

【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 21 年 6 月 25 日 (2009.6.25)

【公表番号】特表 2008-540538 (P2008-540538A)

【公表日】平成 20 年 11 月 20 日 (2008.11.20)

【年通号数】公開・登録公報 2008-046

【出願番号】特願 2008-511227 (P2008-511227)

【国際特許分類】

C 07 D 413/12 (2006.01)

A 61 K 31/422 (2006.01)

A 61 P 31/12 (2006.01)

A 61 P 31/14 (2006.01)

A 61 P 31/20 (2006.01)

A 61 P 31/22 (2006.01)

A 61 K 45/00 (2006.01)

A 61 K 38/21 (2006.01)

【F I】

C 07 D 413/12 C S P

A 61 K 31/422

A 61 P 31/12

A 61 P 31/14

A 61 P 31/20

A 61 P 31/22

A 61 K 45/00

A 61 K 37/66 G

【手続補正書】

【提出日】平成 21 年 4 月 28 日 (2009.4.28)

【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】

約 5 重量 % 未満の非晶質形態を含む (S) - 3 - (3 - (3 - メトキシ - 4 - (オキサゾール - 5 - イル) フェニル) ウレイド) ベンジルカルバミン酸テトラヒドロフラン - 3 - イルの実質的に純粋な多形形態 A 1。

【請求項 2】

前記多形が、Cu K 線を用いて得られる粉末 X 線回折パターンにおいて、約 21.8 度の 2θ でピーク位置を有する、請求項 1 に記載の多形形態 A 1。

【請求項 3】

前記多形が、Cu K 線を用いて得られる粉末 X 線回折パターンにおいて、約 11.8 度、16.0 度、18.5 度、20.1 度または 23.6 度の 2θ で少なくとも 1 つの追加のピーク位置を有する、請求項 2 に記載の多形形態 A 1。

【請求項 4】

前記多形が、示差走査熱量計で測定して約 215℃ で溶融 / 分解吸熱的事象を示す、請求項 1 に記載の多形形態 A 1。

【請求項 5】

(S) - 3 - (3 - (3 - メトキシ - 4 - (オキサゾール - 5 - イル) フェニル) ウレイド) ベンジルカルバミン酸テトラヒドロフラン - 3 - イルの多形形態 B 2。

【請求項 6】

前記多形が、CuK 線を用いて得られる粉末 X 線回折パターンにおいて、約 20.9 度の 2θ でピーク位置を有する、請求項 5 に記載の多形形態 B 2。

【請求項 7】

前記多形が、CuK 線を用いて得られる粉末 X 線回折パターンにおいて、約 5.3 度、15.7 度、18.4 度または 20.0 度の 2θ で少なくとも 1 つの追加のピーク位置を有する、請求項 6 に記載の多形形態 B 2。

【請求項 8】

前記多形が、示差走査熱量計で測定して約 80 ~ 約 100 で幅広い吸熱的事象を示す、請求項 5 に記載の多形形態 B 2。

【請求項 9】

前記多形が、示差走査熱量計で測定して約 146 ~ 約 150 で溶融 / 再結晶化事象を示す、請求項 5 に記載の多形形態 B 2。

【請求項 10】

前記多形が、示差走査熱量計で測定して約 215 で溶融 / 分解吸熱的事象を示す、請求項 5 に記載の多形形態 B 2。

【請求項 11】

(S) - 3 - (3 - (3 - メトキシ - 4 - (オキサゾール - 5 - イル) フェニル) ウレイド) ベンジルカルバミン酸テトラヒドロフラン - 3 - イルの多形形態 C 3。

【請求項 12】

前記多形が、CuK 線を用いて得られる粉末 X 線回折パターンにおいて、約 20.67 度の 2θ でピーク位置を有する、請求項 11 に記載の多形形態 C 3。

【請求項 13】

前記多形が、CuK 線を用いて得られる粉末 X 線回折パターンにおいて、約 5.2 度、15.5 度、17.5 度または 22.5 度の 2θ で少なくとも 1 つの追加のピーク位置を有する、請求項 12 に記載の多形形態 C 3。

【請求項 14】

前記多形が、示差走査熱量計で測定して約 145 ~ 約 160 で溶融 / 再結晶化事象を示す、請求項 11 に記載の多形形態 C 3。

【請求項 15】

(S) - 3 - (3 - (3 - メトキシ - 4 - (オキサゾール - 5 - イル) フェニル) ウレイド) ベンジルカルバミン酸テトラヒドロフラン - 3 - イル・HCl 塩の多形形態 D 4。

【請求項 16】

前記多形が、CuK 線を用いて得られる粉末 X 線回折パターンにおいて、約 25.0 度の 2θ でピーク位置を有する、請求項 15 に記載の多形形態 D 4・HCl 塩。

