

【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 17 年 12 月 22 日 (2005.12.22)

【公表番号】特表 2004-530660(P2004-530660A)

【公表日】平成 16 年 10 月 7 日 (2004.10.7)

【年通号数】公開・登録公報 2004-039

【出願番号】特願 2002-569838(P2002-569838)

【国際特許分類第 7 版】

C 07 D 411/04

A 61 K 31/513

A 61 P 1/16

A 61 P 31/18

A 61 P 31/20

// C 07 M 7:00

C 07 M 9:00

【F I】

C 07 D 411/04

A 61 K 31/513

A 61 P 1/16

A 61 P 31/18

A 61 P 31/20

C 07 M 7:00

C 07 M 9:00

【手続補正書】

【提出日】平成 17 年 2 月 28 日 (2005.2.28)

【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】

粉末 X 線回折パターンにおいて示される特性ピークの角度位置 (2) が、

a) $14.7^{\circ} \pm 0.1^{\circ}$ 、 $16.7^{\circ} \pm 0.1^{\circ}$ 、 $19.6^{\circ} \pm 0.1^{\circ}$ 、 $21.1^{\circ} \pm 0.1^{\circ}$ 、 $21.8^{\circ} \pm 0.1^{\circ}$ 、 $24.6^{\circ} \pm 0.1^{\circ}$ 、および $25.6^{\circ} \pm 0.1^{\circ}$ (I I 型 (-) - シス - F T C)、または

b) $14.5^{\circ} \pm 0.1^{\circ}$ 、 $16.7^{\circ} \pm 0.1^{\circ}$ 、 $19.6^{\circ} \pm 0.1^{\circ}$ 、 $20.4^{\circ} \pm 0.1^{\circ}$ 、 $21.4^{\circ} \pm 0.1^{\circ}$ 、 $21.7^{\circ} \pm 0.1^{\circ}$ 、 $25.2^{\circ} \pm 0.1^{\circ}$ 、および $26.2^{\circ} \pm 0.1^{\circ}$ (I I I 型 (-) - シス - F T C)

である (-) - シス - F T C の結晶多形化合物。

【請求項 2】

I I 型 (-) - シス - F T C である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

I I I 型 (-) - シス - F T C である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

実質上純粋な I I 型 (-) - シス - F T C である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

純度が少なくとも 97% である請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

実質上純粋な I I I 型 (-) - シス - F T C である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

純度が少なくとも 97% である請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

粉末 X 線回折パターンにおいて示される特性ピークの角度位置 (2 θ) が、

a) 14.7° ± 0.1°、16.7° ± 0.1°、19.6° ± 0.1°、21.1° ± 0.1°、21.8° ± 0.1°、24.6° ± 0.1°、および 25.6° ± 0.1° (I I 型 (-) - シス - F T C)、または

b) 14.5° ± 0.1°、16.7° ± 0.1°、19.6° ± 0.1°、20.4° ± 0.1°、21.4° ± 0.1°、21.7° ± 0.1°、25.2° ± 0.1°、および 26.2° ± 0.1° (I I I 型 (-) - シス - F T C)

である (-) - シス - F T C の結晶多形化合物、と薬剤として許容される担体を含む薬剤組成物。

【請求項 9】

a) 粉末 X 線回折パターンにおいて示される特性ピークの角度位置 (2 θ) が、14.1° ± 0.1°、19.9° ± 0.1°、20.2° ± 0.1°、20.6° ± 0.1°、21.0° ± 0.1°、22.4° ± 0.1°、28.5° ± 0.1°、29.5° ± 0.1°、および 32.6° ± 0.1° である I 型 (-) - シス - F T C を融解すること、および

b) 融解した (-) - シス - F T C を再結晶させること
を含む方法によって調製された多形型の (-) - シス - F T C。

【請求項 10】

方法が、再結晶させた F T C を約 96 °C より低温に冷却することをさらに含む、請求項 9 に記載の多形型の (-) - シス - F T C。

【請求項 11】

粉末 X 線回折パターンにおいて示される特性ピークの角度位置 (2 θ) が、14.7° ± 0.1°、16.7° ± 0.1°、19.6° ± 0.1°、21.1° ± 0.1°、21.8° ± 0.1°、24.6° ± 0.1° および 25.6° ± 0.1° である (-) - シス - F T C の I I 型多形体を、約 96 °C より低温に冷却することを含む方法によって調製された多形型の (-) - シス - F T C。

