

【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24年12月27日 (2012.12.27)

【公表番号】特表2012-512262(P2012-512262A)

【公表日】平成24年5月31日 (2012.5.31)

【年通号数】公開・登録公報2012-021

【出願番号】特願2011-542458(P2011-542458)

【国際特許分類】

C 07 F 5/04 (2006.01)

A 61 K 31/69 (2006.01)

A 61 P 31/04 (2006.01)

A 61 P 11/00 (2006.01)

A 61 P 15/00 (2006.01)

A 61 P 27/16 (2006.01)

A 61 P 17/00 (2006.01)

A 61 P 1/12 (2006.01)

A 61 P 13/02 (2006.01)

A 61 P 7/00 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 P 17/02 (2006.01)

A 61 P 27/02 (2006.01)

A 61 P 1/02 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 13/12 (2006.01)

【F I】

C 07 F 5/04 C S P C

A 61 K 31/69

A 61 P 31/04

A 61 P 11/00

A 61 P 15/00

A 61 P 27/16

A 61 P 17/00

A 61 P 1/12

A 61 P 13/02 1 0 5

A 61 P 7/00

A 61 P 9/00

A 61 P 1/04

A 61 P 17/00 1 0 1

A 61 P 17/02

A 61 P 27/02

A 61 P 1/02

A 61 P 19/02

A 61 P 13/12

【手続補正書】

【提出日】平成24年11月12日 (2012.11.12)

【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】

表 1 に記載の  $2\theta$  値  $\pm 0.2^\circ$  の 全て を基本的に有することにより特徴付けられる、(S) - 3 - アミノメチル - 7 - (3 - ヒドロキシ - プロポキシ) - 3 H - ベンゾ [c] [1, 2] オキサボロール - 1 - オールの塩酸塩の結晶多形体。

位置 [ $2\theta$ ]	d-間隔 [Å]
12.1	7.3
14.2	6.2
18.2	4.9
19.2	4.6
20.1	4.4
21.0	4.2
21.9	4.1
22.7	3.9
24.3	3.7
26.6	3.4
27.6	3.2
30.9	2.9
31.5	2.8
34.7	2.6
39.5	2.3

(表 1)

【請求項 2】

X 線結晶解析において、実質的に以下の値の結晶パラメーターを有する (S) - 3 - アミノメチル - 7 - (3 - ヒドロキシ - プロポキシ) - 3 H - ベンゾ [c] [1, 2] オキサボロール - 1 - オールの塩酸塩の結晶多形体：

結晶系：斜方晶系

空間群： $P2_12_12_1$ 

結晶サイズ： $a = 9.1045(2)$ 、 $b = 10.3107(2)$ 、 $c = 14.5988(3)$ 、 $\alpha = 90.00^\circ$ 、 $\beta = 90.00^\circ$ 、 $\gamma = 90.00^\circ$

体積： $1370.44(5) \text{ \AA}^3$ Z、計算密度： $4.1326 \text{ g cm}^{-3}$ 。

【請求項 3】

(S) - 3 - アミノメチル - 7 - (3 - ヒドロキシ - プロポキシ) - 3 H - ベンゾ [c] [1, 2] オキサボロール - 1 - オールの塩酸塩の結晶多形体であって、ラマン分光分析において実質的に以下の波数 ( $\text{cm}^{-1}$ ) を有するピークの全てを有することを特徴とする、前記結晶多形体： $3076.4$ 、 $3054.6$ 、 $2987.4$ 、 $2975.5$ 、 $2954.2$ 、 $2928.0$ 、 $2909.8$ 、 $2896.0$ 、 $1578.6$ 、 $1298.2$ 、 $1291.6$ 、 $1263.0$ 、 $1226.8$ 、 $1068.9$ 、および  $694.9$  のそれぞれ  $\pm 50$  波数。

【請求項 4】

約  $2800 \sim 3200 \text{ cm}^{-1}$  (それぞれ  $\pm 50$  波数) の間にピークの多重線を有し、かつ約  $1600 \sim 600 \text{ cm}^{-1}$  (それぞれ  $\pm 50$  波数) の間に別のピークの多重線を有するが、約  $1800 \sim 2200 \text{ cm}^{-1}$  (それぞれ  $\pm 50$  波数) の間にピークを基

