

【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ウ酸塩を含む組成物。

【請求項 1 8】

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ウ酸塩を含む組成物。

【請求項 1 9】

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。

—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ウ酸塩であって；該結晶性シウ酸塩は：
(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、結晶性シウ酸塩。

(項目 2)

前記結晶性シウ酸塩は、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 に記載の結晶性シウ酸塩。

(項目 3)

前記結晶性シウ酸塩は、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 に記載の結晶性シウ酸塩。

(項目 4)

前記結晶性シウ酸塩は、約 16.2 ~ 約 16.4 の範囲に及ぶ融点によって特徴付けられる、項目 2 に記載の結晶性シウ酸塩。

(項目 5)

前記結晶性シウ酸塩は、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 に記載の結晶性シウ酸塩。

(項目 6)

前記結晶性シウ酸塩は、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 に記載の結晶性シウ酸塩。

(項目 7)

前記結晶性シウ酸塩は、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 に記載の結晶性シウ酸

塩。

(項目8)

前記結晶性シウ酸塩は、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に記載の結晶性シウ酸塩。

(項目9)

前記結晶性シウ酸塩は、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スによって特徴付けられる、項目6に記載の結晶性シウ酸塩。

(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ウ酸塩の使用。