

【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 11 月 21 日 (2019.11.21)

【公開番号】特開 2019-108366 (P2019-108366A)

【公開日】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 2019-38349 (P2019-38349)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4545 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/34 (2017.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/04 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/4545

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 25/06

A 6 1 K 9/20

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/04

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/14

【手続補正書】

【提出日】令和 1 年 10 月 10 日 (2019.10.10)

【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】

治療に必要な患者における偏頭痛の治療に有用な医薬の調製のための薬学的組成物の使用であって、

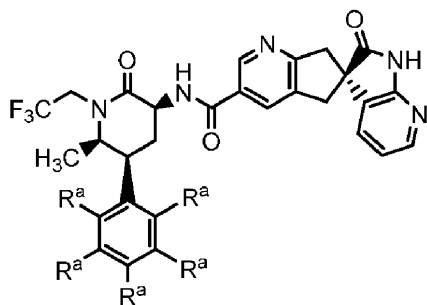
該薬学的組成物が、

(a) (i) 水溶性ポリビニルピロリドン / 酢酸ビニルコポリマーであるポリマーマトリックス、

(i i) 分散剤、および

( i i i ) 治療上有効量の式 I の化合物またはその薬学的に許容可能な塩若しくは水和物：

【化 1】



式 I

( 式中、「 $R^a$ 」は独立して - H または - F である ) を含む押出物であって、ここで、前記分散剤および式 I の化合物は、前記ポリマーマトリックス内に分散している押出物、および

( b ) 崩壊系、  
を含む、薬学的組成物の使用。

【請求項 2】

前記崩壊系が、粉末塩化ナトリウムおよびクロスカルメロースナトリウムを含む、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 3】

前記崩壊系が、1 : 1 重量比の粉末塩化ナトリウムおよびクロスカルメロースナトリウムを含む、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 4】

前記押出物中の前記分散剤が、d - アルファ - トコフェリルポリエチレングリコールスクシネート ( T P G S ) である、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 5】

前記組成物が、( a ) マンニトール、( b ) コロイダルシリカ、( c ) 微結晶セルロース、および ( d ) フマル酸ステアリルナトリウムをさらに含む、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 6】

前記押出物が、前記組成物の約 50 w t . % を構成し、前記押出物が式 I の化合物を約 5 w t . % から約 23 w t . % 含む、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 7】

前記組成物が約 12 k P から約 18 k P の硬度を有し、そして、前記組成物が、37 の模擬胃液 ( p H 1 . 8 ) 900 m l 中、50 r p m で運転される U S P 2 パドルを備えたパドル攪拌装置で、U S P 30 N F 25 第 711 章に準拠する溶解試験に供されるとき、前記組成物中に含有された前記式 I の化合物の少なくとも約 90 % を約 20 分未満で放出する、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 8】

前記組成物が 1 . 75 M P a の引張強度を有し、そして、前記組成物が、37 の模擬胃液 ( p H 1 . 8 ) 900 m l 中、50 r p m で運転される U S P 2 パドルを備えたパドル攪拌装置で、U S P 30 N F 25 第 711 章に準拠する溶解試験に供されるとき、前記組成物中に含有された前記式 I の化合物の少なくとも約 90 % を約 20 分未満で放出する、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 9】

式 I の化合物が、( S ) - N - ( ( 3 S , 5 S , 6 R ) - 6 - メチル - 2 - オキソ - 1 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) - 5 - ( 2 , 3 , 6 - トリフルオロフェニル ) ピペリジン - 3 - イル ) - 2 ' - オキソ - 1 ' , 2 ' , 5 , 7 - テトラヒドロスピロ [ シク

ロペンタ[ b ]ピリジン - 6 , 3 ' - ピロロ[ 2 , 3 - b ]ピリジン ] - 3 - カルボキサミドである、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 1 0】

式 I の化合物が、( S ) - N - ( ( 3 S , 5 S , 6 R ) - 6 - メチル - 2 - オキソ - 5 - フェニル - 1 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) ピペリジン - 3 - イル ) - 2 ' - オキソ - 1 ' , 2 ' , 5 , 7 - テトラヒドロスピロ[ シクロペンタ[ b ]ピリジン - 6 , 3 ' - ピロロ[ 2 , 3 - b ]ピリジン ] - 3 - カルボキサミドである、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 1 1】

式 I の化合物が、( S ) - N - ( ( 3 S , 5 S , 6 R ) - 6 - メチル - 2 - オキソ - 5 - フェニル - 1 - ( 2 , 2 , 2 - トリフルオロエチル ) ピペリジン - 3 - イル ) - 2 ' - オキソ - 1 ' , 2 ' , 5 , 7 - テトラヒドロスピロ[ シクロペンタ[ b ]ピリジン - 6 , 3 ' - ピロロ[ 2 , 3 - b ]ピリジン ] - 3 - カルボキサミド・三水和物である、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 1 2】

前記粉末塩化ナトリウムが、( i ) 約 2 1 0 ミクロン未満の  $d_{50}$  値、( i i ) 約 5 0 ミクロン未満の  $d_{10}$  値、および( i i i ) 約 4 7 0 ミクロン未満の  $d_{90}$  値を有する、請求項 2 又は 3 に記載の使用。

【請求項 1 3】

前記押出物の前記水溶性ポリマーマトリックスが、約 6 : 4 のポリビニルピロリドン / 酢酸ビニルモノマー単位比を有するコポリマーである、請求項 1 に記載の使用。