

【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26年11月13日 (2014.11.13)

【公表番号】特表2013-543874(P2013-543874A)

【公表日】平成25年12月9日 (2013.12.9)

【年通号数】公開・登録公報2013-066

【出願番号】特願2013-540214(P2013-540214)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/381 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 47/04 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/381

A 6 1 P 25/16

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/04

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 47/12

【手続補正書】

【提出日】平成26年9月26日 (2014.9.26)

【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】

ロチゴチン又はその薬学的に許容可能な塩と少なくとも 1 つのポリ(ラクチド - c o - グリコリド)(P L G A)と少なくとも 1 つの炭素原子数 8 ~ 2 4 の脂肪酸とを含む組成物であって、

該少なくとも 1 つの P L G A の分子量が 5 0 0 0 D a ~ 1 0 0 0 0 0 D a であり、

該少なくとも 1 つの P L G A が、9 5 : 5 ~ 5 : 9 5 の範囲のラクチド対グリコリドの重合比を有し、

該組成物の総重量に対して、該ロチゴチン又はその薬学的に許容可能な塩が 2 0 重量% ~ 4 0 重量%であり、該少なくとも 1 つの P L G A が 4 5 重量% ~ 7 9 重量%であり、該少なくとも 1 つの脂肪酸が 1 重量% ~ 1 5 重量%である、ミクロスフェア組成物。

【請求項 2】

前記薬学的に許容可能な塩が無機酸又は有機酸とともに形成される、請求項 1 に記載のミクロスフェア組成物。

【請求項 3】

前記無機酸が塩酸、硫酸、リン酸及び硝酸から選ばれる、請求項 2 に記載のミクロスフェア組成物。

【請求項 4】

前記有機酸がクエン酸、フマル酸、マレイン酸、酢酸、安息香酸、乳酸、メタンスルホン酸、ナフタレンスルホン酸及びトルエン - p - スルホン酸から選ばれる、請求項 2 に記

載のミクロスフェア組成物。

【請求項 5】

前記有機酸が、グルタミン酸及びアスパラギン酸から選ばれる酸性アミノ酸である、請求項 2 に記載のミクロスフェア組成物。

【請求項 6】

前記組成物の総重量に対して、前記ロチゴチン又はその薬学的に許容可能な塩が 20 重量% ~ 40 重量% であり、前記少なくとも 1 つの PLGA が 57.5 重量% ~ 72.5 重量% であり、前記脂肪酸が 2.5 重量% ~ 7.5 重量% である、請求項 1 に記載のミクロスフェア組成物。

【請求項 7】

前記組成物の総重量に対して、前記ロチゴチン又はその薬学的に許容可能な塩が 20 重量% ~ 40 重量% であり、前記少なくとも 1 つの PLGA が 57.5 重量% ~ 77.5 重量% であり、前記脂肪酸が 2.5 重量% である、請求項 1 に記載のミクロスフェア組成物。

【請求項 8】

前記組成物の総重量に対して、前記ロチゴチン又はその薬学的に許容可能な塩が 30 重量% であり、前記少なくとも 1 つの PLGA が 55 重量% ~ 69 重量% であり、前記脂肪酸が 1 重量% ~ 15 重量% である、請求項 1 に記載のミクロスフェア組成物。

【請求項 9】

前記組成物の総重量に対して、前記ロチゴチン又はその薬学的に許容可能な塩が 30 重量% であり、前記少なくとも 1 つの PLGA が 62.5 重量% ~ 67.5 重量% であり、前記脂肪酸が 2.5 重量% ~ 7.5 重量% である、請求項 8 に記載のミクロスフェア組成物。

【請求項 10】

前記少なくとも 1 つの PLGA が、75 : 25 ~ 25 : 75 の範囲のラクチド対グリコリドの重合比を有する、請求項 1 に記載のミクロスフェア組成物。

【請求項 11】

前記少なくとも 1 つの PLGA が第 1 の PLGA と第 2 の PLGA とを含み、該第 1 の PLGA が 42000 Da ~ 75000 Da の分子量を有し、該第 2 の PLGA が 15000 Da ~ 35000 Da の分子量を有し、該第 1 の PLGA と該第 2 の PLGA との重量比が 95 : 5 ~ 5 : 95 である、請求項 1 に記載のミクロスフェア組成物。

【請求項 12】

前記第 1 の PLGA が PLGA (7525 4A) 及び PLGA (7525 5A) から選ばれ、前記第 2 の PLGA が PLGA (5050 2.5A) である、請求項 11 に記載のミクロスフェア組成物。

【請求項 13】

前記第 1 の PLGA と前記第 2 の PLGA との重量比が 50 : 50 である、請求項 11 に記載のミクロスフェア組成物。

【請求項 14】

前記組成物の総重量に対して、前記ロチゴチン又はその薬学的に許容可能な塩が 20 重量% ~ 40 重量% であり、前記第 1 の PLGA 及び前記第 2 の PLGA の量が 57.5 重量% ~ 72.5 重量% であり、前記脂肪酸が 2.5 重量% ~ 7.5 重量% である、請求項 11 に記載のミクロスフェア組成物。

【請求項 15】

前記組成物の総重量に対して、前記ロチゴチン又はその薬学的に許容可能な塩が 20 重量% ~ 40 重量% であり、前記第 1 の PLGA 及び前記第 2 の PLGA の量が 57.5 重量% ~ 77.5 重量% であり、前記脂肪酸が 2.5 重量% である、請求項 11 に記載のミクロスフェア組成物。

【請求項 16】

前記組成物の総重量に対して、前記ロチゴチン又はその薬学的に許容可能な塩が 30 重

量%であり、前記第1のPLGA及び前記第2のPLGAの量が55重量%～69重量%であり、前記脂肪酸が1重量%～15重量%である、請求項11に記載のミクロスフェア組成物。

【請求項17】

前記組成物の総重量に対して、前記ロチゴチン又はその薬学的に許容可能な塩が30重量%であり、前記第1のPLGA及び前記第2のPLGAの量が62.5重量%～67.5重量%であり、前記脂肪酸が2.5重量%～7.5重量%である、請求項16に記載のミクロスフェア組成物。

【請求項18】

前記組成物の総重量に対して、前記ロチゴチン又はその薬学的に許容可能な塩が30重量%であり、前記第1のPLGA及び前記第2のPLGAの量が67.5重量%であり、前記脂肪酸が2.5重量%である、請求項17に記載のミクロスフェア組成物。

【請求項19】

前記少なくとも1つの脂肪酸がステアリン酸、パルミチン酸、オレイン酸、デカン酸、オクタン酸及びリグノセリン酸から選ばれる、請求項1に記載のミクロスフェア組成物。

【請求項20】

前記少なくとも1つの脂肪酸がステアリン酸である、請求項19に記載のミクロスフェア組成物。

【請求項21】

パーキンソン病を治療するための医薬の製造における、請求項1～20のいずれか1項に記載のミクロスフェア組成物の使用。

【請求項22】

ドーパミン受容体に関連する疾患及び/又はパーキンソン病を治療するための医薬の製造における、請求項1～20のいずれか1項に記載のミクロスフェア組成物の使用。

【請求項23】

前記医薬が経口投与される、請求項22に記載の使用。