

【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29年9月28日(2017.9.28)

【公表番号】特表2016-530311(P2016-530311A)

【公表日】平成28年9月29日(2016.9.29)

【年通号数】公開・登録公報2016-057

【出願番号】特願2016-542052(P2016-542052)

【国際特許分類】

C 07 D 405/04 (2006.01)

A 61 K 31/4025 (2006.01)

A 61 P 13/12 (2006.01)

【F I】

C 07 D 405/04

A 61 K 31/4025

A 61 P 13/12

【手続補正書】

【提出日】平成29年8月15日(2017.8.15)

【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】

アトラセンタン・マンデル酸塩。

【請求項2】

前記塩が、S-マンデル酸塩である、請求項1に記載の塩。

【請求項3】

前記塩が、結晶性S-マンデル酸塩である、請求項1に記載の塩。

【請求項4】

前記塩が、非晶質S-マンデル酸塩である、請求項1に記載の塩。

【請求項5】

アトラセンタンのS-マンデル酸塩に対するモル比が、約1:1である、請求項3に記載の塩。

【請求項6】

前記塩が、無水塩である、請求項5に記載の塩。

【請求項7】

前記塩が、溶媒和塩である、請求項5に記載の塩。

【請求項8】

前記溶媒和塩が、アセトニトリル溶媒和物、エタノール溶媒和物およびピリジン溶媒和物からなる群から選択される、請求項7に記載の塩。

【請求項9】

前記塩が、単色K1照射により約25で測定した場合に5.5±0.2、9.7±0.2、および19.4±0.2°2にピークを含むX線粉末回折パターンを有する結晶性S-マンデル酸塩である、請求項6に記載の塩。

【請求項10】

前記塩が、斜方晶格子形を有する結晶性S-マンデル酸塩である、請求項6に記載の塩。

【請求項 1 1】

前記塩が、P 2 1 2 1 2 1 空間群を有する、請求項 1 0 に記載の塩。

【請求項 1 2】

前記塩が、それぞれ約 9 . 9 5 4 、約 1 1 . 0 4 9 、および約 3 0 . 8 6 1 の単位格子 a、b および c 値を有する請求項 1 1 に記載の塩。

【請求項 1 3】

アトラセンタンの S - マンデル酸塩に対するモル比が、約 2 : 1 である、請求項 3 に記載の塩。

【請求項 1 4】

前記塩が、水和塩である、請求項 1 3 に記載の塩。

【請求項 1 5】

前記塩が、単色 K 1 照射により約 2 5 で測定した場合に 4 . 5 ± 0 . 2 、 8 . 6 ± 0 . 2 、および 1 8 . 1 ± 0 . 2 ° 2 にピークを含む X 線粉末回折パターンを有する結晶性 S - マンデル酸塩である、請求項 1 4 に記載の塩。

【請求項 1 6】

前記塩が、R - マンデル酸塩である、請求項 1 に記載の塩。

【請求項 1 7】

前記塩が、結晶性 R - マンデル酸塩である、請求項 1 6 に記載の塩。

【請求項 1 8】

前記塩が、非晶質 R - マンデル酸塩である、請求項 1 6 に記載の塩。

【請求項 1 9】

アトラセンタンの R - マンデル酸塩に対するモル比が、約 1 : 1 である、請求項 1 7 に記載の塩。

【請求項 2 0】

前記塩が、無水塩である、請求項 1 9 に記載の塩。

【請求項 2 1】

前記塩が、単色 K 1 照射により約 2 5 で測定した場合に 5 . 7 ± 0 . 2 、 1 1 . 8 ± 0 . 2 、および 2 0 . 9 ± 0 . 2 ° 2 にピークを含む X 線粉末回折パターンを有する結晶性 R - マンデル酸塩である、請求項 2 0 に記載の塩。

