

【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A1。

【請求項2】

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21.8度の2でピーク位置を有する、請求項1に記載の多形形態A1。

【請求項3】

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11.8度、16.0度、18.5度、20.1度または23.6度の2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A1。

【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A1。

【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B2。

【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2でピーク位置を有する、請求項5に記載の多形形態B2。

【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2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B2。

【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B2。

【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B2。

【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B2。

【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C3。

【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2でピーク位置を有する、請求項11に記載の多形形態C3。

【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2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C3。

【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C3。

【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・HC1塩の多形形態D4。

【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2でピーク位置を有する、請求項15に記載の多形形態D4・HC1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2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D4・HC1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D4・HC1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・HC1塩の多形形態E5。

【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2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E5・

H C 1 塩。

【請求項 2 1】

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19.4度、21.4度、22.5度または25.4度の2で少なくとも1つの追加のピーク位置を有する、請求項20に記載の多形形態E5・H C 1 塩。

【請求項 2 2】

(a) 請求項1から21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A1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A1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23から25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IMPDH媒介による疾患または病態を処置するための、請求項22または請求項26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22または請求項26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、ラビウイルス、ペストウイルス、肝親和性ウイルス、ブンヤウイルス、ハントーンウイルス、カラバウイルス、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、ポックスウイルス、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28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29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、ペゲ化された-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30に記載の薬学的組成物。