

【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6年2月2日(2024.2.2)

【国際公開番号】WO2021/153635

【出願番号】特願2021-574083(P2021-574083)

【国際特許分類】

A 6 1 K 47/24(2006.01)

A 6 1 K 45/00(2006.01)

A 6 1 K 9/08(2006.01)

A 6 1 K 9/107(2006.01)

A 6 1 K 9/12(2006.01)

A 6 1 K 47/69(2017.01)

A 6 1 K 47/14(2017.01)

A 6 1 P 5/06(2006.01)

A 6 1 P 35/00(2006.01)

A 6 1 P 41/00(2006.01)

C 0 7 D 307/20(2006.01)

C 0 7 D 493/04(2006.01)

A 6 1 K 38/09(2006.01)

A 6 1 K 47/22(2006.01)

C 0 7 C 69/28(2006.01)

C 0 7 C 69/30(2006.01)

10

20

【F I】

A 6 1 K 47/24

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 9/107

A 6 1 K 9/12

A 6 1 K 47/69

A 6 1 K 47/14

A 6 1 P 5/06

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 41/00

C 0 7 D 307/20

C 0 7 D 493/04 1 0 1 D

A 6 1 K 38/09

A 6 1 K 47/22

C 0 7 C 69/28

C 0 7 C 69/30

30

40

【手続補正書】

【提出日】令和6年1月25日(2024.1.25)

【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】

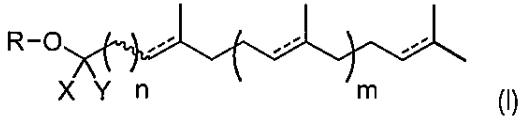
【特許請求の範囲】

【請求項1】

50

下記一般式 (I) で表される両親媒性化合物とリン脂質とを含む、非ラメラ液晶形成性組成物。

【化 1】



(式中、X 及び Y は 一緒になって酸素原子を表すか又はそれぞれ水素原子を表し、n は 2、1、又は 0 を表し、m は 2 又は 1 を表し、

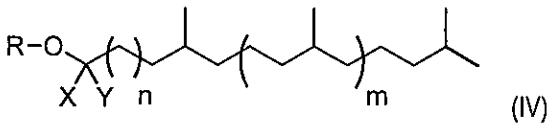
10

は一重結合又は二重結合を表し、R は 1 つ以上の水酸基を有する親水性基を表す)

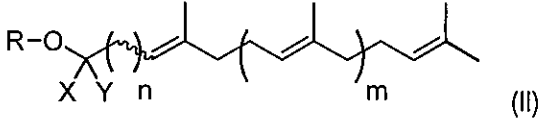
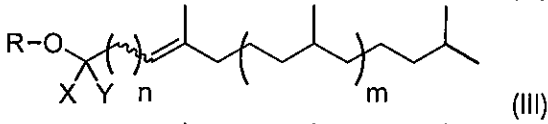
【請求項 2】

前記両親媒性化合物が、以下の一般式 (I V)、(I I I)、又は (I I) で表される、請求項 1 に記載の組成物。

【化 2】



20



(式中、X 及び Y は 一緒になって酸素原子を表すか又はそれぞれ水素原子を表し、n は 2、1、又は 0 を表し、m は 2 又は 1 を表す)

30

【請求項 3】

前記一般式中、 $n = 2$ 、及び $m = 2$ である、請求項 1 又は 2 に記載の組成物。

【請求項 4】

前記両親媒性化合物とリン脂質の重量比が $80 : 20 \sim 20 : 80$ 、又は $70 : 30 \sim 30 : 70$ である、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 5】

前記両親媒性化合物とリン脂質の重量比が $50 : 50 \sim 30 : 70$ 、又は $45 : 55 \sim 30 : 70$ である、請求項 4 に記載の組成物。

【請求項 6】

リン脂質が ホスファチジルコリン及びホスファチジエタノールアミン からなる群から 選択される、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の組成物。

40

【請求項 7】

リン脂質が大豆ホスファチジルコリン、卵黄ホスファチジルコリン、ジミリストイルホスファチジルコリン、ジオレイルホスファチジルコリン、及びジオレイルホスファチジエタノールアミンからなる群から選択される、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 8】

前記一般式 (I) 中の R が ソルピタン、グリセロール、エリスリトール、ペンタエリスリトール、ジグリセロール、イソソルバイド、及びグリコール からなる群から選択される いずれか 1 つから 1 つの水酸基が除かれた親水性基 を表す、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項

