

【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 26 年 9 月 4 日 (2014.9.4)

【公表番号】特表 2013-538857 (P2013-538857A)

【公表日】平成 25 年 10 月 17 日 (2013.10.17)

【年通号数】公開・登録公報 2013-057

【出願番号】特願 2013-531861 (P2013-531861)

【国際特許分類】

C 07 D 401/12 (2006.01)

A 61 K 31/4709 (2006.01)

A 61 K 45/00 (2006.01)

A 61 P 11/00 (2006.01)

A 61 P 11/06 (2006.01)

【F I】

C 07 D 401/12 C S P

A 61 K 31/4709

A 61 K 45/00

A 61 P 11/00

A 61 P 11/06

【手続補正書】

【提出日】平成 26 年 7 月 16 日 (2014.7.16)

【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】

ビフェニル - 2 - イルカルバミン酸 1 - (2 - { [4 - (4 - { [(R) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (8 - ヒドロキシ - 2 - オキソ - 1 , 2 - ジヒドロキノリン - 5 - イル) エチルアミノ] メチル } - フェニルカルバモイル) ブチル] メチルカルバモイル } エチル) ピペリジン - 4 - イルエステルの結晶性シュウ酸塩であって ; 該結晶性シュウ酸塩は :

(a) 11.66 ± 0.20 、 15.75 ± 0.20 、 19.55 ± 0.20 、 23.00 ± 0.20 、および 23.45 ± 0.20 の 2 値における回折ピークを含む粉末 X 線回折パターンによって特徴付けられるイソプロパノール溶媒和物 ; ならびに

(b) 15.32 ± 0.20 、 16.90 ± 0.20 、 19.25 ± 0.20 、および 23.73 ± 0.20 の 2 値における回折ピークを含む粉末 X 線回折パターンによって特徴付けられる水和物

から選択される、結晶性シュウ酸塩。

【請求項 2】

前記結晶性シュウ酸塩は、 11.66 ± 0.20 、 15.75 ± 0.20 、 19.55 ± 0.20 、 23.00 ± 0.20 、および 23.45 ± 0.20 の 2 値における回折ピークを含む粉末 X 線回折パターンによって特徴付けられるイソプロパノール溶媒和物である、請求項 1 に記載の結晶性シュウ酸塩。

【請求項 3】

前記結晶性シュウ酸塩は、ピーク位置が図 1 に示されるパターンのピーク位置に実質的に一致する粉末 X 線回折パターンによって特徴付けられる、請求項 2 に記載の結晶性シュウ酸塩。

【請求項 4】

前記結晶性シュウ酸塩は、約 162 ～ 約 164 の範囲に及ぶ融点によって特徴付けられる、請求項 2 に記載の結晶性シュウ酸塩。

【請求項 5】

前記結晶性シュウ酸塩は、図 2 に示されるものに実質的に一致する示差走査熱分析トレースによって特徴付けられる、請求項 2 に記載の結晶性シュウ酸塩。

【請求項 6】

前記結晶性シュウ酸塩は、 15.32 ± 0.20 、 16.90 ± 0.20 、 19.25 ± 0.20 、および 23.73 ± 0.20 の 2 値における回折ピークを含む粉末 X 線回折パターンによって特徴付けられる水和物である、請求項 1 に記載の結晶性シュウ酸塩。

【請求項 7】

前記結晶性シュウ酸塩は、ピーク位置が図 3 に示されるパターンのピーク位置に実質的に一致する粉末 X 線回折パターンによって特徴付けられる、請求項 6 に記載の結晶性シュウ酸塩。

【請求項 8】

前記結晶性シュウ酸塩は、約 162 ～ 約 164 の範囲に及ぶ融点によって特徴付けられる、請求項 6 に記載の結晶性シュウ酸塩。

【請求項 9】

前記結晶性シュウ酸塩は、図 4 に示されるものに実質的に一致する示差走査熱分析トレースによって特徴付けられる、請求項 6 に記載の結晶性シュウ酸塩。

【請求項 10】

薬学的組成物であって、該薬学的組成物は：

(a) 請求項 1 ～ 9 のうちのいずれか 1 項に記載の結晶性シュウ酸塩；および

(b) 薬学的に受容可能なキャリア

を含む、薬学的組成物。

【請求項 11】

薬学的組成物であって、該薬学的組成物は：

(a) 請求項 1 ～ 9 のうちのいずれか 1 項に記載の結晶性シュウ酸塩；

(b) ステロイド性抗炎症剤、またはその薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物；および

(c) 薬学的に受容可能なキャリア

を含む、薬学的組成物。

【請求項 12】

肺の障害を処置するための組成物であって、該組成物は、請求項 1 ～ 9 のうちのいずれか 1 項に記載の結晶性シュウ酸塩を含む、組成物。

【請求項 13】

肺の障害を処置するための組成物であって、該組成物は、(a) 請求項 1 ～ 9 のうちのいずれか 1 項に記載の結晶性シュウ酸塩；および (b) ステロイド性抗炎症剤、またはその薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物を含む、組成物。

【請求項 14】

前記肺の障害は、慢性閉塞性肺疾患または喘息である、請求項 12 または 13 に記載の組成物。

【請求項 15】

哺乳動物において気管支拡張をもたらすための組成物であって、該組成物は、請求項 1 ～ 9 のうちのいずれか 1 項に記載の結晶性シュウ酸塩を含み、該組成物は、吸入によって該哺乳動物に投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項 16】

