

【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23年3月31日 (2011.3.31)

【公表番号】特表2010-518145(P2010-518145A)

【公表日】平成22年5月27日 (2010.5.27)

【年通号数】公開・登録公報2010-021

【出願番号】特願2009-549413(P2009-549413)

【国際特許分類】

C 0 7 D 519/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/475 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 519/04

A 6 1 K 31/475

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成23年2月10日 (2011.2.10)

【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】

1 または 2 当量の薬学上許容される無機酸または有機酸を用いて得られる、無水結晶ピンプルニン塩。

【請求項 2】

結晶状態が、特徴的なスペクトル線を示す X 線回折スペクトルによって定められる、請求項 1 に記載の結晶ピンプルニン塩。

【請求項 3】

前記塩が、フマル酸塩、臭化水素酸塩、硫酸塩、乳酸塩、p - トルエンスルホン酸塩、安息香酸塩、マンデル酸塩および p - ヒドロキシ安息香酸塩の中から選択される、請求項 1 または 2 に記載の無水結晶塩。

【請求項 4】

結晶ピンプルニン塩を製造する方法であって、以下の工程：
好適な溶媒または溶媒混合物中へのピンプルニン塩基の溶解；
無機酸または有機酸の添加；
塩の沈殿；
形成した塩の濾過および回収；
溶媒または非溶媒中での該塩の熟成および結晶化；
該結晶の濾過、すすぎおよび真空乾燥
を含んでなる、方法。

【請求項 5】

前記ピンプルニン塩基が、アセトン、酢酸エチル、エーテル、トルエン、ジクロロメタン、メタノール、エタノール、1 - プロパノールおよび 2 - プロパノールの中から選択される溶媒または溶媒混合物中に溶解される、請求項 4 に記載の製造方法。

【請求項 6】

前記酸が、臭化水素酸、硫酸、乳酸、フマル酸、p - トルエンスルホン酸、安息香酸、

マンデル酸、および p - ヒドロキシ安息香酸などの薬学上許容される無機酸または有機酸の中から選択される、請求項 4 または 5 に記載の製造方法。

【請求項 7】

前記酸が、1 モル当量のピンフルニンに対して 1 または 2 モル当量の割合で用いられる、請求項 4 ~ 6 のいずれか一項に記載の製造方法。

【請求項 8】

前記酸が、水、アルコール、または好適な有機溶媒中に溶解して添加される、請求項 4 ~ 7 のいずれか一項に記載の製造方法。

【請求項 9】

前記塩の沈殿が、前記媒質中で、またはアセトン、酢酸エチル、エーテル、イソプロピルエーテル、トルエン、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサンもしくは石油エーテルなどの溶媒もしくは溶媒 / 非溶媒混合物中で行われる、請求項 4 ~ 8 のいずれか一項に記載の製造方法。

【請求項 10】

熟成が、アセトン、酢酸エチル、エーテル、イソプロピルエーテル、トルエン、ヘキサン、ヘプタン、シクロヘキサンまたは石油エーテルなどの溶媒または溶媒 / 非溶媒混合物中で行われる、請求項 4 ~ 9 のいずれか一項に記載の製造方法。

【請求項 11】

ピンフルニン精製の手段として用いられる、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の、または請求項 4 ~ 10 のいずれか一項に記載の方法の実施により得られる、無水結晶ピンフルニン塩。

【請求項 12】

薬物として用いられる、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の、または請求項 4 ~ 10 のいずれか一項に記載の方法の実施により得られる、結晶ピンフルニン塩。

【請求項 13】

請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の、または請求項 4 ~ 10 のいずれか一項に記載の方法の実施により得られる、無水結晶ピンフルニン塩の有効量を、生理学上許容される媒質中に含んでなる、医薬組成物。

【請求項 14】

癌病変の治療のための、請求項 13 に記載の医薬組成物。