

【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 2 日 (2021.9.2)

【公表番号】特表 2020-528884 (P2020-528884A)

【公表日】令和 2 年 10 月 1 日 (2020.10.1)

【年通号数】公開・登録公報 2020-040

【出願番号】特願 2020-502185 (P2020-502185)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/42 (2017.01)

A 6 1 K 9/16 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 27/06 (2006.01)

A 6 1 P 13/10 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 39/395 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/444

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/26

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/42

A 6 1 K 9/16

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 17/02

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 37/00
 A 6 1 P 31/18
 A 6 1 P 27/06
 A 6 1 P 13/10
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 35/02
 A 6 1 P 25/18
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 K 45/00
 A 6 1 K 39/395 N

【手続補正書】

【提出日】令和3年7月21日(2021.7.21)

【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

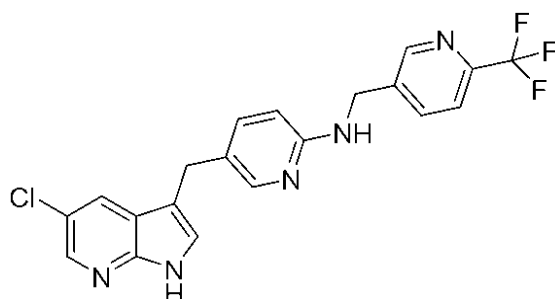
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

40%～60% W/W の以下の構造を有する化合物 I

【化 1】



化合物 I

であって、Cu - K α 放射を使用する回折計で、7.3、23.3、及び28.2° 2 θ でのピーク ($\pm 0.2^\circ$) を含むX線粉末回折図を特徴とする塩酸塩の結晶形態の化合物 I；20%～35% W/W の可溶化剤；10%～22% W/W の賦形剤；1%～5% W/W の崩壊剤；及び0.5%～3% W/W の滑沢剤を含む、薬学的組成物。

【請求項 2】

4.5%～5.5% W/W の化合物 I、2.4%～3.2% W/W の可溶化剤、1.4%～2.0% W/W の賦形剤、2%～4% W/W の崩壊剤、及び1.0%～2.5% W/W の滑沢剤を含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

4.8%～5.3% W/W の化合物 I、2.6%～2.9% W/W の可溶化剤、1.5%～1.8% W/W の賦形剤、2.5%～3.5% W/W の崩壊剤、及び1.2%～1.8% W/W の滑沢剤を含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 4】

5.1.2% W/W の化合物 I、2.7.6% W/W の可溶化剤、1.6.8% W/W の賦形剤、3% W/W の崩壊剤、及び1.5% W/W の滑沢剤を含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 5】

可溶化剤がポリキサマーであり、賦形剤がマンニトールであり、崩壊剤がクロスボドンであり、及び滑沢剤がステアリン酸マグネシウムである、請求項 1～4 のいずれか 1 項

に記載の組成物。

【請求項 6】

可溶化剤がポロキサマー 407 であり、賦形剤がマンニトールであり、崩壊剤がクロスボピドンであり、及び滑沢剤がステアリン酸マグネシウムである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 7】

ポロキサマー 407 が $20\% \sim 35\% \text{ W/W}$ の範囲であり、マンニトールが $10\% \sim 22\% \text{ W/W}$ の範囲であり、クロスボピドンが $1\% \sim 5\% \text{ W/W}$ の範囲であり、及びステアリン酸マグネシウムが $0.5\% \sim 3\% \text{ W/W}$ の範囲である、請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 8】

化合物 I が $45\% \sim 55\% \text{ W/W}$ の範囲であり、ポロキサマー 407 が $24\% \sim 32\% \text{ W/W}$ の範囲であり、マンニトールが $14\% \sim 20\% \text{ W/W}$ の範囲であり、クロスボピドンが $2\% \sim 4\% \text{ W/W}$ の範囲であり、及びステアリン酸マグネシウムが $1.0\% \sim 2.5\% \text{ W/W}$ の範囲である、請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 9】

化合物 I が $48\% \sim 53\% \text{ W/W}$ の範囲であり、ポロキサマー 407 が $26\% \sim 29\% \text{ W/W}$ の範囲であり、マンニトールが $15\% \sim 18\% \text{ W/W}$ の範囲であり、クロスボピドンが $2.5\% \sim 3.5\% \text{ W/W}$ の範囲であり、及びステアリン酸マグネシウムが $1.2\% \sim 1.8\% \text{ W/W}$ の範囲である、請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 10】

