

【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19年11月15日(2007.11.15)

【公表番号】特表2003-512327(P2003-512327A)

【公表日】平成15年4月2日(2003.4.2)

【出願番号】特願2001-531388(P2001-531388)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/34 (2006.01)
 A 6 1 K 9/08 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4164 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4184 (2006.01)
 A 6 1 K 31/422 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4439 (2006.01)
 A 6 1 P 1/04 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 47/34
 A 6 1 K 9/08
 A 6 1 K 31/4164
 A 6 1 K 31/4184
 A 6 1 K 31/422
 A 6 1 K 31/4439
 A 6 1 P 1/04

【手続補正書】

【提出日】平成19年9月19日(2007.9.19)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

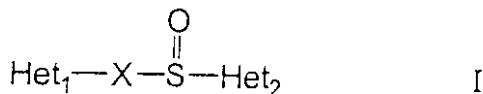
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】ポリエチレングリコールおよびH⁺, K⁺-ATPアーゼインヒビターのナトリウム塩またはカリウム塩を含み、さらに製剤中で溶解性である医薬的に許容できる賦形剤を場合によって含む、水を全く含有しないかまたは水をほとんど含有しない安定な液体製剤。

【請求項2】H⁺, K⁺-ATPアーゼインヒビターのナトリウム塩またはカリウム塩が下記一般式Iをもつ化合物のナトリウム塩またはカリウム塩であるかまたはその1種の鏡像体のナトリウム塩またはカリウム塩である請求項1に記載の安定な液体製剤。

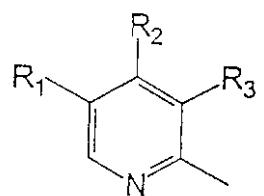
【化1】



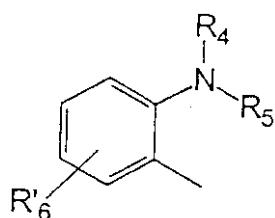
上記式中、

Het₁は下記式：

【化2】



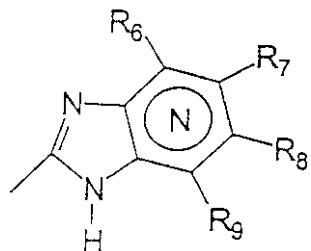
または



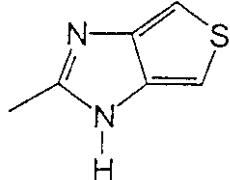
であり、

H e t₂は下記式：

【化3】



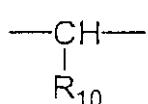
または



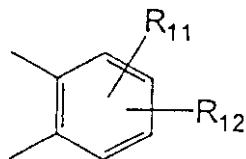
であり、

Xは下記式：

【化4】



または



であり、

ここでベンズイミダゾール部分のNは、R₆～R₉によって置換された環炭素原子の1つは置換基を全くもたない窒素原子と場合によって交換できることを意味し；

R₁、R₂およびR₃は同じでも異なっていてもよく、そして水素、アルキル、フッ素で場合によって置換されたアルコキシ、アルキルチオ、アルコキシアルコキシ、ジアルキルアミノ、ピペリジノ、モルフォリノ、ハロゲン、フェニルおよびフェニルアルコキシから選ばれ；

