

【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29年1月5日 (2017.1.5)

【公表番号】特表2016-502991 (P2016-502991A)

【公表日】平成28年2月1日 (2016.2.1)

【年通号数】公開・登録公報2016-007

【出願番号】特願2015-547039 (P2015-547039)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/445 (2006.01)

A 6 1 K 9/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2017.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 P 11/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/56 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/445

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/18

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/10

A 6 1 P 11/02

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 29/00

A 6 1 K 31/56

A 6 1 P 43/00 1 2 1

【手続補正書】

【提出日】平成28年11月15日 (2016.11.15)

【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

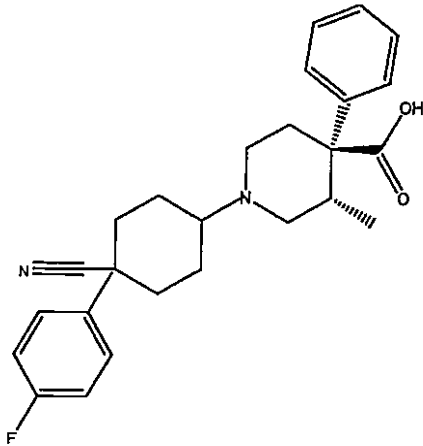
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

レボカバスチン

【化 1】



又はその塩と、フルチカゾンフランカルボン酸エステルとを含む医薬製剤。

【請求項 2】

レボカバスチン塩酸塩とフルチカゾンフランカルボン酸エステルとを含む、請求項1に記載の医薬製剤。

【請求項 3】

フルチカゾンフランカルボン酸エステルとレボカバスチン又はその塩が、懸濁粒子の形態で存在する、請求項1又は2に記載の医薬製剤。

【請求項 4】

水性の医薬製剤である、請求項1～3のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 5】

鼻腔内送達に適する、請求項1～4のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 6】

1つ以上の懸濁剤を更に含む、請求項1～5のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 7】

1つ以上の防腐剤を含む、請求項1～6のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 8】

1つ以上の湿潤剤を含む、請求項1～7のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 9】

1つ以上の等張性調節剤を含む、請求項1～8のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 10】

鼻腔の液と等張であることを特徴とする、請求項1～9のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 11】

バッファーを含む、請求項1～10のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 12】

pHが6～8の間に調整されている、請求項1～11のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 13】

1つ以上の味覚マスキング剤を含む、請求項1～12のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 14】

フルチカゾンフランカルボン酸エステルが、製剤の総重量に対して0.005%～1% (w/w)の量で製剤中に存在する、請求項1～13のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 15】

レボカバスチン又はその塩が、製剤の総重量に対して0.0005%～2% (w/w)の量で製剤中に存在する、請求項1～14のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 16】

(i)レボカバスチン又はその塩の水性懸濁物と、

- (ii)フルチカゾンフランカルボン酸エステルの水性懸濁物と、
- (iii)1つ以上の懸濁剤と、
- (iv)1つ以上の防腐剤と、
- (v)1つ以上の湿潤剤と、
- (vi)バッファーと、
- (vii)1つ以上の等張性調節剤と、任意の
- (viii)1つ以上の味覚マスキング剤と

を含む、請求項1～15のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 1 7】

請求項1～16のいずれか一項に記載の医薬製剤を含む、医薬製剤の鼻腔内送達用に適合されたデバイス。

【請求項 1 8】

炎症性及び/又はアレルギー性の状態を有する患者の治療を対象とする薬剤における使用のための、請求項1～16のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 1 9】

炎症性及び/又はアレルギー性の状態が、鼻炎、季節性の鼻炎、通年性の鼻炎である、請求項18に記載の医薬製剤。

【請求項 2 0】

炎症性及び/又はアレルギー性の状態を有する患者を治療するための薬剤を製造するための、請求項1～16のいずれか一項に記載の医薬製剤の使用。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 7 4

