

【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】令和2年8月13日(2020.8.13)

【公表番号】特表2019-524894(P2019-524894A)

【公表日】令和1年9月5日(2019.9.5)

【年通号数】公開・登録公報2019-036

【出願番号】特願2019-530540(P2019-530540)

【国際特許分類】

C 07 D 491/044 (2006.01)

A 61 K 31/407 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 491/044 C S P

A 61 K 31/407

A 61 P 35/00

A 61 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】令和2年6月30日(2020.6.30)

【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】

C u K 線を用いたときの約7.2、14.5および36.7°2におけるピークを含む粉末X線回折パターンを特徴とする、マリゾミブのモルフィック形態(Morphic Form)I。

【請求項2】

C u K 線を用いたときの約18.1、19.6および20.8°2における粉末X線回折ピークをさらに含む、請求項1に記載のモルフィック形態。

【請求項3】

C u K 線を用いたときの約16.3、19.8および20.5°2における粉末X線回折ピークをさらに含む、請求項1または2に記載のモルフィック形態。

【請求項4】

C u K 線を用いたときの約15.2、21.5および22.3°2における粉末X線回折ピークをさらに含む、請求項1～3のいずれか1項に記載のモルフィック形態。

【請求項5】

C u K 線を用いたときの約14.7、29.2および30.0°2における粉末X線回折ピークをさらに含む、請求項1～4のいずれか1項に記載のモルフィック形態。

【請求項6】

C u K 線を用いたときの約8.2、14.8および27.7°2における粉末X線回折ピークをさらに含む、請求項1～5のいずれか1項に記載のモルフィック形態。

【請求項7】

図1、2または3に示される粉末X線回折パターンと実質的に類似の粉末X線回折パターンをさらに特徴とする、請求項1～6のいずれか1項に記載のモルフィック形態。

FIG. 1

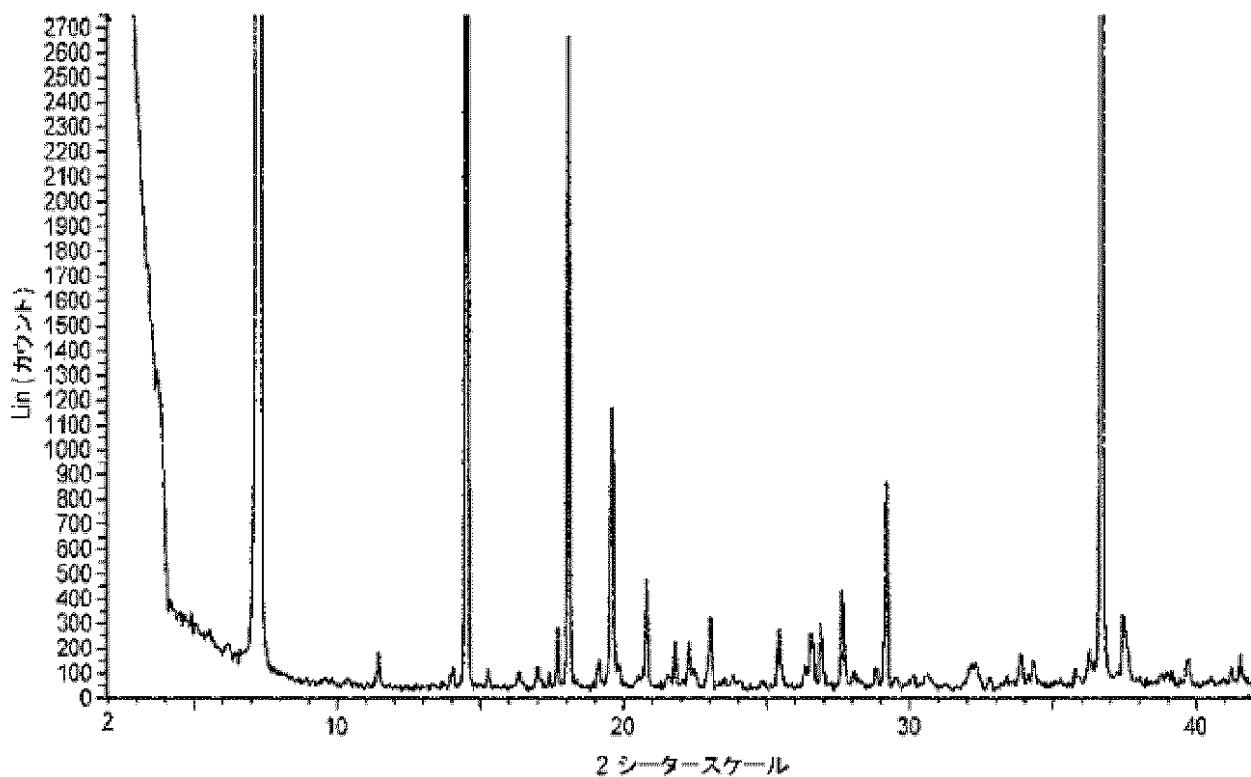


FIG. 2

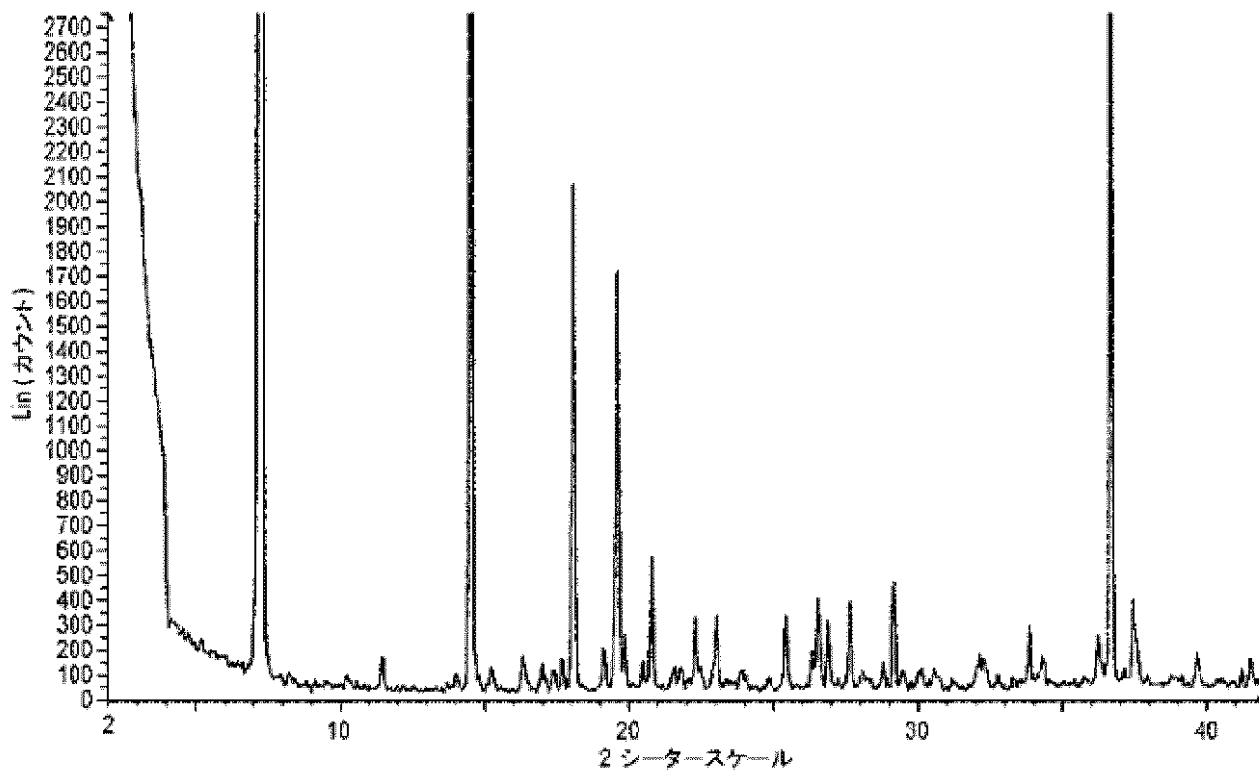
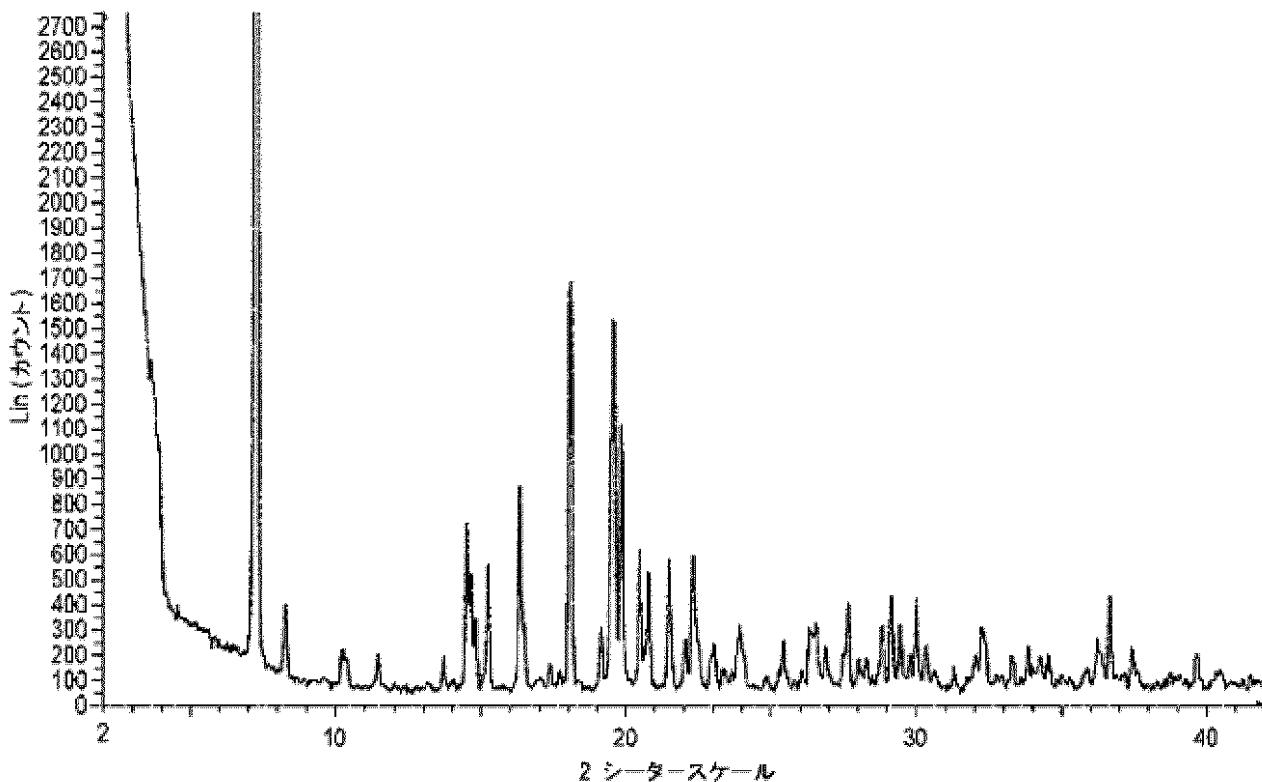


