

【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4日(2009.6.4)

【公表番号】特表2008-539258(P2008-539258A)

【公表日】平成20年11月13日(2008.11.13)

【年通号数】公開・登録公報2008-045

【出願番号】特願2008-509091(P2008-509091)

【国際特許分類】

C 0 7 D 413/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/536 (2006.01)

A 6 1 P 1/14 (2006.01)

A 6 1 P 5/24 (2006.01)

A 6 1 P 15/18 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 15/02 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 413/04 C S P

A 6 1 K 31/536

A 6 1 P 1/14

A 6 1 P 5/24

A 6 1 P 15/18

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 13/08

A 6 1 P 15/02

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成21年4月15日(2009.4.15)

【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】

以下：

(a) 約230 における吸熱温度ピークを欠く示差走査熱量測定サーモグラム；および

(b) 6.6°、10.3°、14.4°、19.8°、23.8°、26.3°、および

29.1°の2 におけるピークを欠くX線回折ピークパターン

を有する、タナプロゲットの多形形態II。

【請求項2】

以下：

(a) 約6.0°、8.3°、12.0°、21.4°および23.4°の2 における

ピークを含むX線回折ピークパターン；および

(b) 約219 のT開始を有する示差走査熱量測定サーモグラム

を有する、タナプロゲットの多形形態II。

【請求項3】

前記サーモグラムが約 230 の吸熱温度ピークを欠く、請求項 2 に記載の多形形態 I I 。

【請求項 4】

以下：

- (i) 塩化メチレンおよびペンタン；
- (i i) アセトニトリルおよび水；または
- (i i i) メタノールおよび水

からタナプロゲット形態 I を再結晶させることによって得られる、タナプロゲットの多形形態 I I 。

【請求項 5】

(i) により調製され、かつタナプロゲットが熱塩化メチレンに溶解されて溶液を形成し、該塩化メチレン溶液が濃縮され、該濃縮された塩化メチレン溶液とペンタンが混合され、そして該濃縮された塩化メチレン/ペンタン溶液が冷却される、請求項 4 に記載の多形形態 I I 。

【請求項 6】

(i i) により調製され、かつタナプロゲットがアセトニトリルに溶解されて溶液を形成し、該アセトニトリル溶液が濃縮され、該濃縮されたアセトニトリル溶液と水が混合され、そして該濃縮されたアセトニトリル/水の溶液が冷却される、請求項 4 に記載の多形形態 I I 。

【請求項 7】

(i i i) により調製され、かつタナプロゲットがメタノールに溶解されて溶液を形成し、該メタノール溶液が濃縮され、該濃縮されたメタノール溶液と水が混合され、そして該濃縮されたメタノール/水の溶液が冷却される、請求項 4 に記載の多形形態 I I 。

【請求項 8】

前記タナプロゲット形態 I がマイクロ化される、請求項 4 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の多形形態 I I 。

【請求項 9】

以下：

- (i) 塩化メチレンおよびペンタン；
- (i i) アセトニトリルおよび水；または
- (i i i) メタノールおよび水

からタナプロゲット形態 I を再結晶させる工程を含む、多形タナプロゲット形態 I I を調製するためのプロセス。

【請求項 10】

請求項 9 に記載のプロセスであって、前記形態 I が (i) から再結晶され、そして該プロセスが、以下の工程：

- (a) 塩化メチレン中にタナプロゲット形態 I を溶解する工程；
- (b) 工程 (a) の塩化メチレン溶液を加熱する工程；
- (c) 工程 (b) の生成物とペンタンを合わせる工程；
- (d) 工程 (c) の生成物を 20 に冷却する工程；および
- (e) 多形タナプロゲット形態 I I を収集する工程

を含む、プロセス。

【請求項 11】

請求項 9 に記載のプロセスであって、前記形態 I が (i i) から再結晶され、そして該プロセスが、以下の工程：

- (a) アセトニトリル中にタナプロゲット形態 I を溶解する工程；
- (b) 工程 (a) のアセトニトリル溶液を加熱する工程；
- (c) 工程 (b) の生成物と水を合わせる工程；
- (d) 工程 (c) の生成物を室温に冷却する工程；および
- (e) 多形タナプロゲット形態 I I を収集する工程

