

【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】令和7年2月6日(2025.2.6)

【公開番号】特開2024-129122(P2024-129122A)

【公開日】令和6年9月26日(2024.9.26)

【年通号数】公開公報(特許)2024-180

【出願番号】特願2024-107963(P2024-107963)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/198(2006.01)

A 6 1 K 47/38(2006.01)

A 6 1 K 9/10(2006.01)

A 6 1 K 47/32(2006.01)

A 6 1 K 47/34(2017.01)

A 6 1 K 47/10(2017.01)

A 6 1 P 25/16(2006.01)

10

【F I】

A 6 1 K 31/198

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/10

A 6 1 P 25/16

20

【手続補正書】

【提出日】令和7年1月29日(2025.1.29)

【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

30

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

十二指腸内投与のための医薬組成物であって、
組成物全体の4.0重量/重量%の量のレボドパ活性剤；
組成物全体の1.0重量/重量%の量のカルビドパ1水和物活性剤；
アクリル酸系ポリマーである、懸濁剤；および
水系担体

を含み、

前記医薬組成物が、 2.2 および 24.1 s^{-1} で 4500 cps 以下の高剪断粘度、
 5 および 0.1 s^{-1} での 45000 cps 以上の低剪断粘度、ならびに低剪断粘度/
高剪断粘度比10以上を有する、医薬組成物。

40

【請求項2】

前記水系担体の濃度が、組成物全体の0%を超え、95重量/重量%までの量である請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項3】

前記医薬組成物が0.04重量/重量%/週より大きい速度でのDHPAへの分解を受けない、請求項1または2に記載の医薬組成物。

【請求項4】

50

前記医薬組成物が 0.04 重量 / 重量 % / 週より大きい速度での DHPA への分解を受けない、請求項 1 から 3 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

前記医薬組成物が、0.6 $\mu\text{g} / \text{g}$ / 週より大きい速度でのヒドラジンを生じる分解を受けない、請求項 1 から 4 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

前記医薬組成物が低酸素透過性の一次または二次容器に入っている、請求項 1 から 5 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

酸素不透過性封入容器が中に入っているディスポーザブル薬剤リザーバー中に請求項 1 から 6 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物を含む医薬製剤であって、前記酸素不透過性封入容器が不活性ガスでパージされ、脱酸素剤が加えられている医薬製剤。

10

【請求項 8】

前記医薬製剤が、治療上有効な形で組成物を送達することができる連続輸液ポンプでの使用に好適である、請求項 7 に記載の医薬製剤。

【請求項 9】

レボドパ活性剤およびカルビドパ活性剤を水に加えてスラリーを形成すること；

前記スラリーを、アクリル酸系ポリマーである懸濁剤に加えて、懸濁液を形成すること；および

前記懸濁液に N_2 吹き込みを行うこと

20

を含む、請求項 1 から 6 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物の製造方法。

【請求項 10】

前記懸濁液を低酸素透過性容器に入れることをさらに含む、請求項 9 に記載の方法。

【請求項 11】

前記懸濁液を形成する前に、前記レボドパ活性剤は、

(i) D 5 0 が 5 μm 以下；

(i i) D 9 0 が 1 1 μm 以下；および

(i i i) D 1 0 0 が 2 2 μm 以下

の粒径分布を有し、

前記カルビドパ活性剤は、

(i) D 5 0 が 3 μm 以下；

(i i) D 9 0 が 7 μm 以下；および

(i i i) D 1 0 0 が 2 1 μm 以下

の粒径分布を有する、請求項 9 または 10 に記載の方法。

30

【請求項 12】

レボドパ活性剤およびカルビドパ 1 水和物活性剤を水に加えてスラリーを形成すること；

前記スラリーを、アクリル酸系ポリマーである 1 以上の懸濁剤に加えて懸濁液を形成すること；ならびに

前記懸濁液に N_2 吹き込みを行うこと

を含む方法によって製造される、請求項 1 から 6 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

40

【請求項 13】

前記方法が、前記懸濁液を低酸素透過性容器に入れることをさらに含む、請求項 12 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

前記懸濁液を形成する前に、前記レボドパ活性剤は、

(i) D 5 0 が 5 μm 以下；

(i i) D 9 0 が 1 1 μm 以下；および

(i i i) D 1 0 0 が 2 2 μm 以下

の粒径分布を有し、

50

前記カルビドパ１水和物活性剤は、

- (i) D 5 0 が 3 μ m 以下；
- (i i) D 9 0 が 7 μ m 以下；および
- (i i i) D 1 0 0 が 2 1 μ m 以下

の粒径分布を有する、請求項 1 2 または 1 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

治療を必要とする患者におけるパーキンソン病の治療方法において使用するための、請求項 1 から 6 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物であって、前記方法が、治療的に有効な量の前記医薬組成物を前記患者に十二指腸内投与を介して投与することを含む、医薬組成物。

10

【請求項 1 6】

前記方法が、少なくとも 1 6 時間の期間にわたり前記医薬組成物を実質的に連続投与することを含む請求項 1 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 7】

前記方法が、少なくとも 2 4 時間の期間にわたり前記医薬組成物を実質的に連続投与することを含む請求項 1 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

前記医薬組成物を請求項 7 に記載の医薬製剤で投与する請求項 1 5 から 1 7 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 9】

請求項 1 から 6 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物を含むキット。

20

【請求項 2 0】

請求項 7 または 8 に記載の医薬製剤を含むキット。

【請求項 2 1】

治療を必要とする患者において状態を治療する方法において使用するための医薬組成物であって、前記方法が、請求項 1 ~ 6 又は 1 2 ~ 1 4 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物を前記患者に投与することを含む、医薬組成物。

【請求項 2 2】

1 種以上の追加の治療剤であって、好ましくは、カルビドパ活性剤とは異なるデカルボキシラーゼ阻害（例えば、ベンセラシド）、カテコール - O - メチルトランスフェラーゼ（「COMT」）阻害剤（例えば、エンタカポンおよびトルカポン）、ならびにモノアミンオキシダーゼ A（「MAO - A」）またはモノアミンオキシダーゼ B（「MAO - B」）阻害剤（例えば、モクロベミド、ラサギリン、セレギリンおよびサフィナミド）などのパーキンソン病の治療のための治療剤を更に含む、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

30

【請求項 2 3】

前記方法が、前記医薬組成物を、前記患者に対して、経皮内視鏡胃瘻造設術により、例えば外部経腹管および内部腸管を用いて挿入された永久的な管によって小腸（例えば、十二指腸または空腸）などの腸管に直接投与することを含む、請求項 2 1 に記載の医薬組成物。

40

【請求項 2 4】

請求項 1 ~ 6 又は 1 2 ~ 1 4 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物を含む、鋼板。

50