

【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 4 月 8 日 (2021.4.8)

【公表番号】特表 2020-509095 (P2020-509095A)

【公表日】令和 2 年 3 月 26 日 (2020.3.26)

【年通号数】公開・登録公報 2020-012

【出願番号】特願 2019-569659 (P2019-569659)

【国際特許分類】

C 07 C 217/18 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 35/02 (2006.01)

A 61 K 47/14 (2006.01)

A 61 K 47/12 (2006.01)

A 61 K 47/18 (2006.01)

A 61 K 47/10 (2006.01)

A 61 K 9/64 (2006.01)

A 61 K 9/62 (2006.01)

A 61 K 47/42 (2017.01)

A 61 K 47/38 (2006.01)

A 61 K 31/195 (2006.01)

【F I】

C 07 C 217/18 C S P

A 61 P 35/00

A 61 P 35/02

A 61 K 47/14

A 61 K 47/12

A 61 K 47/18

A 61 K 47/10

A 61 K 9/64

A 61 K 9/62

A 61 K 47/42

A 61 K 47/38

A 61 K 31/195

【手続補正書】

【提出日】令和 3 年 2 月 26 日 (2021.2.26)

【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

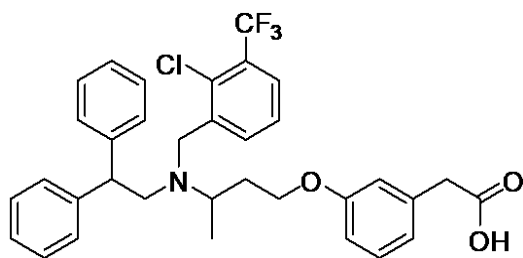
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

構造式：

【化 1】



の化合物または薬学的に許容されるその塩と、少なくとも 1 つの親油性賦形剤を含む親油性ビヒクルとを含み、該化合物または薬学的に許容されるその塩が可溶である、製剤。

【請求項 2】

少なくとも 1 つの親油性賦形剤が、脂質賦形剤および界面活性剤を含む、請求項 1 に記載の製剤。

【請求項 3】

脂質賦形剤がモノグリセリド、ジグリセリド、および / またはトリグリセリド、好ましくは少なくとも 1 つのリノール酸グリセロールを含む、請求項 1 または 2 に記載の製剤。

【請求項 4】

界面活性剤が少なくとも 1 つのラウリン酸マクロゴール - 3 2 グリセリルを含む、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の製剤。

【請求項 5】

化合物が塩酸塩、脂肪酸カルボキシレート塩、またはオレエート塩である、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の製剤。

【請求項 6】

緩衝剤、好ましくは弱塩基または脂溶性もしくは部分脂溶性カルボン酸塩をさらに含む、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の製剤。

【請求項 7】

脂溶性カルボン酸塩が、カプリル酸、カプリン酸、ラウリン酸、ステアリン酸、ミリストレイン酸、リノール酸、リノレン酸、アラキドン酸、エイコセン酸、パルミトレイン酸、サピエン酸、オレイン酸、エライジン酸および / またはバクセン酸のナトリウム、カリウム、マグネシウムおよび / またはカルシウム塩からなる群から選択される少なくとも 1 つである、請求項 6 に記載の製剤。

【請求項 8】

弱塩基がオレイン酸ナトリウムを含む、請求項 6 に記載の製剤。

【請求項 9】

40 の温度および 75 % の相対湿度で 1 週間、3 週間、3 ヶ月間または 6 ヶ月間保存した後で、製剤中の化合物または薬学的に許容されるその塩の量が約 2 % 未満で減少する、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の製剤。

【請求項 10】

製剤の pH が約 pH 4 ~ 約 pH 8、好ましくは約 pH 5 ~ 約 pH 7 である、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の製剤。

【請求項 11】

安定化剤をさらに含む、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の製剤。

【請求項 12】

安定化剤が抗酸化物質、好ましくは、クエン酸ナトリウム、BHT (ブチル化ヒドロキシトルエン)、および / または BHA (ブチル化ヒドロキシアニソール) を含む、請求項 11 に記載の製剤。

【請求項 13】

安定化剤が、ビタミン E - TP GS (コハク酸 D - トコフェリルポリエチレングリコール 1000) および EDTA (エチレンジアミン四酢酸) のうちの少なくとも 1 つである、請求項 11 に記載の製剤。

【請求項 14】

40 の温度および75%の相対湿度で1週間、3週間、3ヶ月間または6ヶ月間保存した後での製剤中の化合物の、または薬学的に許容されるその塩の量が約2%未満で減少する、請求項1～13のいずれか1項に記載の製剤。

【請求項 15】

製剤が半固体懸濁液である、請求項1～14のいずれか1項に記載の製剤。

【請求項 16】

自己乳化性であるか、および/または自己乳化性でない化合物の製剤と比べて、大きな経口生物学的利用能を有する、請求項15に記載の製剤。

【請求項 17】

経口投与に適する、請求項1～16のいずれか1項に記載の製剤。

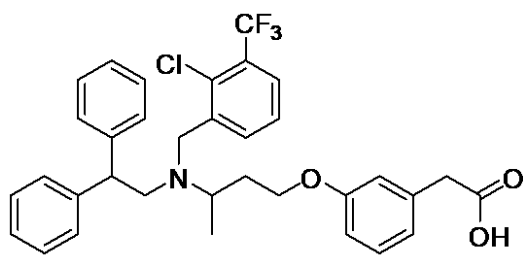
【請求項 18】

がん、好ましくは卵巣癌、乳癌、肺癌、神経膠芽腫、メラノーマ、膀胱癌、頭頸部癌、腎細胞癌、大腸癌、リンパ腫、白血病、多発性骨髄腫、肝細胞癌腫、高度の神経内分泌腫瘍、および/または肺癌などの小細胞癌腫の治療のための、請求項1～17のいずれか1項に記載の製剤の使用。

【請求項 19】

脂質賦形剤および/または界面活性剤を含む親油性ビヒクルと、構造式：

【化2】



の化合物または薬学的に許容されるその塩とを混合することを含む、製剤を生産する方法。