

【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2月23日 (2017.2.23)

【公表番号】特表2016-505036(P2016-505036A)

【公表日】平成28年2月18日 (2016.2.18)

【年通号数】公開・登録公報2016-011

【出願番号】特願2015-553165(P2015-553165)

【国際特許分類】

C 0 7 C 233/69 (2006.01)

C 0 7 C 231/24 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 13/10 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/166 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 233/69 C S P

C 0 7 C 231/24

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 13/10

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 1/12

A 6 1 K 31/166

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成29年1月16日 (2017.1.16)

【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

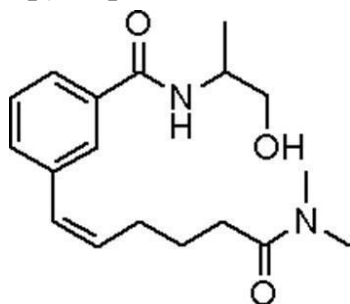
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

遊離塩基若しくはその薬学的に許容される塩、又は遊離塩基若しくはその塩形態の溶媒和物の形態である、式 (I)

【化 1】



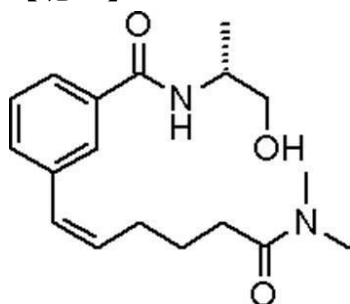
(I)

の化合物の結晶形態。

【請求項 2】

化合物が、式 (I a)

【化 2】



(Ia)

のものであり、

前記化合物が、遊離塩基若しくはその薬学的に許容される塩、又は遊離塩基若しくはその塩形態の溶媒和物の形態である、請求項 1 に記載の結晶形態。

【請求項 3】

化合物が遊離塩基である、請求項 1 又は 2 に記載の結晶形態。

【請求項 4】

以下の 2 $[\theta]$ 値： 9.53 ± 0.3 、 10.35 ± 0.3 、 14.21 ± 0.3 、 14.35 ± 0.3 、 19.02 ± 0.3 、 19.18 ± 0.3 、 20.11 ± 0.3 、 20.34 ± 0.3 、 20.63 ± 0.3 、 21.55 ± 0.3 、 23.91 ± 0.3 、 24.03 ± 0.3 、 33.89 ± 0.3 、 38.48 ± 0.3 、 38.71 ± 0.3 、 38.89 ± 0.3 、 41.83 ± 0.3 及び 41.95 ± 0.3 から選択される少なくとも 2 つの回析ピークを有する X 線粉末回析パターンにより特徴づけられる、請求項 2 又は 3 に記載の結晶形態。

【請求項 5】

以下の 2 $[\theta]$ 値： 9.53 ± 0.3 、 14.21 ± 0.3 、 14.35 ± 0.3 、 19.02 ± 0.3 、 19.18 ± 0.3 、 20.34 ± 0.3 、 21.55 ± 0.3 、 38.71 ± 0.3 及び 38.89 ± 0.3 から選択される少なくとも 2 つの回析ピークを有する X 線粉末回析パターンにより特徴づけられる、請求項 2～4 のいずれかに記載の結晶形態。

【請求項 6】

以下の 2 $[\theta]$ 値： 9.53 ± 0.3 、 14.21 ± 0.3 、 14.35 ± 0.3 、 38.71 ± 0.3 及び 38.89 ± 0.3 から選択される少なくとも 2 つの回析ピークを有する X 線粉末回析パターンにより特徴づけられる、請求項 2～5 のいずれかに記載の結晶形態。

晶形態。

【請求項 7】

請求項 6 に記載の 2 [θ] 値から選択される少なくとも 3 つの回析ピークを有する X 線粉末回析パターンにより特徴づけられる、請求項 2 ～ 6 のいずれかに記載の結晶形態。

【請求項 8】

請求項 6 に記載の 2 [θ] 値から選択される少なくとも 4 つの回析ピークを有する X 線粉末回析パターンにより特徴づけられる、請求項 2 ～ 7 のいずれかに記載の結晶形態。

【請求項 9】

請求項 6 に記載の 2 [θ] 値から選択される 5 つすべての回析ピークを有する X 線粉末回析パターンにより特徴づけられる、請求項 2 ～ 8 のいずれかに記載の結晶形態。

【請求項 10】

ピーク位置が、図 1 又は表 1 に示されているパターンのピーク位置に実質的に一致している X 線粉末回析パターンにより特徴づけられる、請求項 1 ～ 9 のいずれかに記載の結晶形態。

【請求項 11】

請求項 1 ～ 10 のいずれかに記載の結晶形態及び薬学的に許容される担体、希釈剤又は賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 12】

筋障害又は胃腸障害の予防若しくは治療、或いは痙攣又は振戦の治療若しくはコントロールのための薬剤の調製における、請求項 1 ～ 10 のいずれかに記載の結晶形態の使用。

