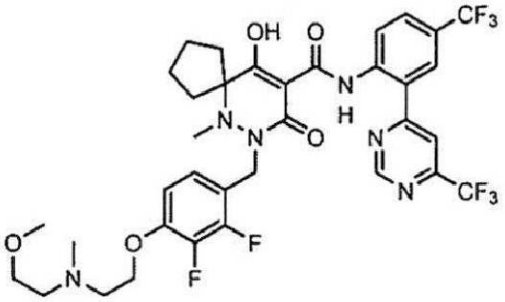
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和7年6月17日(2025.6.17)

【国際公開番号】WO2022/260064
【出願番号】特願2023-527886(P2023-527886)
【国際特許分類】
Ａ６１Ｋ 31/506(2006.01)
Ａ６１Ｋ 47/14(2017.01)
Ａ６１Ｋ 47/12(2006.01)
Ａ６１Ｋ 47/04(2006.01)
Ａ６１Ｋ 47/26(2006.01)
Ａ６１Ｋ 47/36(2006.01)
Ａ６１Ｋ 47/38(2006.01)
Ａ６１Ｋ 47/20(2006.01)
Ａ６１Ｋ 47/32(2006.01)
Ａ６１Ｋ 9/14(2006.01)
Ａ６１Ｋ 9/16(2006.01)
Ａ６１Ｋ 9/20(2006.01)
Ａ６１Ｋ 9/48(2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00(2006.01)
Ａ６１Ｐ 3/00(2006.01)
Ａ６１Ｐ 7/00(2006.01)
【ＦＩ】
Ａ６１Ｋ 31/506
Ａ６１Ｋ 47/14
Ａ６１Ｋ 47/12
Ａ６１Ｋ 47/04
Ａ６１Ｋ 47/26
Ａ６１Ｋ 47/36
Ａ６１Ｋ 47/38
Ａ６１Ｋ 47/20
Ａ６１Ｋ 47/32
Ａ６１Ｋ 9/14
Ａ６１Ｋ 9/16
Ａ６１Ｋ 9/20
Ａ６１Ｋ 9/48
Ａ６１Ｐ 43/00 １１１
Ａ６１Ｐ 3/00
Ａ６１Ｐ 7/00

【手続補正書】
【提出日】令和7年6月9日(2025.6.9)
【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】

式１

【化１】



で表される化合物、もしくはその塩またはそれらの溶媒和物、および崩壊剤を含み、

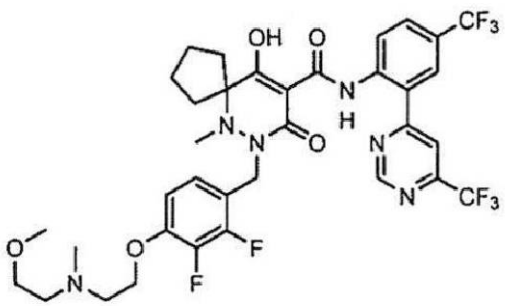
崩壊剤の量が、該組成物の全体の重量に対して１２重量％以上であり、

崩壊剤が、クロスカルメロースナトリウム、カルメロースナトリウム、ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロース、カルメロースカルシウム、メチルセルロース、結晶セルロース、ラウリル硫酸ナトリウム、ポビドン、およびポリソルベートからなる群から選択される、医薬組成物。

【請求項２】

式１

【化２】



で表される化合物、もしくはその塩またはそれらの溶媒和物を含み、

該化合物、もしくはその塩またはそれらの溶媒和物の体積基準粒子径が、d_{10}が４．００μｍ未満、d_{50}が５．００μｍ未満、またはd_{90}が１０．００μｍ未満である、医薬組成物。

【請求項３】

崩壊剤をさらに含み、崩壊剤が、クロスカルメロースナトリウム、カルメロースナトリウム、ヒドロキシプロピルセルロース、カルメロース、カルメロースカルシウム、メチルセルロース、結晶セルロース、ラウリル硫酸ナトリウム、ポビドン、およびポリソルベートからなる群から選択される、請求項２に記載の医薬組成物。

