

【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26年5月1日(2014.5.1)

【公表番号】特表2011-503142(P2011-503142A)

【公表日】平成23年1月27日(2011.1.27)

【年通号数】公開・登録公報2011-004

【出願番号】特願2010-533564(P2010-533564)

【国際特許分類】

C 0 7 C 237/26 (2006.01)

C 0 7 C 231/24 (2006.01)

A 6 1 K 31/65 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C 237/26 C S P

C 0 7 C 231/24

A 6 1 K 31/65

A 6 1 P 31/04

【誤訳訂正書】

【提出日】平成26年3月6日(2014.3.6)

【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 0 1

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 0 1】

本発明は、A 晶型および B 晶型チゲサイクリン塩酸塩、ならびにこの調整法に関する。さらに本発明は、抗感染薬剤の処方のための中間体としての、A 晶型および B 晶型チゲサイクリン塩酸塩の使用に関する。さらに本発明は、A 晶型チゲサイクリン塩酸塩を有効量で含む薬学的組成物、および A 晶型チゲサイクリン塩酸塩の抗感染薬剤としての使用に関する。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 0 5

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 0 5】

チゲサイクリンは、注射用の凍結乾燥粉末として市販されており、この開発元は W y e t h である。処方過程の間、チゲサイクリンはまず水に溶解し、その後凍結乾燥する。従って、結晶型チゲサイクリンまたはこれに代わる結晶性チゲサイクリン酸付加塩は、高い水溶性を示すはずである。

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 0 6

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 0 6】

2 0 0 7 年に、開発元は米国でチゲサイクリンの新規製剤を発売した。市販の T y g a c i l (登録商標) 第二世代製品は、開発元によれば、以下の成分を含有する：

## 【誤訳訂正 4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0012

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0012】

一般に、結晶性固体は、非晶質型および結晶性の低い型のものよりも優れた化学的および物理的安定性を有する。従って、結晶性チゲサイクリン塩酸塩は、非晶質チゲサイクリン塩酸塩よりも好ましい。つまり、抗感染薬剤処方に適した溶解性および安定性を持つ結晶性チゲサイクリン塩酸塩が依然として必要とされている。

## 【誤訳訂正 5】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0022

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0022】

さらに本発明は、A 晶型および B 晶型チゲサイクリン塩酸塩の、抗感染薬剤処方のための中間体としての使用に関する。

## 【誤訳訂正 6】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0065

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0065】

完成した剤型は、非晶質チゲサイクリンおよびチゲサイクリン塩酸塩それぞれが凍結乾燥したものを含有する。凍結乾燥前、非晶質チゲサイクリンおよびチゲサイクリン塩酸塩それぞれを水に溶解させるので、水溶性は考慮すべき重要な因子である。表 6 は、様々な晶型のチゲサイクリン遊離塩基の溶解性データと A 晶型および B 晶型チゲサイクリン塩酸塩の溶解性データを比較して示す。A 晶型チゲサイクリン塩酸塩は水溶性が一番高いことがはっきりとわかる。例えば、A 晶型は W O

2006 / 128150 の I 型、I I 型、I I I 型、I V 型、および V 型よりも高い水溶性を示し、同じく W O 2007 / 127292 の I 晶型および I 1 晶型よりも高い水溶性を示す。一方で、B 晶型チゲサイクリン塩酸塩は A 晶型よりも溶解性が低い。そうは言っても、B 晶型は、遊離塩基で最も溶解性が高いもの、即ち W O

2006 / 128150 の I V 型と同様な水溶性を示す。従って、本発明の結晶型チゲサイクリン塩酸塩、特に A 晶型のものは、抗感染薬剤を処方する目的の凍結乾燥方法に特に適した形である。

## 【誤訳訂正 7】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0070

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0070】

さらに、本発明の A 晶型および B 晶型チゲサイクリン塩酸塩は、非晶質チゲサイクリン塩酸塩よりも良い物理的安定性を示す。例えば、非晶質チゲサイクリン塩酸塩を、凍結乾燥で調製してから室温で約 9 ヶ月貯蔵した場合、このバッチは、19.56% の 4 - E p i - チゲサイクリン含量および 21.55% の不純物合計を示した。従って、非晶質チゲサイクリン塩酸塩は、安定性が低いために、抗感染薬剤の処方のための中間体として適していない。

## 【誤訳訂正 8】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0071

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0071】

まとめると、A晶型およびB晶型チゲサイクリン塩酸塩、特にA晶型は、優れた水溶性および良好な物理的および熱力学的安定性を有し、従って抗感染薬剤の処方のための中間体として適している。

【誤訳訂正9】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0072

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0072】

水溶性は、処方過程の間にチゲサイクリンおよびチゲサイクリン塩酸塩それぞれを凍結乾燥前に水に溶解させることを考えると重要な因子である。このことが、本発明の結晶型、特に最も水溶性の高いA晶型のものが、抗感染薬剤の処方のための中間体として特に適している理由である。

【誤訳訂正10】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0075

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0075】

新規A晶型および新規B晶型チゲサイクリン塩酸塩は、特に感染の治療に有用である。従って、本発明は、A晶型およびB晶型チゲサイクリン塩酸塩の、抗感染薬剤の処方のための中間体としての使用に関する。