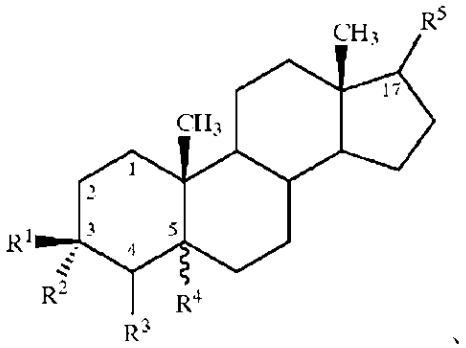
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和4年5月2日(2022.5.2)

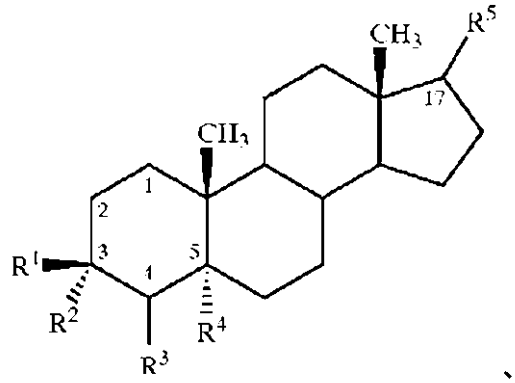
【国際公開番号】WO2019/211668
【公表番号】特表2021-523938(P2021-523938A)
【公表日】令和3年9月9日(2021.9.9)
【出願番号】特願2021-510564(P2021-510564)
【国際特許分類】
C07J 7/00(2006.01)
A61P 25/24(2006.01)
A61P 25/22(2006.01)
A61P 25/04(2006.01)
A61P 29/00(2006.01)
A61P 21/00(2006.01)
A61P 25/08(2006.01)
A61P 25/16(2006.01)
A61P 25/14(2006.01)
A61K 31/57(2006.01)
A61P 43/00(2006.01)
A61K 45/00(2006.01)
A61K 47/44(2017.01)
A61K 47/26(2006.01)
A61K 47/14(2006.01)
A61K 9/06(2006.01)
A61K 9/02(2006.01)
A61K 9/70(2006.01)
A61K 47/04(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｊ 7/00 ＣＳＰ
Ａ６１Ｐ 25/24
Ａ６１Ｐ 25/22
Ａ６１Ｐ 25/04
Ａ６１Ｐ 29/00
Ａ６１Ｐ 21/00
Ａ６１Ｐ 25/08
Ａ６１Ｐ 25/16
Ａ６１Ｐ 25/14
Ａ６１Ｋ 31/57
Ａ６１Ｐ 43/00 １２１
Ａ６１Ｋ 45/00
Ａ６１Ｐ 43/00 １２３
Ａ６１Ｋ 47/44
Ａ６１Ｋ 47/26
Ａ６１Ｋ 47/14
Ａ６１Ｋ 9/06
Ａ６１Ｋ 9/02
Ａ６１Ｋ 9/70 ４０１
Ａ６１Ｋ 47/04

【手続補正書】
【提出日】令和４年４月２１日(２０２２.４.２１)
【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】
以下を含む式を有する神経ステロイド化合物であって、
【化１】



、

式中、Ｒ１がメチルまたは水素であり、Ｒ２がエステル官能基（Ｒ－Ｃ（Ｏ）Ｏ－）であり、Ｒ３が水素であり、Ｒ４がアルファまたはベータ水素であり、Ｒ５がＲ－ＣＯ－または任意の炭化水素構造（Ｒ－）であり、Ｒ（Ｒ２またはＲ５中）が独立して、線状または分岐、飽和または不飽和である１０個以下の炭素原子を含む任意の構造から選択され、前記構造内に環状または芳香族官能基を含み得、Ｒが１つ以下のＯＨもしくはＮＲ２、または２つのエーテルもしくはチオエーテル官能基を含有する、神経ステロイド化合物。
【請求項２】
以下を含む式を有する神経ステロイド化合物であって、
【化２】



、

式中、Ｒ１がメチルまたは水素であり、Ｒ２がエステル官能基（Ｒ－Ｃ（Ｏ）Ｏ－）であり、Ｒ３が水素であり、Ｒ４がアルファまたはベータ水素であり、Ｒ５がＲ－ＣＯ－または任意の炭化水素構造（Ｒ－）であり、Ｒ（Ｒ２またはＲ５中）が独立して、線状または分岐、飽和または不飽和である１０個以下の炭素原子を含む任意の構造から選択され、前記構造内に環状または芳香族官能基を含み得、Ｒが１つ以下のＯＨもしくはＮＲ２、または２つのエーテルもしくはチオエーテル官能基を含有する、神経ステロイド化合物。
【請求項３】