【請求項４】

滑沢剤をさらに含む、請求項１～３に記載の医薬組成物。

【請求項５】

賦形剤をさらに含む、請求項１～３に記載の医薬組成物。

【請求項６】

前記医薬組成物全体に対し、前記滑沢剤を５．３重量％以上含有する、請求項４に記載の医薬組成物。

【請求項７】

前記医薬組成物全体に対し、前記賦形剤を２５重量％以上含有する、請求項５に記載の医薬組成物。

【請求項８】
前記医薬組成物全体に対し、前記崩壊剤を１２重量％以上含有する、請求項３に記載の医薬組成物。
【請求項９】
前記滑沢剤として、フマル酸ステアリルナトリウム、ステアリン酸亜鉛、ステアリン酸アルミニウム、ステアリン酸カルシウム、ステアリン酸マグネシウム、タルク、およびショ糖脂肪酸エステルからなる群から選択される滑沢剤を少なくとも１つ含む、請求項４に記載の医薬組成物。
【請求項１０】
前記賦形剤として、マンニトール、乳糖水和物、果糖、ブドウ糖、ソルビトール、トウモロコシデンプン、馬鈴薯デンプン、コムギデンプン、およびコメデンプンからなる群から選択される賦形剤を少なくとも１つ含む、請求項５に記載の医薬組成物。
【請求項１１】
崩壊剤が、クロスカルメロースナトリウム、またはカルメロースナトリウムである、請求項１又は３に記載の医薬組成物。
【請求項１２】
前記医薬組成物全体に対し、式１で表される化合物、もしくはその塩またはそれらの溶媒和物を５重量％以上５０重量％以下の範囲で含有する、請求項１～３のいずれか一項に記載の医薬組成物。
【請求項１３】
式１で表される化合物、もしくはその塩またはそれらの溶媒和物が、式１で表される化合物のｐ－トルエンスルホン酸塩である、請求項１～３のいずれか一項に記載の医薬組成物。
【請求項１４】
式１で表される化合物のｐ－トルエンスルホン酸塩が、１型結晶である、請求項１～３のいずれか一項に記載の医薬組成物。
【請求項１５】
請求項１～３のいずれか一項に記載の医薬組成物を含有する、医薬製剤。
【請求項１６】
前記医薬製剤が、粉剤、散剤、顆粒剤、錠剤、およびカプセル剤からなる群から選択される、請求項１３に記載の医薬製剤。
【請求項１７】
医薬製剤がカプセル剤である、請求項１５に記載の医薬製剤。
【請求項１８】
有効成分である式１で表される化合物のｐ－トルエンスルホン酸塩を１型結晶として含有し、さらにマンニトール、クロスカルメロースナトリウム、およびフマル酸ステアリルナトリウムを含有するカプセル剤の形態である、請求項１～３のいずれか一項に記載の医薬組成物。
【請求項１９】
式１で表される化合物、もしくはその塩またはそれらの溶媒和物、および崩壊剤を混合し、滑沢剤および／または賦形剤を一緒に混合してもよく、混合物を得ること、を含む、請求項１～３のいずれか一項に記載の医薬組成物の製造方法。
【手続補正２】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００８７
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００８７】
［２－４０］結晶の粉末Ｘ線回折パターンが
４．９°、９．４°および９．９°（±０．２°）、

