

【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 23 年 11 月 4 日 (2011.11.4)

【公表番号】特表 2010-540440 (P2010-540440A)

【公表日】平成 22 年 12 月 24 日 (2010.12.24)

【年通号数】公開・登録公報 2010-051

【出願番号】特願 2010-525845 (P2010-525845)

【国際特許分類】

C 07 D 473/18 (2006.01)

A 61 K 31/522 (2006.01)

A 61 P 31/12 (2006.01)

A 61 P 31/22 (2006.01)

A 61 P 31/18 (2006.01)

【F I】

C 07 D 473/18 C S P

A 61 K 31/522

A 61 P 31/12

A 61 P 31/22

A 61 P 31/18

【手続補正書】

【提出日】平成 23 年 9 月 12 日 (2011.9.12)

【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】

結晶性バロマシクロビル又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 2】

粉末 X 線回折図において、 $22.9^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $18.6^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $19.5^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $24.3^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $20.8^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $21.8^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $27.0^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $14.7^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $15.5^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $25.5^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、及び $29.9^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ に特徴的な吸収ピークを有する、請求項 1 に記載の結晶性バロマシクロビル。

【請求項 3】

結晶性バロマシクロビル又はその薬学的に許容される塩、及び薬学的に許容される賦形剤又は希釈剤を含む医薬組成物。

【請求項 4】

前記結晶性バロマシクロビルが、粉末 X 線回折図において $22.9^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $18.6^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $19.5^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $24.3^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $20.8^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $21.8^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $27.0^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $14.7^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $15.5^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、 $25.5^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ 、及び $29.9^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ に特徴的な吸収ピークを有する、請求項 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

純度が 90% 以上である、請求項 1 又は 2 に記載の結晶性バロマシクロビル。

【請求項 6】

純度が 95% 以上である、請求項 1 又は 2 に記載の結晶性バロマシクロビル。

【請求項 7】

純度が 99 % 以上である、請求項 1 又は 2 に記載の結晶性バロマシクロビル。

【請求項 8】

結晶性バロマシクロビルを調製するプロセスであって、
バロマシクロビルを、適当な内部温度に加熱することにより低級アルカノール溶媒又は低級アルカノールの混合溶媒に溶解する工程、
バロマシクロビルの大部分が結晶化されるよう、溶液を攪拌しながら冷却する工程、及び

結晶性バロマシクロビルを回収する工程を含む、プロセス。

【請求項 9】

前記低級アルカノール溶媒がエタノールである、請求項 8 に記載のプロセス。

【請求項 10】

前記低級アルカノールの混合溶媒が、95 : 5 (v / v) のエタノール / 2 - プロパノールの混合物である、請求項 8 に記載のプロセス。

【請求項 11】

前記内部温度が約 65 ~ 約 74 である、請求項 8 に記載のプロセス。

【請求項 12】

前記内部温度が約 68 ~ 約 72 である、請求項 11 に記載のプロセス。

【請求項 13】

前記冷却する工程を約 5 / 時間 ~ 約 15 / 時間の速度で行なう、請求項 8 に記載のプロセス。

【請求項 14】

前記冷却する工程を約 8 / 時間 ~ 約 12 / 時間の速度で行う、請求項 13 に記載のプロセス。