

【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30年11月8日 (2018.11.8)

【公表番号】特表2017-530195(P2017-530195A)

【公表日】平成29年10月12日 (2017.10.12)

【年通号数】公開・登録公報2017-039

【出願番号】特願2017-536991(P2017-536991)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/27	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 K	31/439	(2006.01)
A 6 1 K	31/485	(2006.01)
A 6 1 K	31/13	(2006.01)
A 6 1 K	31/451	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 K	9/08	(2006.01)
A 6 1 K	47/12	(2006.01)
A 6 1 K	47/38	(2006.01)
A 6 1 K	47/32	(2006.01)
A 6 1 K	47/34	(2017.01)
A 6 1 K	47/36	(2006.01)
A 6 1 K	47/42	(2017.01)
A 6 1 K	47/10	(2006.01)
A 6 1 K	47/46	(2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K	31/27	
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 K	31/439	
A 6 1 K	31/485	
A 6 1 K	31/13	
A 6 1 K	31/451	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 K	9/08	
A 6 1 K	47/12	
A 6 1 K	47/38	
A 6 1 K	47/32	
A 6 1 K	47/34	
A 6 1 K	47/36	
A 6 1 K	47/42	
A 6 1 K	47/10	
A 6 1 K	47/46	

【手続補正書】

【提出日】平成30年9月25日(2018.9.25)

【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】

リバスチグミン又は薬学的に許容されるその塩、pH調節剤、及び増粘剤を含む徐放性鼻腔投与水性製剤であって、

リバスチグミンが、製剤全体の0.5質量%から1.5質量%を構成し、
増粘剤が、製剤全体の0.1質量%から2質量%を構成し、

製剤のpHが、3から6の範囲にある徐放性鼻腔投与水性製剤。

【請求項2】

リバスチグミンが、リバスチグミン遊離塩基又は酒石酸リバスチグミンである、請求項1に記載の水性製剤。

【請求項3】

pH調節剤が、クエン酸緩衝剤又はクエン酸から選択される、請求項1又は2に記載の水性製剤。

【請求項4】

pH調節剤が、製剤全体の0.01質量%から2質量%の量である、請求項1～3のいずれか一項に記載の水性製剤。

【請求項5】

増粘剤が、メチルセルロース、エチルセルロース、ヒドロキシエチルセルロース、ヒドロキシルプロピルセルロース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、カルボキシメチルセルロースナトリウム；ポリアクリル酸ポリマー、ポリヒドロキシエチルメチルアクリレート；ポリエチレンオキシド；ポリビニルピロリドン；ポリビニルアルコール、トラガント、アルギン酸ナトリウム、グアーガム、キサンタンガム、レクチン、水溶性デンプン、ゼラチン、ペクチン、及びキトサンから選択される、請求項1～4のいずれか一項に記載の水性製剤。

【請求項6】

少なくとも60%と等価なリバスチグミンの絶対的生物学的利用能(F)をもたらす、請求項1～5のいずれか一項に記載の水性製剤。

【請求項7】

感覚剤を更に含む、請求項1～6のいずれか一項に記載の水性製剤。

【請求項8】

感覚剤が、 $C_2 \sim C_4$ のアルコール、メントール、テルペン、チモール、カンファー、トウガラシ、フェノール、カルベオール(carveol)、メントールグルクロニド、ユーカリ油、ベンジルアルコール、サリチルアルコール(salicyl alcohol)、エタノール、イソプロパノール、クローブ花蕾油(clove bud oil)、ミント、スペアミント、ペパーミント、ユーカリ、ラベンダー、シトラス、レモン、ライム、ヘキシルレゾルシノール、ケタール、ジオール、及びそれらの混合物から選択される、請求項7に記載の水性製剤。

【請求項9】

感覚剤が、製剤全体の1質量%から1.5質量%の量である、請求項7又は8に記載の水性製剤。

【請求項10】

シグマ-1受容体アゴニスト、NMDAアンタゴニスト、ニコチン酸アセチルコリン受容体アゴニスト、及びそれらの組合せから選択される追加の治療剤を更に含む、請求項1～9のいずれか一項に記載の水性製剤。

【請求項11】

追加の治療剤が、デキストロメトर्फアン、メマンチン、イフェンプロジル、エンセニクリン、又は薬学的に許容されるそれらの誘導体から選択される、請求項 1 0 に記載の水性製剤。

【請求項 1 2】

哺乳動物において神経変性疾患を治療するための請求項 1 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の鼻腔投与水性製剤であって、それを必要とする哺乳動物に投与されるものである、鼻腔投与水性製剤。

【請求項 1 3】

前記神経変性疾患が、アルツハイマー病、パーキンソン病、及び認知機能障害症候群から選択される、請求項 1 2 に記載の鼻腔投与水性製剤。

【請求項 1 4】

哺乳動物のリバスチグミン血漿中濃度 (C_{max}) が、少なくとも 5 0 0 0 p g / m L となるように投与するために用いられる、請求項 1 2 又は 1 3 に記載の鼻腔投与水性製剤。

【請求項 1 5】

哺乳動物の治療的リバスチグミン血漿中濃度 (C_{ther}) が、2 0 0 0 p g / m L から 2 0 , 0 0 0 p g / m L の範囲にあるように投与するために用いられる、請求項 1 2 又は 1 3 に記載の鼻腔投与水性製剤。

【請求項 1 6】

前記治療的リバスチグミン血漿中濃度が、少なくとも 4 時間のあいだ維持される (T_{maint})、請求項 1 4 に記載の鼻腔投与水性製剤。

【請求項 1 7】

鼻腔内投与が、副作用の発生が減少されることに関連する、請求項 1 4 又は 1 5 に記載の鼻腔投与水性製剤。

【請求項 1 8】

それを必要とする哺乳動物において神経変性疾患の治療をするための鼻腔投与製剤の調製におけるリバスチグミン又は薬学的に許容されるその塩、pH調節剤、及び増粘剤の使用であって、

鼻腔投与製剤がリバスチグミン又は薬学的に許容されるその塩、pH調節剤、及び増粘剤を含み、

リバスチグミンが、製剤全体の 0 . 5 質量%から 1 5 質量%を構成し、

増粘剤が、製剤全体の 0 . 1 質量%から 2 質量%を構成し、

前記鼻腔投与製剤が 3 から 6 の範囲にある pH を有する、使用。

【請求項 1 9】

前記製剤が、少なくとも 6 0 % と等価なリバスチグミンの絶対的生物学的利用能 (F) をもたらすものである、請求項 1 8 に記載の使用。

【請求項 2 0】

神経変性疾患が、アルツハイマー病、パーキンソン病、及び認知機能障害症候群から選択される、請求項 1 8 又は 1 9 に記載の使用。