を含む、プロセス。

【請求項 1 2】

請求項 9 に記載のプロセスであって、前記形態 I が (i i i) から再結晶され、そして該プロセスが、以下の工程：

- (a) メタノール中にタナプロゲット形態 I を溶解する工程；
- (b) 工程 (a) のメタノール溶液を加熱する工程；
- (c) 工程 (b) の生成物と水を合わせる工程；および
- (d) 多形タナプロゲット形態 I I を収集する工程

を含む、プロセス。

【請求項 1 3】

多形タナプロゲット形態 I I を加熱する工程を含む、多形タナプロゲット形態 I を調製するためのプロセス。

【請求項 1 4】

前記多形タナプロゲット形態 I I が約 2 1 9 ~ 約 2 2 6 の温度に加熱される、請求項 1 3 に記載のプロセス。

【請求項 1 5】

前記多形タナプロゲット形態 I が溶解した形態 I I タナプロゲット多形から再結晶される、請求項 1 3 に記載のプロセス。

【請求項 1 6】

多形タナプロゲット形態 I I をアセトンおよび水と合わせる工程を含む、多形タナプロゲット形態 I を調製するためのプロセス。

【請求項 1 7】

アセトン 対 水の比が 1 : 1 である、請求項 1 6 に記載のプロセス。

【請求項 1 8】

図 1 の X 線回折パターンまたは図 2 の示差走査熱量測定サーモグラフを有する、タナプロゲットの多形形態 I I 。

【請求項 1 9】

化合物のミクロ化形態であって、該化合物が 5 - (4 , 4 - ジメチル - 2 - チオキソ - 1 , 4 - ジヒドロ - 2 H - 3 , 1 - ベンゾキサジン - 6 - イル) - 1 - メチル - 1 H - ピロール - 2 - カルボニトリル形態 I I であり、約 2 0 μ m 未満のメジアン粒子サイズを有する、ミクロ化形態。

【請求項 2 0】

多形タナプロゲット形態 I I および薬学的に受容可能なキャリアを含む、医薬組成物。

【請求項 2 1】

以下：

- (i) 多形タナプロゲット形態 I I ；および
- (i i) 哺乳動物被験体への投与に適したキャリアを備える、キット。

【請求項 2 2】

多形タナプロゲット形態 I I を含む医薬組成物を調製する方法であって、該方法が、多形タナプロゲット形態 I I 、ならびに以下：

- (i) 金属キレート剤；
- (i i) p H 調節剤；
- (i i i) 界面活性剤；
- (i v) 少なくとも 1 つの充填剤；
- (v) 結合剤；
- (v i) 崩壊剤；および
- (v i i) 滑沢剤

のうちの 1 つ以上を混合する工程を含む、方法。

【請求項 2 3】

請求項 1～8 および 18 のいずれか 1 項に記載の多形タナプロゲット形態 I I、または請求項 19 に記載のミクロ化形態を含む、避妊のための医薬組成物。

【請求項 24】

請求項 1～8 および 18 のいずれか 1 項に記載の多形タナプロゲット形態 I I、または請求項 19 に記載のミクロ化形態を含む、ホルモン補充療法のための医薬組成物。

【請求項 25】

請求項 1～8 および 18 のいずれか 1 項に記載の多形タナプロゲット形態 I I、または請求項 19 に記載のミクロ化形態を含む、食物摂取を刺激するための医薬組成物。

【請求項 26】

子宮筋層類線維腫、良性前立腺肥大、良性および悪性の新生物疾患、機能不全性出血、子宮平滑筋種、子宮内膜症、多嚢胞性卵巣症候群、または癌および腺癌を、処置または予防するための医薬組成物であって、請求項 1～8 および 18 のいずれか 1 項に記載の多形タナプロゲット形態 I I、または請求項 19 に記載のミクロ化形態を含む、医薬組成物。