

【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 3 年 9 月 24 日 (2021.9.24)

【公表番号】特表 2020-530832 (P2020-530832A)

【公表日】令和 2 年 10 月 29 日 (2020.10.29)

【年通号数】公開・登録公報 2020-044

【出願番号】特願 2019-572820 (P2019-572820)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/42 (2017.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 21/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 25/32 (2006.01)

A 6 1 P 25/30 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 5/38 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 5/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 47/42

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/36

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 9/20

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/24
A 6 1 P 25/22
A 6 1 P 25/28
A 6 1 P 25/14
A 6 1 P 21/04
A 6 1 P 25/16
A 6 1 P 25/06
A 6 1 P 25/32
A 6 1 P 25/30
A 6 1 P 3/04
A 6 1 P 3/06
A 6 1 P 5/38
A 6 1 P 9/12
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 1/04
A 6 1 P 15/00
A 6 1 P 29/00
A 6 1 P 37/08
A 6 1 P 25/04
A 6 1 P 25/20
A 6 1 P 37/06
A 6 1 P 5/00

【手続補正書】

【提出日】令和3年8月16日(2021.8.16)

【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】

固形投与形態にある医薬製剤であって、

(a) 約 1 m g ~ 約 5 0 0 m g の3-(4-クロロ-2-(モルフォリン-4-イル)チアゾール-5-イル)-7-(1-エチルプロピル)-2,5-ジメチルピラゾロ(1,5-)ピリミジン又はその薬剂的に許容できる塩若しくは溶媒和物と、

(b) 医薬製剤の約 5 重量% ~ 約 9 5 重量%の希釈剤とを含む、医薬製剤。

【請求項 2】

約 1 0 m g から約 3 0 0 m g の3-(4-クロロ-2-(モルフォリン-4-イル)チアゾール-5-イル)-7-(1-エチルプロピル)-2,5-ジメチルピラゾロ(1,5-)ピリミジンを含む、請求項 1 記載の医薬製剤。

【請求項 3】

約 1 0 m g の3-(4-クロロ-2-(モルフォリン-4-イル)チアゾール-5-イル)-7-(1-エチルプロピル)-2,5-ジメチルピラゾロ(1,5-)ピリミジンを含む、請求項 1 記載の医薬製剤。

【請求項 4】

約 2 5 m g の3-(4-クロロ-2-(モルフォリン-4-イル)チアゾール-5-イル)-7-(1-エチルプロピル)-2,5-ジメチルピラゾロ(1,5-)ピリミジンを含む、請求項 1 記載の医薬製剤。

【請求項 5】

約 5 0 m g の3-(4-クロロ-2-(モルフォリン-4-イル)チアゾール-5-イル)-7-(1-エチル

プロピル)-2,5-ジメチルピラゾロ(1,5-)ピリミジンを含む、請求項1記載の医薬製剤。

【請求項6】

約200mgの3-(4-クロロ-2-(モルフォリン-4-イル)チアゾール-5-イル)-7-(1-エチルプロピル)-2,5-ジメチルピラゾロ(1,5-)ピリミジンを含む、請求項1記載の医薬製剤。

【請求項7】

前記希釈剤が、炭酸カルシウム、微結晶セルロース、リン酸カルシウム、デンプン、アルファ化デンプン、炭酸ナトリウム、マンニトール及びラクトースー水和物から成る群より選ばれる請求項1記載の医薬製剤。

【請求項8】

前記希釈剤がラクトースー水和物である、請求項7記載の医薬製剤。

【請求項9】

前記ラクトースー水和物が、医薬製剤の約20重量%～約75重量%である、請求項8記載の医薬製剤。

【請求項10】

前記ラクトースー水和物が、医薬製剤の約40.25重量%である、請求項9記載の医薬製剤。

【請求項11】

前記ラクトースー水和物が、16.1mg、40.25mg、80.5mg又は322mgである、請求項8記載の医薬製剤。

【請求項12】

第2の希釈剤をさらに含み、該第2の希釈剤が微結晶セルロースを含む、請求項1記載の医薬製剤。

【請求項13】

前記微結晶セルロースが、医薬製剤の約25重量%である、請求項12記載の医薬製剤。

【請求項14】

医薬製剤の約1重量%～約6重量%の結合剤を含み、該結合剤がコーンスターチ、ジャガイモデンプン、ゼラチン、スクロース、ヒドロキシプロピルセルロース(HPC)、ポリビニルピロリドン(PVP)、およびヒドロキシプロピルメチルセルロース(HPMC)から成る群より選ばれる、請求項1記載の医薬製剤。