50

に記載の組成物。

【請求項 9】

前記両親媒性化合物が以下：

- モノオ - (5 , 9 , 1 3 , 1 7 - テトラメチルオクタデカノイル) ソルビタン、
 モノオ - (5 , 9 , 1 3 , 1 7 - テトラメチルオクタデカ - 4 - エノイル) グリセロール、
 モノオ - (5 , 9 , 1 3 , 1 7 - テトラメチルオクタデカノイル) グリセロール、
 モノオ - (5 , 9 , 1 3 , 1 7 - テトラメチルオクタデカ - 4 , 8 , 1 2 , 1 6 - テトラ
 エノイル) グリセロール、
 モノオ - (5 , 9 , 1 3 , 1 7 - テトラメチルオクタデカノイル) エリスリトール、 10
 モノオ - (5 , 9 , 1 3 , 1 7 - テトラメチルオクタデカ - 4 - エノイル) ペンタエリス
 リトール、
 モノオ - (5 , 9 , 1 3 , 1 7 - テトラメチルオクタデカノイル) ペンタエリスリトール
 、
 モノオ - (5 , 9 , 1 3 , 1 7 - テトラメチルオクタデカ - 4 - エノイル) ジグリセロー
 ル、
 モノオ - (5 , 9 , 1 3 , 1 7 - テトラメチルオクタデカ - 4 - エノイル) ソルビタン、
 モノオ - (5 , 9 , 1 3 , 1 7 - テトラメチルオクタデカ - 4 - エノイル) イソソルバイ
 ド、
 モノオ - (5 , 9 , 1 3 , 1 7 - テトラメチルオクタデカノイル) イソソルバイド、 20
 モノオ - (5 , 9 , 1 3 - トリメチルテトラデカ - 4 - エノイル) グリセロール、
 モノオ - (5 , 9 , 1 3 - トリメチルテトラデカ - 4 - エノイル) ソルビタン、
 モノオ - (5 , 9 , 1 3 - トリメチルテトラデカノイル) ソルビタン、
 モノオ - (5 , 9 , 1 3 - トリメチルテトラデカ - 4 - エノイル) プロピレングリコール
 、
 モノオ - (5 , 9 , 1 3 , 1 7 - テトラメチルオクタデカ - 4 - エノイル) プロピレング
 リコール、
 モノオ - (5 , 9 , 1 3 , 1 7 - テトラメチルオクタデカノイル) プロピレングリコール
 、
 モノオ - (4 , 8 , 1 2 , 1 6 - テトラメチルヘプタデカ - 3 - エノイル) ソルビタン、 30
 モノオ - (4 , 8 , 1 2 , 1 6 - テトラメチルヘプタデカ - 3 - エノイル) イソソルバイ
 ド、
 モノオ - (4 , 8 , 1 2 , 1 6 - テトラメチルヘプタデカ - 3 - エノイル) プロピレング
 リコール、
 モノオ - (5 , 9 , 1 3 , 1 7 - テトラメチルオクタデカ - 4 - エノイル) エチレングリ
 コール、
 モノオ - (5 , 9 , 1 3 , 1 7 - テトラメチルオクタデカ - 4 - エノイル) 1 , 3 - ブチ
 レングリコール、
 モノオ - (5 , 9 , 1 3 , 1 7 - テトラメチルオクタデカ - 4 - エノイル) 3 - メチル -
 1 , 3 - ブタンジオール、 40
モノオ - (3 , 7 , 1 1 , 1 5 - テトラメチルヘキサデカ - 2 - エノイル) ソルビタン、
モノオ - (3 , 7 , 1 1 , 1 5 - テトラメチルヘキサデカノイル) ソルビタン、
モノオ - (3 , 7 , 1 1 , 1 5 - テトラメチルヘキサデカ - 2 - エノイル) イソソルバイ
ド、
モノオ - (3 , 7 , 1 1 , 1 5 - テトラメチルヘキサデカ - 2 - エノイル) プロピレング
リコール、及び
モノオ - (3 , 7 , 1 1 , 1 5 - テトラメチルヘキサデカノイル) プロピレングリコール
 からなる群から選択される、請求項 1 又は 2 に記載の組成物。

【請求項 10】

油分及び有機溶媒のうち少なくとも一方を含む、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の 50

組成物。

【請求項 1 1】

水性媒体をさらに含む、非ラメラ液晶組成物である、請求項 1 ~ 1 0 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 1 2】

界面活性剤をさらに含む、非ラメラ液晶エマルション組成物である、請求項 1 1 に記載の組成物。

【請求項 1 3】

水性媒体の存在下で非ラメラ液晶を形成可能である液晶前駆体組成物である、請求項 1 ~ 1 0 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 1 4】

