

【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 0 7 D 411/04

A 6 1 K 31/513

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 31/18

A 6 1 P 31/20

// C 0 7 M 7:00

C 0 7 M 9:00

【F I】

C 0 7 D 411/04

A 6 1 K 31/513

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 31/18

A 6 1 P 31/20

C 0 7 M 7:00

C 0 7 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(2θ)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°(II型(-)-シス-FTC)、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°(III型(-)-シス-FTC)

である(-)-シス-FTCの結晶多形化合物。

【請求項2】

II型(-)-シス-FTCである請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

III型(-)-シス-FTCである請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

実質上純粋なII型(-)-シス-FTC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 II 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) 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 II 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 III 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) 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 ℃ 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) 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 II 型多形体を、約 96 ℃ 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) 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 III 型多形体を、約 112 ℃ 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) 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 ℃ 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) が、14.7 ° ± 0.1 °

$\pm 0.1^\circ$ 、 $16.7^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $19.6^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $21.1^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $21.8^\circ \pm 0.1^\circ$ 、 $24.6^\circ \pm 0.1^\circ$ および $25.6^\circ \pm 0.1^\circ$ である(-)-シス-FTCのII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-FTC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-FTCのIII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-FTCを調製する方法。

【請求項17】

a) 第1の結晶型の(\pm)-シス-FTCを水に溶解すること、および
b) 溶解した(\pm)-シス-FTC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(\pm)-シス-FTC。

【請求項18】

再結晶させた(\pm)-シス-FTC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(\pm)-シス-FTC。

【請求項19】

第1の結晶型の(\pm)-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17に記載の結晶型の(\pm)-シス-FTC。

【請求項20】

(\pm)-シス-FTC 1.5水和物。

【請求項21】

実質上純粋な型の(\pm)-シス-FTC 1.5水和物。

【請求項22】

純度が少なくとも97%である(\pm)-シス-FTC 1.5水和物。

【請求項23】

(\pm)-シス-FTC 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(\pm)-シス-FTC 1.5水和物。

【請求項25】

実質上純粋な型の脱水された(\pm)-シス-FTC 1.5水和物。

【請求項26】

純度が少なくとも97%の脱水された(\pm)-シス-FTC 1.5水和物。

【請求項27】

脱水された(\pm)-シス-FTC 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(\pm)-シス-FTC。

【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(\pm)-シス-FTC。

【請求項30】

a) 第1の結晶型の(\pm)-シス-FTC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、結晶型の (±) - シス - F T C を調製する方法。

【請求項 3 1】

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 3 0 に記載の方法。

【請求項 3 2】

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 9 8 % 含むシス - F T C の組成物中に存在する、請求項 3 0 に記載の方法。

【請求項 3 3】

非晶質 (-) - シス - F T C 。

【請求項 3 4】

実質上純粹な型の非晶質 (-) - シス - F T C 。

【請求項 3 5】

純度が少なくとも 9 7 % である非晶質 (-) - シス - F T C 。

【請求項 3 6】

非晶質 (-) - シス - F T C と薬剤として許容される担体を含む薬剤組成物。

【請求項 3 7】

a) (-) - シス - F T C 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 - F T C を調製する方法。

【請求項 3 8】

非晶質 (-) - シス - F T C を約 9 6 より低温に冷却することをさらに含む請求項 3 7 に記載の方法。

【請求項 3 9】

H I V 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 4 0】

H B V 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 4 1】

H I V 治療用の医薬品の製造における、(±) - 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 の使用。

【請求項 4 2】

H B V 治療用の医薬品の製造における、(±) - 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 の使用。

【請求項 4 3】

請求項 1 に記載の化合物を含む、H I V を治療するための薬剤組成物。

【請求項 4 4】

請求項 1 に記載の化合物を含む、H B V を治療するための薬剤組成物。

【請求項 4 5】

(±) - 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 I V を治療するための薬剤組成物。

【請求項 4 6】

(±) - 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 を治療するための薬剤組成物。

【請求項 4 7】

請求項 1 に記載の化合物を含む、H I V の治療に使用される薬剤組成物。

【請求項 4 8】

請求項 1 に記載の化合物を含む、H B V の治療に使用される薬剤組成物。

【請求項 4 9】

(±) - 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 I V の治療に使用される薬剤組成物。

【請求項 50】

(±)-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の治療に使用される薬剤組成物。