

【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18年1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2005-527497(P2005-527497A)

【公表日】平成17年9月15日(2005.9.15)

【年通号数】公開・登録公報2005-036

【出願番号】特願2003-566027(P2003-566027)

【国際特許分類】

C 0 7 J 31/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/56 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/08 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/16 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/22 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

【F I】

C 0 7 J 31/00

A 6 1 K 31/56

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/08

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/16

A 6 1 K 47/18

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 47/22

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 37/08

【手続補正書】

【提出日】平成17年10月12日(2005.10.12)

【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

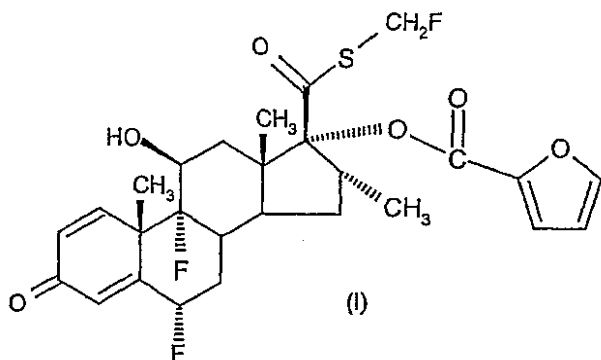
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

結晶格子がゲスト分子の存在によって安定化された式(I)：

【化 1】



の化合物を含む結晶性複合体において、前記結晶性複合体が120Kまたは150Kで測定した場合に単位格子サイズが約 12.5 ± 1.0 、 15 ± 1.0 および 16.2 ± 1.0 である空間群 $P2_12_12_1$ のものであることを特徴とする複合体。

【請求項 2】

ゲスト分子が好ましくは、16～150の範囲の相対分子量を有する請求項 1 に記載の複合体。

【請求項 3】

ゲスト分子が水素結合受容体として作用することができる部分を有する請求項 1 または 2 に記載の複合体。

【請求項 4】

ゲスト分子が、シクロペンタノン、シクロヘキサノン、ジメチルスルホキシド、エタノール、プロパン - 1 - オール、ブタン - 1 - オール、1, 4 - ジオキサン、ギ酸エチル、酢酸メチル、水、酢酸、ピリジン、*t* - ブチルアミンおよびシクロヘキシルアミンからなるリストから選択される請求項 1 ～ 3 のいずれかに記載の複合体。

【請求項 5】

ゲスト分子がアセトンである請求項 1 に記載の複合体。

【請求項 6】

ゲスト分子がメチルエチルケトンである請求項 1 に記載の複合体。

【請求項 7】

ゲスト分子がテトラヒドロフランである請求項 1 に記載の複合体。

【請求項 8】

ゲスト分子がプロパン - 2 - オールである請求項 1 に記載の複合体。

【請求項 9】

ゲスト分子がジメチルホルムアミドである請求項 1 に記載の複合体。

【請求項 10】

ゲスト分子がブタン - 1 - オールである請求項 1 に記載の複合体。

【請求項 11】

ゲスト分子が酢酸メチルである請求項 1 に記載の複合体。

【請求項 12】

ゲスト分子が酢酸である請求項 1 に記載の複合体。

【請求項 13】

ゲスト分子がプロパン - 1 - オールである請求項 1 に記載の複合体。

【請求項 14】

ゲスト分子がエタノールである請求項 1 に記載の複合体。

【請求項 15】

ゲスト分子がギ酸エチルである請求項 1 に記載の複合体。

【請求項 16】

ゲスト分子が1, 4 - ジオキサンである請求項 1 に記載の複合体。

【請求項 17】

ゲスト分子がジメチルスルホキシドである請求項 1 に記載の複合体。

【請求項 18】

ゲスト分子が N - メチル - 2 - ピロリジノンである請求項 1 に記載の複合体。

【請求項 19】

ゲスト分子がジメチルアセトアミドである請求項 1 に記載の複合体。

【請求項 20】

ゲスト分子がシクロペンタノンである請求項 1 に記載の複合体。

【請求項 21】

ゲスト分子が水である請求項 1 に記載の複合体。

【請求項 22】

ゲスト分子がシクロヘキサノンである請求項 1 に記載の複合体。

【請求項 23】

ゲスト分子がピリジンである請求項 1 に記載の複合体。

【請求項 24】

ゲスト分子が t - ブチルアミンである請求項 1 に記載の複合体。

【請求項 25】

ゲスト分子がシクロヘキシルアミンである請求項 1 に記載の複合体。

【請求項 26】

ゲスト分子が - カプロラクタムである請求項 1 に記載の複合体。

【請求項 27】

式 (I) の化合物とゲスト分子との比が 1 : 2.0 ~ 1 : 0.3 である請求項 1 ~ 26 のいずれかに記載の複合体。

【請求項 28】

生理的に許容される希釈剤もしくは担体とともに請求項 1 ~ 27 のいずれかに記載の複合体を含む医薬組成物。

【請求項 29】

別の治療活性薬剤との組合せで請求項 1 ~ 27 のいずれかに記載の複合体を含む医薬組成物。

【請求項 30】

前記他の治療活性成分が長期作用性 β_2 - アドレナリン受容体作動薬である請求項 29 に記載の医薬組成物。

【請求項 31】

請求項 1 ~ 27 のいずれかに記載の複合体の製造方法であって、

(a) 式 (I) の化合物およびゲスト分子を含む溶液から前記複合体を結晶化する段階；あるいは

(b) 固体での式 (I) の化合物または請求項 1 ~ 27 のいずれかに記載の別の複合体とゲスト分子を含む液体とを接触させ、そこから前記複合体を得る段階；あるいは

(c) 固体での式 (I) の化合物または請求項 1 ~ 27 のいずれかに記載の別の複合体とゲスト分子を含む蒸気とを接触させる段階

を有する方法。

【請求項 32】

(a) 等軸な粒子または実質的に等軸な粒子の形態で請求項 1 ~ 27 のいずれかに記載の複合体を製造する段階；および

(b) ゲスト分子を除去する段階

を有する方法によって、等軸な粒子または実質的に等軸な粒子の形態で非溶媒和形態での式 (I) の化合物を製造する方法。

【請求項 33】

前記複合体がゲスト分子としてのプロパン - 2 - オールまたはアセトンとの複合体である請求項 32 に記載の方法。

【請求項 3 4】

炎症および／またはアレルギー状態患者の治療におけるヒトまたは動物用の薬に使用するための請求項 1 ～ 2 7 のいずれかに記載の複合体。

【請求項 3 5】

炎症および／またはアレルギー状態患者の治療のための医薬の製造における請求項 1 ～ 2 7 のいずれかに記載の複合体の使用。

【請求項 3 6】

1 日 1 回投与のための請求項 3 5 に記載の使用。