

【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28年6月30日 (2016.6.30)

【公表番号】特表2014-513143(P2014-513143A)

【公表日】平成26年5月29日 (2014.5.29)

【年通号数】公開・登録公報2014-028

【出願番号】特願2014-509721(P2014-509721)

【国際特許分類】

C 0 7 D 473/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/522 (2006.01)

A 6 1 K 31/155 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/64 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 473/06 C S P

A 6 1 K 31/522

A 6 1 K 31/155

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/64

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【誤訳訂正書】

【提出日】平成28年5月13日 (2016.5.13)

【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 1 0

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 1 0 】

本発明者らは、W O 2 0 1 0 / 0 7 2 7 7 6 A 1 のリナグリブチンベンゾエートの結晶形態が非常に吸湿性であることを見出した。しかしながら、湿式造粒法などの一般的な医薬品加工条件下では吸湿性化合物を扱いづらいため、例えば、加工中に化学分解または多型形質転換を回避するためには特殊な技術および機器が要る。更にまた、吸湿性化合物およびこれらを含む医薬組成物は、特殊なコンテインメントにパッケージングされていない限り、保管中に適切な製品品質を確保できない場合が多い。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

リナグリブチンベンゾエートの結晶形態であって、 $8.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $8.7 \pm 0.2^\circ$ 、 $10.4 \pm 0.2^\circ$ 、 $12.9 \pm 0.2^\circ$ 、 $13.8 \pm 0.2^\circ$  および  $17.4 \pm 0.2^\circ$  の 2 角度におけるピークを含む X 線粉末回折パターンを有する、結晶形態。

【請求項 2】

請求項 1 に記載のリナグリブチンベンゾエートの結晶形態であって、赤外線スペクトルが  $1701 \pm 2 \text{ cm}^{-1}$ 、 $1663 \pm 2 \text{ cm}^{-1}$ 、 $1134 \pm 2 \text{ cm}^{-1}$ 、 $760 \pm 2 \text{ cm}^{-1}$  および  $724 \pm 2 \text{ cm}^{-1}$  の波数におけるピークを含むことを特徴とする、結晶形態。

【請求項 3】

請求項 1 または請求項 2 に記載のリナグリブチンベンゾエートの結晶形態であって、DSC 曲線が 193 の開始温度で吸熱ピークを示すことを特徴とする、結晶形態。

【請求項 4】

請求項 1 から請求項 3 のいずれかに記載のリナグリブチンベンゾエートの結晶形態であって、含水率が相対湿度 3 % にて 0 重量%、相対湿度 90 % にて 2.0 重量%であることを特徴とする、結晶形態。

【請求項 5】

球顆状粒子の形態の請求項 1 から請求項 4 のいずれかに記載のリナグリブチンベンゾエートの結晶形態であって、球顆状粒子の外径が 10 から 100  $\mu\text{m}$  である、結晶形態。

【請求項 6】

請求項 1 から 5 のいずれか一項に記載のリナグリブチンベンゾエートの結晶形態の調製方法であって、

- a) 加熱によりリナグリブチンベンゾエートを 10 g / l から 20 g / l の濃度範囲でアセトニトリル中に溶解する段階と、
  - b) 場合によって溶液を濾過する段階と、
  - c) 35 超の温度で結晶化を誘導するため、溶液を -1 / min の冷却速度で冷却する段階と、
  - d) 得られた結晶を単離する段階と、
  - e) 場合によって結晶を乾燥させる段階
- とを含む、調製方法。

【請求項 7】

請求項 1 から 5 のいずれか一項に記載のリナグリブチンベンゾエートの結晶形態を含む医薬組成物であって、少なくとも 1 種の医薬上許容される賦形剤を更に含む、医薬組成物。

【請求項 8】

請求項 7 に記載の医薬組成物であって、特にカプセルまたは錠剤の経口投与形態である、医薬組成物。

【請求項 9】

請求項 7 または 8 に記載の医薬組成物であって、メトホルミン、ピオグリタゾン、スルホニル尿素、またはその医薬上許容される塩を更に含む、医薬組成物。

【請求項 10】

- 請求項 7 または 8 に記載の医薬組成物であって、
- メトホルミンまたはその医薬上許容される塩と、
  - スルホニル尿素またはその医薬上許容される塩
- とを更に含む、医薬組成物。

【請求項 11】

ケッペン - ガイガー気候分類による Af または Am 気候地域を有する国における販売を意図した医薬組成物を調製することを目的とする、請求項 1 から 5 のいずれか一項に記載のリナグリブチンベンゾエートの結晶形態の使用。

【請求項 12】

請求項 1 から 5 のいずれかに記載のリナグリブチンベンゾエートの結晶形態を含む医薬組成物を調製する方法であって、請求項 1 から 5 のいずれかに記載のリナグリブチンベンゾエートの結晶形態を少なくとも 1 種の医薬上許容される賦形剤と混合する段階を含む、方法。

【請求項 13】

湿式造粒法により混合が行われる、請求項 1 2 に記載の方法。

【請求項 1 4】

D I N 5 3 1 2 2 に従って測定した水蒸気の浸透率が  $1.0 \text{ g} \cdot \text{m}^{-2} \cdot \text{d}^{-1}$  から  $5000 \text{ g} \cdot \text{m}^{-2} \cdot \text{d}^{-1}$  である材料から調製される、請求項 7 から 1 0 のいずれか一項に記載の医薬組成物を含む、コンテナ。

【請求項 1 5】

経口投与剤形を含むブリスタパッケージである請求項 1 4 に記載のコンテナであって、ブリスタが、ポリ塩化ビニル、ポリスチロール、ポリアミド、ポリエチレンビニルアセテート、セロハン、および / またはセルロースアセテートからできている、コンテナ。