４．９°、９．４°および１５．２°（±０．２°）、
４．９°、９．４°および１５．８°（±０．２°）、
４．９°、９．４°および１８．９°（±０．２°）、
４．９°、９．４°および２２．６°（±０．２°）、
４．９°、９．９°および１５．２°（±０．２°）、
４．９°、９．９°および１５．８°（±０．２°）、
４．９°、９．９°および１８．９°（±０．２°）、
４．９°、９．９°および２２．６°（±０．２°）、
４．９°、１５．２°および１５．８°（±０．２°）、
４．９°、１５．２°および１８．９°（±０．２°）、
４．９°、１５．２°および２２．６°（±０．２°）、
４．９°、１５．８°および１８．９°（±０．２°）、
４．９°、１５．８°および２２．６°（±０．２°）、
４．９°、１８．９°および２２．６（±０．２°）°、
９．４°、９．９°および１５．２°（±０．２°）、
９．４°、９．９°および１５．８°（±０．２°）、
９．４°、９．９°および１８．９°（±０．２°）、
９．４°、９．９°および２２．６°（±０．２°）、
９．４°、１５．２°および１５．８°（±０．２°）、
９．４°、１５．２°および１８．９°（±０．２°）、
９．４°、１５．２°および２２．６°（±０．２°）、
９．４°、１５．８°および１８．９°（±０．２°）、
９．４°、１５．８°および２２．６°（±０．２°）、
９．４°、１８．９°および２２．６°（±０．２°）、
９．９°、１５．２°および１５．８°（±０．２°）、
９．９°、１５．２°および１８．９°（±０．２°）、
９．９°、１５．２°および２２．６°（±０．２°）、
９．９°、１５．８°および１８．９°（±０．２°）、
９．９°、１５．８°および２２．６°（±０．２°）、
９．９°、１８．９°および２２．６°（±０．２°）、
１５．２°、１５．８°および１８．９°（±０．２°）、
１５．２°、１５．８°および２２．６°（±０．２°）、
１５．２°、１８．９°および２２．６°（±０．２°）、または
１５．８°、１８．９°および２２．６°（±０．２°）の回折角（２θ）にピークを有する、［２－３９］に記載の医薬製剤。

【手続補正３】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００９１
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００９１】
［２－４４］結晶の粉末Ｘ線回折パターンが
４．９°、９．４°、９．９°、１５．２°および１５．８°（±０．２°）、
４．９°、９．４°、９．９°、１５．２°および１８．９°（±０．２°）、
４．９°、９．４°、９．９°、１５．２°および２２．６°（±０．２°）、
４．９°、９．４°、９．９°、１５．８°および１８．９°（±０．２°）、
４．９°、９．４°、９．９°、１５．８°および２２．６°（±０．２°）、
４．９°、９．４°、９．９°、１８．９°および２２．６°（±０．２°）、
４．９°、９．４°、１５．２°、１５．８°および１８．９°（±０．２°）、
４．９°、９．４°、１５．２°、１５．８°および２２．６°（±０．２°）、

４．９°、９．４°、１５．２°、１８．９°および２２．６°（±０．２°）、
４．９°、９．４°、１５．８°、１８．９°および２２．６°（±０．２°）、
４．９°、９．９°、１５．２°、１５．８°および１８．９°（±０．２°）、
４．９°、９．９°、１５．２°、１５．８°および２２．６°（±０．２°）、
４．９°、９．９°、１５．２°、１８．９°および２２．６°（±０．２°）、
４．９°、９．９°、１５．８°、１８．９°および２２．６°（±０．２°）、
４．９°、１５．２°、１５．８°、１８．９°および２２．６°（±０．２°）、
９．４°、９．９°、１５．２°、１５．８°および１８．９°（±０．２°）、
９．４°、９．９°、１５．２°、１５．８°および２２．６°（±０．２°）、
９．４°、９．９°、１５．２°、１８．９°および２２．６°（±０．２°）、
９．４°、９．９°、１５．８°、１８．９°および２２．６°（±０．２°）、
９．４°、１５．２°、１５．８°、１８．９°および２２．６°（±０．２°）、または
９．９°、１５．２°、１５．８°、１８．９°および２２．６°（±０．２°）、の回折角（２θ）にピークを有する、［２－４３］に記載の医薬製剤。

【手続補正４】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】０１５８
【補正方法】変更
【補正の内容】
【０１５８】
本明細書において、化合物Ｉの１重量部に対する滑沢剤の比率は、下限として、０．１０重量部、０．１３重量部、または０．１５重量部が例示され、上限として、０．９０重量部、０．８７重量部、または０．８５重量部が例示される。下限として０．１５重量部が好ましく、上限として０．８５重量部が好ましい。好ましい比率の範囲は、０．１０重量部以上０．９０重量部以下の範囲、０．１３重量部以上０．８７重量部以下の範囲が例示され、より好ましくは、０．１５重量部以上０．８５重量部以下の範囲である。好ましい滑沢剤の例として、フマル酸ステアリルナトリウム、またはステアリン酸マグネシウム、さらに好ましい滑沢剤の例として、フマル酸ステアリルナトリウムが挙げられる。

