

【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22年4月2日(2010.4.2)

【公表番号】特表2009-534373(P2009-534373A)

【公表日】平成21年9月24日(2009.9.24)

【年通号数】公開・登録公報2009-038

【出願番号】特願2009-506041(P2009-506041)

【国際特許分類】

C 0 7 D 411/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/513 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/7072 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 411/04 C S P

A 6 1 K 31/513

A 6 1 P 31/18

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 31/7072

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成22年2月9日(2010.2.9)

【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】

5 . 5 0、7 . 6 0、9 . 0 0、9 . 6 2、1 0 . 9 8、1 1 . 9 7、1 2 . 5 2、1 2 . 8 1、1 3 . 5 2、1 5 . 1 9、1 5 . 7 1、1 5 . 9 4、1 6 . 5 7、1 6 . 7 2、1 7 . 1 1、1 7 . 5 7、1 7 . 9 8、1 8 . 3 0、1 9 . 2 6、1 9 . 6 8、2 0 . 3 7、2 1 . 0 4、2 2 . 0 0、2 2 . 8 6、2 3 . 4 0、2 3 . 7 0、2 4 . 0 4、2 4 . 6 8、2 5 . 1 5、2 6 . 9 7、2 7 . 7 0、2 8 . 7 4、3 0 . 3 5、3 0 . 6 0、3 1 . 9 4、3 3 . 2 5 ± 0 . 2 の 2 θ 値で粉末 X 線回折のピークを有し、2 / 分の加熱速度での示差走査熱量測定プロフィールにおいて、1 0 0 および 1 7 9 . 6 に吸熱ピークを有する、単斜晶系結晶の形態の (-) - シス - 4 - アミノ - 1 - (2 - ヒドロキシメチル - 1 , 3 - オキサチオラン - 5 - イル) - (1 H) - ピリミジン - 2 - オンの新規な結晶。

【請求項 2】

1 0 0 / 分の加熱速度での示差走査熱量測定プロフィールにおいて、1 1 5 から 1 3 0 の間に吸熱ピークを有する、請求項 1 記載の結晶。

【請求項 3】

熱重量分析において、温度 8 0 から 1 4 0 の間で 4 % ~ 4 . 5 % の重量減少を示す、請求項 1 記載の結晶。

【請求項 4】

請求項 1 に記載の (-) - シス - 4 - アミノ - 1 - (2 - ヒドロキシメチル - 1 , 3 - オキサチオラン - 5 - イル) - (1 H) - ピリミジン - 2 - オンの単斜晶系結晶の調製方

法であって、ラミブジンを45 の水に溶解し、次いで、その溶液を攪拌しながらゆっくり冷却し、その形態 I I I の純粋な結晶を30 で播種してもよく、母液からその結晶を分離し、該生成物を有機溶剤を用いて洗浄してもよく、そして乾燥させることを含む、方法。

【請求項5】

冷却速度が、0.5 /分～3.5 /分の範囲にあるところの、請求項4記載の方法。

【請求項6】

請求項1に記載の(-) - シス - 4 - アミノ - 1 - (2 - ヒドロキシメチル - 1 , 3 - オキサチオラン - 5 - イル) - (1 H) - ピリミジン - 2 - オンの単斜晶系結晶の調製方法であって、20 ～45 の間の温度の水中でラミブジンの結晶形態 I または結晶形態 I I を攪拌し、次いで、攪拌しながらその混合物をゆっくり冷却し、母液からその結晶形態を分離し、該生成物を有機溶媒を用いて洗浄してもよく、そして乾燥させることを含む、方法。

【請求項7】

結晶を洗浄するために用いられる有機溶媒が、C₁～C₄の脂肪族アルコールから選択されるところの、請求項6記載の方法。

【請求項8】

脂肪族アルコールがエタノールであるところの、請求項7記載の方法。

【請求項9】

請求項1に記載の単斜晶系結晶の形態の(-) - シス - 4 - アミノ - 1 - (2 - ヒドロキシメチル - 1 , 3 - オキサチオラン - 5 - イル) - (1 H) - ピリミジン - 2 - オンの治療上の有効量を、医薬上許容される担体と組み合わせて含む、固体投与単位形態の医薬組成物。

【請求項10】

ヒトにおけるHIV感染症を処置するのに有用な医薬組成物であって、治療上有効量の、3' - アジド - 3' - デオキシチミジン (AZT) および請求項1に記載の単斜晶系結晶の形態の(-) - シス - 4 - アミノ - 1 - (2 - ヒドロキシメチル - 1 , 3 - オキサチオラン - 5 - イル) - I H - ピリミジン - 2 - オンの組み合わせを、医薬上許容される担体と組み合わせて含む、医薬組成物。

【請求項11】

経口投与形態であるところの、請求項10記載の医薬組成物。

【請求項12】

錠剤形であるところの、請求項11記載の医薬組成物。

【請求項13】

カプセル剤形であるところの、請求項11記載の医薬組成物。

【請求項14】

ヒトにおけるHIV感染症の治療用医薬の製造における3' - アジド - 3' - デオキシチミジン (AZT) および請求項1に記載の単斜晶系結晶の形態の(-) - シス - 4 - アミノ - 1 - (2 - ヒドロキシメチル - 1 , 3 - オキサチオラン - 5 - イル) - I H - ピリミジン - 2 - オンの使用。

【請求項15】

治療用医薬が連続して、または同時に投与される、請求項14記載の使用。

【請求項16】

治療用医薬が経口用であるところの、請求項14記載の使用。

【請求項17】

治療用医薬が錠剤であるところの、請求項16記載の使用。

【請求項18】

治療用医薬がカプセル剤であるところの、請求項16記載の使用。