

【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21年5月21日(2009.5.21)

【公表番号】特表2008-534563(P2008-534563A)

【公表日】平成20年8月28日(2008.8.28)

【年通号数】公開・登録公報2008-034

【出願番号】特願2008-503581(P2008-503581)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/198 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/30 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/24 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/198

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 47/30

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 47/24

A 6 1 K 47/12

A 6 1 P 25/16

A 6 1 K 9/20

【手続補正書】

【提出日】平成21年3月27日(2009.3.27)

【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】

弱酸性物質と活性成分としての薬理的に有効な量のL-ドーパとを含み、前記活性成分はより大きなキャリア粒子の表面上に粒子状形態で提供される製薬組成物。

【請求項2】

(a) 前記キャリア粒子が前記弱酸性物質を含み；及び/または
(b) 前記弱酸性物質の粒子が前記キャリア粒子の表面上に提供され；及び/または
(c) 前記弱酸性物質の粒子が前記キャリア粒子の間に提供される；
の少なくとも1つを適用する、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

前記活性成分が微粒子の形態をとる、請求項1または2に記載の組成物。

【請求項4】

前記微粒子が約15 μ m未満の重量ベースの平均粒径を有する、請求項3に記載の組成物。

【請求項5】

存在する活性成分の総量が、当該組成物の総重量に基づき、約2-20重量%の範囲にある、請求項1から4のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項6】

前記範囲が約5-15重量%である、請求項5に記載の組成物。

【請求項7】

生体付着及び/または粘膜付着促進剤をさらに含む、請求項1から6のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項8】

前記生体付着及び/または粘膜付着促進剤が、5,000を超える重量平均分子量を有するポリマー性物質である、請求項7に記載の組成物。

【請求項9】

前記生体付着及び/または粘膜付着促進剤が、セルロース誘導體、デンプン誘導體、アクリル系ポリマー、ポリビニルピロリドン、酸化ポリエチレン、キトサン、天然ポリマー、スクレログルカン、キサンタンガム、グアーゴム、ポリコ-(メチルビニルエーテル/無水マレイン酸)、及びクロスカルメロース、またはそれらの混合物から選択される、請求項8に記載の組成物。

【請求項10】

前記生体付着及び/または粘膜付着促進剤が、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、メチルセルロース、エチルヒドロキシエチルセルロース、カルボキシメチルセルロース、変性セルロースガム、カルボキシメチルセルロースナトリウム、適度に架橋されたデンプン、変性デンプン、デンプングリコール酸ナトリウム、カルボマーまたはその誘導體、架橋されたポリビニルピロリドン、酸化ポリエチレン、キトサン、ゼラチン、アルギン酸ナトリウム、ペクチン、スクレログルカン、キサンタンガム、グアーゴム、ポリコ-(メチルビニルエーテル/無水マレイン酸)、及びクロスカルメロースナトリウム、あるいはそれらの混合物から選択される、請求項9に記載の組成物。

【請求項11】

前記生体付着及び/または粘膜付着促進剤が、クロスカルメロースナトリウムまたは架橋されたポリビニルピロリドンである、請求項10に記載の組成物。

【請求項12】

存在する生体付着及び/または粘膜付着促進剤の量が、当該組成物の総重量に基づき、約0.1-25重量%の範囲にある、請求項7から11のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項13】

前記範囲が約1-15重量%である、請求項12に記載の組成物。

【請求項14】

前記キャリア粒子が弱酸性物質を含む、請求項1から13のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 15】

弱酸性物質の粒子もまた、前記キャリア粒子の表面上に少なくとも部分的に提供されている、請求項 14 に記載の組成物。

【請求項 16】

前記キャリア粒子が弱酸性物質を含まず、且つ弱酸性物質の粒子が前記キャリア粒子の表面上に提供されている、請求項 1 から 13 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 17】

弱酸性物質の粒子が前記キャリア粒子の間に提供されている、請求項 1 から 16 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 18】

前記キャリア粒子が、炭水化物、製薬上許容し得る無機塩、ポリマー、またはそれらの混合物を含むまたは含有する、請求項 1 から 17 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 19】

前記粒子が、糖、マンニトール、ラクトース、塩化ナトリウム、リン酸カルシウム、リン酸二カルシウム水和物、リン酸二カルシウム脱水物、リン酸三カルシウム、炭酸カルシウム、硫酸バリウム、結晶セルロース、セルロース、架橋されたポリビニルピロリドン、またはそれらの混合物を含むまたは含有する、請求項 18 に記載の組成物。

【請求項 20】

前記粒子が、マンニトール及び/またはラクトースを含むまたは含有する、請求項 19 に記載の組成物。

【請求項 21】

前記弱酸性物質が食物酸である、請求項 1 から 20 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 22】

前記酸が、クエン酸、酒石酸、アマル酸、フマル酸、アジピン酸、コハク酸、またはそれらの組合せである、請求項 21 に記載の組成物。

【請求項 23】

前記酸がクエン酸である、請求項 22 に記載の組成物。

【請求項 24】

前記キャリア粒子のサイズが約 50-750 μm である、請求項 1 から 23 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 25】

前記粒子サイズが約 100-600 μm である、請求項 24 に記載の組成物。

【請求項 26】

前記生体付着及び/または粘膜付着促進剤が、約 1-100 μm の範囲にある粒子サイズを有する、請求項 7 から 25 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 27】

使用される活性成分の粒子及び前記キャリア粒子の相対サイズ及び量が、前記キャリア粒子が前記活性成分によって少なくとも約 90% 被覆され得ることを保証するのに十分である、請求項 1 から 26 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 28】

ドーパミン脱炭素酵素インヒビターをさらに含む、請求項 1 から 27 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 29】

舌下投与に適した錠剤の形態をとる、請求項 1 から 28 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 30】

前記組成物が崩壊剤をさらに含む、請求項 29 に記載の組成物。

【請求項 31】

前記崩壊剤が、架橋されたポリビニルピロリドン、カルボキシメチルデンブロン、天然デンブロン、及びそれらの混合物から選択される、請求項 30 に記載の組成物。

【請求項 3 2】

前記崩壊剤の量が、当該組成物の総重量に基づき、約2-7重量%である、請求項 3 0 または 3 1 に記載の組成物。

【請求項 3 3】

前記キャリア粒子を、前記活性成分及びさらなる弱酸性の粒子（存在する場合）とともに乾燥混合する工程を含む、請求項 1 から 2 8 のいずれか一項に記載の組成物の調製方法。

【請求項 3 4】

前記生体付着 / 粘膜付着促進剤もまた、微細粒子の形態で、前記キャリア粒子とともに混合する、請求項 3 3 に記載の方法。

【請求項 3 5】

請求項 2 9 から 3 2 のいずれか一項に規定の舌下錠剤の調製方法であって、請求項 1 から 2 8 のいずれか一項に記載の組成物を直接に押し固めるまたは圧縮する工程を含む方法。

【請求項 3 6】

パーキンソン病の治療用の薬剤の製造のための、請求項 1 から 3 2 のいずれか一項に記載の組成物の使用。

【請求項 3 7】

前記治療が、パーキンソン病の治療のためにL-ドーパを摂取している患者における運動症状の変動のものである、請求項 3 6 に記載の使用。

【請求項 3 8】

医薬における使用のための、請求項 1 から 3 2 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 3 9】

パーキンソン病の治療における使用のための、請求項 1 から 3 2 のいずれか一項に記載の組成物。