

【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10月22日(2009.10.22)

【公表番号】特表2009-507809(P2009-507809A)

【公表日】平成21年2月26日(2009.2.26)

【年通号数】公開・登録公報2009-008

【出願番号】特願2008-529633(P2008-529633)

【国際特許分類】

C 0 7 D 309/10 (2006.01)

C 0 7 D 207/16 (2006.01)

A 6 1 K 31/351 (2006.01)

A 6 1 K 31/401 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 3/08 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/06 (2006.01)

A 6 1 P 7/10 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 309/10

C 0 7 D 207/16

A 6 1 K 31/351

A 6 1 K 31/401

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 3/08

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 9/06

A 6 1 P 7/10

【手続補正書】

【提出日】平成21年9月7日(2009.9.7)

【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-グルコピラノス-1-イル)-2-(4-エチニル-ベンジル)-ベンゼンと一つ以上の天然のアミノ酸との結晶複合体。

【請求項2】

天然アミノ酸がプロリンである、請求項1記載の結晶複合体。

【請求項3】

1-クロロ-4-(-D-グルコピラノス-1-イル)-2-(4-エチニル-ベンジル)-ベンゼンとプロ

リンとの、モル比が約 1 : 1 の複合体である、請求項 1 記載の結晶複合体。

【請求項 4】

X線粉末回折パターンが、16.75、17.55及び18.91度² (±0.05度²)でのピークを含み、前記X線粉末回折パターンがCuK_α照射を使用して作成される、請求項 2 又は 3 記載の結晶複合体。

【請求項 5】

X線粉末回折パターンが、5.07、21.62度² (±0.05度²)でのピークをさらに含み、前記X線粉末回折パターンがCuK_α照射を使用して作成される、請求項 4 記載の結晶複合体。

【請求項 6】

複合体の少なくとも50%が、請求項 4 又は 5 記載の結晶複合体として存在する、1-クロロ-4-(α -D-グルコピラノス-1-イル)-2-(4-エチニル-ベンジル)-ベンゼンとプロリンとの複合体。

【請求項 7】

請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項記載の結晶複合体を一つ以上含む医薬組成物。

【請求項 8】

1-クロロ-4-(α -D-グルコピラノス-1-イル)-2-(4-エチニル-ベンジル)-ベンゼンの結晶水和物。

【請求項 9】

1-クロロ-4-(α -D-グルコピラノス-1-イル)-2-(4-エチニル-ベンジル)-ベンゼン1モル当たりの水含量が約1~2モルである、請求項 8 記載の結晶水和物。

【請求項 10】

X線粉末回折パターンが17.16、18.53及び22.94度² (±0.05度²)でのピークを含み、前記X線粉末回折パターンがCuK_α照射を使用して作成される、請求項 8 又は 9 記載の結晶水和物。

【請求項 11】

X線粉末回折パターンが、4.53及び13.11度² (±0.05度²)でのピークをさらに含み、前記X線粉末回折パターンがCuK_α照射を使用して作成される、請求項 10 記載の結晶水和物。

【請求項 12】

物質中の少なくとも50%が、請求項 8 ~ 11 のいずれか 1 項による結晶水和物の形態で存在する、1-クロロ-4-(α -D-グルコピラノス-1-イル)-2-(4-エチニル-ベンジル)-ベンゼン。

【請求項 13】

請求項 8 ~ 11 のいずれか 1 項記載の結晶水和物を一つ以上含む医薬組成物。

【請求項 14】

代謝性疾患、特に1型及び2型の真性糖尿病、糖尿病合併症、代謝性アシドーシス又はケトosis、反応性低血糖症、高インシュリン血症、グルコース代謝性疾患、インシュリン耐性、代謝性シンドローム、異なる起源の異脂肪血症、アテローム性動脈硬化症及び関連疾患、肥満、高血圧、慢性心不全、浮腫及び高尿酸血症からなる群より選ばれる代謝性疾患の治療又は予防に適した医薬組成物の製造のための、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載される一つ以上の結晶複合体又は請求項 8 ~ 11 のいずれか 1 項に記載される一つ以上の結晶水和物の使用。

【請求項 15】

ナトリウム依存性グルコース共輸送体SGLT2の阻害用医薬組成物を製造するための、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載される一つ以上の結晶複合体又は請求項 8 ~ 11 のいずれか 1 項に記載される一つ以上の結晶水和物の使用。

【請求項 16】

以下の工程を含む、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項記載の結晶複合体の製造方法：

(a) 溶媒又は溶媒の混合物中に1-クロロ-4-(α -D-グルコピラノス-1-イル)-2-(4-エチニル-

- ル-ベンジル)-ベンゼン及び一つ以上の天然アミノ酸を含む溶液を調製する工程；
- (b) 溶液から結晶複合体を沈殿させるために溶液を貯蔵する工程；
- (c) 溶液から沈殿物を除去する工程；及び
- (d) 所望により過剰な前記溶媒又は溶媒の混合物を除去するまで沈殿物を乾燥する工程。
- 【請求項 17】

以下の工程を含む、請求項 8 ~ 11 のいずれか 1 項記載の結晶水和物の製造方法：

- (a) 溶媒又は溶媒の混合物中に1-クロロ-4-(β -D-グルコピラノス-1-イル)-2-(4-エチニル-ベンジル)-ベンゼンを溶解して溶液を作る工程、但し、出発物質である1-クロロ-4-(β -D-グルコピラノス-1-イル)-2-(4-エチニル-ベンジル)-ベンゼン及び/又は前記溶媒又は溶媒の混合物は、水和物を形成するのに少なくとも要求されるH₂O量を含むことを条件とする；
- (b) 溶液から結晶水和物を沈殿するために溶液を貯蔵する工程；
- (c) 溶液から沈殿物を除去する工程；及び
- (d) 所望により、過剰な前記溶媒又は溶媒の混合物を除去するまで、沈殿物を乾燥する工程。