$51.2\% \text{ W/W}$ の化合物 I、 $27.6\% \text{ W/W}$ のポロキサマー 407、 $16.8\% \text{ W/W}$ のマンニトール、 $3\% \text{ W/W}$ のクロスボピドン、及び $1.5\% \text{ W/W}$ のステアリン酸マグネシウムを含む、請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 11】

組成物が経口投薬に好適なカプセル形態である、請求項 1 ～ 10 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 12】

カプセルが硬質ゼラチン又はヒプロメロースを含む、請求項 11 に記載の組成物。

【請求項 13】

カプセルがヒプロメロースを含む、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 14】

化合物 I 及び可溶化剤を、対流ミキサー内で混合することを含む、請求項 1 ～ 13 のいずれか 1 項に記載の薬学的組成物を製造するための方法。

【請求項 15】

対流ミキサーが垂直式高強度ミキサーである、請求項 14 に記載の方法。

【請求項 16】

(1) 化合物 I 及び可溶化剤を混合し、混合物を得て、
(2) (1) で得られた混合物をローラー圧縮することにより、ローラー圧縮リボンを得て、
(3) ローラー圧縮リボンを粉砕することにより、顆粒を得て、
(4) (3) で得られた顆粒、賦形剤、及び崩壊剤を混合し、並びに
(5) (4) で得られた混合物及び滑沢剤を混合することにより最終混合物を得ることを含む、請求項 1 ～ 13 のいずれか 1 項に記載の組成物の製造方法。

【請求項 17】

(1) の混合で対流ミキサーが用いられ、(2) のローラー圧縮で乾式造粒機が用いられ、ローラー圧縮リボンが提供され、(3) の粉砕でスクリーニングミル又はカッティングミルが用いられ、(4) の混合で拡散ミキサーが用いられ、及び(5) の混合で拡散ミキサーが用いられる、請求項 16 に記載の方法。

【請求項 18】

c - f m s、c - k i t、F l t 3、若しくはそれらの組み合わせから選択されるタン

パク質キナーゼ、及び／又はマクロファージ若しくはミクログリアを介する疾患又は病態の治療における使用のための請求項 1 ～ 13 のいずれか 1 項に記載の組成物であって、疾患又は病態が骨粗鬆症、神経線維腫症、アルツハイマー病、てんかん、外傷性脳損傷、タウオパチー、非小細胞肺癌、前眼部疾患、後眼部疾患、リソソーム蓄積症、多発性硬化症、複合局所疼痛症候群、神経炎症、神経炎症性障害、HIV、ピンスワー型認知症、レビー小体型認知症、脳性麻痺、進行性核上性麻痺、緑内障、血管性認知症、多発梗塞性認知症、前頭側頭型認知症、仮性認知症、膀胱癌、急性骨髄性白血病、慢性リンパ球性白血病、乳癌、胆管細胞癌、結腸癌、子宮内膜癌、食道癌、神経膠腫、神経膠芽腫、肝細胞癌、ホジキンリンパ腫、白血病、肺癌、黒色腫、中皮腫、脾臓癌、腎臓癌、単球性白血病、悪性末梢神経鞘腫（MPNST）、叢状神経線維腫、唾液腺腫瘍、唾液腺の粘表皮癌、唾液腺の腺房細胞癌、消化管間質腫瘍（GIST）、巨細胞腫（GCT）、骨のGCT、色素性絨毛結節性滑膜炎（PVNS）、腱滑膜巨細胞腫（TGCT）、腱鞘のTGCT（TGCT-TS）、統合失調症、緊張病、慢性外傷性脳症、心臓炎症、網膜色素変性、脳石灰化症、及びFms、CSF1R、CSF1、若しくはIL-34、又は上記のいずれかの活性化変異若しくは転座を異常又は別様に発現する疾患若しくは病態から選択される、組成物。

【請求項 19】

PD-L1 阻害剤、PD-1 阻害剤、IDO 阻害剤、モノクローナル抗体、又はFLT3 キナーゼ阻害剤と併用される、請求項 18 に記載の使用のための組成物。

【請求項 20】

疾患又は病態が腱滑膜巨細胞腫である、請求項 18 に記載の使用のための組成物。

【請求項 21】

疾患又は病態がアルツハイマー病である、請求項 18 に記載の使用のための組成物。