

【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5年2月24日(2023.2.24)

【国際公開番号】WO2022/009863

【出願番号】特願2022-535331(P2022-535331)

【国際特許分類】

C 0 7 D 2 6 1 / 2 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 2 3 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 1 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 2 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

10

【 F I 】

C 0 7 D 2 6 1 / 2 0 C S P

A 6 1 K 3 1 / 4 2 3

A 6 1 P 2 5 / 1 4

A 6 1 P 2 5 / 1 6

A 6 1 P 2 5 / 2 2

A 6 1 P 2 5 / 0 2 1 0 1

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1

20

【手続補正書】

【提出日】令和5年2月8日(2023.2.8)

【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】

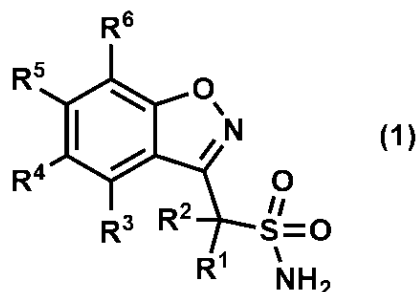
30

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(1)で表される化合物、又はその製薬学的に許容される塩。

【化1】



40

[式中、

R¹は、水素、ハロゲン、C₁-6アルキル(該アルキルはハロゲン、水酸基、C₃-6シクロアルキル及びC₁-3アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてよい)、又はC₃-6シクロアルキル(該シクロアルキルはハロゲン、水酸基、C₁-3アルキル及びC₁-3アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてよい)を表し、

R²は、ハロゲン、C₁-6アルキル(該アルキルはハロゲン、水酸基、C₃-6シク

50

ロアルキル及びC₁₋₃アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)、又はC₃₋₆シクロアルキル(該シクロアルキルはハロゲン、水酸基、C₁₋₃アルキル及びC₁₋₃アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)を表すか、あるいは

R¹及びR²はそれらが結合する炭素原子と一緒にあってC₃₋₆シクロアルキル(該シクロアルキルはハロゲン、水酸基、C₁₋₃アルキル及びC₁₋₃アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)を構成した基を表し、

R³、R⁴、R⁵及びR⁶は、同一又は異なって、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁₋₆アルキル(該アルキルはハロゲン、水酸基、C₃₋₆シクロアルキル及びC₁₋₃アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)、C₃₋₆シクロアルキル(該シクロアルキルはハロゲン、水酸基、C₁₋₃アルキル及びC₁₋₃アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)、又はC₁₋₆アルコキシ(該アルコキシはハロゲン、水酸基、C₃₋₆シクロアルキル及びC₁₋₃アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)を表す。]

10

【請求項2】

R¹が、水素、フッ素、C₁₋₆アルキル(該アルキルはフッ素、水酸基、C₃₋₆シクロアルキル及びC₁₋₃アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)、又はC₃₋₆シクロアルキル(該シクロアルキルはフッ素、水酸基、C₁₋₃アルキル及びC₁₋₃アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)であり、

20

R²が、フッ素、C₁₋₆アルキル(該アルキルはフッ素、水酸基、C₃₋₆シクロアルキル及びC₁₋₃アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)、又はC₃₋₆シクロアルキル(該シクロアルキルはフッ素、水酸基、C₁₋₃アルキル及びC₁₋₃アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)であるか、あるいは

R¹及びR²がそれらが結合する炭素原子と一緒にあってC₃₋₆シクロアルキル(該シクロアルキルはフッ素、水酸基、C₁₋₃アルキル及びC₁₋₃アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)を構成した基である

30

、請求項1に記載の化合物又はその製薬学的に許容される塩。

【請求項3】

R³、R⁴、R⁵及びR⁶が、同一又は異なって、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁₋₆アルキル(該アルキルはフッ素、水酸基、C₃₋₆シクロアルキル及びC₁₋₃アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)、C₃₋₆シクロアルキル(該シクロアルキルはフッ素、水酸基、C₁₋₃アルキル及びC₁₋₃アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)、又はC₁₋₆アルコキシ(該アルコキシはフッ素、水酸基、C₃₋₆シクロアルキル及びC₁₋₃アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)である、

