

【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 3 月 26 日 (2020.3.26)

【公表番号】特表 2018-537469 (P2018-537469A)

【公表日】平成 30 年 12 月 20 日 (2018.12.20)

【年通号数】公開・登録公報 2018-049

【出願番号】特願 2018-528313 (P2018-528313)

【国際特許分類】

C 0 7 H 19/056 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/7056 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 H 19/056 C S P

A 6 1 P 11/00

A 6 1 K 31/7056

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 1 月 24 日 (2020.1.24)

【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

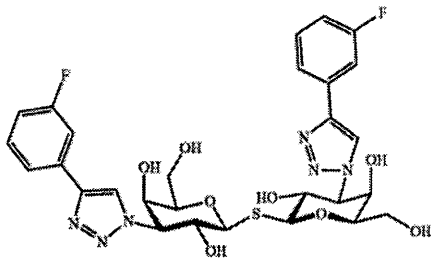
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の化合物

【化 1】



の多形であって、前記多形が 3, 3'-デオキシ-3, 3'-ビス-[4-(3-フルオロフェニル)-1H-1, 2, 3-トリアゾール-1-イル]-1, 1'-スルファンジイル-β-D-ガラクトピラノシドであり、かつ
前記多形が、XRPDディフラクトグラムピークリスト

【表 1】

No.	位置 [(回折角) 2θ]	相対強度 [%]
1	7. 1269	77. 72
2	7. 5067	56
3	10. 125	36. 86
4	14. 3791	32. 28
5	15. 0846	18. 59
6	15. 8201	35. 78
7	16. 7088	78. 1
8	18. 6001	21. 29
9	19. 7777	100
10	20. 3353	57. 04
11	21. 7744	79. 92
12	22. 6053	35. 8
13	23. 4305	45. 78
14	24. 3658	51. 03
15	25. 8091	54. 36
16	26. 7046	25. 38
17	29. 028	16. 19
18	30. 2989	28. 02
19	32. 2693	14. 86
20	33. 5132	11. 55
21	34. 6078	11. 54
22	35. 8435	9. 6
23	44. 6257	22. 73

で確認される多形形態 1 を有する、

または

前記多形が、図 1 の XRPD ディフракogram で確認される多形形態 1 を有する多形。

【請求項 2】

前記多形は水和物である、請求項 1 に記載の多形。

【請求項 3】

前記水和物は含水率 3 ～ 5 重量%である、請求項 2 に記載の多形。

【請求項 4】

前記多形は微粉化されている、請求項 1 に記載の多形。

【請求項 5】

前記多形は、ヒトの細気管支および／または肺胞に到達可能な大きさに微粉化されている、請求項 4 に記載の多形。

【請求項 6】

請求項 1 に記載の多形と、任意選択で薬学的に許容可能な添加剤とを含む医薬組成物。

【請求項 7】

3, 3'-デオキシ-3, 3'-ビス-[4-(3-フルオロフェニル)-1H-1,

2, 3-トリアゾール-1-イル]-1, 1'-スルファンジイル-β-D-ガラクトピラノシドを有機溶媒に懸濁または溶解させるステップと、次いで温度サイクル、急速冷却、蒸発、またはその組み合わせによって多形態1を作製するステップとを含む、請求項1に記載の多形を作製するプロセス。

【請求項8】

ヒトの肺線維症の治療に有効な、請求項1に記載の多形の一定量をヒトの肺組織に投与するステップを含む、前記肺線維症の治療方法。

【請求項9】

前記投与は乾燥粉末吸入器によって行われる、請求項8に記載の方法。

【請求項10】

前記投与は、単回投与乾燥粉末吸入器によって行われる、請求項9に記載の方法。

【請求項11】

前記多形は、ヒトの細気管支および／または肺胞に投与される、請求項8に記載の方法。

【請求項12】

前記一定量は0.15～50mgの1日1回用量である、請求項8に記載の方法。

【請求項13】

前記一定量は、0.15～0.50mg、0.50～0.75mg、0.75～1.25mg、1.25～1.5mg、1.5～1.75mg、1.75～2mg、2～2.25mg、2.25～2.5mg、2.5～2.75mg、2.75～3mg、3～5mg、5～7mg、7～8mg、8～10mg、10～20mg、および20～50mgの群から選択される1日1回用量である、請求項12に記載の方法。

【請求項14】

ヒトの肺線維症の治療に有効な、請求項2に記載の多形の一定量をヒトの肺組織に投与するステップを含む、前記肺線維症の治療方法。

【請求項15】

ヒトの肺線維症の治療に有効な、請求項3に記載の多形の一定量をヒトの肺組織に投与するステップを含む、前記肺線維症の治療方法。

【請求項16】

ヒトの肺線維症の治療に有効な、請求項4に記載の多形の一定量をヒトの肺組織に投与するステップを含む、前記肺線維症の治療方法。

【請求項17】

ヒトの肺線維症の治療に有効な、請求項5に記載の多形の一定量をヒトの肺組織に投与するステップを含む、前記肺線維症の治療方法。