.1%～0.25%であり、および/またはアルキルサッカリドが、10～16個の炭素を含むアルキル鎖を有する、請求項1記載の組成物。

【請求項3】

アルキルサッカリドが、ウンデシル- -D-マルチド、ドデシル- -D-マルチド、トリデシル- -D-マルチド、テトラデシル- -D-マルチド、スクロースモノデカノエート、またはそれらの組み合わせである、請求項1または2記載の組成物。

【請求項4】

前記化合物が鼻腔内送達のために製剤化されている、請求項1～3のいずれか一項記載の組成物。

【請求項 5】

アルキルグリコシドの臨界ミセル濃度（CMC）が約1mM未満または約0.5mM未満である、請求項1～4のいずれか一項記載の組成物。

【請求項 6】

エチレンジアミン四酢酸（EDTA）またはその塩をさらに含み、EDTAが重量比で約0.01%～2%の濃度を有する、請求項1～5のいずれか一項記載の組成物。

【請求項 7】

約7またはそれ未満のpHを有する、請求項1～6のいずれか一項記載の組成物。

【請求項 8】

アルキルサッカリドの非存在下でもたらされる対応するCmaxと比較して、トリブタン類似体に関して約1.3倍またはそれ以上の大きさであるCmaxをもたらす、請求項1～7のいずれか一項記載の組成物。

【請求項 9】

ヒトへの投与後約20分未満の時点で、投与約60分後の時点でのトリブタン類似体の血漿中濃度または血中濃度と比較して少なくとも約1.3倍、1.5倍またはそれ以上の高さであるトリブタン類似体の最大血漿中濃度または血中濃度をもたらす、請求項1～8のいずれか一項記載の組成物。

【請求項 10】

ヒトへの投与後約20分未満のうちに血漿中または血液中のトリブタン類似体に関するCmaxをもたらす、アルキルサッカリド濃度が0.05～0.2%であり、かつCmaxの少なくとも約0.25倍である60分時点での持続的トリブタン類似体濃度をもたらす、請求項1～9のいずれか一項記載の組成物。

【請求項 11】

トリブタン類似体がスマトリブタンである、鼻腔内投与のために製剤化されている、請求項1～10のいずれか一項記載の組成物。

【請求項 12】

1) 前記組成物が、IMITREX（登録商標）注射剤と比較して少なくとも約17%の生物学的利用能を有し、かつAUC0-1hrが約10ng・hr/mLもしくはそれ以上であるか、または、前記組成物が、IMITREX（登録商標）鼻噴霧薬と比較して少なくとも約120%の生物学的利用能を有し、かつAUC0-1hrが約10ng・hr/mLもしくはそれ以上であり、

2) 前記組成物が、15ng/mLを上回るCmaxを有するか、または約 1×10^6 (exp 6) mL (exp -1) ($1 \times 10^6 \text{ mL}^{-1}$) を上回る用量/Cmax比を有し、

3) 前記組成物が、約20分未満のTmaxを有するか、または約15分未満のTmaxを有し、

4) スマトリブタン濃度が5mg～100mgであり、および/または

5) 前記組成物が、約10ng・hr/mLを上回るAUC0-1hrをもたらす、

請求項11記載の組成物。

【請求項 13】

約2分またはそれ未満で約5ng/mLを上回るかもしくはそれと等しいスマトリブタンの血漿レベルをもたらすか、約5分もしくはそれ未満で約5ng/mLを上回るかもしくはそれと等しいスマトリブタンの血漿レベルをもたらすか、または約15分もしくはそれ未満で約10ng/mLを上回るかもしくはそれと等しいスマトリブタンの血漿レベルをもたらす、請求項11記載の組成物。

【請求項 14】

約20mgのスマトリブタンを含み、約20分またはそれ未満で約16ng/mLを上回るかまたはそれと等しいスマトリブタンの血漿レベルをもたらす、請求項11記載の組成物。

【請求項 15】

アルキルサッカリドが、ウンデシル-β-D-マルトシド、ドデシル-β-D-マルトシド、トリデシル-β-D-マルトシド、テトラデシル-β-D-マルトシド、スクロースモノデカノエート、またはそれらの組み合わせから選択され、かつ

前記組成物が、トリブタン類似体の減量されているが治療的には有効な量を、それを必

要としている対象に与え、かつ、曲線下面積（AUC）が、アルキルサッカリドの非存在下で投与されたトリブタン類似体の増量された治療的有効量によってもたらされるAUCと比較してほぼ等しいか；あるいは、

前記化合物が、アルキルサッカリドの非存在下でもたらされる対応するAUC 0-1hrと比較して、トリブタン類似体に関して約1.3倍、1.5倍またはそれ以上の大きさであるAUC 0-1hrをもたらし；

前記化合物が対象において約30分またはそれ未満のTmaxを示し、それにより、対象において片頭痛緩和の迅速開始をもたらすか；あるいは、

前記組成物が約20分未満のTmaxをもたらし、それにより、対象における片頭痛再発の発生率の低下を提供する、

請求項1記載の組成物。