

【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 2 年 7 月 30 日 (2020.7.30)

【公表番号】特表 2019-524727 (P2019-524727A)

【公表日】令和 1 年 9 月 5 日 (2019.9.5)

【年通号数】公開・登録公報 2019-036

【出願番号】特願 2019-501566 (P2019-501566)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/198	(2006.01)
A 6 1 K	9/16	(2006.01)
A 6 1 K	9/48	(2006.01)
A 6 1 K	9/20	(2006.01)
A 6 1 K	9/30	(2006.01)
A 6 1 K	47/38	(2006.01)
A 6 1 K	47/32	(2006.01)
A 6 1 K	47/44	(2017.01)
A 6 1 K	47/10	(2006.01)
A 6 1 K	9/56	(2006.01)
A 6 1 K	47/36	(2006.01)
A 6 1 K	47/04	(2006.01)
A 6 1 K	47/42	(2017.01)
A 6 1 K	47/14	(2006.01)
A 6 1 K	47/12	(2006.01)
A 6 1 K	31/48	(2006.01)
A 6 1 K	31/428	(2006.01)
A 6 1 K	31/4045	(2006.01)
A 6 1 K	31/506	(2006.01)
A 6 1 K	31/277	(2006.01)
A 6 1 K	31/13	(2006.01)
A 6 1 K	31/44	(2006.01)
A 6 1 K	31/06	(2006.01)
A 6 1 K	31/485	(2006.01)
A 6 1 K	31/167	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 K	31/473	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/198
A 6 1 K	9/16
A 6 1 K	9/48
A 6 1 K	9/20
A 6 1 K	9/30
A 6 1 K	47/38
A 6 1 K	47/32
A 6 1 K	47/44
A 6 1 K	47/10
A 6 1 K	9/56
A 6 1 K	47/36
A 6 1 K	47/04

A 6 1 K	47/42	
A 6 1 K	47/14	
A 6 1 K	47/12	
A 6 1 K	31/48	
A 6 1 K	31/428	
A 6 1 K	31/4045	
A 6 1 K	31/506	
A 6 1 K	31/277	
A 6 1 K	31/13	
A 6 1 K	31/44	
A 6 1 K	31/06	
A 6 1 K	31/485	
A 6 1 K	31/167	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 K	31/473	
A 6 1 P	43/00	1 2 1

【手続補正書】**【提出日】** 令和2年6月15日 (2020.6.15)**【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】**

i) レボドパを含む第 1 の拍動性放出成分であって、前記第 1 の拍動性放出成分が所定の遅延時間に続いてレボドパのパルス放出をもたらす、第 1 の拍動性放出成分と、

i i) ドパデカルボキシラーゼ阻害剤を含む第 2 の拍動性放出成分であって、前記第 2 の拍動性放出成分が所定の遅延時間に続いて前記ドパデカルボキシラーゼ阻害剤のパルス放出をもたらす、第 2 の拍動性放出成分と

を別々にまたは共に含む拍動性放出医薬組成物であって、

任意選択で、レボドパを含む前記第 1 の拍動性放出成分の遅延時間がドパデカルボキシラーゼ阻害剤を含む前記第 2 の拍動性放出成分の遅延時間よりも長い、拍動性放出医薬組成物。

【請求項 2】

前記ドパデカルボキシラーゼ阻害剤がカルビドパ、ベンセラジド、メチルドパおよび D F M D (α-ジフルオロメチルドパ)、またはその薬学的に許容される誘導体からなる群から選択される、請求項 1 に記載の拍動性放出医薬組成物。

【請求項 3】

前記レボドパがレボドパメチルエステルおよび X P 2 1 2 7 9 などのレボドパプロドラッグを含むがこれらに限定されない、レボドパの薬学的に許容される誘導体と、重水素化レボドパなどの改変レボドパとを含む、請求項 1 または請求項 2 に記載の拍動性放出医薬組成物。

