

【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6月19日(2014.6.19)

【公表番号】特表2013-532170(P2013-532170A)

【公表日】平成25年8月15日(2013.8.15)

【年通号数】公開・登録公報2013-043

【出願番号】特願2013-518688(P2013-518688)

【国際特許分類】

C 07 D 207/08	(2006.01)
A 61 K 31/40	(2006.01)
A 61 P 25/04	(2006.01)
A 61 P 25/24	(2006.01)
A 61 P 25/18	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 3/04	(2006.01)
A 61 P 3/02	(2006.01)
A 61 P 13/00	(2006.01)
A 61 P 15/12	(2006.01)
A 61 K 45/00	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 207/08	C S P
A 61 K 31/40	
A 61 P 25/04	
A 61 P 25/24	
A 61 P 25/18	
A 61 P 25/28	
A 61 P 3/04	
A 61 P 3/02	
A 61 P 13/00	
A 61 P 15/12	
A 61 K 45/00	
A 61 P 43/00	1 1 4

【手続補正書】

【提出日】平成26年4月21日(2014.4.21)

【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】

8.78±0.20、15.26±0.20、19.08±0.20、20.20.36±0.20、21.50±0.20、および25.46±0.20の2値に回折ピークを含む粉末X線回折パターンを特徴とする、(S)-3-[ (S)-1-(4-クロロフェニル)-2-メチルプロピル]ピロリジンと塩酸の1:1のモル比の結晶塩。

【請求項2】

26.42±0.20、30.65±0.20、28.91±0.20、24.77±0

.20、14.42±0.20、16.74±0.20、および5.20±0.20より選択される2値に1つ以上のさらなる回折ピークを有することを特徴とする、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

ピーク位置が図1に示すパターンのピーク位置と実質的に一致する粉末X線回折パターンを特徴とする、請求項1～2のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項4】

約128の融点を有する示差走査熱量測定法のトレースを特徴とする、請求項1～3のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項5】

図2に示すトレースと実質的に一致する示差走査熱量測定法のトレースを特徴とする、請求項1～4のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項6】

薬学的に許容され得る担体と請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物を含む薬学的組成物。

【請求項7】

アルツハイマー病治療薬、抗痙攣薬、抗鬱薬、パークリンソン病治療薬、セロトニン・ノルエピネフェリン二重再取り込み阻害薬、非ステロイド系抗炎症薬、ノルエピネフェリン再取り込み阻害薬、オピオイド作動薬、オピオイド拮抗薬、選択的セロトニン再取り込み阻害薬、ナトリウムチャンネル遮断薬、交感神経遮断薬、およびこれらの組み合わせより選択される第2の治療薬をさらに含む、請求項6に記載の薬学的組成物。

【請求項8】

以下の工程を含む、請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物を調製するためのプロセス：

(a) (S)-3-[ (S)-1-(4-クロロフェノキシ)-2-メチルプロピル]ピロリジンの塩酸塩を極性溶媒で処理して第1の組成物を形成させるか、または(S)-3-[ (S)-1-(4-クロロフェノキシ)-2-メチルプロピル]ピロリジン-1-カルボン酸t-ブチルエステルを不活性希釈剤中で塩酸で脱保護して第1の組成物を形成させる工程；および

(b) 非極性溶媒を添加して第2の組成物を形成させる工程であって、前記第2の組成物から請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物が形成される、工程。

【請求項9】

工程(b)は以下を含む、請求項8に記載のプロセス：

(i) 非極性溶媒を添加して第2の組成物を形成させる工程；

(ii) 必要に応じて冷却して結晶化させる工程；および

(iii) 得られた固体を単離して前記化合物を得る工程。

【請求項10】

前記極性溶媒がイソプロパノールである、請求項8～9のいずれか1項に記載のプロセス。

【請求項11】

脱保護が3MのHClを用いて行われ、前記不活性希釈剤がシクロペンチルメチルエーテルである、請求項8～9のいずれか1項に記載のプロセス。

【請求項12】

前記非極性溶媒がジイソプロピルエーテルである、請求項8～9のいずれか1項に記載のプロセス。

【請求項13】

請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物を調製する工程を含む、(S)-3-[ (S)-1-(4-クロロフェノキシ)-2-メチルプロピル]ピロリジンを精製するためのプロセス。

【請求項14】

治療に使用するための組成物であって、請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項15】

疼痛性障害、抑鬱性障害、情動障害、注意欠陥多動性障害、認知障害、腹圧性尿失禁、慢性疲労症候群、肥満症、または閉経に伴う血管運動症状を処置するための、請求項14に記載の組成物。