【手続補正５】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００８６
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００８６】
［２－３９］結晶の粉末Ｘ線回折パターンが、４．９°、９．４°、９．９°、１５．２°、１５．８°、１８．９°、および２２．６°（±０．２°）からなる群から選択される少なくとも３つの回折角（２θ）にピークを有する、［２－３４］～［２－３８］のいずれかに記載の医薬製剤。

【手続補正６】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００８８
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００８８】
［２－４１］結晶の粉末Ｘ線回折パターンが、４．９°、９．４°、９．９°、１５．２°、１５．８°、１８．９°、および２２．６°（±０．２°）からなる群から選択される少なくとも４つの回折角（２θ）にピークを有する、［２－３４］～［２－４０］のいずれかに記載の医薬製剤。

【手続補正７】

【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００９０
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００９０】
［２－４３］結晶の粉末Ｘ線回折パターンが、４．９°、９．４°、９．９°、１５．２°、１５．８°、１８．９°、および２２．６°（±０．２°）からなる群から選択される少なくとも５つの回折角（２θ）にピークを有する、［２－３４］～［２－４２］のいずれかに記載の医薬製剤。
【手続補正８】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００９２
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００９２】
［２－４５］結晶の粉末Ｘ線回折パターンが、４．９°、９．４°、９．９°、１５．２°、１５．８°、１８．９°、および２２．６°（±０．２°）からなる群から選択される少なくとも６つの回折角（２θ）にピークを有する、［２－３４］～［２－４４］のいずれかに記載の医薬製剤。
【手続補正９】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００９４
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００９４】
［２－４７］結晶の粉末Ｘ線回折パターンが、４．９°、９．４°、９．９°、１５．２°、１５．８°、１８．９°、および２２．６°（±０．２°）の回折角（２θ）にピークを有する、［２－３４］～［２－４６］のいずれかに記載の医薬製剤。
【手続補正１０】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００９５
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００９５】
［２－４８］式１で表される化合物のｐ－トルエンスルホン酸塩の結晶の体積基準粒子径が、d_{10}が５．７６μｍ未満、d_{50}が８．８１μｍ未満、またはd_{90}が１３．０８μｍ未満である、［２－３４］～［２－４７］のいずれかに記載の医薬製剤。
【手続補正１１】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００９６
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００９６】
［２－４９］式１で表される化合物のｐ－トルエンスルホン酸塩の結晶の体積基準粒子径が、d_{10}が５．００μｍ以下、d_{50}が８．００μｍ以下、またはd_{90}が１２．００μｍ以下である、［２－３４］～［２－４８］のいずれかに記載の医薬製剤。
【手続補正１２】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００９７
【補正方法】変更

【補正の内容】
【００９７】
［２－５０］式１で表される化合物のｐ－トルエンスルホン酸塩の結晶の体積基準粒子径が、ｄ$_{10}$が４．００μｍ以下、ｄ$_{50}$が６．００μｍ以下、またはｄ$_{90}$が１１．００μｍ以下である、［２－３４］～［２－４９］のいずれかに記載の医薬製剤。
【手続補正１３】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００９８
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００９８】
［２－５１］式１で表される化合物のｐ－トルエンスルホン酸塩の結晶の体積基準粒子径が、ｄ$_{10}$が３．００μｍ以下、ｄ$_{50}$が５．００μｍ以下、またはｄ$_{90}$が８．００μｍ以下である、［２－３４］～［２－５０］のいずれかに記載の医薬製剤。
【手続補正１４】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００９９
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００９９】
［２－５２］式１で表される化合物のｐ－トルエンスルホン酸塩の結晶の体積基準粒子径が、ｄ$_{10}$が１．００μｍ以上５．７６μｍ未満の範囲、ｄ$_{50}$が２．３０μｍ以上８．８１μｍ未満の範囲、またはｄ$_{90}$が４．３０μｍ以上１３．０８μｍ未満の範囲である、［２－３４］～［２－５１］のいずれかに記載の医薬製剤。
【手続補正１５】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】０１００
【補正方法】変更
【補正の内容】
【０１００】
［２－５３］式１で表される化合物のｐ－トルエンスルホン酸塩の結晶の体積基準粒子径が、ｄ$_{10}$が１．２０μｍ以上５．７６μｍ未満の範囲、ｄ$_{50}$が２．４０μｍ以上８．８１μｍ未満の範囲、またはｄ$_{90}$が４．５０μｍ以上１３．０８μｍ未満の範囲である、［２－３４］～［２－５２］のいずれかに記載の医薬製剤。
【手続補正１６】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】０１０１
【補正方法】変更
【補正の内容】
【０１０１】
［２－５４］式１で表される化合物のｐ－トルエンスルホン酸塩の結晶の体積基準粒子径が、ｄ$_{10}$が１．３０μｍ以上５．７６μｍ未満の範囲、ｄ$_{50}$が２．５０μｍ以上８．８１μｍ未満の範囲、またはｄ$_{90}$が４．７０μｍ以上１３．０８μｍ未満の範囲である、［２－３４］～［２－５３］のいずれかに記載の医薬製剤。
【手続補正１７】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】０１０２
【補正方法】変更
【補正の内容】
【０１０２】