【請求項 4】

前記拍動性放出医薬組成物が多粒子剤形である、請求項 1 ～ 3 のいずれか 一項 に記載の拍動性放出医薬組成物。

【請求項 5】

i) レボドパを含む前記第 1 の拍動性放出成分の遅延時間が 2 ～ 8 時間の間、例えば 2

～3時間など、3～4時間など、4～5時間など、5～6時間など、6～7時間など、7～8時間などであり、および／または

i i) ドパデカルボキシラーゼ阻害剤を含む前記第2の拍動性放出成分の遅延時間が2～8時間の間、例えば2～3時間など、3～4時間など、4～5時間など、5～6時間など、6～7時間など、7～8時間などである、

請求項1～4のいずれか一項に記載の拍動性放出医薬組成物。

【請求項6】

レボドパを含む第1の剤形の遅延時間がドパデカルボキシラーゼ阻害剤を含む第2の剤形の遅延時間よりも5分～90分長い、例えば5～10分長いなど、10～15分長いなど、15～20分長いなど、20～25分長いなど、25～30分長いなど、30～35分長いなど、35～40分長いなど、40～45分長いなど、45～50分長いなど、50～55分長いなど、55～60分長いなど、60～65分長いなど、65～70分長いなど、70～75分長いなど、75～80分長いなど、80～85分長いなど、85～90分長いなどである、請求項1～5のいずれか一項に記載の拍動性放出医薬組成物。

【請求項7】

医薬品剤形が、錠剤、ミニ錠剤、マイクロ錠剤、スフェア剤、ペレット剤、顆粒剤およびカプセル剤からなる群から選択され、例えばコーティング錠剤、コーティングミニ錠剤、コーティングマイクロ錠剤、コーティングスフェア剤、コーティングペレット剤、コーティング顆粒剤およびコーティングカプセル剤からなる群から選択される、請求項1～6のいずれか一項に記載の拍動性放出医薬組成物。

【請求項8】

前記医薬品剤形が可溶性で膨潤性のコアなどの、溶性コアと、コーティングを含む、請求項1～7のいずれか一項に記載の拍動性放出医薬組成物。

【請求項9】

前記拍動性放出医薬組成物が

i) 半透不溶性コーティング、または

i i) 破裂可能な不溶性コーティング

などの、不溶性コーティングである、請求項1～8のいずれか一項に記載の拍動性放出医薬組成物。

【請求項10】

前記不溶性コーティングがフィルム形成ポリマーおよび／または水不溶性ポリマーを含み、任意選択で、前記フィルム形成ポリマーおよび／または水不溶性ポリマーがエチルセルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、酢酸セルロース、アクリルポリマー、腸溶性ポリマー、ヒプロメロース酢酸エステルコハク酸エステル、シェラック、ワックスおよびエチルセルロース分散剤からなる群から選択される、請求項1～9のいずれか一項に記載の拍動性放出医薬組成物。

【請求項11】

前記拍動性放出医薬組成物が半透過性不溶性コーティングを含み、前記半透過性不溶性コーティングが水不溶性ポリマーと親水性ポア形成剤などのポア形成剤とを含み、任意選択で、前記ポア形成剤がポリビニルアルコール（PVA）、ヒドロキシプロピルメチルセルロース（HPMC）、ポリビニルピロリドン（PVP）およびポリエチレングリコール（PEG）からなる群から選択される、請求項1～10のいずれか一項に記載の拍動性放出医薬組成物。