【請求項16】

前記疼痛性障害が、神経因性疼痛、線維筋痛症、慢性腰痛、および変形性関節症より選択される、請求項15に記載の組成物。

【請求項17】

請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物を含む医薬。

【請求項18】

医薬の製造のための請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物の使用。

【請求項19】

前記医薬が、疼痛性障害、抑鬱性障害、情動障害、注意欠陥多動性障害、認知障害、腹圧性尿失禁、慢性疲労症候群、肥満症、または閉経に伴う血管運動症状の処置のためのものである、請求項18に記載の使用。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0011

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0011】

本発明の様々な態様を、添付の図面を参照して説明する。

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)

8.78±0.20、15.26±0.20、19.08±0.20、20.36±0.20、21.50±0.20、および25.46±0.20の2値に回折ピークを含む粉末X線回折パターンを特徴とする、(S)-3-[ (S)-1-(4-クロロフェノキシ)-2-メチルプロピル]ピロリジンと塩酸の1:1のモル比の結晶塩。

(項目2)

26.42±0.20、30.65±0.20、28.91±0.20、24.77±0.20、14.42±0.20、16.74±0.20、および5.20±0.20より選択される2値に1つ以上のさらなる回折ピークを有することを特徴とする、項目1に記載の化合物。

(項目3)

ピーク位置が図1に示すパターンのピーク位置と実質的に一致する粉末X線回折パターンを特徴とする、項目1～2のいずれか1項に記載の化合物。

(項目4)

約128の融点を有する示差走査熱量測定法のトレースを特徴とする、項目1～3のいずれか1項に記載の化合物。

(項目5)

図2に示すトレースと実質的に一致する示差走査熱量測定法のトレースを特徴とする、項目1～4のいずれか1項に記載の化合物。

(項目6)

薬学的に許容され得る担体と項目1～5のいずれか1項に記載の化合物を含む薬学的組成物。

(項目7)

アルツハイマー病治療薬、抗痙攣薬、抗鬱薬、パーキンソン病治療薬、セロトニン・ノルエピネフリン二重再取り込み阻害薬、非ステロイド系抗炎症薬、ノルエピネフリン再取

込み阻害薬、オピオイド作動薬、オピオイド拮抗薬、選択的セロトニン再取り込み阻害薬、ナトリウムチャネル遮断薬、交感神経遮断薬、およびこれらの組み合わせより選択される第2の治療薬をさらに含む、項目6に記載の薬学的組成物。

(項目8)

以下の工程を含む、項目1～5のいずれか1項に記載の化合物を調製するためのプロセス：

(a) (S)-3-[ (S)-1-(4-クロロフェノキシ)-2-メチルプロピル]ピロリジンの塩酸塩を極性溶媒で処理して第1の組成物を形成させるか、または(S)-3-[ (S)-1-(4-クロロフェノキシ)-2-メチルプロピル]ピロリジン-1-カルボン酸t-ブチルエステルを不活性希釈剤中で塩酸で脱保護して第1の組成物を形成させる工程；および

(b) 非極性溶媒を添加して第2の組成物を形成させる工程であって、前記第2の組成物から項目1～5のいずれか1項に記載の化合物が形成される、工程。

(項目9)

工程(b)は以下を含む、項目8に記載のプロセス：

(i) 非極性溶媒を添加して第2の組成物を形成させる工程；

(ii) 必要に応じて冷却して結晶化させる工程；および

(iii) 得られた固体を単離して前記化合物を得る工程。

(項目10)

前記極性溶媒がイソプロパノールである、項目8～9のいずれか1項に記載のプロセス。

(項目11)

脱保護が3MのHClを用いて行われ、前記不活性希釈剤がシクロペンチルメチルエーテルである、項目8～9のいずれか1項に記載のプロセス。

(項目12)

前記非極性溶媒がジイソプロピルエーテルである、項目8～9のいずれか1項に記載のプロセス。

(項目13)

項目1～5のいずれか1項に記載の化合物を調製する工程を含む、(S)-3-[ (S)-1-(4-クロロフェノキシ)-2-メチルプロピル]ピロリジンを精製するためのプロセス。

(項目14)

治療に使用するための、項目1～5のいずれか1項に記載の化合物。

(項目15)

疼痛性障害、抑鬱性障害、情動障害、注意欠陥多動性障害、認知障害、腹圧性尿失禁、慢性疲労症候群、肥満症、または閉経に伴う血管運動症状を処置するための、項目14に記載の化合物。

(項目16)

前記疼痛性障害が、神経因性疼痛、線維筋痛症、慢性腰痛、および変形性関節症より選択される、項目15に記載の化合物。

(項目17)

項目1～5のいずれか1項に記載の化合物を含む医薬。

(項目18)

医薬の製造のための項目1～5のいずれか1項に記載の化合物の使用。

(項目19)

前記医薬が、疼痛性障害、抑鬱性障害、情動障害、注意欠陥多動性障害、認知障害、腹圧性尿失禁、慢性疲労症候群、肥満症、または閉経に伴う血管運動症状の処置のためのものである、項目18に記載の使用。