【請求項15】

前記結合剤がHPCを含む、請求項14記載の医薬製剤。

【請求項16】

前記HPCが、医薬製剤の約3重量%である、請求項15記載の医薬製剤。

【請求項17】

約0.5重量%～約10重量%の界面活性剤を含み、該界面活性剤が、ラウリル硫酸ナトリウム、ドデシル体及びヘキサデシル体を含むテトラデシルトリメチルアンモニウムブロミド、塩化ベンザルコニウム、塩化セチルピリジニウム、アルキル硫酸塩、アルキルエトキシレートスルフェート、石けん、カルボン酸イオン、硫酸イオン、スルホン酸イオン、ポリオキシエチレン誘導体、ポリオキシプロピレン誘導体、ポリオール誘導体、ポリオールエステル、ポリオキシエチレンエステル、ポロキサマー、グリコール、グリセロールステル、ソルビタン誘導体及びポリエチレングリコールから成る群より選ばれる、請求項1記載の医薬製剤。

【請求項18】

前記界面活性剤がラウリル硫酸ナトリウムを含む、請求項17記載の医薬製剤。

【請求項19】

ラウリル硫酸ナトリウムが、医薬製剤の約0.75重量%である、請求項18記載の医薬製剤。

【請求項20】

デンプン、アルギン酸、ac-diゾル、クロスカルメロースナトリウム、デンプングリコール酸ナトリウム及びクロスポビドンから成る群より選ばれる崩壊剤をさらに含む、請求項 1 記載の医薬製剤。

【請求項 2 1】

前記崩壊剤がクロスカルメロースナトリウムを含む、請求項 2 0 記載の医薬製剤。

【請求項 2 2】

流動促進剤をさらに含み、該流動促進剤がコロイダル二酸化ケイ素である、請求項 1 記載の医薬製剤。

【請求項 2 3】

滑沢剤をさらに含み、該滑沢剤が、タルク、ステアリン酸、ステアリン酸マグネシウム及びフマル酸ステアリルナトリウムから成る群より選ばれる、請求項 1 記載の医薬製剤。

【請求項 2 4】

前記滑沢剤が、ステアリン酸マグネシウムを含む、請求項 1 記載の医薬製剤。

【請求項 2 5】

前記固形投与形態が錠剤である、請求項 1 記載の医薬製剤。

【請求項 2 6】

前記固形投与形態が顆粒である、請求項 1 記載の医薬製剤。

【請求項 2 7】

前記顆粒がカプセルに包装されたものである、請求項 2 6 記載の医薬製剤。

【請求項 2 8】

前記顆粒がサッシェに包装されたものである、請求項 2 6 記載の医薬製剤。

【請求項 2 9】

錠剤の形態にある医薬製剤であって、

(a) 約 10 mg ~ 約 300 mg の 3-(4-クロロ-2-(モルフォリン-4-イル)チアゾール-5-イル)-7-(1-エチルプロピル)-2,5-ジメチルピラゾロ(1,5-)ピリミジン又はその薬剂的に許容できる塩若しくは溶媒和物と、

(b) 前記錠剤の約 40 重量% ~ 約 75 重量%の第 1 の希釈剤であって、ラクトース水和物を含む第 1 の希釈剤と、

(c) 前記錠剤の約 25 重量%の第 2 の希釈剤であって、微結晶セルロースを含む第 2 の希釈剤と、

(d) 前記錠剤の約 6 重量%のヒドロキシプロピルセルロースと、

(e) 前記錠剤の約 0.5 重量%のラウリル硫酸ナトリウムと、

(f) 前記錠剤の約 4 重量%のクロスカルメロースナトリウムとを含む医薬製剤。

【請求項 3 0】

流動促進剤をさらに含み、該流動促進剤がコロイダル二酸化ケイ素である、請求項 2 9 記載の医薬製剤。

【請求項 3 1】

滑沢剤をさらに含み、該滑沢剤がステアリン酸マグネシウムを含む、請求項 2 9 記載の医薬製剤。