治療において使用するための、請求項 1 ～ 9 のうちのいずれか 1 項に記載の結晶性シュウ酸塩を含む組成物。

【請求項 17】

肺の障害の処置において使用するための、請求項 1 ~ 9 のうちのいずれか 1 項に記載の結晶性シュウ酸塩を含む組成物。

【請求項 18】

慢性閉塞性肺疾患または喘息の処置において使用するための、請求項 1 ~ 9 のうちのいずれか 1 項に記載の結晶性シュウ酸塩を含む組成物。

【請求項 19】

医薬の製造のための、請求項 1 ~ 9 のうちのいずれか 1 項に記載の結晶性シュウ酸塩の使用。

【手続補正 2】

【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】

本発明の他の局面および実施形態は、本明細書中に開示される。

一実施形態において、例えば、以下の項目が提供される。

(項目 1)

ビフェニル - 2 - イルカルバミン酸 1 - (2 - { [4 - (4 - { [(R) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (8 - ヒドロキシ - 2 - オキソ - 1, 2 - ジヒドロキノリン - 5 - イル) エチルアミノ] メチル } - フェニルカルバモイル) ブチル] メチルカルバモイル } エチル) ピペリジン - 4 - イルエステルの結晶性シュウ酸塩であって；該結晶性シュウ酸塩は：

(a) 11.66 ± 0.20 、 15.75 ± 0.20 、 19.55 ± 0.20 、 23.00 ± 0.20 、および 23.45 ± 0.20 の 2 値における回折ピークを含む粉末 X 線回折パターンによって特徴付けられるイソプロパノール溶媒和物；ならびに

(b) 15.32 ± 0.20 、 16.90 ± 0.20 、 19.25 ± 0.20 、および 23.73 ± 0.20 の 2 値における回折ピークを含む粉末 X 線回折パターンによって特徴付けられる水和物

から選択される、結晶性シュウ酸塩。

(項目 2)

前記結晶性シュウ酸塩は、 11.66 ± 0.20 、 15.75 ± 0.20 、 19.55 ± 0.20 、 23.00 ± 0.20 、および 23.45 ± 0.20 の 2 値における回折ピークを含む粉末 X 線回折パターンによって特徴付けられるイソプロパノール溶媒和物である、項目 1 に記載の結晶性シュウ酸塩。

(項目 3)

前記結晶性シュウ酸塩は、ピーク位置が図 1 に示されるパターンのピーク位置に実質的に一致する粉末 X 線回折パターンによって特徴付けられる、項目 2 に記載の結晶性シュウ酸塩。

(項目 4)

前記結晶性シュウ酸塩は、約 162 ~ 約 164 の範囲に及ぶ融点によって特徴付けられる、項目 2 に記載の結晶性シュウ酸塩。

(項目 5)

前記結晶性シュウ酸塩は、図 2 に示されるものに実質的に一致する示差走査熱分析トレースによって特徴付けられる、項目 2 に記載の結晶性シュウ酸塩。

(項目 6)

前記結晶性シュウ酸塩は、 15.32 ± 0.20 、 16.90 ± 0.20 、 19.25 ± 0.20 、および 23.73 ± 0.20 の 2 値における回折ピークを含む粉末 X 線回折パターンによって特徴付けられる水和物である、項目 1 に記載の結晶性シュウ酸塩。

(項目 7)

前記結晶性シュウ酸塩は、ピーク位置が図 3 に示されるパターンのピーク位置に実質的に一致する粉末 X 線回折パターンによって特徴付けられる、項目 6 に記載の結晶性シュウ酸

塩。

(項目 8)

前記結晶性シュウ酸塩は、約 162 ～ 約 164 の範囲に及ぶ融点によって特徴付けられる、項目 6 に記載の結晶性シュウ酸塩。

(項目 9)

前記結晶性シュウ酸塩は、図 4 に示されるものに実質的に一致する示差走査熱分析トレースによって特徴付けられる、項目 6 に記載の結晶性シュウ酸塩。

(項目 10)

薬学的組成物であって、該薬学的組成物は：

(a) 項目 1 ～ 9 のうちのいずれか 1 項に記載の結晶性シュウ酸塩；および

(b) 薬学的に受容可能なキャリア

を含む、薬学的組成物。

(項目 11)

薬学的組成物であって、該薬学的組成物は：

(a) 項目 1 ～ 9 のうちのいずれか 1 項に記載の結晶性シュウ酸塩；

(b) ステロイド性抗炎症剤、またはその薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物；および

(b) 薬学的に受容可能なキャリア

を含む、薬学的組成物。

(項目 12)

肺の障害を処置する方法であって、該方法は、項目 1 ～ 9 のうちのいずれか 1 項に記載の結晶性シュウ酸塩を患者に投与する工程を含む、方法。

(項目 13)

肺の障害を処置する方法であって、該方法は、(a) 項目 1 ～ 9 のうちのいずれか 1 項に記載の結晶性シュウ酸塩；および (b) ステロイド性抗炎症剤、またはその薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物を患者に投与する工程を含む、方法。

(項目 14)

前記肺の障害は、慢性閉塞性肺疾患または喘息である、項目 12 または 13 に記載の方法。

(項目 15)

哺乳動物において気管支拡張をもたらす方法であって、該方法は、項目 1 ～ 9 のうちのいずれか 1 項に記載の結晶性シュウ酸塩を吸入によって該哺乳動物に投与する工程を含む、方法。

(項目 16)

治療において使用するための、項目 1 ～ 9 のうちのいずれか 1 項に記載の結晶性シュウ酸塩。

(項目 17)

肺の障害の処置において使用するための、項目 1 ～ 9 のうちのいずれか 1 項に記載の結晶性シュウ酸塩。

(項目 18)

慢性閉塞性肺疾患または喘息の処置において使用するための、項目 1 ～ 9 のうちのいずれか 1 項に記載の結晶性シュウ酸塩。

(項目 19)

医薬の製造のための、項目 1 ～ 9 のうちのいずれか 1 項に記載の結晶性シュウ酸塩の使用。