

【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5年4月5日(2023.4.5)

【国際公開番号】WO2022/234850
 【出願番号】特願2022-548967(P2022-548967)

【国際特許分類】

A 6 1 K 38/12(2006.01)
 A 6 1 K 47/14(2017.01)
 A 6 1 K 47/10(2017.01)
 A 6 1 K 47/34(2017.01)
 A 6 1 K 47/44(2017.01)
 A 6 1 P 43/00(2006.01)
 A 6 1 P 35/00(2006.01)
 A 6 1 K 47/12(2006.01)
 A 6 1 K 47/22(2006.01)
 A 6 1 K 9/48(2006.01)
 C 0 7 K 7/50(2006.01)

10

【F I】

A 6 1 K 38/12
 A 6 1 K 47/14
 A 6 1 K 47/10
 A 6 1 K 47/34
 A 6 1 K 47/44
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 K 47/12
 A 6 1 K 47/22
 A 6 1 K 9/48
 C 0 7 K 7/50

20

30

【手続補正書】

【提出日】令和4年8月12日(2022.8.12)

【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】

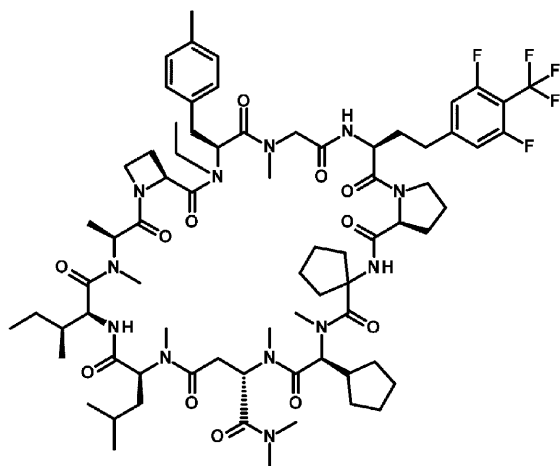
【特許請求の範囲】

【請求項1】

40

下記式(1):

【化 1】



(1)

10

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と、液体添加剤、および任意で油性成分を含有する、組成物。

【請求項 2】

前記液体添加剤が、界面活性剤である、請求項 1 に記載の組成物。

20

【請求項 3】

前記界面活性剤が、疎水性界面活性剤、および親水性界面活性剤の組み合わせである、請求項 2 に記載の組成物。

【請求項 4】

前記疎水性界面活性剤の HLB 値が 0 以上 10 未満であり、前記親水性界面活性剤の HLB 値が 10 以上 30 以下である、請求項 3 に記載の組成物。

【請求項 5】

前記疎水性界面活性剤が、プロピレングリコール脂肪酸エステル、グリセリン脂肪酸エステル、ポリグリセリン脂肪酸エステル、ソルビタン脂肪酸エステル、および疎水性ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油からなる群より選択される少なくとも 1 種である、請求項 3 に記載の組成物。

30

【請求項 6】

前記疎水性界面活性剤が、プロピレングリコール脂肪酸エステルである、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 7】

前記プロピレングリコール脂肪酸エステルが、モノカブロン酸プロピレングリコール、モノカプリル酸プロピレングリコール、モノカプリン酸プロピレングリコール、モノラウリン酸プロピレングリコール、モノミリスチン酸プロピレングリコール、モノパルミチン酸プロピレングリコール、モノステアリン酸プロピレングリコール、およびモノオレイン酸プロピレングリコールからなる群より選択される少なくとも 1 種である、請求項 6 に記載の組成物。

40

【請求項 8】

前記プロピレングリコール脂肪酸エステルが、モノカプリル酸プロピレングリコールである、請求項 7 に記載の組成物。

【請求項 9】

前記親水性界面活性剤が、ポリエチレングリコール脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンヒマシ油、親水性ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、D - - トコフェリルポリエチレングリコール 1000 コハク酸塩、カプリロカプロイルポリオキシシル-8 グリセリド、およびこれらのいずれかの組合せからなる群より選択される少なくとも 1 種である、請求項 3 に記載の組成物。

【請求項 10】

50

前記親水性界面活性剤が、ポリオキシエチレンヒマシ油である、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 1 1】

