

【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 19 年 4 月 19 日 (2007.4.19)

【公表番号】特表 2006-519852(P2006-519852A)
 【公表日】平成 18 年 8 月 31 日 (2006.8.31)
 【年通号数】公開・登録公報 2006-034
 【出願番号】特願 2006-507175(P2006-507175)
 【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4184 (2006.01)
A 6 1 K 31/427 (2006.01)
A 6 1 K 31/437 (2006.01)
A 6 1 K 31/4164 (2006.01)
A 6 1 K 31/455 (2006.01)
A 6 1 K 31/517 (2006.01)
A 6 1 K 31/428 (2006.01)
A 6 1 K 31/4545 (2006.01)
A 6 1 K 31/245 (2006.01)
A 6 1 K 9/08 (2006.01)
A 6 1 K 9/10 (2006.01)
C 0 7 D 417/04 (2006.01)
C 0 7 D 235/08 (2006.01)
C 0 7 D 235/32 (2006.01)

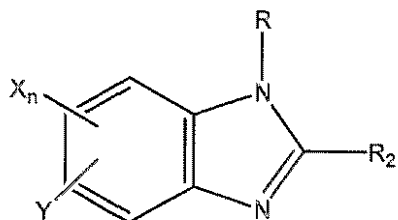
【 F I 】

A 6 1 K 31/4184
 A 6 1 K 31/427
 A 6 1 K 31/437
 A 6 1 K 31/4164
 A 6 1 K 31/455
 A 6 1 K 31/517
 A 6 1 K 31/428
 A 6 1 K 31/4545
 A 6 1 K 31/245
 A 6 1 K 9/08
 A 6 1 K 9/10
 C 0 7 D 417/04 C S P
 C 0 7 D 235/08
 C 0 7 D 235/32 A

【手続補正書】
 【提出日】平成 19 年 2 月 27 日 (2007.2.27)
 【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】

式：

【化 1】



の弱塩基化合物の塩；

1つ以上の遊離の酸；ならびに

任意の薬学的添加剤を含む薬学的組成物であって、ここでXは、水素、ハロゲン、7個未満の炭素原子のアルキルもしくは7個未満の炭素原子のアルコキシであり；nは、4未満の正の整数であり；Yは、水素、塩素、ニトロ、メチル、エチルまたはオキシクロロであり；Rは、水素、アルキル基が3～6個の炭素原子を有するアルキルアミノカルボニルまたは1～8個の炭素原子を有するアルキル基であり、R₂は、4-チアゾリル、R₁が7個未満の炭素原子の脂肪族炭化水素であるNHCOOR₁、または7個未満の炭素原子のアルキル基であり、該塩と1つ以上の遊離の酸は、該組成物中で1：0.5～1：3の重量比で存在する、薬学的組成物。

【請求項 2】

前記塩が、塩化物、臭化物、リン酸塩、硫酸塩、トシラート、ベンゾイル化物、硝酸塩、スルホン酸塩、ギ酸塩、酒石酸塩、マレイン酸塩、リンゴ酸塩、クエン酸塩、安息香酸塩、サリチル酸塩、アスコルビン酸塩およびメシラートからなる群から選択される1つ以上のものである、請求項1に記載の薬学的組成物。

【請求項 3】

前記塩が、塩化物、リン酸塩、硫酸塩、トシラート、ベンゾイル化物およびメシラートからなる群から選択される1つ以上のものである、請求項2に記載の薬学的組成物。

【請求項 4】

前記塩および前記遊離の酸が、前記組成物中で1：1の重量比で存在する、請求項1に記載の薬学的組成物。

【請求項 5】

前記塩および前記遊離の酸が、前記組成物中で1：2の重量比で存在する、請求項1に記載の薬学的組成物。

【請求項 6】

前記塩が結晶性である、請求項1に記載の薬学的組成物。

【請求項 7】

前記組成物の水溶液または懸濁液のpHが、2以下である、請求項1に記載の薬学的組成物。

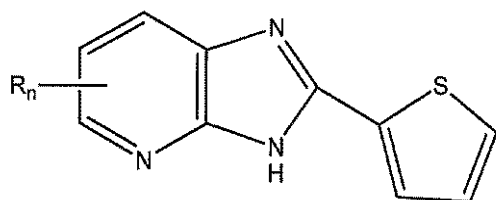
【請求項 8】

前記弱塩基化合物が、イミダゾール誘導体である、請求項1に記載の薬学的組成物。

【請求項 9】

前記弱塩基化合物が、

【化 2】



であり、ここで、nは1～3の整数であり、Rは、水素、1～7個の炭素原子を有するア

ルキル、クロロ、プロモ、フルオロ、オキシクロロ、ヒドロキシ、スルフヒドリル、または式 $-O(CH_2)_yCH_3$ を有するアルコキシであり、ここで y は 0 ~ 6 の整数である、請求項 8 に記載の薬学的組成物。

【請求項 10】

前記弱塩基化合物がベンゾイミダゾール誘導体である、請求項 1 に記載の薬学的組成物。

【請求項 11】

前記弱塩基化合物が、カルベンダジムである、請求項 10 に記載の薬学的組成物。

【請求項 12】

前記弱塩基化合物が、ピリジン誘導体である、請求項 1 に記載の薬学的組成物。

【請求項 13】

前記弱塩基化合物が、アニリン誘導体である、請求項 1 に記載の薬学的組成物。

【請求項 14】

前記組成物が、経口投与、静脈内投与または点滴投与のために使用される、請求項 1 に記載の薬学的組成物。

【請求項 15】

前記遊離の酸が、前記塩と同一のアニオンを有する、請求項 1 に記載の薬学的組成物。

【請求項 16】

前記塩とは異なるアニオンを有する遊離の酸をさらに含む、請求項 15 に記載の薬学的組成物。

【請求項 17】

前記遊離の酸が、前記塩と異なるアニオンを有する、請求項 1 に記載の薬学的組成物。

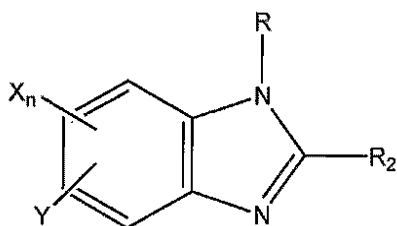
【請求項 18】

請求項 1 に記載の薬学的組成物の溶液または懸濁液。

【請求項 19】

式：

【化 3】



の弱塩基化合物の結晶性塩であって、

ここで X は、水素、ハロゲン、7 個未満の炭素原子のアルキルもしくは 7 個未満の炭素原子のアルコキシであり； n は、4 未満の正の整数であり； Y は、水素、塩素、ニトロ、メチル、エチルまたはオキシクロロであり； R は、水素、アルキル基が 3 ~ 6 個の炭素原子を有するアルキルアミノカルボニルまたは 1 ~ 8 個の炭素原子を有するアルキル基であり、 R_2 は、4 - チアゾリル、 R_1 が 7 個未満の炭素原子の脂肪族炭化水素である $NHCOOR_1$ 、または 7 個未満の炭素原子のアルキル基であり；

該塩は、塩酸塩、リン酸塩、硫酸塩、トシラート、ベンゾイル化物およびメシラートから選択される、結晶性塩。

【請求項 20】

1 つ以上の遊離の酸をさらに含む、請求項 19 に記載の結晶性塩。

【請求項 21】

患者における疾患を処置するための、請求項 1 に記載の薬学的組成物。