

【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11月25日(2010.11.25)

【公表番号】特表2010-506932(P2010-506932A)  
 【公表日】平成22年3月4日(2010.3.4)  
 【年通号数】公開・登録公報2010-009  
 【出願番号】特願2009-533389(P2009-533389)  
 【国際特許分類】

C 0 7 D 305/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/337 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 305/14 C S P

A 6 1 K 31/337

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成22年10月7日(2010.10.7)

【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8.0、12.4および16.8±0.2度に2シートのピークを有する粉末X線回折パターンにより特徴付けられる、結晶性の無水N-デベンゾイル-N-tert-ブトキシカルボニル-10-デアセチル タキソール。

【請求項2】

約11.3、13.8、15.4、20.3および23.3±0.2度に2シートのピークを有する粉末X線回折パターンによってさらに特徴付けられる、請求項1に記載の結晶性の無水N-デベンゾイル-N-tert-ブトキシカルボニル-10-デアセチル タキソール。

【請求項3】

約4.6、9.2、18.1、18.4、19.5、20.8、22.5、23.7、24.1、28.3および30.6±0.2度に2シートのピークを有する粉末X線回折パターンによってさらに特徴付けられる、請求項1に記載の結晶性の無水N-デベンゾイル-N-tert-ブトキシカルボニル-10-デアセチル タキソール。

【請求項4】

図3に実質的に示される粉末X線回折パターンにより特徴付けられる、請求項1に記載の結晶性の無水N-デベンゾイル-N-tert-ブトキシカルボニル-10-デアセチル タキソール。

【請求項5】

図4に実質的に示される粉末X線回折パターンにより特徴付けられる、請求項1に記載の結晶性の無水N-デベンゾイル-N-tert-ブトキシカルボニル-10-デアセチル タキソール。

【請求項6】

約710、1248、1723、2978および3430( $\text{cm}^{-1}$ )にバンドを有する赤外スペクトルによってさらに特徴付けられる、請求項1に記載の結晶性の無水N-デベン

ゾイル - N - t e r t - ブトキシカルボニル - 1 0 - デアセチル タキソール。

【請求項 7】

図 1 0 に実質的に示される赤外スペクトルによってさらに特徴付けられる、請求項 1 に記載の結晶性の無水 N - デベンゾイル - N - t e r t - ブトキシカルボニル - 1 0 - デアセチル タキソール。

【請求項 8】

約 8 . 8、1 3 . 9 および 1 7 . 7 ± 0 . 2 度に 2 シータのピークを有する粉末 X 線回折パターンにより特徴付けられる、結晶性の N - デベンゾイル - N - t e r t - ブトキシカルボニル - 1 0 - デアセチル タキソール 3 水和物。

【請求項 9】

約 4 . 4、1 1 . 0 および 2 2 . 2 ± 0 . 2 度に 2 シータのピークを有する粉末 X 線回折パターンによってさらに特徴付けられる、請求項 8 に記載の結晶性の N - デベンゾイル - N - t e r t - ブトキシカルボニル - 1 0 - デアセチル タキソール 3 水和物。

【請求項 1 0】

図 1 4 に実質的に示される粉末 X 線回折パターンによってさらに特徴付けられる、請求項 8 に記載の結晶性の N - デベンゾイル - N - t e r t - ブトキシカルボニル - 1 0 - デアセチル タキソール 3 水和物。

【請求項 1 1】

約 7 1 0、1 2 6 8、1 7 3 7、2 9 8 1 および 3 3 7 4 ( c m <sup>-1</sup> ) にバンドを有する赤外スペクトルによってさらに特徴付けられる、請求項 8 に記載の結晶性の N - デベンゾイル - N - t e r t - ブトキシカルボニル - 1 0 - デアセチル タキソール 3 水和物。

【請求項 1 2】

図 1 9 に実質的に示される赤外スペクトルのパターンによってさらに特徴付けられる、請求項 8 に記載の結晶性の N - デベンゾイル - N - t e r t - ブトキシカルボニル - 1 0 - デアセチル タキソール 3 水和物。

【請求項 1 3】

( a ) ドセタキセルおよび八口炭化水素を混合して溶液を形成し、そして

( b ) この溶液に逆溶媒を加えて結晶を沈殿させる

工程を含む、無水ドセタキセルの製造方法。

【請求項 1 4】

前記の八口炭化水素がクロロ炭化水素である、請求項 1 3 に記載の製造方法。

【請求項 1 5】

前記のクロロ炭化水素がジクロロメタンである、請求項 1 4 に記載の製造方法。

【請求項 1 6】

前記の逆溶媒が C<sub>3</sub> ~ C<sub>8</sub> の直鎖状および分枝鎖状のアルカン類からなる群から選択される、請求項 1 3 に記載の製造方法。

【請求項 1 7】

前記の逆溶媒が n - ヘプタンである、請求項 1 3 に記載の製造方法。

【請求項 1 8】

ドセタキセル、八口炭化水素および逆溶媒の溶液の温度を約 2 5 ~ 4 0 に維持する工程を含む、請求項 1 3 に記載の製造方法。

【請求項 1 9】

前記の溶液を約 0 ~ 3 0 に冷却して結晶を沈殿させる工程をさらに含む、請求項 1 3 に記載の製造方法。

【請求項 2 0】

( a ) ドセタキセルおよびアセトニトリルを混合し、

( b ) 工程 ( a ) の混合物を約 3 0 ~ 4 5 に加熱し、

( c ) 工程 ( b ) の加熱混合物に水を加え、

( d ) 工程 ( c ) の混合物を約 1 0 ~ 3 0 に冷却してスラリーを得、

( e ) 工程 ( d ) のスラリーを濾過し、洗浄し、乾燥してドセタキセル 3 水和物を得るこ

とを含む、ドセタキセル 3 水和物の製造方法。

【請求項 2 1】

請求項 1 に記載の結晶性の無水ドセタキセルの治療有効量、および少なくとも 1 つの医薬的に許容される賦形剤を含む組成物。

【請求項 2 2】

請求項 2 1 に記載の組成物を、増殖性疾患を患っている哺乳動物に投与することを含む、前記哺乳動物の治療方法。