前記ポリオキシエチレンヒマシ油が、ポリオキシル 3 0 ヒマシ油、ポリオキシル 3 5 ヒマシ油、およびポリオキシル 4 0 ヒマシ油からなる群から選択される少なくとも 1 種である、請求項 1 0 に記載の組成物。

【請求項 1 2】

前記ポリオキシエチレンヒマシ油が、ポリオキシル 3 5 ヒマシ油である、請求項 1 1 に記載の組成物。

【請求項 1 3】

前記親水性界面活性剤が、ポリエチレングリコール脂肪酸エステル、ポリオキシエチレンヒマシ油、親水性ポリオキシエチレン硬化ヒマシ油、ポリオキシエチレンソルビタン脂肪酸エステル、D - - トコフェリルポリエチレングリコール 1 0 0 0 コハク酸塩、カプリロカプロイルポリオキシル-8グリセリド、およびこれらのいずれかの組合せからなる群より選択される少なくとも 1 種である、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 1 4】

前記親水性界面活性剤が、ポリオキシエチレンヒマシ油である、請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 1 5】

前記親水性界面活性剤が、ポリオキシル 3 5 ヒマシ油である、請求項 8 に記載の組成物。

【請求項 1 6】

組成物が油性成分を含む、請求項 3 に記載の組成物。

【請求項 1 7】

前記油性成分が、脂肪酸、アシルグリセロール、植物油およびこれらの組合せからなる群より選択される少なくとも 1 種である、請求項 1 6 に記載の組成物。

【請求項 1 8】

前記油性成分が、脂肪酸である、請求項 1 7 に記載の組成物。

【請求項 1 9】

前記脂肪酸が、カプロン酸、カプリル酸、カプリン酸、ラウリン酸、ミリスチン酸、ミリストレイン酸、パルミチン酸、パルミトレイン酸、ステアリン酸、オレイン酸、リノール酸、およびリノレン酸からなる群より選択される少なくとも 1 種である、請求項 1 8 に記載の組成物。

【請求項 2 0】

前記脂肪酸が、オレイン酸、リノール酸、およびリノレン酸からなる群より選択される少なくとも 1 種である、請求項 1 9 に記載の組成物。

【請求項 2 1】

前記脂肪酸が、オレイン酸である、請求項 2 0 に記載の組成物。

【請求項 2 2】

脂肪酸、アシルグリセロール、植物油およびこれらの組合せからなる群より選択される少なくとも 1 種の油性成分をさらに含む、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 2 3】

脂肪酸、アシルグリセロール、植物油およびこれらの組合せからなる群より選択される少なくとも 1 種の油性成分をさらに含む、請求項 1 3 に記載の組成物。

【請求項 2 4】

組成物が、脂肪酸をさらに含む、請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 2 5】

組成物が、脂肪酸をさらに含む、請求項 1 4 に記載の組成物。

【請求項 2 6】

さらにオレイン酸を含む、請求項 8 に記載の組成物。

【請求項 2 7】

10

20

30

40

50

組成物が、オレイン酸をさらに含む、請求項 1 5 に記載の組成物。

【請求項 2 8】

さらに抗酸化剤を含む、請求項 2 1 に記載の組成物。

【請求項 2 9】

さらに抗酸化剤を含む、請求項 2 3 に記載の組成物。

【請求項 3 0】

さらに抗酸化剤を含む、請求項 2 5 に記載の組成物。

【請求項 3 1】

さらに抗酸化剤を含む、請求項 2 7 に記載の組成物。

【請求項 3 2】

前記抗酸化剤が、dl - - トコフェロールである、請求項 3 1 に記載の組成物。

【請求項 3 3】

前記抗酸化剤が、dl - - トコフェロール、ブチレート化ヒドロキシトルエン、ブチレート化ヒドロキシアニソール、プロピルガレート、没食子酸プロピル、医薬として許容されうるキノン、アスタキサンチン、および D - - トコフェリルポリエチレングリコール 1 0 0 0 コハク酸塩からなる群より選択される少なくとも 1 種である、請求項 2 8 に記載の組成物。

【請求項 3 4】

前記抗酸化剤が、dl - - トコフェロールである、請求項 3 3 に記載の組成物。

【請求項 3 5】

前記式 (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の組成物全体に対する含有率が、1 0 重量 % 以下である、請求項 3 に記載の組成物。