［２－５５］式１で表される化合物のｐ－トルエンスルホン酸塩の結晶の体積基準粒子径が、ｄ１０が５．７６μｍ未満、ｄ５０が８．８１μｍ未満、およびｄ９０が１３．０８μｍ未満である、［２－３４］～［２－５４］のいずれかに記載の医薬製剤。

【手続補正１８】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】０１０３
【補正方法】変更
【補正の内容】
【０１０３】
［２－５６］式１で表される化合物のｐ－トルエンスルホン酸塩の結晶の体積基準粒子径が、ｄ１０が５．００μｍ以下、ｄ５０が８．００μｍ以下、およびｄ９０が１２．００μｍ以下である、［２－３４］～［２－５５］のいずれかに記載の医薬製剤。

【手続補正１９】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】０１０４
【補正方法】変更
【補正の内容】
【０１０４】
［２－５７］式１で表される化合物のｐ－トルエンスルホン酸塩の結晶の体積基準粒子径が、ｄ１０が４．００μｍ以下、ｄ５０が６．００μｍ以下、およびｄ９０が１１．００μｍ以下である、［２－３４］～［２－５６］のいずれかに記載の医薬製剤。

【手続補正２０】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】０１０５
【補正方法】変更
【補正の内容】
【０１０５】
［２－５８］式１で表される化合物のｐ－トルエンスルホン酸塩の結晶の体積基準粒子径が、ｄ１０が３．００μｍ以下、ｄ５０が５．００μｍ以下、およびｄ９０が８．００μｍ以下である、［２－３４］～［２－５７］のいずれかに記載の医薬製剤。

【手続補正２１】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】０１０６
【補正方法】変更
【補正の内容】
【０１０６】
［２－５９］式１で表される化合物のｐ－トルエンスルホン酸塩の結晶の体積基準粒子径が、ｄ１０が１．００μｍ以上５．７６μｍ未満の範囲、ｄ５０が２．３０μｍ以上８．８１μｍ未満の範囲、およびｄ９０が４．３０μｍ以上１３．０８μｍ未満の範囲である、［２－３４］～［２－５８］のいずれかに記載の医薬製剤。

【手続補正２２】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】０１０７
【補正方法】変更
【補正の内容】
【０１０７】
［２－６０］式１で表される化合物のｐ－トルエンスルホン酸塩の結晶の体積基準粒子径が、ｄ１０が１．２０μｍ以上５．７６μｍ未満の範囲、ｄ５０が２．４０μｍ以上８．８１μｍ未満の範囲、およびｄ９０が４．５０μｍ以上１３．０８μｍ未満の範囲である、［２－３４］～［２－５９］のいずれかに記載の医薬製剤。

【手続補正２３】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】０１０８
【補正方法】変更
【補正の内容】
【０１０８】
［２－６１］式１で表される化合物のｐ－トルエンスルホン酸塩の結晶の体積基準粒子径が、d_{10}が１．３０μｍ以上５．７６μｍ未満の範囲、d_{50}が２．５０μｍ以上８．８１μｍ未満の範囲、およびd_{90}が４．７０μｍ以上１３．０８μｍ未満の範囲である、［２－３４］～［２－６０］のいずれかに記載の医薬製剤。