

【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10月29日 (2015.10.29)

【公表番号】特表2014-527995(P2014-527995A)

【公表日】平成26年10月23日 (2014.10.23)

【年通号数】公開・登録公報2014-058

【出願番号】特願2014-532367(P2014-532367)

【国際特許分類】

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 P 31/22 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 417/12 C S P

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 P 31/22

【手続補正書】

【提出日】平成27年9月4日 (2015.9.4)

【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

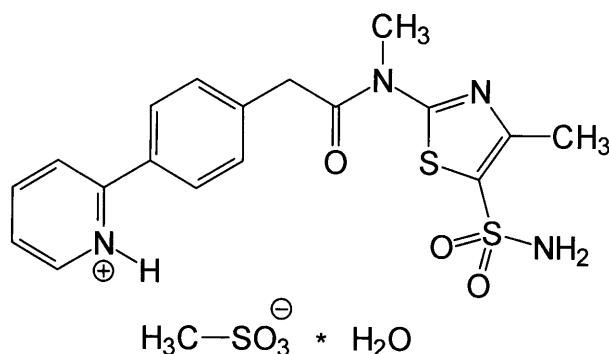
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

次の式

【化 1】



で表される結晶性 N - [5 - (アミノスルホニル) - 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - N - メチル - 2 - [4 - (2 - ピリジニル) - フェニル] アセトアミドモノメタンスルホン酸一水和物であって、

ここで、N - [5 - (アミノスルホニル) - 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - N - メチル - 2 - [4 - (2 - ピリジニル) - フェニル] - アセトアミドモノメタンスルホン酸一水和物粒子は、1 ~ 500 μm の粒径範囲を有し、 $d(0.1)2 \sim 100 \mu\text{m}$ 、 $d(0.5)30 \sim 210 \mu\text{m}$ 、および $d(0.9)70 \sim 400 \mu\text{m}$ 、ならびに $1.0 \text{ m}^2 / \text{g}$ 未満の粒子の比表面積によって定義される粒径分布を有する、

前記結晶性 N - [5 - (アミノスルホニル) - 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - N - メチル - 2 - [4 - (2 - ピリジニル) - フェニル] アセトアミドモノメタンスルホン酸一水和物。

【請求項 2】

前記 N - [5 - (アミノスルホニル) - 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - N - メチル - 2 - [4 - (2 - ピリジニル) - フェニル] - アセトアミドモノメタンスルホン酸一水和物粒子は、 $2\ \mu\text{m} \sim 400\ \mu\text{m}$ の粒径範囲を有する、請求項 1 に記載の結晶性 N - [5 - (アミノスルホニル) - 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - N - メチル - 2 - [4 - (2 - ピリジニル) - フェニル] アセトアミドモノメタンスルホン酸一水和物。

【請求項 3】

前記 N - [5 - (アミノスルホニル) - 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - N - メチル - 2 - [4 - (2 - ピリジニル) - フェニル] - アセトアミドモノメタンスルホン酸一水和物粒子は、 $d(0.1)10 \sim 75\ \mu\text{m}$ 、 $d(0.5)100 \sim 175\ \mu\text{m}$ 、 $d(0.9)200 \sim 350\ \mu\text{m}$ によって定義される粒径分布を有する、請求項 1 又は請求項 2 に記載の結晶性 N - [5 - (アミノスルホニル) - 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - N - メチル - 2 - [4 - (2 - ピリジニル) - フェニル] アセトアミドモノメタンスルホン酸一水和物。

【請求項 4】

前記 N - [5 - (アミノスルホニル) - 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - N - メチル - 2 - [4 - (2 - ピリジニル) - フェニル] - アセトアミドモノメタンスルホン酸一水和物粒子は、 $0.3\ \text{m}^2/\text{g}$ 未満の粒子の比表面積を有する、請求項 1 ～請求項 3 のいずれか一項に記載の結晶性 N - [5 - (アミノスルホニル) - 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - N - メチル - 2 - [4 - (2 - ピリジニル) - フェニル] アセトアミドモノメタンスルホン酸一水和物。