【請求項 12】

粉末 X 線回折パターンにおいて示される特性ピークの角度位置 (2 θ) が、14.5° ± 0.1°、16.7° ± 0.1°、19.6° ± 0.1°、20.4° ± 0.1°、21.4° ± 0.1°、21.7° ± 0.1°、25.2° ± 0.1°、および 26.2° ± 0.1° である (-) - シス - F T C の I I I 型多形体を、約 112 °C より高温に加熱することを含む方法によって調製された多形型の (-) - シス - F T C。

【請求項 13】

a) 粉末 X 線回折パターンにおいて示される特性ピークの角度位置 (2 θ) が、14.1° ± 0.1°、19.9° ± 0.1°、20.2° ± 0.1°、20.6° ± 0.1°、21.0° ± 0.1°、22.4° ± 0.1°、28.5° ± 0.1°、29.5° ± 0.1°、および 32.6° ± 0.1° である I 型 (-) - シス - F T C を融解すること、および

b) 融解した (-) - シス - F T C を再結晶させること
を含む、多形型の (-) - シス - F T C を調製する方法。

【請求項 14】

再結晶させた F T C を約 96 °C より低温に冷却することをさらに含む請求項 13 に記載の方法。

【請求項 15】

粉末 X 線回折パターンにおいて示される特性ピークの角度位置 (2 θ) が、14.7°

$\pm 0.1^\circ$ 、 $16.7^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $19.6^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $21.1^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $21.8^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $24.6^\circ \pm 0.1^\circ$ および $25.6^\circ \pm 0.1^\circ$ である (-) - シス - F T C の I I 型多形体を約 96 より低温に冷却することを含む、多形型の (-) - シス - F T C を調製する方法。

【請求項 16】

粉末 X 線回折パターンにおいて示される特性ピークの角度位置 (2) が、 $14.5^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $16.7^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $19.6^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $20.4^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $21.4^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $21.7^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $25.2^\circ \pm 0.1^\circ$ 、および $26.2^\circ \pm 0.1^\circ$ である (-) - シス - F T C の I I I 型多形体を約 112 より高温に加熱することを含む、多形型の (-) - シス - F T C を調製する方法。

【請求項 17】

a) 第 1 の結晶型の (±) - シス - F T C を水に溶解すること、および
b) 溶解した (±) - シス - F T C を再結晶させること
を含む方法によって調製された結晶型の (±) - シス - F T C。

【請求項 18】

再結晶させた (±) - シス - F T C を脱水することをさらに含む、請求項 17 に記載の結晶型の (±) - シス - F T C。

【請求項 19】

第 1 の結晶型の (±) - シス - F T C が、(-) または (+) 鏡像異性体を最高で 98 % 含むシス - F T C の組成物中に存在する、請求項 17 に記載の結晶型の (±) - シス - F T C。

【請求項 20】

(±) - シス - F T C 1.5 水和物。

【請求項 21】

実質上純粋な型の (±) - シス - F T C 1.5 水和物。

【請求項 22】

純度が少なくとも 97 % である (±) - シス - F T C 1.5 水和物。

【請求項 23】

(±) - シス - F T C 1.5 水和物と薬剤として許容される担体を含む薬剤組成物。

【請求項 24】

脱水された (±) - シス - F T C 1.5 水和物。

【請求項 25】

実質上純粋な型の脱水された (±) - シス - F T C 1.5 水和物。

【請求項 26】

純度が少なくとも 97 % の脱水された (±) - シス - F T C 1.5 水和物。

【請求項 27】

脱水された (±) - シス - F T C 1.5 水和物と薬剤として許容される担体を含む薬剤組成物。

【請求項 28】

粉末 X 線回折パターンにおいて示される特性ピークの角度位置 (2) が、 $11.5^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $13.4^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $19.1^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $20.3^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $20.8^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $21.5^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $21.9^\circ \pm 0.1^\circ$ 、および $30.9^\circ \pm 0.1^\circ$ である結晶型の (±) - シス - F T C。

