

【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3年2月4日(2021.2.4)

【公表番号】特表2020-503318(P2020-503318A)

【公表日】令和2年1月30日(2020.1.30)

【年通号数】公開・登録公報2020-004

【出願番号】特願2019-534375(P2019-534375)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/198 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 13/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/10 (2006.01)

A 6 1 K 9/16 (2006.01)

A 6 1 K 9/50 (2006.01)

A 6 1 K 9/107 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/16 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/198

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 13/00

A 6 1 P 31/00

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 9/16

A 6 1 K 9/50

A 6 1 K 9/107

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/16

A 6 1 K 47/32

【手続補正書】

【提出日】令和2年12月21日(2020.12.21)

【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】

(a) ドロキシドパ又はその薬学的に許容され得る塩及び放出制御剤を含む多粒子、並びに

(b) 液体ビヒクル

を含む、経口投与用の徐放性液体組成物。

【請求項 2】

前記液体ビヒクルが、7.0未満のpHを有する、請求項1に記載の液体組成物。

【請求項 3】

前記多粒子が、

(i) ドロキシドパ又はその薬学的に許容され得る塩及び任意に第1の放出制御剤を含む第1の多粒子、並びに

(ii) ドロキシドパ又はその薬学的に許容され得る塩及び第2の放出制御剤を含む第2の多粒子

を含む、請求項1又は2に記載の液体組成物。

【請求項 4】

前記第1の放出制御剤及び/又は前記第2の放出制御剤が、非ポリマー材料を含む、請求項3に記載の液体組成物。

【請求項 5】

前記第2の多粒子が、腸溶層をさらに含む、請求項3又は4に記載の液体組成物。

【請求項 6】

前記第1の多粒子が、前記組成物中のドロキシドパ又はその薬学的に許容され得る塩の総量の約20%～約40%を含み、前記第2の多粒子が、前記組成物中のドロキシドパ又はその薬学的に許容され得る塩の総量の約60%～約80%を含む、請求項3から5のいずれかに記載の液体組成物。

【請求項 7】

前記液体ビヒクルがpH調整剤を含み、前記pH調整剤が、前記組成物中のドロキシドパの安定性を高めるのに十分な量で存在する、請求項1に記載の液体組成物。

【請求項 8】

前記液体組成物が、溶液又は懸濁物である、請求項1から7のいずれかに記載の液体組成物。

【請求項 9】

前記液体組成物中の総量の14%又は56%の即放型のドロキシドパ又はその薬学的に許容され得る塩をさらに含む、請求項1から8のいずれかに記載の液体組成物。

【請求項 10】

5mL～100mLの単回用量の前記液体組成物中のドロキシドパ又はその薬学的に許容され得る塩の総量が、約100mg～約3000mgであり、任意に約100mg～約1800mgである、請求項1から9のいずれかに記載の液体組成物。

【請求項 11】

前記液体組成物が、被験体への経口投与後の約4～24時間又は約4～16時間という持続時間にわたって、前記被験体において約0.5µg/mL～5µg/mLのドロキシドパ血漿レベルをもたらす、請求項1から10のいずれかに記載の液体組成物。

【請求項 12】

前記多粒子が、水分保護層でコーティングされている、請求項1から11のいずれかに記載の液体組成物。

【請求項 13】

前記ドロキシドパ又はその薬学的に許容され得る塩が、前記液体ビヒクルへの懸濁後、少なくとも7日間にわたって安定である、請求項1から12のいずれかに記載の液体組成物。

【請求項 14】

有効量のドロキシドパ又はその薬学的に許容され得る塩及び放出制御剤を含む徐放性多粒子

を含む、経口投与用の固体医薬組成物。

【請求項 15】

前記固体組成物が、懸濁するためにボトル又はサシェに包装された、請求項 14 に記載の固体組成物。

【請求項 16】

37 及び 50 r p m の U S P I I 装置（パドル）において 1 時間で 20 % 超のドロキシドパが前記組成物から 0 . 1 N H C l 中に放出される、請求項 14 に記載の固体組成物。

【請求項 17】

（a）（i）ドロキシドパ又はその薬学的に許容され得る塩及び任意に第 1 の放出制御剤を含む第 1 の多粒子、並びに

（ii）ドロキシドパ又はその薬学的に許容され得る塩及び第 2 の放出制御剤を含む第 2 の多粒子

を含む多粒子を含む固体組成物、並びに

（b）液体ビヒクル

を含む、薬学的キット。

【請求項 18】

キャップ付きボトルの形態であって、
前記固体組成物が、前記ボトルのキャップ内のコンパートメントに保存されており、
前記液体ビヒクルが、前記ボトルに保存されている、
請求項 17 に記載のキット。

【請求項 19】

経口液体剤形を製造する方法であって、
請求項 18 に記載のキット内の固体組成物を液体ビヒクルと混ぜる工程であって、前記液体剤形を製造する、工程
を含み、前記組成物を前記液体ビヒクル中に放出するために前記ボトルのキャップ内のコンパートメントを開封することにより、前記固体組成物が液体ビヒクルと混ざる、方法。

【請求項 20】

被験体を処置するために被験体に経口投与される医薬組成物であって、
有効量の請求項 1 から 13 のいずれか一項に記載の液体組成物を含み、前記被験体が、低血圧、神経原性起立性低血圧（nOH）、透析中低血圧、パーキンソン病症状、パーキンソン病に伴う起立性低血圧、パーキンソン病に伴う体位不安定、体位性起立性頻拍症候群（POTS）、ダウン症候群、脱髄性疾患、アルツハイマー病、注意欠陥障害、睡眠過剰、線維筋痛症に伴う疼痛、運動麻痺、運動性失語、尿失禁、認知症、抗利尿、体位性頻拍症候群、タウオパチー、疲労、頭痛、脳虚血、頭蓋内圧亢進もしくは脳浮腫によって誘導される神経障害もしくは神経細胞死、癌、排尿、鼻閉、急性疼痛、慢性疼痛を誘導もしくは促進する細菌感染症、又はそれらの任意の組み合わせの処置を必要とする、医薬組成物。