Ｒ１がメチルであり、Ｒ２が生理学的に切断可能なエステルであり、Ｒ４がアルファ配置である、請求項１又は２に記載の神経ステロイド化合物。
【請求項４】
Ｒ１が水素であり、Ｒ２が生理学的に切断可能なエステルであり、Ｒ４がアルファ配置である、請求項１又は２に記載の神経ステロイド化合物。
【請求項５】
前記神経ステロイドが、プロピオン酸ガナキソロン、エナント酸ガナキソロン、シピオン酸ガナキソロン、ウンデカン酸ガナキソロン、およびそれらの組み合わせまたは混合物からなる神経ステロイドの群から選択される、請求項１又は２に記載の神経ステロイド。
【請求項６】
（ａ）請求項１又は２に記載の生理学的に切断可能なエステル化合物の化合物または混合物と、（ｂ）薬学的に許容される油性ビヒクルと、を含む、医薬組成物。
【請求項７】
前記薬学的に許容される油性ビヒクルが、植物油とスクロースアセテートイソブチレート（ＳＡＩＢ）との混合物である、請求項６に記載の医薬組成物。
【請求項８】
前記薬学的に許容される油性ビヒクルが、植物油または植物油の混合物である、請求項６に記載の医薬組成物。
【請求項９】
前記薬学的に許容される油性ビヒクルが、約７５％を超えるヒマシ油からなる、請求項６に記載の医薬組成物。
【請求項１０】
前記薬学的に許容される油性ビヒクルが、７５％を超える中鎖トリグリセリド（ＭＣＴ）の神経ステロイド化合物からなる、請求項６に記載の医薬組成物。
【請求項１１】
前記薬学的に許容される油性ビヒクルが、ＳＡＩＢである、請求項６に記載の医薬組成物。
【請求項１２】
請求項１に記載の生理学的に切断可能なエステル化合物の前記化合物または混合物が、前記組成物の約１重量％～約７５重量％の量の神経ステロイド化合物を含む、請求項６に記載の医薬組成物。
【請求項１３】
前記医薬組成物が、湿潤剤をさらに含む、請求項６に記載の医薬組成物。
【請求項１４】
前記医薬組成物が、増粘剤をさらに含む、請求項６または１３に記載の医薬組成物。
【請求項１５】
前記医薬組成物が、水をさらに含む、請求項６、１３または１４に記載の医薬組成物。
【請求項１６】
前記医薬組成物が、チキソトロピー性である、請求項１４または１５に記載の医薬組成物。
【請求項１７】
前記医薬組成物が、固体またはワックスである、請求項１４または１５に記載の医薬組成物。
【請求項１８】
前記医薬組成物が、それを必要とする対象に投与するためにカートリッジ、注射器、スプレーボトル、パッチ、またはディスペンサーボトルなどの医療デバイスに配置される、請求項６および１３～１６のいずれかに記載の医薬組成物。
【請求項１９】
前記医薬組成物が、それを必要とする対象に投与するためにゲルカプセルに配置される、請求項６および１３～１６のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項２０】
前記医薬組成物が、それを必要とする対象に投与するための局所剤形（クリーム、ゲル、またはパッチ）である、請求項６および１２のいずれかに記載の医薬組成物。
【請求項２１】
前記医薬組成物が、それを必要とする対象に投与するための坐剤である、請求項６および１３～１６のいずれかに記載の医薬組成物。
【請求項２２】
前記医薬組成物が、それを必要とする対象に投与するために注射用の注射器に配置される、請求項６、８および１２のいずれかに記載の医薬組成物。
【請求項２３】
請求項１～５のいずれか１項に記載の化合物のいずれか１つまたは混合物の１日あたり最大約５～５００ｍｇの１日用量を提供する、医薬組成物。
【請求項２４】
医薬組成物であって、（１）エステル化されたガナキサロン誘導体と、（２）油性ビヒクルと、（３）湿潤剤もしくは湿潤剤の混合物および／または薬学的に許容される界面活性剤もしくは界面活性剤の混合物と、を含む、医薬組成物。
【請求項２５】
医薬組成物であって、（１）エステル化されたガナキサロン誘導体と、（２）油性ビヒクルと、（３）湿潤剤もしくは湿潤剤の混合物および／または薬学的に許容される界面活性剤もしくは界面活性剤の混合物と、（４）増粘剤と、を含む、医薬組成物。
【請求項２６】
医薬組成物であって、（１）エステル化されたガナキサロン誘導体と、（２）油性ビヒクルと、（３）湿潤剤もしくは湿潤剤の混合物および／または薬学的に許容される界面活性剤もしくは界面活性剤の混合物と、（４）増粘剤と、（５）任意に水と、を含む、医薬組成物。
【請求項２７】
チキソトロピー性医薬組成物であって、（１）エステル化されたガナキサロン誘導体と、（２）油性ビヒクルと、（３）湿潤剤もしくは湿潤剤の混合物および／または薬学的に許容される界面活性剤もしくは界面活性剤の混合物と、（４）増粘剤と、（５）任意に水と、を含む、チキソトロピー性医薬組成物。
【請求項２８】
前記増粘剤が、コロイド状シリカである、請求項２６又は２７に記載のチキソトロピー性医薬組成物。
【請求項２９】
対象、例えば、動物またはヒトを病状に対して治療するための医薬組成物であって、前記対象が、前記病状のための治療を必要とし、前記方法組成物が、
（ａ）プロピオン酸ガナキソロン、エナント酸ガナキソロン、シピオン酸ガナキソロン、ウンデカン酸ガナキソロン、およびそれらの組み合わせまたは混合物からなる神経ステロイドの群から選択される神経ステロイドと、
（ｂ）薬学的に許容される賦形剤と、を含む、医薬組成物。