【請求項 29】

粉末 X 線回折パターンにおいて示される特性ピークの角度位置 (2) が、 $12.3^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $14.0^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $20.7^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $22.6^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $23.3^\circ \pm 0.1^\circ$ 、および $25.5^\circ \pm 0.1^\circ$ である結晶型の (±) - シス - F T C。

【請求項 30】

a) 第 1 の結晶型の (±) - シス - F T C を水に溶解すること、および

b) 溶解した(±)-シス-FTCを再結晶させること
を含む、結晶型の(±)-シス-FTCを調製する方法。

【請求項31】

再結晶させた(±)-シス-FTCを脱水することをさらに含む請求項30に記載の方法。

【請求項32】

第1の結晶型の(±)-シス-FTCが、(-)または(+)鏡像異性体を最高で98%含むシス-FTCの組成物中に存在する、請求項30に記載の方法。

【請求項33】

非晶質(-)-シス-FTC。

【請求項34】

実質上純粋な型の非晶質(-)-シス-FTC。

【請求項35】

純度が少なくとも97%である非晶質(-)-シス-FTC。

【請求項36】

非晶質(-)-シス-FTCと薬剤として許容される担体を含む薬剤組成物。

【請求項37】

a) (-)-シス-FTCを融解すること、および
b) 再結晶を防止するために融解物を急冷すること
を含む、非晶質(-)-シス-FTCを調製する方法。

【請求項38】

非晶質(-)-シス-FTCを約96より低温に冷却することをさらに含む請求項37に記載の方法。

【請求項39】

HIV治療用の医薬品の製造における請求項1に記載の化合物の使用。

【請求項40】

HBV治療用の医薬品の製造における請求項1に記載の化合物の使用。

【請求項41】

HIV治療用の医薬品の製造における、(±)-シス-FTC 1.5水和物、脱水された(±)-シス-FTC 1.5水和物、または非晶質(-)-シス-FTCの使用。

【請求項42】

HBV治療用の医薬品の製造における、(±)-シス-FTC 1.5水和物、脱水された(±)-シス-FTC 1.5水和物、または非晶質(-)-シス-FTCの使用。

【請求項43】

請求項1に記載の化合物を含む、HIVを治療するための薬剤組成物。

【請求項44】

請求項1に記載の化合物を含む、HBVを治療するための薬剤組成物。

【請求項45】

(±)-シス-FTC 1.5水和物、脱水された(±)-シス-FTC 1.5水和物、または非晶質(-)-シス-FTCを含む、HIVを治療するための薬剤組成物。

【請求項46】

(±)-シス-FTC 1.5水和物、脱水された(±)-シス-FTC 1.5水和物、または非晶質(-)-シス-FTCを含む、HBVを治療するための薬剤組成物。

【請求項47】

請求項1に記載の化合物を含む、HIVの治療に使用される薬剤組成物。

【請求項48】

請求項1に記載の化合物を含む、HBVの治療に使用される薬剤組成物。

【請求項49】

(±)-シス-FTC 1.5水和物、脱水された(±)-シス-FTC 1.5水和物、または非晶質(-)-シス-FTCを含む、HIVの治療に使用される薬剤組成物。

【請求項 50】

(±) - シス - F T C 1 . 5 水和物、脱水された (±) - シス - F T C 1 . 5 水和物、または非晶質 (-) - シス - F T C を含む、H B V の治療に使用される薬剤組成物。