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 7 4】

【表 7】

治験治療

治験薬及びその他の治験治療

	治験治療		
製品名:	フルチカゾンフランカルボン酸エステル/レボカバスチン(FDC)	フルチカゾンフランカルボン酸エステル (市販医薬品 Avamys)	レボカバスチン(市販医薬品 Livostin)
処方:	EDTA (0.015% w/w) 及び塩化ベンザルコニウム(0.015% w/w)で防腐処理された0.05% w/wフルチカゾンフランカルボン酸エステル及び0.10% w/wレボカバスチン水性懸濁物。	EDTA (0.015% w/w) 及び塩化ベンザルコニウム(0.015% w/w)で防腐処理された0.05% w/wフルチカゾンフランカルボン酸エステル水性懸濁物。	EDTA及び塩化ベンザルコニウムで防腐処理された0.05% w/wレボカバスチン水性懸濁物。
剤形:	鼻腔内水性微小懸濁物	鼻腔内水性微小懸濁物	鼻腔内水性微小懸濁物
単位投与強度/ 投与レベル:	27.5µg/50µg	27.5µg	50µg
経路/投与/期間:	鼻腔内	鼻腔内	鼻腔内
投与法の指示:	朝方絶食状態で、鼻孔毎に2回スプレー	朝方絶食状態で、鼻孔毎に2回スプレー	朝方絶食状態で、鼻孔毎に2回スプレー
物理的性状:	白色均一懸濁物で充填され、白色トップ作動型プラスチック製定量噴霧式スプレーポンプが取り付けられた褐色ガラスボトル	白色均一懸濁物で充填され、プラスチック製定量噴霧式スプレーポンプが取り付けられた褐色ガラスボトルを取り囲む側方作動型白色及び青色プラスチック製デバイス	白色トップ作動型プラスチック製定量噴霧式スプレーポンプが取り付けられた白色プラスチック製ボトル

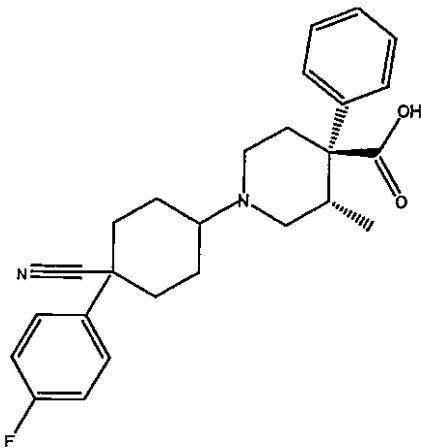
デバイス:	アクチュエーター、キャップ、及びクリップを有するポンプ上の白色50mcl VP7スクリーを備えた褐色ガラス製スクリートップボトル	Mistpro市販デバイス。青色キャップを有する、プラスチック製50mcl定量噴霧式スプレーポンプが取り付けられた、褐色ガラスボトルを取り囲む側方作動型白色及び青色プラスチック製デバイス	キャップを有する、白色トップ作動型プラスチック製100mcl定量噴霧式スプレーポンプが取り付けられた白色プラスチック製ボトル
製造業者/調達先:	グラクソスミスクライン	グラクソスミスクライン	Johnson & Johnson、Pacific
用量分配方法:	定量噴霧式スプレーポンプ	定量噴霧式スプレーポンプ	定量噴霧式スプレーポンプ

本発明の実施形態として例えば以下を挙げることができる。

【実施形態1】

レボカバスチン

【化3】



又はその塩と、フルチカゾンフランカルボン酸エステルとを含む医薬製剤。

【実施形態2】

レボカバスチン塩酸塩とフルチカゾンフランカルボン酸エステルとを含む、実施形態1に記載の医薬製剤。

【実施形態3】

フルチカゾンフランカルボン酸エステルとレボカバスチン又はその塩が、懸濁粒子の形態で存在する、実施形態1又は2に記載の医薬製剤。

【実施形態4】

水性の医薬製剤である、実施形態1～3のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【実施形態5】

鼻腔内送達に適する、実施形態1～4のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【実施形態6】

1つ以上の懸濁剤を更に含む、実施形態1～5のいずれか一項に記載の医薬製剤。

[実施形態 7]

懸濁剤が、微結晶セルロース及びカルボキシメチルセルロースナトリウムである、実施形態6に記載の医薬製剤。

[実施形態 8]

