

【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28年9月23日 (2016.9.23)

【公開番号】特開2014-111672(P2014-111672A)

【公開日】平成26年6月19日 (2014.6.19)

【年通号数】公開・登録公報2014-032

【出願番号】特願2014-56829(P2014-56829)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4178 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/08 (2006.01)

A 6 1 K 47/24 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/22 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 9/107 (2006.01)

A 6 1 P 31/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/167 (2006.01)

A 6 1 K 31/135 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/4178

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/08

A 6 1 K 47/24

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/22

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 9/107

A 6 1 P 31/10

A 6 1 K 31/167

A 6 1 K 31/135

【手続補正書】

【提出日】平成28年8月8日 (2016.8.8)

【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】

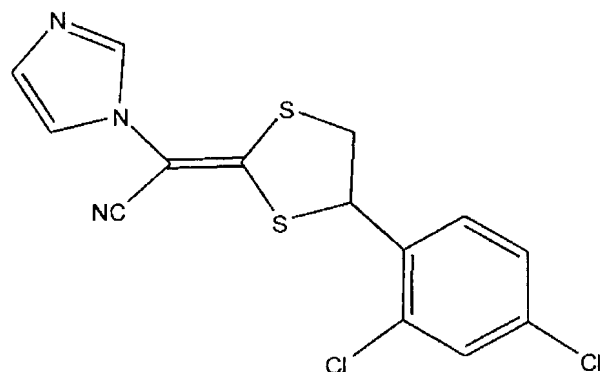
【請求項 1】

1) 化学式 (1) に表されるルリコナゾールと、2) カルボン酸及びその誘導体、ケトン、リン酸及びその誘導体、局所麻酔剤、抗ヒスタミン剤並びに P O E 系非イオン界面活性剤から選択される 1 種又は 2 種以上の成分とを含有する医薬組成物であって、

6 0 3 週間又は 4 0 6 ヶ月の保存後において、化学式 (2) に表されるアミド体の

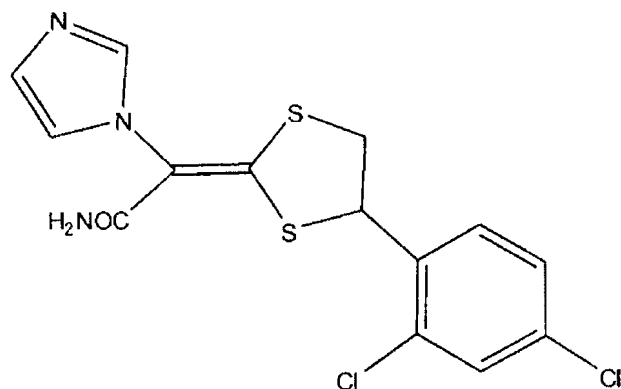
含有量が、ルリコナゾールの仕込み量に対して 0.2 質量 % 以下であることを特徴とする、医薬組成物。

【化 1】



化学式 (1) : ルリコナゾール

【化 2】



化学式 (2) アミド体

【請求項 2】

前記カルボン酸及びその誘導体、ケトン、リン酸及びその誘導体、局所麻酔剤、抗ヒスタミン剤並びに P O E 系非イオン界面活性剤から選択される成分は、次の (イ) 群から選択されるものであることを特徴とする、請求項 1 に記載の医薬組成物。

(イ)

カルボン酸及びその誘導体：ミリスチン酸イソプロピル、ソルビタン脂肪酸エステル、中鎖脂肪酸トリグリセリド、トリアセチン、クエン酸トリエチル、二塩基酸エステル、サリチル酸エチレングリコール；

ケトン：アセトン、メチルエチルケトン；

リン酸及びその誘導体：ヒドロキシエチリデンジホスホン酸；

局所麻酔剤：リドカイン及びその塩；

抗ヒスタミン剤：ジフェンヒドラミン及びその塩；

P O E 系非イオン界面活性剤：P O E 脂肪酸エステル、P O E アルキル（アルケニル）エーテル、P O E ソルビタン脂肪酸エステル、P O E 硬化ヒマシ油

【請求項 3】

更に、多価アルコール、中鎖、長鎖又は環状の単価アルコール並びにピロリドン及びその誘導体から選ばれる 1 種又は 2 種以上を含有することを特徴とする、請求項 1 または 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

