

【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27年6月25日(2015.6.25)

【公表番号】特表2014-520077(P2014-520077A)

【公表日】平成26年8月21日(2014.8.21)

【年通号数】公開・登録公報2014-044

【出願番号】特願2014-510546(P2014-510546)

【国際特許分類】

C 0 7 C 239/20 (2006.01)

C 0 7 B 57/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/65 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C 239/20

C 0 7 B 57/00 3 7 0

A 6 1 K 31/65

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 31/04

【手続補正書】

【提出日】平成27年4月28日(2015.4.28)

【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】

(4S,4aS,5aR,12aS)-4-ジメチルアミノ-3,10,12,12a-テトラヒドロキシ-7-[(メトキシ(メチル)アミノ)-メチル]-1,11-ジオキソ-1,4,4a,5,5a,6,11,12a-オクタヒドロ-ナフタセン-2-カルボン酸アミドの結晶塩であって、モノ塩酸塩、モノメシル酸塩及びモノ硫酸塩からなる群から選択される、前記結晶塩。

【請求項2】

前記塩が実質的に純粋である、請求項1に記載の結晶塩。

【請求項3】

前記塩がモノ塩酸塩である、請求項1に記載の結晶塩。

【請求項4】

結晶塩の合成後に実質的に図1に示すようなXRPDパターンを有する、請求項3に記載の結晶塩。

【請求項5】

XRPDで測定して少なくとも約13.4、約20.5及び約23.3に現れる回折角度2°の特性ピークを有する、請求項3に記載の結晶塩。

【請求項6】

結晶塩の合成後に実質的に図2に示すようなDSC曲線を有する、請求項3に記載の結晶塩。

【請求項7】

結晶塩の合成後に実質的に図3に示すようなTGA曲線を有する、請求項3に記載の結晶塩。

【請求項 8】

前記塩が、0日目で、HPLCで測定して約0.1ピーク面積%～約7.0ピーク面積%の異性体含量を有する、請求項3に記載の結晶塩。

【請求項 9】

前記塩がモノメシル酸塩である、請求項1に記載の結晶塩。

【請求項 10】

結晶塩の合成後に実質的に図4に示すようなXRPDパターンを有する、請求項9に記載の結晶塩。

【請求項 11】

XRPDで測定して少なくとも約9、約15及び約23.8に現れる回折角度2°の特性ピークを有する、請求項9に記載の結晶塩。

【請求項 12】

結晶塩の合成後に実質的に図5に示すようなDSC曲線を有する、請求項9に記載の結晶塩。

【請求項 13】

結晶塩の合成後に実質的に図6に示すようなTGA曲線を有する、請求項9に記載の結晶塩。

【請求項 14】

前記塩が、0日目で、HPLCで測定して約2.0ピーク面積%～約10.0ピーク面積%の異性体含量を有する、請求項9に記載の結晶塩。

【請求項 15】

前記塩がモノ硫酸塩である、請求項1に記載の結晶塩。

【請求項 16】

結晶塩の合成後に実質的に図7に示すようなXRPDパターンを有する、請求項15に記載の結晶塩。

【請求項 17】

XRPDで測定して少なくとも約15、約17.8及び約23.5に現れる回折角度2°の特性ピークを有する、請求項15に記載の結晶塩。

【請求項 18】

結晶塩の合成後に実質的に図8に示すようなDSC曲線を有する、請求項15に記載の結晶塩。

【請求項 19】

結晶塩の合成後に実質的に図9に示すようなTGA曲線を有する、請求項15に記載の結晶塩。

【請求項 20】

前記塩が、0日目で、HPLCで測定して約3.0ピーク面積%～約26.0ピーク面積%の異性体含量を有する、請求項15に記載の結晶塩。

【請求項 21】

請求項1に記載の結晶塩及び薬学的に許容される賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 22】

前記塩がモノ塩酸塩である、請求項21に記載の医薬組成物。

【請求項 23】

前記塩がモノメシル酸塩である、請求項21に記載の医薬組成物。

【請求項 24】

前記塩がモノ硫酸塩である、請求項21に記載の医薬組成物。

【請求項 25】

座瘡を治療するのに使用するための、請求項21に記載の医薬組成物。

【請求項 26】

酒さを治療するのに使用するための、請求項21に記載の医薬組成物。

【請求項 27】

グラム陽性菌感染症を治療するのに使用され、前記グラム陽性菌が、プロピオニバクテリウム・アクネス、黄色ブドウ球菌、肺炎連鎖球菌、化膿連鎖球菌及びクロストリジウム・ディフィシレからなる群から選択される、請求項21に記載の医薬組成物。