【請求項 3 6】

前記液体添加剤の組成物全体に対する含有率が、5 0 重量 % 以上 9 7 重量 % 以下である、請求項 3 に記載の組成物。

【請求項 3 7】

前記液体添加剤の、前記式 (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に対する重量比が、5 以上である、請求項 3 に記載の組成物。

【請求項 3 8】

前記式 (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の組成物全体に対する含有率が、1 0 重量 % 以下であり、前記液体添加剤の組成物全体に対する含有率が、5 0 重量 % 以上 9 7 重量 % 以下である、請求項 2 3 に記載の組成物。

【請求項 3 9】

前記式 (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の組成物全体に対する含有率が、1 0 重量 % 以下であり、前記液体添加剤の組成物全体に対する含有率が、5 0 重量 % 以上 9 7 重量 % 以下である、請求項 2 5 に記載の組成物。

【請求項 4 0】

前記式 (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の組成物全体に対する含有率が、1 0 重量 % 以下であり、前記液体添加剤の組成物全体に対する含有率が、5 0 重量 % 以上 9 7 重量 % 以下である、請求項 2 7 に記載の組成物。

【請求項 4 1】

前記式 (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の組成物全体に対する含有率が、1 0 重量 % 以下であり、前記液体添加剤の組成物全体に対する含有率が、5 0 重量 % 以上 9 7 重量 % 以下である、請求項 2 9 に記載の組成物。

【請求項 4 2】

前記式 (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の組成物全体に対する含有率が、1 0 重量 % 以下であり、前記液体添加剤の組成物全体に対する含有率が、5 0 重量 % 以上 9 7 重量 % 以下である、請求項 3 0 に記載の組成物。

【請求項 4 3】

前記式 (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の組成物全体

10

20

30

40

50

に対する含有率が、10重量%以下であり、前記液体添加剤の組成物全体に対する含有率が、50重量%以上97重量%以下である、請求項31に記載の組成物。

【請求項44】

前記式(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の組成物全体に対する含有率が、10重量%以下であり、前記液体添加剤の組成物全体に対する含有率が、50重量%以上97重量%以下である、請求項32に記載の組成物。

【請求項45】

請求項1～44のいずれか一項に記載の組成物を含有する、医薬製剤。

【請求項46】

前記式(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水和物である、請求項45に記載の医薬製剤。

10

【請求項47】

前記式(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)で表される化合物である、請求項45に記載の医薬製剤。

【請求項48】

前記製剤の剤型がカプセル剤である、請求項45に記載の医薬製剤。

【請求項49】

前記製剤の剤型がカプセル剤である、請求項46に記載の医薬製剤。

【請求項50】

前記製剤の剤型がカプセル剤である、請求項47に記載の医薬製剤。

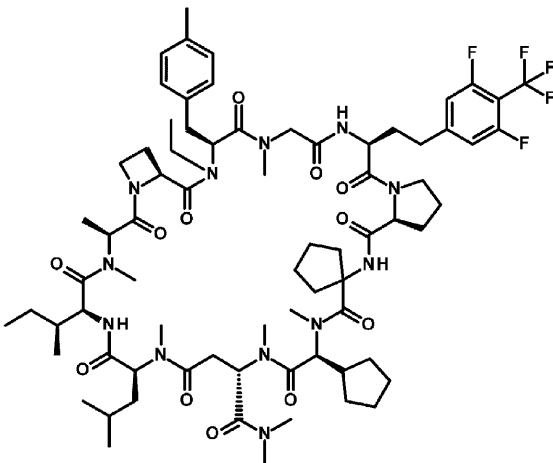
20

【請求項51】

下記の工程を含む、請求項1～37のいずれか1項に記載の組成物の製造方法；

(1)下記式(1)：

【化2】



(1)

30

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、液体添加剤、および任意で油性成分を提供する工程；

40

(2)該式(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、液体添加剤、および任意で油性成分を混合する工程；および、

(3)該式(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溶解した組成物を得る工程。

【請求項52】

前記工程(1)において提供される式(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水和物である、請求項51に記載の方法。

