

【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 0 7 D 491/044 (2006.01)

A 6 1 K 31/407 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 491/044 C S P

A 6 1 K 31/407

A 6 1 P 35/00

A 6 1 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】

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 (M o r p h i c F o r m) I。

【請求項 2】

CuK 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】

CuK 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】

CuK 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】

CuK 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】

CuK 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

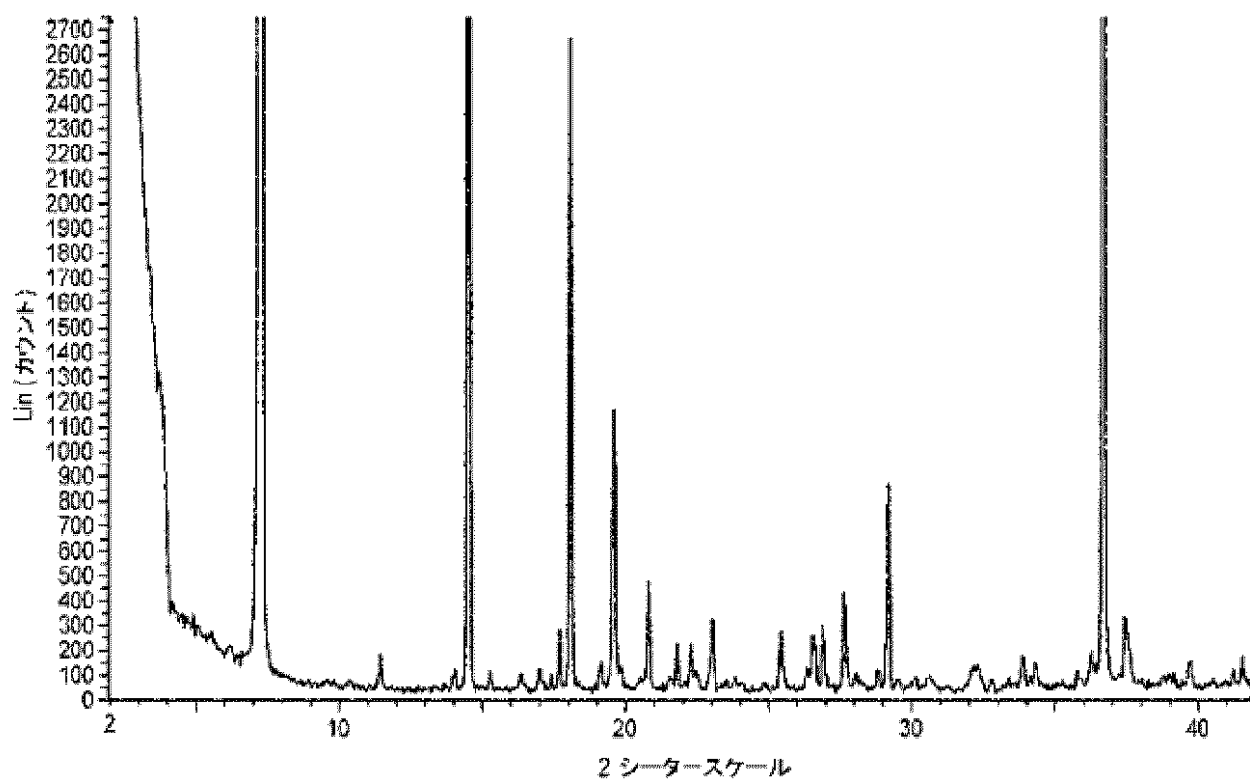


FIG. 2

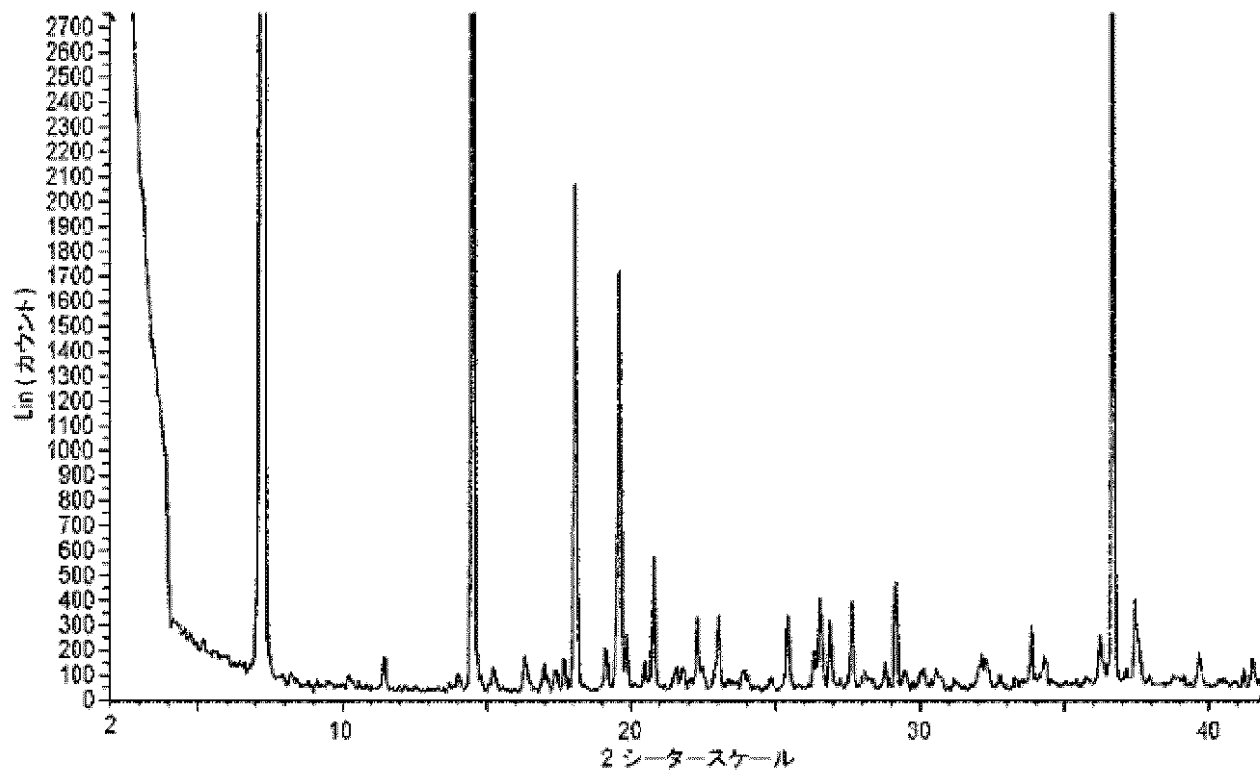
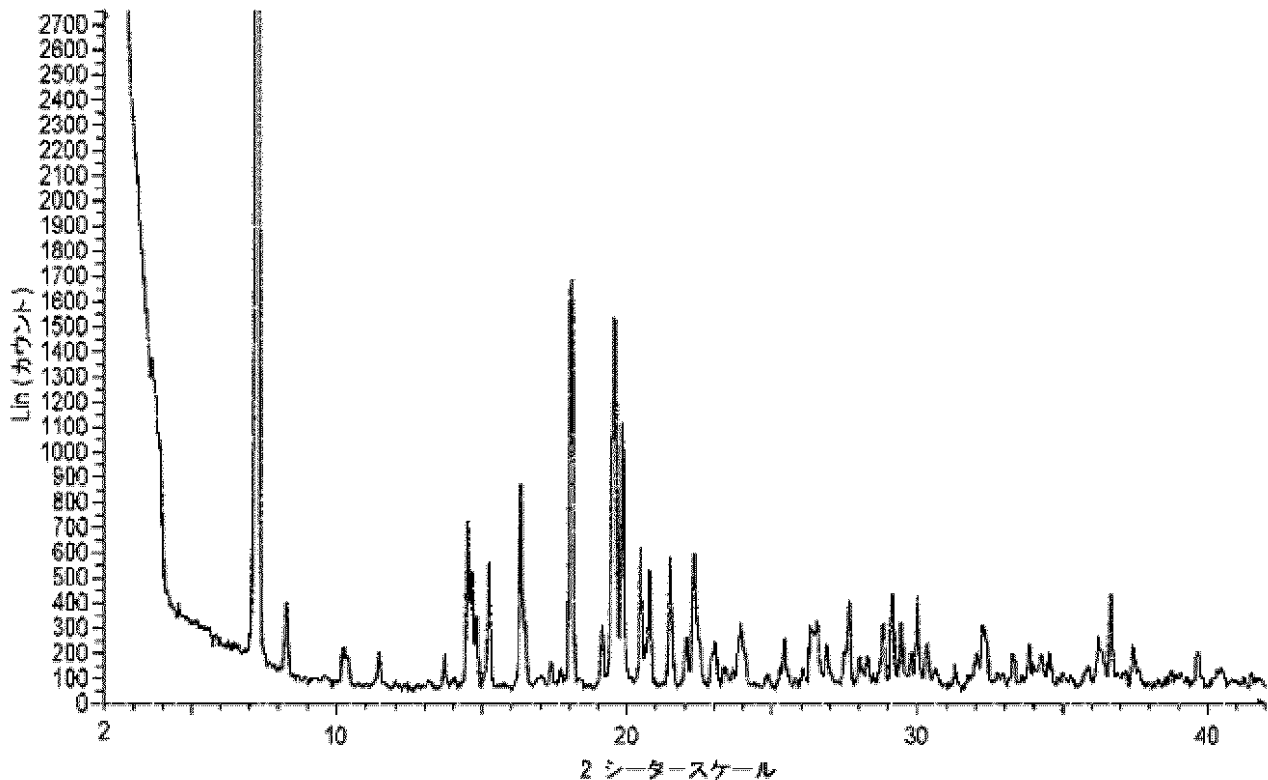


FIG. 3



【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° 2θ 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 17】

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 16 に記載の方法。