

【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6年12月10日(2024.12.10)

【国際公開番号】WO2022/250731

【公表番号】特表2024-521765(P2024-521765A)

【公表日】令和6年6月4日(2024.6.4)

【年通号数】公開公報(特許)2024-102

【出願番号】特願2023-572709(P2023-572709)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/53(2006.01)

A 6 1 P 15/10(2006.01)

A 6 1 K 45/00(2006.01)

A 6 1 P 43/00(2006.01)

A 6 1 K 9/08(2006.01)

A 6 1 K 9/12(2006.01)

A 6 1 K 47/10(2017.01)

A 6 1 K 47/34(2017.01)

A 6 1 K 47/14(2017.01)

A 6 1 K 31/519(2006.01)

A 6 1 K 31/4985(2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/53

A 6 1 P 15/10

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 9/12

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 31/4985

【手続補正書】

【提出日】令和6年11月29日(2024.11.29)

【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】

製剤であって、前記製剤は、

ホスホジエステラーゼ阻害剤と、

エタノールと、

(a) ポリエーテル、ジエチレングリコールモノエチルエーテル、中鎖グリセリド、1つ以上の飽和ポリグリコール化C8 - C10グリセリド、またはそれらの組み合わせからなる有機水溶性溶媒と、および/または、

(b) 弱塩と、を含み、

10

20

30

40

50

前記弱塩は、N - メチルピロリドン (N M P) および / または 乳酸 である、製剤。

【請求項 2】

前記エタノールは、5 % ~ 40 % の濃度で存在する、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 3】

前記有機水溶性溶媒は、プロピレングリコール および / または ポリエーテル を含む、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 4】

前記ポリエーテルは、ポリエチレングリコール である、請求項 3 に記載の製剤。

【請求項 5】

前記ポリエチレングリコールは、PEG 6000 または PEG 400 である、請求項 4 に記載の製剤。 10

【請求項 6】

前記プロピレングリコール および / または ポリエーテルは、1 % ~ 4 % の濃度で存在する、請求項 3 に記載の製剤。

【請求項 7】

前記製剤は、約 3.5 ~ 約 8.0 の pH を有する、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 8】

前記製剤は、4.0 より大きい pH を有する、請求項 7 に記載の製剤。

【請求項 9】

前記製剤は、勃起不全を治療するための 1 つ以上の他の有効成分を含む、請求項 1 に記載の製剤。 20

【請求項 10】

前記製剤は、少なくとも 2 つのホスホジエステラーゼ阻害剤を含む、請求項 9 に記載の製剤。

【請求項 11】

前記ホスホジエステラーゼ阻害剤は、バルデナフィル、シルデナフィル、タダラフィル、またはそれらの組み合わせ である、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 12】

前記有機水性溶媒中の飽和溶解度は、20 mg / ml 以上 である、請求項 1 に記載の製剤。 30

【請求項 13】

前記製剤は、4.0 以上の pH で溶解度が 20 mg / ml 以上の水性製剤で得られるものと同様以上の定常状態フラックス (J s s) を有する、請求項 12 に記載の製剤。

【請求項 14】

前記弱塩は 1 % ~ 40 % の濃度で存在する、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 15】

前記乳酸は 乳酸カルシウム である、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 16】

勃起不全の治療のための医薬品の製造における 請求項 1 に記載の製剤の使用。

【請求項 17】

前記医薬品は、鼻腔内投与のために製剤される、請求項 16 に記載の使用。 40

【請求項 18】

前記医薬品は、舌下投与のために製剤される、請求項 16 に記載の使用。

【請求項 19】

請求項 1 ~ 15 のいずれか 1 項に記載の製剤を調製する方法であって、
前記方法は、
前記 ホスホジエステラーゼ阻害剤 を前記有機水溶性溶媒に添加するステップと、
前記 ホスホジエステラーゼ阻害剤 を含む前記有機水溶性溶媒の pH を約 3.5 ~ 8.0 に調整するステップと、
を含む、方法。 50

【請求項 20】

前記ホスホジエステラーゼ阻害剤の溶解度は、前記ホスホジエステラーゼ阻害剤の水への溶解度と比較して前記有機水溶性溶媒中で増加する、請求項 19 に記載の方法。

【請求項 21】

鼻粘膜中の前記ホスホジエステラーゼ阻害剤の透過は、水中での前記ホスホジエステラーゼ阻害剤の透過と比較して、前記有機水溶性溶媒中で増加する、請求項 19 に記載の方法。

【請求項 22】

前記ホスホジエステラーゼ阻害剤の生物学的利用能は、水中での前記ホスホジエステラーゼ阻害剤の生物学的利用能と比較して前記有機水溶性溶媒中で増加する、請求項 19 に記載の方法。

10

【請求項 23】

勃起不全の治療における使用のための請求項 1 ~ 15 のいずれか 1 項に記載の製剤。

20

30

40

50