請求項 1 ~ 1 3 のいずれか 1 項に記載の組成物を含む、医薬製剤。

【請求項 1 5】

生体組織の癒着防止用の、請求項 1 4 に記載の医薬製剤。

【請求項 1 6】

前記組成物が薬物をさらに含む、徐放性製剤である請求項 1 4 に記載の医薬製剤。

【請求項 1 7】

薬物が、ゴナドトロピン放出ホルモン (GnRH) アゴニストである、請求項 1 6 に記載の医薬製剤。

【請求項 1 8】

GnRH アゴニストが、ロイプロリド又はその塩である、請求項 1 7 に記載の医薬製剤。

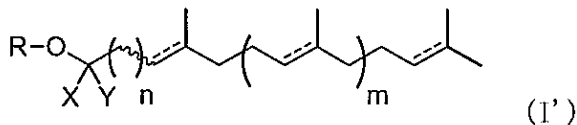
【請求項 1 9】

スプレー剤、エアゾール剤、注射剤、又はデポ剤である、請求項 1 4 ~ 1 8 のいずれか 1 項に記載の医薬製剤。

【請求項 2 0】

下記一般式 (I ') で表される両親媒性化合物又はその塩。

【化 3】



(式中、 X 及び Y は 一緒になって酸素原子を表すか又はそれぞれ水素原子を表し、 n は 2、1、又は 0 を表し、 m は 2 又は 1 を表し、

=====

は一重結合又は二重結合を表し、 R はソルビタン、イソソルバイド、及びグリコールからなる群から選択されるいずれか 1 つから 1 つの水酸基が除かれた親水性基を表す)

【請求項 2 1】

前記一般式 (I ') 中、 n = 2 である、請求項 2 0 に記載の化合物又はその塩。

【請求項 2 2】

前記両親媒性化合物が、下記：

モノ O - (5 , 9 , 1 3 , 1 7 - テトラメチルオクタデカノイル) ソルビタン、

モノ O - (5 , 9 , 1 3 , 1 7 - テトラメチルオクタデカ - 4 - エノイル) ソルビタン、

モノ O - (5 , 9 , 1 3 - トリメチルテトラデカ - 4 - エノイル) ソルビタン、

モノ O - (5 , 9 , 1 3 - トリメチルテトラデカノイル) ソルビタン、

モノ O - (5 , 9 , 1 3 , 1 7 - テトラメチルオクタデカ - 4 - エノイル) イソソルバイド、

モノ O - (5 , 9 , 1 3 , 1 7 - テトラメチルオクタデカノイル) イソソルバイド、

モノO - (5 , 9 , 13 - トリメチルテトラデカ - 4 - エノイル) プロピレングリコール
、
モノO - (5 , 9 , 13 , 17 - テトラメチルオクタデカ - 4 - エノイル) プロピレング
リコール、
モノO - (5 , 9 , 13 , 17 - テトラメチルオクタデカノイル) プロピレングリコール
、
モノO - (4 , 8 , 12 , 16 - テトラメチルヘプタデカ - 3 - エノイル) ソルピタン、
モノO - (4 , 8 , 12 , 16 - テトラメチルヘプタデカ - 3 - エノイル) イソソルバイ
ド、
モノO - (4 , 8 , 12 , 16 - テトラメチルヘプタデカ - 3 - エノイル) プロピレング 10
リコール、
モノO - (5 , 9 , 13 , 17 - テトラメチルオクタデカ - 4 - エノイル) エチレングリ
コール、
モノO - (5 , 9 , 13 , 17 - テトラメチルオクタデカ - 4 - エノイル) 1 , 3 - ブチ
レングリコール、
モノO - (5 , 9 , 13 , 17 - テトラメチルオクタデカ - 4 - エノイル) 3 - メチル -
1 , 3 - ブタンジオール、
~~モノO - (3 , 7 , 11 , 15 - テトラメチルヘキサデカ - 2 - エノイル) ソルピタン、~~
~~モノO - (3 , 7 , 11 , 15 - テトラメチルヘキサデカノイル) ソルピタン、~~
~~モノO - (3 , 7 , 11 , 15 - テトラメチルヘキサデカ - 2 - エノイル) イソソルバイ 20
ド、~~
~~モノO - (3 , 7 , 11 , 15 - テトラメチルヘキサデカ - 2 - エノイル) プロピレング
リコール、及び~~
~~モノO - (3 , 7 , 11 , 15 - テトラメチルヘキサデカノイル) プロピレングリコール~~
からなる群から選択される、請求項 20 若しくは 21 に記載の化合物又はその塩。

30

40

50