FIG. 3



## 【請求項 8】

熱重量分析によって計測される約 175 における分解事象をさらに特徴とする、請求項 1～7 のいずれか 1 項に記載のモルフィック形態。

## 【請求項 9】

約 2 / 分の速度における示差走査熱量測定によって計測されたときの約 150～180 における 2 つの発熱をさらに特徴とする、請求項 1～8 のいずれか 1 項に記載のモルフィック形態。

## 【請求項 10】

高温顕微鏡法によって計測されたときの約 160～175 における融解を特徴とする、請求項 1～9 のいずれか 1 項に記載のモルフィック形態。

## 【請求項 11】

前記多形が、HPLC によって計測されたとき少なくとも約 98 % 純粋である、請求項 1～10 のいずれか 1 項に記載のモルフィック形態。

## 【請求項 12】

前記多形が、HPLC によって計測されたとき少なくとも約 99.1 % 純粋である、請求項 11に記載のモルフィック形態。

## 【請求項 13】

請求項 1～12 のいずれか 1 項に記載のモルフィック形態および薬学的に許容される担体を含む、医薬組成物。

## 【請求項 14】

癌を治療するための、請求項 13に記載の医薬組成物。

## 【請求項 15】

プロテアーゼを阻害するための、請求項 1～12 のいずれか 1 項に記載のモルフィック形態を含む、組成物。

## 【請求項 16】

CuK 線を用いたときの約 7.2、14.5 および 36.7 ° 2 におけるピークを含む粉末 X 線回折パターンを特徴とするマリゾミブのモルフィック形態を調製する方法で

あって、マリゾミブを溶媒から再結晶する工程を含む、方法。

【請求項 1 7】

前記溶媒が、n - ヘプタン、酢酸エチル、メチル - イソブチルケトン、2 - プロパノール、アセトン、クロロホルム、ジメチルスルホキシド、tert - ブチルメチルエーテル、アニソール、クメン、メチルエチルケトン、酢酸イソプロピル、ジメチルホルムアミド、トルエン、テトラヒドロフラン、ジクロロメタン、アセトニトリル、ニトロメタン、エタノールおよびジメチルアセトアミドからなる群より選択される、請求項1 6に記載の方法。