【請求項 13】

筋障害が神経筋障害である、請求項 12 に記載の使用。

【請求項 14】

胃腸障害が、胃潰瘍、クローン病、分泌性下痢及び麻痺性イレウスから選択される、請求項 12 に記載の使用。

【請求項 15】

請求項 1 ～ 10 のいずれかに記載の結晶形態を含む、筋障害又は胃腸障害の治療剤、或いは痙攣、又は振戦の治療剤若しくはコントロール剤。

【請求項 16】

筋障害が神経筋障害である、請求項 15 に記載の治療剤又はコントロール剤。

【請求項 17】

胃腸障害が、胃潰瘍、クローン病、分泌性下痢及び麻痺性イレウスから選択される、請求項 15 に記載の治療剤又はコントロール剤。

【請求項 18】

請求項 1 ～ 10 のいずれかに記載の結晶形態を含む、膀胱痙攣の治療剤。

【請求項 19】

請求項 2 に記載の結晶化合物を調製する方法であって、
(i) 反応容器中で式 (I a) の化合物を酢酸メチル及び酢酸エチルから選択される溶媒に溶解させて、溶液を形成するステップと、
(ii) 回転蒸発により前記溶媒を除去して、油を得るステップと、
(iii) 任意でステップ (i) 及び (ii) を繰り返すステップと、
(iv) 前記反応容器をガラス棒でこすって結晶化を誘発するステップと、
(v) 前記油を放置して結晶化させるステップと
を含む方法。

【請求項 20】

式 (I a) の結晶化合物を調製する方法であって、
(i) 式 (I a) の化合物を酢酸メチル又は酢酸エチルから選択される溶媒に溶解させて、溶液を形成するステップと、
(ii) ステップ (i) で得られた前記溶液を 5℃未満の温度まで冷却するステップと、
(iii) 前記式 (I a) の化合物の 1 つ又は 2 つ以上の種晶を前記溶液に加えて、そのよ

うにして生成された混合物を攪拌するステップと、
(iv) ステップ (iii) で形成された結晶物質を単離するステップと、
(v) 任意でステップ (i) ~ (iv) を繰り返すステップと
を含む方法。

【請求項 21】

ステップ (i) が、混合物を少なくとも 50℃ の温度まで温めることを含む、請求項 20 に記載の方法。

【請求項 22】

ステップ (iv) が、結晶物質を冷溶媒で洗浄することをさらに含み、前記溶媒が、ステップ (i) で使用したのと同じ溶媒である、請求項 20 に記載の方法。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0001

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0001】

本発明は、筋障害、胃腸障害の治療、又は痙攣若しくは振戦のコントロール (controlling)に治療上有用な化合物の結晶形態に関する。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0022

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0022】

本発明の第4の態様は、筋障害、胃腸障害の予防若しくは治療、又は痙攣及び振戦の治療若しくはコントロールでの使用のための、上に記載した結晶形態に関する。

【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0023

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0023】

本発明の第5の態様は、筋障害、胃腸障害の予防若しくは治療、又は痙攣及び振戦の治療若しくはコントロールのための薬剤の調製における、上に記載した結晶形態の使用に関する。

【手続補正 5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0024

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0024】

本発明の第6の態様は、上に記載した結晶形態の薬理学的に有効な量を、それを必要とする対象に投与することを含む、筋障害、胃腸障害の予防若しくは治療、又は痙攣及び振戦の治療若しくはコントロールの方法に関する。

【手続補正 6】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0060

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0060】

したがって、V S N 1 6 は、筋障害、胃腸障害の予防の治療若しくは治療、又は痙攣及び振戦の治療若しくはコントロールに使用するものであると考えられる。さらなる詳細は国際公開第 2 0 0 5 / 0 8 0 3 1 6 号パンフレットを参照されたい。

【手続補正 7】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 6 2

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 6 2】

本発明のさらに別の態様は、筋障害、胃腸障害の予防若しくは治療、又は痙攣及び振戦の治療若しくはコントロールでの使用のための、上に記載した結晶形態に関する。

【手続補正 8】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 6 3

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 6 3】

本発明の別の態様は、筋障害、胃腸障害の予防若しくは治療、又は痙攣及び振戦の治療若しくはコントロールのための薬剤の調製での上に記載した結晶形態の使用に関する。

【手続補正 9】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 6 4

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 6 4】

本発明の別の態様は、上に記載した結晶形態の薬理学的に有効な量を、それを必要とする対象に投与することを含む、筋障害、胃腸障害の予防若しくは治療、又は痙攣及び振戦の治療若しくはコントロールの方法に関する。

【手続補正 1 0】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 6 7

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 6 7】

一つの好ましい実施形態は、筋障害、胃腸障害の治療、又は痙攣及び振戦の治療若しくはコントロールのための本発明による結晶形態の使用に関する。

【手続補正 1 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 7 2

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 7 2】

一つの好ましい実施形態は、痙攣及び振戦の治療若しくはコントロールのための本発明による結晶形態の使用に関する。