【請求項 5】

アセチルサルチル酸、トリフルリジン、イドクスウリジン、フォスカーネット、シドホビル、ガンシクロビル、アシクロビル、ペンシクロビル、バラシクロビル、ファムシクロビル、および/またはバルガンシクロビルと組み合わせる、請求項 1 ～請求項 4 のいずれか一項に記載の結晶性 N - [5 - (アミノスルホニル) - 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - N - メチル - 2 - [4 - (2 - ピリジニル) - フェニル] アセトアミドモノメタンスルホン酸一水和物。

【請求項 6】

感染症の治療用および/もしくは予防用ならびに/または感染症の伝染の予防用の請求項 1 ～請求項 5 のいずれか一項に記載の結晶性 N - [5 - (アミノスルホニル) - 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - N - メチル - 2 - [4 - (2 - ピリジニル) - フェニル] アセトアミドモノメタンスルホン酸一水和物。

【請求項 7】

前記感染症は、単純ヘルペスウイルスによって引き起こされる感染症である請求項 6 に記載の結晶性 N - [5 - (アミノスルホニル) - 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - N - メチル - 2 - [4 - (2 - ピリジニル) - フェニル] アセトアミドモノメタンスルホン酸一水和物。

【請求項 8】

N - [5 - (アミノスルホニル) - 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - N - メチル - 2 - [4 - (2 - ピリジニル) - フェニル] アセトアミドモノメタンスルホン酸一水和物粒子が、少なくとも一つの薬学的に許容可能な担体、賦形剤、溶媒および/または希釈剤と共に、 $1 \sim 500\ \mu\text{m}$ の粒径範囲を有し、 $d(0.1)2 \sim 100\ \mu\text{m}$ 、 $d(0.5)30 \sim 210\ \mu\text{m}$ 、および $d(0.9)70 \sim 400\ \mu\text{m}$ 、ならびに $1.0\ \text{m}^2/\text{g}$ 未満の粒子の比表面積によって定義される粒径分布を有する、結晶性 N - [5 - (アミノスルホニル) - 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - N - メチル - 2 - [4 - (2 - ピリジニル) フェニル] アセトアミドモノメタンスルホン酸一水和物粒子を含む医薬組成物。

【請求項 9】

前記 N - [5 - (アミノスルホニル) - 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - N - メチル - 2 - [4 - (2 - ピリジニル) - フェニル] アセトアミドモノメタンスルホン酸一水和物粒子は、 $2\ \mu\text{m} \sim 400\ \mu\text{m}$ の粒径範囲を有する、請求項 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

前記 N - [5 - (アミノスルホニル) - 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - N - メチル - 2 - [4 - (2 - ピリジニル) - フェニル] アセトアミドモノメタンスルホン酸一水和物粒子は、 $d(0.1)10 \sim 75\ \mu\text{m}$ 、 $d(0.5)100 \sim 175\ \mu\text{m}$ 、 $d(0.9)200 \sim 350\ \mu\text{m}$ によって定義される粒径分布を有する、請求項 8 または請求項 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

前記 N - [5 - (アミノスルホニル) - 4 - メチル - 1 , 3 - チアゾール - 2 - イル] - N - メチル - 2 - [4 - (2 - ピリジニル) - フェニル] アセトアミドモノメタンスルホン酸一水和物粒子は、 $0.3\ \text{m}^2/\text{g}$ 未満の粒子の比表面積を有する、請求項 8 ~ 請求項 10 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

アセチルサルチル酸、トリフルリジン、イドクスウリジン、フォスカーネット、シドホビル、ガンシクロビル、アシクロビル、ペンシクロビル、バラシクロビル、ファムシクロビル、および / またはバルガンシクロビルと組み合わせる、請求項 8 ~ 請求項 11 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

感染症の治療用および / もしくは予防用ならびに / または感染症の伝染の予防用の請求項 8 ~ 請求項 11 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

前記感染症は、単純ヘルペスウイルス感染症である、請求項 13 に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

前記医薬組成物を、一日に三度、一日に二度、一日に一度、一週間に三度、一週間に二度、または一週間に一度投与することができる請求項 13 または請求項 14 に記載の医薬組成物。