

【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1年10月17日(2019.10.17)

【公表番号】特表2019-518757(P2019-518757A)

【公表日】令和1年7月4日(2019.7.4)

【年通号数】公開・登録公報2019-026

【出願番号】特願2018-564930(P2018-564930)

【国際特許分類】

C 07 C 63/08 (2006.01)

C 07 C 57/10 (2006.01)

C 07 C 57/44 (2006.01)

C 07 D 213/80 (2006.01)

【F I】

C 07 C 63/08 C S P

C 07 C 57/10

C 07 C 57/44

C 07 D 213/80

【手続補正書】

【提出日】令和1年9月5日(2019.9.5)

【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

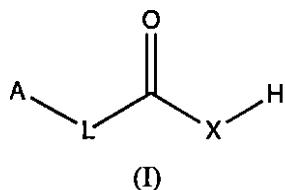
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

安息香酸リチウム化合物と共に形成剤の共結晶であって、ここで、前記共形成剤が、式(I)の化合物:

【化1】



(式中、

Lが、アルキル、カルボシクリル、C=C、C=C-C=C、C=C、又は非存在であり；

Aが、アルキル、カルボシクリル、アリール、又はヘテロアリールであり；及び

X=O又はN-Bであり、ここでBが、H、アルキル、カルボシクリル、アリール、又はヘテロアリールである)