【請求項 2 2】

(a) アトラセンタンをマンデル酸含有溶媒と接触させて、アトラセンタン・マンデル酸塩を含む混合物を形成する工程；および

(b) 前記混合物から前記アトラセンタン・マンデル酸塩を単離する工程を含む方法によって製造されるアトラセンタン・マンデル酸塩であって、

前記単離塩が無水結晶性塩である、

アトラセンタン・マンデル酸塩。

【請求項 2 3】

前記マンデル酸が、S - マンデル酸である、請求項 2 2 に記載の塩。

【請求項 2 4】

前記マンデル酸が、R - マンデル酸である、請求項 2 2 に記載の塩。

【請求項 2 5】

前記接触段階での S - マンデル酸のアトラセンタンに対するモル比が、少なくとも約 1 : 1 である、請求項 2 3 に記載の塩。

【請求項 2 6】

前記溶媒が、水を含む、請求項 2 3 に記載の塩。

【請求項 2 7】

前記溶媒が、メタノールを含む、請求項 2 3 に記載の塩。

【請求項 2 8】

前記溶媒が、水およびメタノールを含む、請求項 2 3 に記載の塩。

【請求項 2 9】

前記溶媒が、アセトニトリル、エタノールおよびピリジンからなる群から選択される少なくとも一つの要素を含む、請求項23に記載の塩。

【請求項30】

請求項1から29のいずれか1項に記載のアトラセンタン・マンデル酸塩および医薬として許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項31】

前記組成物が、アトラセンタン親化合物当量基準で約0.25mgから約1.25mgの前記塩を含む、請求項30に記載の組成物。

【請求項32】

治療上有効量の請求項1から29のいずれか1項に記載のアトラセンタン・マンデル酸塩を含む、腎症にかかりやすいかまたは患っているヒト対象者での腎症を治療するための医薬組成物。

【請求項33】

治療上有効量の請求項1から29のいずれか1項に記載のアトラセンタン・マンデル酸塩を含む、慢性腎疾患にかかりやすいかまたは患っているヒト対象者での慢性腎疾患を治療するための医薬組成物。

【請求項34】

治療上有効量の請求項1から29のいずれか1項に記載のアトラセンタン・マンデル酸塩を含む、慢性腎疾患を患うもしくはその疾患にかかりやすいヒト対象者での尿中アルブミン/クレアチニン比を低下させるための医薬組成物。

【請求項35】

治療上有効量の請求項1から29のいずれか1項に記載のアトラセンタン・マンデル酸塩を含む、慢性腎疾患を患うもしくはその疾患にかかりやすいヒト対象者での血清クレアチニン濃度の上昇速度を低下させるための医薬組成物。

【請求項36】

前記塩の量が、アトラセンタン親化合物当量基準で約0.25mg/日から約1.25mg/日である、請求項32から35のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項37】

(a) アトラセンタンをマンデル酸含有溶媒と接触させて、アトラセンタン・マンデル酸塩を含む混合物を形成する工程；および

(b) 前記混合物から前記アトラセンタン・マンデル酸塩を単離する工程を含む、アトラセンタン・マンデル酸塩の製造方法であって、

前記単離塩が無水結晶性塩である、

アトラセンタン・マンデル酸塩の製造方法。

【請求項38】

前記マンデル酸が、S-マンデル酸である、請求項37に記載の方法。

【請求項39】

前記マンデル酸が、R-マンデル酸である、請求項37に記載の方法。

【請求項40】

前記接触段階でのS-マンデル酸のアトラセンタンに対するモル比が、少なくとも約1:1である、請求項38に記載の方法。

【請求項41】

前記溶媒が、水を含む、請求項38に記載の方法。

【請求項42】

前記溶媒が、メタノールを含む、請求項38に記載の方法。

【請求項43】

前記溶媒が、水およびメタノールを含む、請求項38に記載の方法。

【請求項44】

前記溶媒が、アセトニトリル、エタノールおよびピリジンからなる群から選択される少なくとも一つの要素を含む、請求項38に記載の方法。