前記多価アルコール、中鎖、長鎖又は環状の単価アルコール並びにピロリドン及びその誘導体は次の (ロ) 群から選択されるものであることを特徴とする、請求項 3 に記載の医薬組成物。

(ロ)

多価アルコール：1, 3 - ブタンジオール、ポリエチレングリコール、プロピレングリコール、ポリプロピレングリコール、グリセリン；

中鎖、長鎖又は環状の単価アルコール：ベンジルアルコール、オレイルアルコール、イソステアリルアルコール；

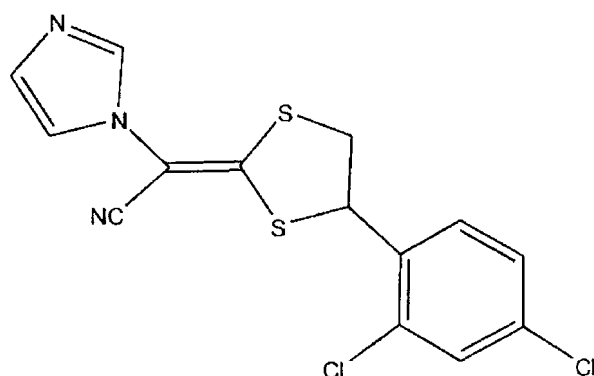
ピロリドン及びその誘導体：ピロリドン及びその誘導体

【請求項 5】

1) 化学式(1)に表されるルリコナゾールと、2) 多価アルコール、中鎖、長鎖又は環状の単価アルコール並びにピロリドン及びその誘導体から選ばれる1種又は2種以上とを1質量%未満含有する医薬組成物であって、

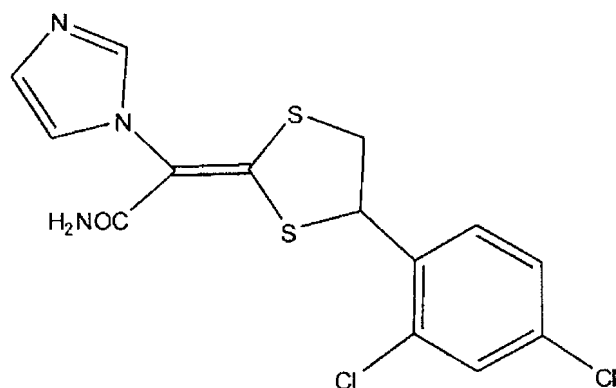
60 3週間又は40 6ヶ月の保存後において、化学式(2)に表されるアミド体の含有量が、ルリコナゾールの仕込み量に対して0.2質量%以下であることを特徴とする、医薬組成物。

【化 3】



化学式(1)：ルリコナゾール

【化 4】



化学式(2) アミド体

【請求項 6】

前記多価アルコール、中鎖、長鎖又は環状の単価アルコール並びにピロリドン及びその誘導体から選ばれる1種又は2種以上は次の(ロ)群から選択されるものであることを特徴とする、請求項5に記載の医薬組成物。

(ロ)

多価アルコール：1, 3 - ブタンジオール、ポリエチレングリコール、プロピレングリコール、ポリプロピレングリコール、グリセリン；

中鎖、長鎖又は環状の単価アルコール：ベンジルアルコール、オレイルアルコール、イソステアリルアルコール；

ピロリドン及びその誘導体：ピロリドン及びその誘導体

【請求項 7】

前記医薬組成物は、液剤またはクリーム剤であることを特徴とする、請求項 1 ～ 6 の何れか 1 項に記載の医薬組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0027

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0027】

かかるアミド体は、HPLCによっても検知、定量できる。なお、ルリコナゾールの類縁体の確認においては、SE体あるいはZ体のような異性体との識別のためにキラル順相カラムを用いることが多いが、キラル順相カラムの溶出条件では化学式(2)の化合物は検知されにくいため、アルキルスルホン酸塩等の陽イオン捕捉性カウンターイオンを用いた逆相カラムを用いた条件で検討することが好ましい。このような分析条件としては、次にあげるものが好ましく例示できる。この条件では、SE体あるいはZ体などの主要類縁体もルリコナゾールとともに検知できる。このような条件で特に好ましいものは次に示す条件である。