【請求項12】

前記拍動性放出医薬組成物が水溶性または浸食性のコーティングを含む、請求項1～11のいずれか一項に記載の拍動性放出医薬組成物。

【請求項13】

前記第1の拍動性放出成分が

i) 25～75重量%のレボドパ、例えば25～30重量%など、30～35重量%など、35～40重量%など、40～45重量%など、45～50重量%など、50～55

重量%など、60～65重量%など、65～70重量%など、70～75重量%などのレボドパと、

i i) 15～50重量%の超崩壊剤、例えば15～20重量%など、20～25重量%など、25～30重量%など、30～35重量%など、35～40重量%など、40～45重量%など、45～50重量%などの超崩壊剤と、

i i i) 10～50重量%の賦形剤、例えば10～15重量%など、15～20重量%など、20～25重量%など、25～30重量%など、30～35重量%など、35～40重量%など、40～45重量%など、45～50重量%などの賦形剤と、

i v) 0～2重量%の抗付着剤、例えば0.25～0.50重量%など、0.50～0.75重量%など、0.75～1.0重量%など、1.0～1.25など、1.25～1.50など、1.50～1.75重量%など、1.75～2.0重量%などの抗付着剤とを含むまたはこれらからなる、ミニ錠剤コアと、

コーティング、

を含むコーティングミニ錠剤である、請求項1～12のいずれか一項に記載の拍動性放出医薬組成物。

【請求項14】

前記第2の拍動性放出成分が

i) 25～75重量%のドパデカルボキシラーゼ阻害剤、例えば25～30重量%など、30～35重量%など、35～40重量%など、40～45重量%など、45～50重量%など、50～55重量%など、60～65重量%など、65～70重量%など、70～75重量%などのドパデカルボキシラーゼ阻害剤と、

i i) 15～50重量%の超崩壊剤、例えば15～20重量%など、20～25重量%など、25～30重量%など、30～35重量%など、35～40重量%など、40～45重量%など、45～50重量%などの超崩壊剤と、

i i i) 10～50重量%の賦形剤、例えば10～15重量%など、15～20重量%など、20～25重量%など、25～30重量%など、30～35重量%など、35～40重量%など、40～45重量%など、45～50重量%などの賦形剤と、

i v) 0～2重量%の抗付着剤、例えば0.25～0.50重量%など、0.50～0.75重量%など、0.75～1.0重量%など、1.0～1.25など、1.25～1.50など、1.50～1.75重量%など、1.75～2.0重量%などの抗付着剤とを含むまたはこれらからなるミニ錠剤コアと、

コーティング

を含むコーティングミニ錠剤である、請求項1～13のいずれかに記載の拍動性放出医薬組成物。

【請求項15】

前記拍動性放出医薬組成物が1種または複数種のさらなる医薬品有効成分を、別々にまたは共に、さらに含み、任意選択で、

前記さらなる医薬品有効成分がドーパミン；プロモクリプチン、ペルゴリド、プラミペキソール、ロピニロール、ピリベジル、カベルゴリン、アポモルフィネ、リスリド、およびその誘導体などのドーパミン受容体アゴニスト；例えばトルカポンおよびエンタカポンなどのカテコール-O-メチルトランスフェラーゼ（COMT）阻害剤；アポモルフィネ注射などのアポモルフィネ；アマンタジン（Symmetrel）などのNMDAアンタゴニスト；セレギリンおよびラサギリンなどのMAO-B阻害剤；セロトニン受容体モジュレーター；TRK-820（（E）-N-[17-シクロプロピルメチル]-4,5α-エポキシ-3,14-ジヒドロキシモルフィナン-6β-イル）-3-（フラン-3-イル）-N-メチルプロパー-2-エナミド塩酸塩）などのκオピオイド受容体アゴニスト；GABAモジュレーター；フルビルチンおよびレチガビンなどの神経カリウムチャネルのモジュレーター；グルタミン酸受容体モジュレーター；レボドパを含む即放性製品ならびにレボドパを含む制御放出性製品からなる群から選択される、請求項1～14のいずれか一項に記載の拍動性放出医薬組成物。

【請求項 16】

パーキンソン病患者における朝の無動状態の治療での使用のための拍動性放出医薬組成物であって、任意選択で、前記医薬組成物が睡眠の前に投与される、請求項 1 ～ 15 のいずれか一項に記載の拍動性放出医薬組成物。