1つ以上の防腐剤を含む、実施形態1～7のいずれか一項に記載の医薬製剤。

[実施形態 9]

防腐剤が、塩化ベンザルコニウム及び/又はエデト酸(EDTA)二ナトリウムを含む、実施形態8に記載の医薬製剤。

[実施形態 10]

1つ以上の湿潤剤を含む、実施形態1～9のいずれか一項に記載の医薬製剤。

[実施形態 11]

湿潤剤が、ポリオキシエチレン(20)ソルビタンモノオレエートを含む、実施形態18に記載の医薬製剤。

[実施形態 12]

1つ以上の等張性調節剤を含む、実施形態1～11のいずれか一項に記載の医薬製剤。

[実施形態 13]

等張性調節剤が、デキストロース及び/又はグルコースを含む、実施形態12に記載の医薬製剤。

[実施形態 14]

鼻腔の液と等張であることを特徴とする、実施形態1～13のいずれか一項に記載の医薬製剤。

[実施形態 15]

バッファーを含む、実施形態1～14のいずれか一項に記載の医薬製剤。

[実施形態 16]

バッファーが、リン酸バッファーを含む、実施形態15に記載の医薬製剤。

[実施形態 17]

pHが6～8の間に調整されている、実施形態1～16のいずれか一項に記載の医薬製剤。

[実施形態 18]

pHが、塩酸及び/又は水酸化ナトリウムを用いて調整される、実施形態17に記載の医薬製剤。

[実施形態 19]

1つ以上の味覚マスキング剤を含む、実施形態1～18のいずれか一項に記載の医薬製剤。

[実施形態 20]

味覚マスキング剤が、スクラロース及び/又はメントールから選択される、実施形態19に記載の医薬製剤。

[実施形態 21]

フルチカゾンフランカルボン酸エステルが、製剤の総重量に対して0.005%～1% (w/w)の量で製剤中に存在する、実施形態1～20のいずれか一項に記載の医薬製剤。

[実施形態 22]

レボカバスチン又はその塩が、製剤の総重量に対して0.0005%～2% (w/w)の量で製剤中に存在する、実施形態1～21のいずれか一項に記載の医薬製剤。

[実施形態 23]

(i)レボカバスチン又はその塩の水性懸濁物と、

(ii)フルチカゾンフランカルボン酸エステルの水性懸濁物と、

(iii)1つ以上の懸濁剤と、

(iv)1つ以上の防腐剤と、

(v)1つ以上の湿潤剤と、

(vi)バッファーと、

(vii)1つ以上の等張性調節剤と、任意の

(viii)1つ以上の味覚マスキング剤と

を含む、実施形態1～22のいずれか一項に記載の医薬製剤。

[実施形態 2 4]

防腐剤を含まない、実施形態23に記載の医薬製剤。

[実施形態 2 5]

実施形態1～24のいずれか一項に記載の医薬製剤を含む医薬製剤を、鼻腔内送達のために適合されたデバイス。

[実施形態 2 6]

実施形態1～24のいずれか一項に記載の医薬製剤を、薬学的に許容される量で、患者に投与するステップを含む、アレルギー性鼻炎の治療方法。

[実施形態 2 7]

投与が、1日1回である、実施形態26に記載の方法。

[実施形態 2 8]

炎症性及び/又はアレルギー性の状態を有する患者の治療を対象とする薬剤における使用のための、実施形態1～24のいずれか一項に記載の医薬製剤。

[実施形態 2 9]

炎症性及び/又はアレルギー性の状態が、鼻炎、季節性の鼻炎、通年性の鼻炎である、実施形態28に記載の使用。

[実施形態 3 0]

炎症性及び/又はアレルギー性の状態を有する患者を治療するための薬剤を製造するための、実施形態1～24のいずれか一項に記載の医薬製剤の使用。

[実施形態 3 1]

実施形態1～24のいずれか一項に記載の医薬製剤を、炎症性及び/又はアレルギー性の状態を有するヒト対象に有効量投与するステップを含む、前記ヒト対象を治療する方法。