から選択される、共結晶。

【請求項2】

前記安息香酸リチウム化合物及び前記共形成剤が、1:10～10:1の分子比率の範囲で前記共結晶中に存在する、請求項1に記載の共結晶。

【請求項3】

Lが、C=C又はC=C-C=Cであり、及びAが、C₁-C₆アルキル、アリール、又はヘテロアリー

ルである、請求項1又は2に記載の共結晶。

【請求項4】

Lが、C=C-C=Cであり、Aが、メチルであり、及びXが、Oである、請求項3に記載の共結晶。

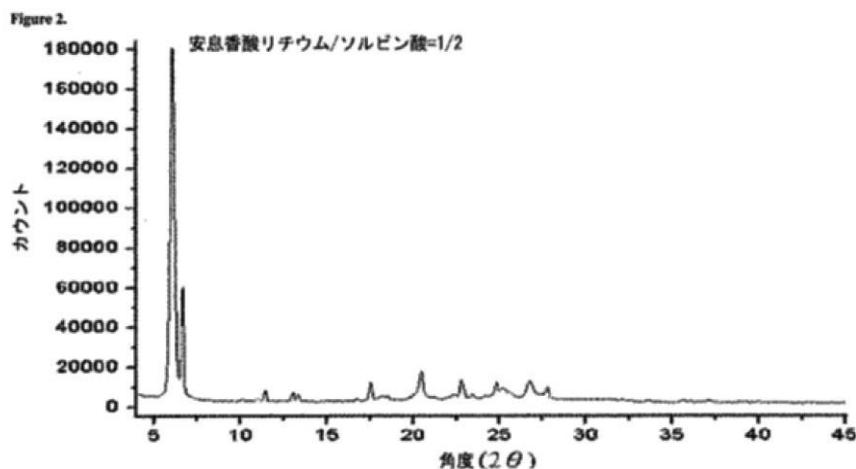
【請求項5】

前記安息香酸リチウム化合物及び前記共形成剤が、1:2の分子比率で前記共結晶中に存在する、請求項4に記載の共結晶。

【請求項6】

前記共結晶が、以下；

【表1】



に実質的に示される粉末X線回析パターンを有する、請求項5に記載の共結晶。

【請求項7】

Lが、C=Cであり、Aが、フェニルであり、及びXが、Oである、請求項3に記載の共結晶。

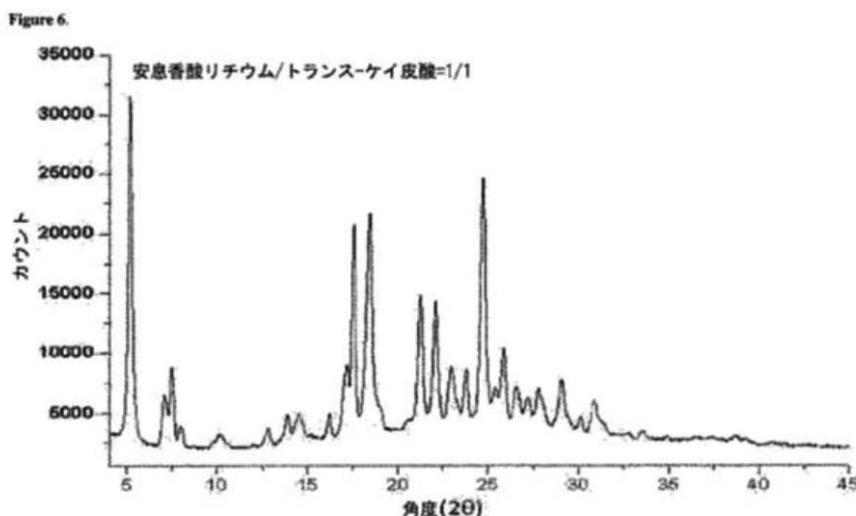
【請求項8】

前記安息香酸リチウム化合物及び前記共形成剤が、1:1の分子比率で前記共結晶中に存在する、請求項7に記載の共結晶。

【請求項9】

前記共結晶が、以下；

【表2】



に実質的に示される粉末X線回析パターン、及び約188 °Cの融点に相当する吸熱ピークを有する、請求項8に記載の共結晶。

【請求項 10】

Lが、不存在であり、Aが、ピリジルであり、及びXが、0である、請求項3に記載の共結晶。

【請求項 11】

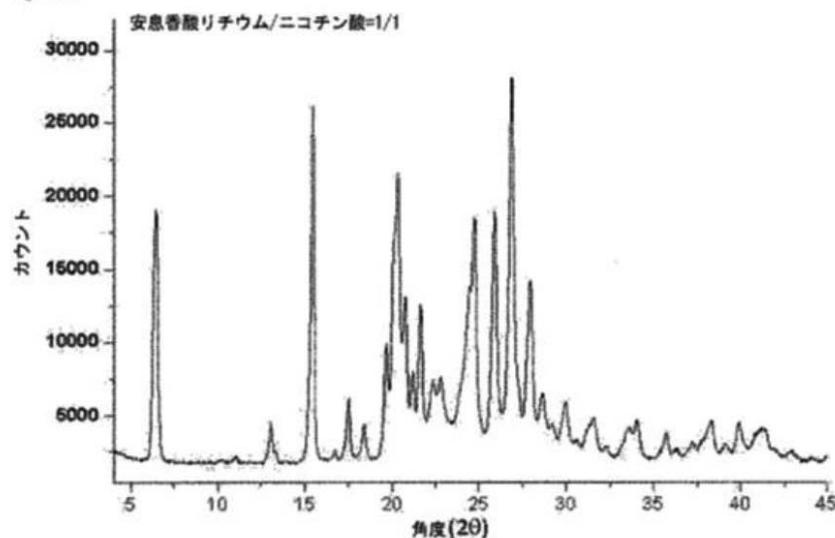
前記安息香酸リチウム化合物及び前記共形成剤が、1:1の分子比率で前記共結晶中に存在する、請求項10に記載の共結晶。

【請求項 12】

前記共結晶が、以下；

【表 3】

Figure 11.



に実質的に示される粉末X線回析パターン、及び約161°の融点に相当する吸熱ピークを有する、請求項11に記載の共結晶。

【請求項 13】

有効量の請求項1～12の何れか1項に記載の共結晶及び担体を含む、組成物。

【請求項 14】

前記組成物が、医薬組成物、栄養補助組成物、健康食品、又は医療用食品である、請求項13に記載の組成物。

【請求項 15】

治療有効量の請求項1～12の何れか1項に記載の共結晶を含み、対象の精神神経疾患を治療する又はそのリスクを低減させる、請求項13又は14に記載の組成物。

【請求項 16】

前記精神神経疾患が、統合失調症、精神障害、アルツハイマー病、認知症、軽度認知障害、良性健忘症、閉鎖性頭部外傷、自閉症スペクトル障害、アスペルガー症候群、注意欠陥・多動性障害、強迫性障害、チック症、幼年期学習障害、月経前症候群、うつ病、双極性障害、不安症、心的外傷後ストレス障害、慢性疼痛、摂食障害、依存症、パーソナリティ障害、パーキンソン病、ハンチントン病及び筋萎縮性側索硬化症、からなる群から選択される、請求項15に記載の組成物。

【請求項 17】

共結晶を調製する方法であって、当該方法が、

(i) 約40～110°の温度で、前記安息香酸リチウム化合物及び前記共形成剤を溶媒中で混合し、飽和溶液を形成する工程、ここで、前記安息香酸リチウム化合物及び前記共形成剤が、1:10～10:1のモル比率であり；

(ii) 約70～150°の温度で前記溶液を加熱及び攪拌し、前記共結晶を形成させる工程；及び

(iii) で形成された前記共結晶を回収する工程、

を含む、請求項1～12の何れか1項に記載の共結晶の調製方法。

【請求項18】

工程(i)が、前記安息香酸リチウム化合物及び前記共形成剤に前記溶媒を滴下し、形成された混合物を攪拌することによって行われ、そのような方法で前記安息香酸リチウム化合物及び前記共形成剤を前記溶媒中に溶解させる、請求項17に記載の方法。

【請求項19】

請求項1～12の何れか1項に記載の共結晶を提供する工程、

(i) 約35～110 の範囲の温度で、前記共結晶を溶媒に溶解して溶液を形成する工程；

(ii) 前記溶液を約40～110 の温度で第1の期間攪拌し、前記共結晶を形成させる工程；ここで、前記第1の期間は、約1～10日であり；及び

前記共結晶を回収する工程、

を含む、請求項1～12の何れか1項に記載の共結晶の調製方法。

【請求項20】

工程(iii)に続いて、前記溶液を約40～110 の温度で第2の期間攪拌することをさらに含み、ここで、第2の期間は、約1～10日である、

請求項19に記載の方法。