本的に有しない、請求項 3 に記載の結晶多形体。

【請求項 5】

- a) 請求項 1 に記載の結晶多形体；および
- b) 少なくとも 1 種類の賦形剤または担体

を含む医薬組成物。

【請求項 6】

細菌に関連する疾病に罹患した動物を治療するための、請求項 1 に記載の結晶多形体を含む医薬組成物。

【請求項 7】

前記細菌がグラム陰性細菌である、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

前記細菌が、ナイセリア属の種、エシェリキア属の種、シゲラ属の種、サルモネラ属の種、エルシニア属の種、クレブシエラ属の種、プロテウス属の種、エンテロバクター属の種、セラシア属の種、ビブリオ属の種、カンピロバクター属の種、ヘリコバクター属の種、シュドモナス属の種、バクテロイデス属の種、ヘモフィルス属の種、ボルデテラ属の種、レジオネラ属の種、フランシセラ属の種、ブルセラ属の種、パスツレラ属の種、ガルドネラ属の種、スピロヘータ属の種、クラミジア属の種、リケッチア属の種から成る群から選択される、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

前記疾病が、髄膜炎、淋病、耳炎、外耳炎、毛嚢炎、下痢、尿路感染、敗血症(sepsis)、HAP、菌血症、心内膜炎、胃腸炎、腸チフス、敗血症(supsis)、心内膜炎、副鼻腔炎(sinusitis)、腺ペスト、チフス、院内感染、皮膚および皮膚組織感染、肺炎、コレラ、慢性胃炎、骨髄炎、熱傷創感染、角膜感染、歯周病、えん下肺炎、喉頭蓋炎、敗血症性関節炎、軟性下疳、膺炎、百日咳、ボンティアック熱、ツラレミア、ブルセラ症、梅毒、ライム病、クラミジア、ロッキー山発疹熱、発疹チフス、気管気管支炎、遊走生肺炎、尿道炎、腎盂腎炎、腹腔内感染、発熱性好中球減少、骨盤内感染、菌血症ならびに敗血症(septicemia)から成る群から選択される、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

前記疾病が肺炎である、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

X 線結晶解析において以下の $^{\circ}2$  値の全てを基本的に有する (S) - 3 - アミノメチル - 7 - (3 - ヒドロキシ - プロポキシ) - 3 H - ベンゾ [c] [1, 2] オキサボロール - 1 - オール・HCl の結晶多形体：7.8、12.3、14.0、20.2、21.3、22.4、23.3、24.7、27.6、および 32.1 のそれぞれ  $\pm 0.2^{\circ}2$ 。

【請求項 12】

X 線結晶解析において以下の $^{\circ}2$  値の全てを基本的に有する (S) - 3 - アミノメチル - 7 - (3 - ヒドロキシ - プロポキシ) - 3 H - ベンゾ [c] [1, 2] オキサボロール - 1 - オール・HCl の結晶多形体：6.2、8.8、9.8、12.4、13.9、17.7、22.3、23.1、24.3、24.8、26.1、27.2、28.0、30.9、32.2、および 33 のそれぞれ  $\pm 0.2^{\circ}2$ 。

【請求項 13】

(S) - 3 - アミノメチル - 7 - (3 - ヒドロキシ - プロポキシ) - 3 H - ベンゾ [c] [1, 2] オキサボロール - 1 - オールの塩酸塩の結晶多形体であって、(S) - 3 - アミノメチル - 7 - (3 - ヒドロキシ - プロポキシ) - 3 H - ベンゾ [c] [1, 2] オキサボロール - 1 - オール・HCl の濃度が約 11 mg/mL ~ 約 30 mg/mL である (S) - 3 - アミノメチル - 7 - (3 - ヒドロキシ - プロポキシ) - 3 H - ベンゾ [c] [1, 2] オキサボロール - 1 - オール・HCl の溶液のエバポレーションおよび/または再結晶によって製造される、前記結晶多形体。

【請求項 14】

(S) - 3 - アミノメチル - 7 - ( 3 - ヒドロキシ - プロポキシ ) - 3 H - ベンゾ [ c ] [ 1 , 2 ] オキサボロール - 1 - オールの塩酸塩の結晶多形体であって、(S) - 3 - アミノメチル - 7 - ( 3 - ヒドロキシ - プロポキシ ) - 3 H - ベンゾ [ c ] [ 1 , 2 ] オキサボロール - 1 - オール・HCl の濃度が約 15 mg / mL ~ 約 50 mg / mL である (S) - 3 - アミノメチル - 7 - ( 3 - ヒドロキシ - プロポキシ ) - 3 H - ベンゾ [ c ] [ 1 , 2 ] オキサボロール - 1 - オール・HCl の溶液のエバポレーションおよび / または再結晶によって製造される、前記結晶多形体。