R₄およびR₅は同じでも異なっていてもよく、そして水素、アルキルおよびアルアルキルから選ばれ；

R₆は水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、アルキルまたはアルコキシであり；

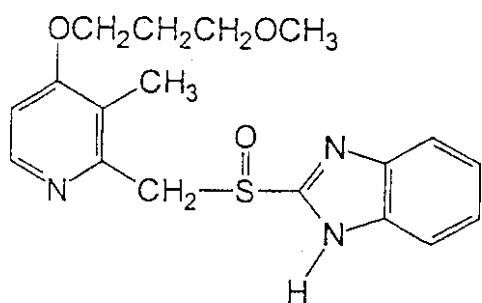
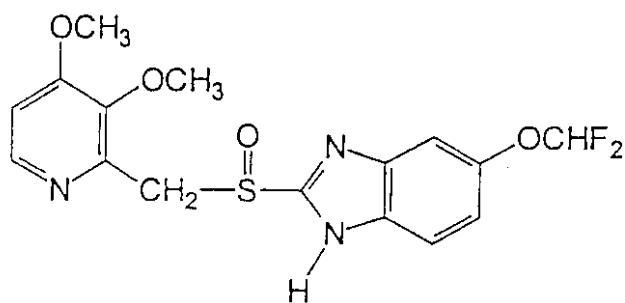
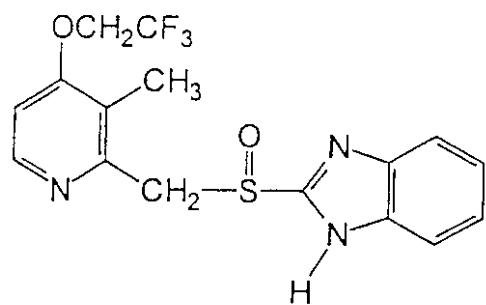
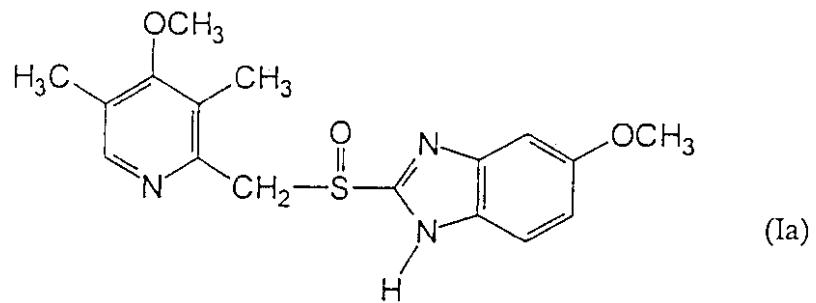
R₆～R₉は同じでも異なっていてもよく、そして水素、アルキル、アルコキシ、ハロゲン、ハロアルコキシ、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、オキサゾリル、トリフルオロアルキルから選ばれるか、または隣接基R₆～R₉は環構造を形成しさらに置換されていてもよく；

R₁₀は水素であるか、またはR₃と一緒にになってアルキレン鎖を形成し；

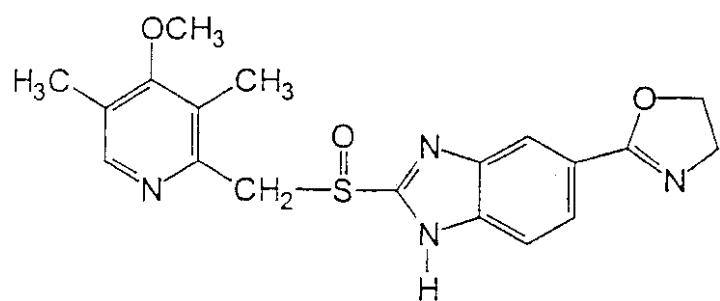
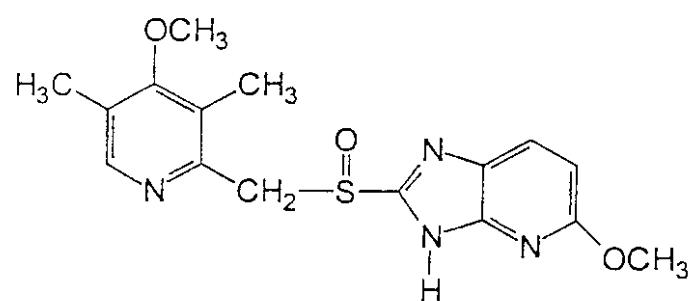
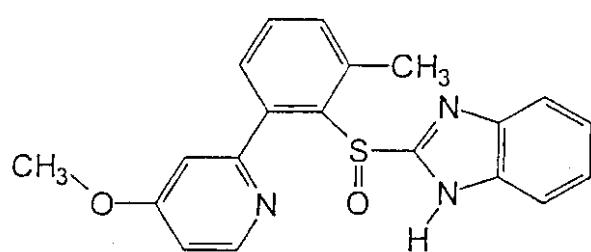
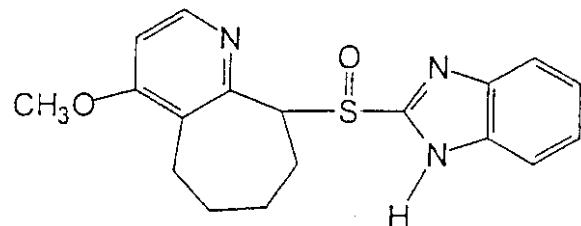
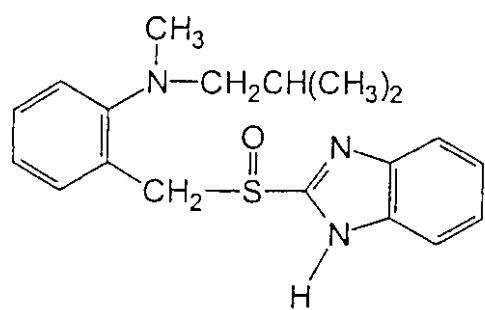
R₁₁およびR₁₂は同じでも異なっていてもよく、そして水素、ハロゲンまたはアルキルから選ばれる。