40

請求項1または2に記載の化合物又はその製薬学的に許容される塩。

【請求項4】

R¹が、水素、フッ素、又はC₁₋₆アルキル(該アルキルはフッ素、水酸基、C₁₋₃アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)であり、

R²が、フッ素、又はC₁₋₆アルキル(該アルキルはフッ素、水酸基及びC₁₋₃アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)であるか、あるいは

R¹及びR²がそれらが結合する炭素原子と一緒にあってC₃₋₆シクロアルキル(該

50

シクロアルキルはフッ素、水酸基、 C_{1-3} アルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)を構成した基である、

請求項1~3のいずれかに記載の化合物又はその製薬学的に許容される塩。

【請求項5】

R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 が、同一又は異なって、水素、ハロゲン、又は C_{1-3} アルコキシ(該アルコキシは、1~3個のフッ素で置換されていてもよい)である、

請求項1~4のいずれかに記載の化合物又はその製薬学的に許容される塩。

【請求項6】

R^1 が、水素、フッ素、又は C_{1-6} アルキル(該アルキルはフッ素、水酸基、 C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)であり、

R^2 が、フッ素、又は C_{1-6} アルキル(該アルキルはフッ素、水酸基及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)であるか、あるいは

R^1 及び R^2 がそれらが結合する炭素原子と一緒になって C_{3-6} シクロアルキル(該シクロアルキルはフッ素、水酸基、 C_{1-3} アルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい)を構成した基であり、

R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 が、同一又は異なって、水素、ハロゲン、又は C_{1-3} アルコキシ(該アルコキシは、1~3個のフッ素で置換されていてもよい)である、請求項1に記載の化合物又はその製薬学的に許容される塩。

【請求項7】

以下の化合物から選択される、請求項1に記載の化合物又はその製薬学的に許容される塩：

- 1 - (1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル)エタン - 1 - スルホンアミド、
- 2 - (1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル)プロパン - 2 - スルホンアミド、
- 1 - (1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) - 1 - フルオロメタンスルホンアミド

1 - (1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) - 1, 1 - ジフルオロメタンスルホンアミド、

- 1 - (1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル)シクロプロパン - 1 - スルホンアミド

1 - (1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル)プロパン - 1 - スルホンアミド、

- 1 - (1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル)ブタン - 1 - スルホンアミド、

1 - (1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) - 1 - フルオロエタン - 1 - スルホンアミド、

1 - (1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) - 2 - メチルプロパン - 1 - スルホンアミド、

1 - (5 - メトキシ - 1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル)エタン - 1 - スルホンアミド、

1 - (5 - フルオロ - 1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル)エタン - 1 - スルホンアミド、

1 - (5 - クロロ - 1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル)エタン - 1 - スルホンアミド、

(1R) - 1 - (1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル)エタン - 1 - スルホンアミド、または

(1S) - 1 - (1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル)エタン - 1 - スルホンアミド。

【請求項8】

以下の化合物から選択される、請求項 1 に記載の化合物又はその製薬学的に許容される塩：

- 1 - (1 , 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) エタン - 1 - スルホンアミド、
 2 - (1 , 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) プロパン - 2 - スルホンアミド、
 1 - (1 , 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) - 1 - フルオロメタンスルホンアミド

、
 1 - (1 , 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) - 1 , 1 - ジフルオロメタンスルホンアミド、

- 1 - (1 , 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) シクロプロパン - 1 - スルホンアミド

、
 1 - (1 , 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) - 1 - フルオロエタン - 1 - スルホンアミド、

(1 R) - 1 - (1 , 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) エタン - 1 - スルホンアミド、または

(1 S) - 1 - (1 , 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) エタン - 1 - スルホンアミド。

【請求項 9】

以下の化合物から選択される、請求項 1 に記載の化合物又はその製薬学的に許容される塩：

- 1 - (1 , 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) エタン - 1 - スルホンアミド、
 2 - (1 , 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) プロパン - 2 - スルホンアミド、
 1 - (1 , 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) シクロプロパン - 1 - スルホンアミド

、
 (1 R) - 1 - (1 , 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) エタン - 1 - スルホンアミド、または

(1 S) - 1 - (1 , 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) エタン - 1 - スルホンアミド。