【請求項53】

請求項52に記載の組成物を提供する工程、および該組成物を製剤化して、医薬製剤を提

50

供する工程、を含む、医薬製剤の製造方法。

【請求項 54】

請求項 52 に記載の組成物を提供する工程、および該組成物をカプセルに充填して、カプセル製剤を提供する工程、を含む、カプセル製剤の製造方法。

【請求項 55】

前記式(1)で表される化合物の水和物が結晶であり、該結晶は、粉末X線回折において、回折角 2θ として、 4.964° 、 7.921° 、 8.296° 、 8.855° 、 9.956° 、 10.435° 、 11.729° 、 12.704° 、 13.552° 、 13.901° 、 15.895° 、 16.643° 、および 17.813° ($\pm 0.2^\circ$)のうちの、少なくとも7つのピークを含む粉末X線回折パターンを有する、請求項 52 に記載の方法。

10

【請求項 56】

前記式(1)で表される化合物の水和物が結晶であり、該結晶は、粉末X線回折において、回折角 2θ として、 4.964° 、 7.921° 、 8.296° 、 8.855° 、 9.956° 、 10.435° 、 11.729° 、 12.704° 、 13.552° 、 13.901° 、 15.895° 、 16.643° 、および 17.813° ($\pm 0.2^\circ$)のうちの、少なくとも10個のピークを含む粉末X線回折パターンを有する、請求項 52 に記載の方法。

【請求項 57】

前記式(1)で表される化合物の水和物が結晶であり、該結晶は、粉末X線回折において、回折角 2θ として、 4.964° 、 7.921° 、 8.296° 、 8.855° 、 9.956° 、 10.435° 、 11.729° 、 12.704° 、 13.552° 、 13.901° 、 15.895° 、 16.643° 、および 17.813° ($\pm 0.2^\circ$)のピークを含む粉末X線回折パターンを有する、請求項 52 に記載の方法。

20

【請求項 58】

前記式(1)で表される化合物の水和物が結晶であり、該結晶は、粉末X線回折において、回折角 2θ として、 4.964° 、 7.921° 、 8.296° 、 8.855° 、 9.956° 、 10.435° 、 11.729° 、 12.704° 、 13.552° 、 13.901° 、 14.752° 、 14.968° 、 15.895° 、 16.190° 、 16.643° 、 17.813° 、および 19.424° ($\pm 0.2^\circ$)のうちの、少なくとも7つのピークを含む粉末X線回折パターンを有する、請求項 52 に記載の方法。

30

【請求項 59】

前記式(1)で表される化合物の水和物が結晶であり、該結晶は、粉末X線回折において、回折角 2θ として、 4.964° 、 7.921° 、 8.296° 、 8.855° 、 9.956° 、 10.435° 、 11.729° 、 12.704° 、 13.552° 、 13.901° 、 14.752° 、 14.968° 、 15.895° 、 16.190° 、 16.643° 、 17.813° 、および 19.424° ($\pm 0.2^\circ$)のうちの、少なくとも10個のピークを含む粉末X線回折パターンを有する、請求項 52 に記載の方法。

【請求項 60】

前記式(1)で表される化合物の水和物が結晶であり、該結晶は、粉末X線回折において、回折角 2θ として、 4.964° 、 7.921° 、 8.296° 、 8.855° 、 9.956° 、 10.435° 、 11.729° 、 12.704° 、 13.552° 、 13.901° 、 14.752° 、 14.968° 、 15.895° 、 16.190° 、 16.643° 、 17.813° 、および 19.424° ($\pm 0.2^\circ$)のうちの、少なくとも13個のピークを含む粉末X線回折パターンを有する、請求項 52 に記載の方法。

40

【請求項 61】

前記式(1)で表される化合物の水和物が結晶であり、該結晶は、粉末X線回折において、回折角 2θ として、 4.964° 、 7.921° 、 8.296° 、 8.855° 、 9.956° 、 10.435° 、 11.729° 、 12.704° 、 13.552° 、 13.901° 、 14.752° 、 14.968° 、 15.895° 、 16.190° 、 $16.$

50

64.3°、17.813°、および19.424°(±0.2°)のピークを含む粉末X線回折パターンを有する、請求項52に記載の方法。

10

20

30

40

50