

【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21年6月18日(2009.6.18)

【公開番号】特開2009-46513(P2009-46513A)

【公開日】平成21年3月5日(2009.3.5)

【年通号数】公開・登録公報2009-009

【出願番号】特願2008-265492(P2008-265492)

【国際特許分類】

C 07 D 407/12 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 3/00 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 3/04 (2006.01)

A 61 P 3/06 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 9/12 (2006.01)

A 61 P 9/04 (2006.01)

A 61 P 7/10 (2006.01)

A 61 P 19/06 (2006.01)

A 61 P 1/18 (2006.01)

A 61 K 31/351 (2006.01)

【F I】

C 07 D 407/12 C S P

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 3/00

A 61 P 3/10

A 61 P 3/04

A 61 P 3/06

A 61 P 9/10

A 61 P 9/12

A 61 P 9/04

A 61 P 7/10

A 61 P 19/06

A 61 P 1/18

A 61 P 43/00 1 0 5

A 61 K 31/351

【手続補正書】

【提出日】平成21年5月1日(2009.5.1)

【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】

1-クロロ-4-( -D-グルコピラノース-1-イル)-2-[4-((S)-テトラヒドロフラン-3-イルオキシ)-ベンジル]-ベンゼンの結晶性形態。

【請求項 2】

約149 ± 3 の融点（DSCにより測定された；開始温度として評価された；加熱速度10 K/分）をもつ1-クロロ-4-( -D-グルコピラノース-1-イル)-2-[4-((S)-テトラヒドロフラン-3-イルオキシ)-ベンジル]-ベンゼンの結晶性形態。

【請求項 3】

X 線粉末回折パターンが

4.46 °、9.83 °、11.68 °、13.35 °、14.69 °、15.73 °、16.20 °、17.95 °、18.31 °、18.43 °、18.84 °、19.16 °、19.50 °、20.36 °、20.55 °、21.18 °、21.46 °、22.09 °、22.22 °、22.71 °、23.44 °、23.72 °、24.09 °、24.33 °、24.81 °、25.21 °、25.65 °、26.40 °、26.85 °、27.26 °、27.89 °、28.24 °、29.01 °、29.41 ° 2 ( ± 0.05 ° 2 ) にピークを更に含み、前記 X 線粉末回折パターンが CuK<sub>α</sub> 放射線を使用してつくられる、1-クロロ-4-( -D-グルコピラノース-1-イル)-2-[4-((S)-テトラヒドロフラン-3-イルオキシ)-ベンジル]-ベンゼンの結晶性形態。

【請求項 4】

少なくとも50%が請求項 1、2 又は 3 記載の結晶性形態の形態で存在する、1-クロロ-4-( -D-グルコピラノース-1-イル)-2-[4-((S)-テトラヒドロフラン-3-イルオキシ)-ベンジル]-ベンゼン。

【請求項 5】

請求項 1、2 又は 3 記載の結晶性形態を含む医薬組成物。

【請求項 6】

ナトリウム依存性グルコースコトランスポーター-SGLTを抑制することにより影響し得る疾患又は症状の治療又は予防に適している医薬組成物を調製するための請求項 1、2 又は 3 記載の結晶性形態の使用。

【請求項 7】

代謝障害、特に型 1 及び型 2 真性糖尿病、糖尿病の合併症、代謝性アシドーシス又はケトosis、反応性低血糖、高インスリン血症、グルコース代謝障害、インスリン耐性、メタボリック症候群、異なる起源の脂質異常、アテローム硬化症及び関連疾患、肥満、高血圧、慢性心不全、浮腫及び高尿酸血からなる群から選ばれた代謝障害の治療又は予防に適している医薬組成物を調製するための請求項 1、2 又は 3 記載の結晶性形態の使用。

【請求項 8】

ナトリウム依存性グルコースコトランスポーター-SGLT2を抑制するための医薬組成物を調製するための請求項 1、2 又は 3 記載の結晶性形態の使用。

【請求項 9】

膵臓β細胞の変性を予防し、かつ / 又は膵臓β細胞の機能を改善かつ / 又は回復するための医薬組成物を調製するための請求項 1、2 又は 3 記載の結晶性形態の使用。

【請求項 10】

請求項 1、2 又は 3 記載の結晶性形態の製造方法であって、

前記方法が下記の工程：

- (a) 1-クロロ-4-( -D-グルコピラノース-1-イル)-2-[4-((S)-テトラヒドロフラン-3-イルオキシ)-ベンジル]-ベンゼンを溶媒又は溶媒の混合物に溶解して飽和又はほぼ飽和溶液を生成する工程、
  - (b) その溶液を貯蔵して請求項 1、2 又は 3 記載の結晶性形態を溶液から沈殿させ、こうして懸濁液を得る工程、
  - (c) 沈殿をその懸濁液から単離する工程、及び
  - (d) 過剰の前記溶媒又は溶媒の混合物が除去されるまで沈殿を乾燥させる工程
- を含むことを特徴とする、前記結晶性形態の製造方法。

【請求項 11】

溶媒が、C<sub>1-4</sub>-アルカノール、水、酢酸エチル、アセトニトリル、アセトン、ジエチルエーテル及びこれらの溶媒の 2 種以上の混合物からなる群から選ばれる、請求項 10 記載の方法。

【請求項 12】

溶媒が、酢酸エチル、エタノール、イソプロパノール並びにエタノール及び／又はイソプロパノールと水の混合物からなる群から選ばれる、請求項 1 1 記載の方法。

【請求項 1 3】

1-クロロ-4-( $\alpha$ -D-グルコピラノース-1-イル)-2-[4-((S)-テトラヒドロフラン-3-イルオキシ)-ベンジル]-ベンゼンの溶解性を低下するために、工程(a)及び／又は工程(b)で、一種以上のアンチソルベント又は非溶媒が添加される、請求項 1 0、1 1 または 1 2 記載の方法。

【請求項 1 4】

アンチソルベント又は非溶媒が水である、請求項 1 3 記載の方法。