

【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29年7月27日(2017.7.27)

【公開番号】特開2017-105804(P2017-105804A)

【公開日】平成29年6月15日(2017.6.15)

【年通号数】公開・登録公報2017-022

【出願番号】特願2017-16400(P2017-16400)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4035 (2006.01)

A 6 1 K 9/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/04 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 33/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 7/00 (2006.01)

A 6 1 P 7/06 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/4035

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/04

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 33/00

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 25/20
 A 6 1 P 7/00
 A 6 1 P 7/06
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 31/12
 A 6 1 P 37/08
 A 6 1 P 31/04
 A 6 1 P 9/00

【手続補正書】

【提出日】平成29年5月26日(2017.5.26)

【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

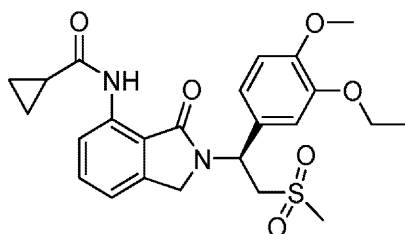
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

1) 式(I)の化合物:

【化 1】



(I)

又はその医薬として許容し得る塩の親水性ポリマー中の非晶質固体分散体;及び2)医薬として許容し得る担体又は賦形剤を含む、経口剤形であって、

該剤形が、約5重量%～約10重量%の式(I)の化合物を含み;

該分散体が、約15重量%～約25重量%の式(I)の化合物、及び約75重量%～約85重量%の親水性ポリマーからなり;

該剤形が、約33重量%～約67重量%の該非晶質固体分散体を含み;かつ

該剤形が、約5重量%～約15重量%の最大圧縮性グレード微結晶性セルロースを含む、前記経口剤形。

【請求項 2】

前記親水性ポリマーが、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリビニルピロリドン、ヒドロキシプロピルセルロース、PVP VA64、ヒドロキシプロピルメチルセルロースアセテートスクシネート、Eudragitポリマー、ポリビニルアセテート、Polyox、Soluplus、又はポリエチレングリコールである、請求項 1 記載の経口剤形。

【請求項 3】

前記親水性ポリマーが、ヒドロキシプロピルメチルセルロースである、請求項 1 記載の経口剤形。

【請求項 4】

前記担体又は賦形剤が、微結晶性セルロース、マンニトール、ナトリウムクロスカルメロース、ステアリン酸カルシウム、クロスボビドン、ポリビニルアルコール、ステアリン

酸マグネシウム、無水ラクトース、二酸化ケイ素、フルクトース、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、ポリビニルピロリドン、ヒドロキシプロピルセルロース、及びこれらの組み合わせからなる群から選択される、請求項 1 記載の経口剤形。

【請求項 5】

前記剤形が、約 5 重量%の式 (I) の化合物を含む、請求項 1 記載の経口剤形。

【請求項 6】

前記非晶質固体分散体が、約 15 重量%の式 (I) の化合物及び約 85 重量%の親水性ポリマーからなる、請求項 1 記載の経口剤形。

【請求項 7】

前記剤形が約 33 重量%の前記分散体を含む、請求項 1 記載の経口剤形。

【請求項 8】

前記剤形が、一緒に前記分散体を構成する約 5 重量%の式 (I) の化合物及び約 28 重量%のヒドロキシプロピルメチルセルロース；約 24 重量%の微結晶性セルロース；約 36 重量%のマンニトール；約 5 重量%のクロスカルメロースナトリウム；及び約 1 重量%のステアリン酸カルシウム又はステアリン酸マグネシウムからなる、請求項 1 記載の経口剤形。

【請求項 9】

前記分散体が非晶質固体分散体である、請求項 8 記載の経口剤形。

【請求項 10】

約 24 重量%の微結晶性セルロースの約 10 重量%が最大圧縮性グレード微結晶性セルロースからなる、請求項 8 記載の経口剤形。

【請求項 11】

癌、疼痛、黄斑変性、皮膚疾患、肺疾患、アスベスト関連疾患、寄生虫疾患、免疫不全疾患、CNS 疾患、CNS 損傷、アテローム性動脈硬化、睡眠障害、異常ヘモグロブリン症、貧血、炎症性疾患、自己免疫疾患、ウイルス性疾患、遺伝性疾患、アレルギー性疾患、細菌性疾患、眼の血管新生病、脈絡膜血管新生病、網膜血管新生病、ハンセン病における ENL、結核及び関連障害、又はルペオーシスを治療、管理、又は予防するための請求項 1 記載の経口剤形。

【請求項 12】

前記寄生虫疾患が、マラリア、バベシア症、トリパノソマ症、リーシュマニア症、トキソプラズマ症、髄膜脳炎、角膜炎、アメーバ症、ジアルジア虫症、クリプトスポリジウム症、イソスポーラ症、サイクロスポーラ症、微孢子虫症、回虫症、鞭虫症、鉤虫症、糞線虫症、トキソカラ症、旋毛虫症、リンパフィラリア症、オンコセルカ症、フィラリア症、住血吸虫症、又は動物住血吸虫によって引き起こされる皮膚炎である、請求項 11 記載の経口剤形。

【請求項 13】

前記寄生虫疾患が、*P. ファルシファリウム*、*P. オバレ*、*P. ビバクス*、*P. マラリア*、*L. ドノバリ*、*L. インファンタム*、*L. エチオピカ*、*L. マジョル*、*L. トロピカ*、*L. メキシカナ*、*L. ブラジリエンシス*、*T. ゴンジ*、*B. ミクロチ*、*B. ディバージェンス*、*B. コリ*、*C. パルブム*、*C. カイエタネンシス*、*E. ヒストリチカ*、*I. ベリ*、*S. マンソニ*、*S. ハエマトビウム*、*トリパノソマ ssp.*、*トキソプラズマ ssp.*、又は *O. ボルブルス* によって引き起こされる、請求項 11 記載の経口剤形。

【請求項 14】

前記寄生虫疾患が、バベシアボビス、バベシアカニス、バネシアギブソニ、ベスノイチアダーリング、シタウクスズーンフェリス、エイメリア *ssp.*、ハモンジア *ssp.*、又はテイレリア *ssp.* によって引き起こされる、請求項 11 記載の経口剤形。

【請求項 15】

前記結核が、肺結核又は肺外結核である、請求項 11 記載の経口剤形。

【請求項 16】

前記肺外結核が、泌尿生殖器結核、結核性髄膜炎、軍隊結核、結核性腹膜炎、結核性心膜炎、結核性リンパ節炎、骨及び関節の結核、胃腸結核、又は肝結核である、請求項 15

記載の経口剤形。

【請求項 17】

結核に関連した症状を治療、予防、又は管理し、該症状が、発熱である、請求項 11 記載の経口剤形。

【請求項 18】

第2の活性薬をさらに含み、該第2の活性薬が、クロロキン、キニン、キニジン、ピリメタミン、スルファジアジン、ドキシシクリン、クリンダマイシン、メフロキン、ハロファントリン、プリマキン、ヒドロキシクロロキン、プログアニル、アトバクオン、アジトロマイシン、スラミン、ペンタミジン、メラルソプロル、ニフルチモクス、ベンズニダゾール、アンホテリシンB、五価アンチモン化合物(例えば、スチボグルコン酸ナトリウム)、インターフェロンガンマ、イトラコナゾール、死んだプロマスチゴートとBCGの組合せ、ロイコボリン、コルチコステロイド、スルホンアミド、スピラマイシン、IgG(血清)、トリメトプリム、又はスルファメトキサゾールである、請求項 1 記載の経口剤形。