【請求項 17】

前記多形が、CuK 線を用いて得られる粉末 X 線回折パターンにおいて、約 11.1 度、15.7 度、16.9 度、18.8 度または 27.4 度の 2θ で少なくとも 1 つの追加のピーク位置を有する、請求項 15 に記載の多形形態 D 4・HCl 塩。

【請求項 18】

前記多形が、示差走査熱量計で測定して約 100 ~ 約 170 で幅広い吸熱的事象を示す、請求項 15 に記載の多形形態 D 4・HCl 塩。

【請求項 19】

(S) - 3 - (3 - (3 - メトキシ - 4 - (オキサゾール - 5 - イル) フェニル) ウレイド) ベンジルカルバミン酸テトラヒドロフラン - 3 - イル・HCl 塩の多形形態 E 5。

【請求項 20】

前記多形が、CuK 線を用いて得られる粉末 X 線回折パターンにおいて、約 14.79 度の 2θ で少なくとも 1 つのピーク位置を有する、請求項 19 に記載の多形形態 E 5。

H C l 塩。

【請求項 2 1】

前記多形が、C u K 線を用いて得られる粉末 X 線回折パターンにおいて、約 1 9 . 4 度、2 1 . 4 度、2 2 . 5 度または 2 5 . 4 度の 2 θ で少なくとも 1 つの追加のピーク位置を有する、請求項 2 0 に記載の多形形態 E 5 ・ H C l 塩。

【請求項 2 2】

(a) 請求項 1 から 2 1 のいずれか一項に記載の多形形態と、

(b) 薬学的に受容可能なキャリアまたはアジュバントを含む薬学的組成物。

【請求項 2 3】

5 重量 % 未満の形態 A 1 を含む (S) - 3 - (3 - (3 - メトキシ - 4 - (オキサゾール - 5 - イル) フェニル) ウレイド) ベンジルカルバミン酸テトラヒドロフラン - 3 - イルの実質的に純粋な非晶質形態。

【請求項 2 4】

2 , 2 , 2 - トリフルオロエタノールもしくはヘキサフルオロイソプロパノールまたはその混合物中の多形形態 A 1 の溶液を蒸発させることによって得られる (S) - 3 - (3 - (3 - メトキシ - 4 - (オキサゾール - 5 - イル) フェニル) ウレイド) ベンジルカルバミン酸テトラヒドロフラン - 3 - イルの非晶質形態。

【請求項 2 5】

(S) - 3 - (3 - (3 - メトキシ - 4 - (オキサゾール - 5 - イル) フェニル) ウレイド) ベンジルカルバミン酸テトラヒドロフラン - 3 - イルの結晶形態の溶融サンプルを冷却することによって得られる (S) - 3 - (3 - (3 - メトキシ - 4 - (オキサゾール - 5 - イル) フェニル) ウレイド) ベンジルカルバミン酸テトラヒドロフラン - 3 - イルの非晶質形態。

【請求項 2 6】

請求項 2 3 から 2 5 のいずれか一項に記載の非晶質形態を含む薬学的組成物であって、前記非晶質形態を 1 種または複数の適切な薬学的キャリアまたはアジュバントと合わせることによって得られる薬学的組成物。

【請求項 2 7】

哺乳動物の I M P D H 媒介による疾患または病態を処置するための、請求項 2 2 または請求項 2 6 に記載の薬学的組成物。

【請求項 2 8】

哺乳動物におけるウイルス複製を阻害するための、請求項 2 2 または請求項 2 6 に記載の薬学的組成物。

【請求項 2 9】

前記哺乳動物が、B 型肝炎ウイルス、C 型肝炎ウイルス、オルトミクソウイルス、パラミクソウイルス、ヘルペスウイルス、レトロウイルス、フラビウイルス、ペスチウイルス、肝親和性ウイルス、ブニヤウイルス、ハンタウイルス、カラバルウイルス、ヒト乳頭腫ウイルス、脳炎ウイルス、アレナウイルス、レオウイルス、水疱性口内炎ウイルス、ライノウイルス、エンテロウイルス、ラッサ熱ウイルス、トガウイルス、ボックスウイルス、アデノウイルス、ルベオーラまたは風疹から選択されるウイルスによって引き起こされるウイルス感染症に罹患していることを特徴とする、請求項 2 8 に記載の薬学的組成物。

【請求項 3 0】

前記哺乳動物に、別個の投薬形態で、または前記組成物の一部として、追加の抗ウイルス剤が投与されることを特徴とする、請求項 2 9 に記載の薬学的組成物。

【請求項 3 1】

前記追加の抗ウイルス剤が - インターフェロン、ペグ化された - インターフェロンまたはリバビリンから選択される、請求項 3 0 に記載の薬学的組成物。