【請求項3】 H⁺, K⁺ - ATPアーゼインヒビターのナトリウム塩またはカリウム塩が、下記式のいずれかをもつ化合物のナトリウム塩もしくはカリウム塩、またはその1種の鏡像体のナトリウム塩もしくはカリウム塩である請求項1または2に記載の安定な液体製剤。

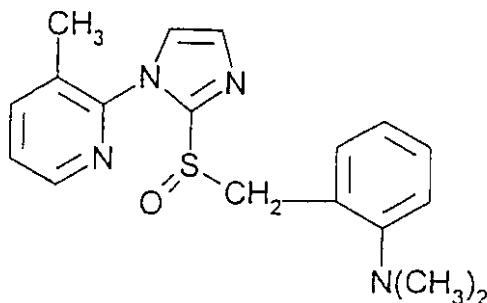
【化5】



【化 6】



【化7】



【請求項 4】 化合物がナトリウム塩である請求項 1～3 のいずれかに記載の安定な液体製剤。

【請求項 5】 化合物がカリウム塩である請求項 1～3 のいずれかに記載の安定な液体製剤。

【請求項 6】 化合物が (S)-オメプラゾールのナトリウム塩およびオメプラゾールのナトリウム塩から選ばれる請求項 1～4 のいずれかに記載の安定な液体製剤。

【請求項 7】 ポリエチレングリコールがポリエチレングリコール 200、300 および 400 から選ばれる請求項 1～6 のいずれかに記載の安定な液体製剤。

【請求項 8】 ポリエチレングリコールがポリエチレングリコール 400 である請求項 7 に記載の安定な液体製剤。

【請求項 9】 溶液の水分含有量が 6 重量 % 未満、好ましくは重量で 3 % 未満である請求項 1～8 のいずれかに記載の安定な液体製剤。

【請求項 10】 水分含有量が 2 重量 % 未満である請求項 9 に記載の安定な液体製剤。

【請求項 11】 ポリエチレングリコールおよび H^+ , K^+ - ATP アーゼインヒビターのナトリウム塩またはカリウム塩を含み、さらに場合によって医薬的に許容できる賦形剤を含む安定な液体製剤の製造方法であって、 H^+ , K^+ - ATP アーゼインヒビターのナトリウム塩またはカリウム塩およびポリエチレングリコールを混合し、さらに可溶性の賦形剤を場合によって添加し、その後で該溶液を場合によって窒素でバージして予め設定した値の水分含有量を得る上記製造方法。

【請求項 12】 液体製剤の濾過滅菌工程をさらに含むことを特徴とする請求項 10 または 11 に記載の方法。

【請求項 13】 請求項 1 に記載の安定な液体製剤の医薬における使用。

【請求項 14】 胃腸疾患の治療に用いられる請求項 1～10 のいずれかに記載の安定な液体製剤の製造におけるポリエチレングリコールおよび H^+ , K^+ - ATP アーゼインヒビターのナトリウム塩またはカリウム塩の使用。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0014

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0014】

式中、

ベンズイミダゾール成分の N は、 R_6 ～ R_9 によって置換された環炭素原子の 1 つを置換基を全くもたない窒素原子と場合によって交換できることを意味し；

R_1 、 R_2 および R_3 は同じでも異なっていてもよく、水素、アルキル、フッ素で場合によって置換されたアルコキシ、アルキルチオ、アルコキシアルコキシ、ジアルキルアミノ、ピペリジノ、モルフォリノ、ハロゲン、フェニルおよびフェニルアルコキシから選ばれ；

R_4 および R_5 は同じでも異なっていてもよく、水素、アルキルおよびアルアルキルから選ばれ；

R_6 は水素、ハロゲン、トリフルオロメチル、アルキルまたはアルコキシであり；
 R_6 ~ R_9 は同じでも異なっていてもよく、水素、アルキル、アルコキシ、ハロゲン、ハロアルコキシ、アルキルカルボニル、アルコキシカルボニル、オキサゾリル、トリフルオロアルキルから選ばれるか、または隣接基 R_6 ~ R_9 は環構造を形成しこれはさらに置換されてもよく；

R_{10} は水素であるか、または R_3 と一緒にになってアルキレン鎖を形成し；

R_{11} および R_{12} は同じでも異なっていてもよく、水素、ハロゲンまたはアルキルから選ばれる。