【請求項 10】

化合物が 1 - (1 , 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) エタン - 1 - スルホンアミドである、請求項 1 に記載の化合物又はその製薬学的に許容される塩。

【請求項 11】

化合物が (1 R) - 1 - (1 , 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) エタン - 1 - スルホンアミドである、請求項 1 に記載の化合物又はその製薬学的に許容される塩。

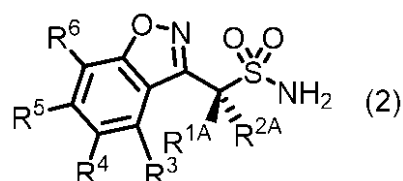
【請求項 12】

化合物が (1 S) - 1 - (1 , 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) エタン - 1 - スルホンアミドである、請求項 1 に記載の化合物又はその製薬学的に許容される塩。

【請求項 13】

式 (2) :

【化 2】



[式中、

R^{1A} は、水素、ハロゲン、C₁ - 6 アルキル (該アルキルはハロゲン、水酸基、C₃ - 6 シクロアルキル及び C₁ - 3 アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよい)、又は C₃ - 6 シクロアルキル (該シクロアルキルはハロゲン、水酸基、C₁ - 3 アルキル及び C₁ - 3 アルコキシからなる群から独立して選

10

20

30

40

50

択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよい) を表し、

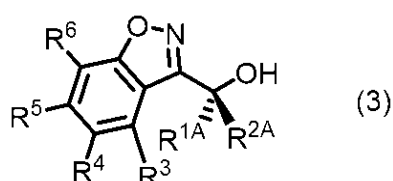
R^{2A} は、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル (該アルキルはハロゲン、水酸基、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよい)、又は C_{3-6} シクロアルキル (該シクロアルキルはハロゲン、水酸基、 C_{1-3} アルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよい) を表し、ここにおいて、 R^{1A} と R^{2A} は、異なる置換基であり、

R^3 、 R^4 、 R^5 及び R^6 は、同一又は異なって、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、 C_{1-6} アルキル (該アルキルはハロゲン、水酸基、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよい)、 C_{3-6} シクロアルキル (該シクロアルキルはハロゲン、水酸基、 C_{1-3} アルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよい)、又は C_{1-6} アルコキシ (該アルコキシはハロゲン、水酸基、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよい) を表す。]

で表される化合物またはその製薬学的に許容される塩の製造方法であって、下記の工程 1 ~ 3 を含む製造方法;

(工程 1) 式 (3) :

【化 3】



[式中、 R^{1A} 、 R^{2A} 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、および R^6 は、上記と同じ基を表す。]

で表される化合物またはその塩と式 (4a) または (4b) :

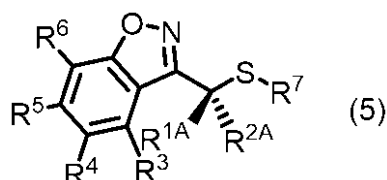
【化 4】



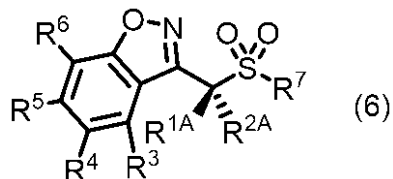
[式中、 R^7 は、2 - (メトキシカルボニル) エチル、メシチレンカルボニロキシメチル、2 - ベンゾチアゾイル (該基は、ベンゼン環上に、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル (該アルキルはハロゲン、水酸基、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよい)、 C_{1-6} アルコキシ (該アルコキシはハロゲン、水酸基、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよい)、水酸基、シアノ、ニトロ、アミノ (該アミノは、 C_{1-3} アルキルによって 1 ~ 2 個置換されていてもよい)、カルボン酸、カルバモイル (該カルバモイルは、アミノ部分が C_{1-3} アルキルによって 1 ~ 2 個置換されていてもよい)、 C_{1-6} アルコキシカルボニルからなる群から独立して選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよい)、2 - ピリジル、2 - ピリミジニルまたは 2 - (トリメチルシリル) エチルから選択されるスルフィン酸塩を放出することが可能な脱離基を表す。]

で表される化合物またはその塩を反応させて、式 (5) :

【化 5】



[式中、 R^{1A} 、 R^{2A} 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 は、上記と同じ基を表す。]
 で表される化合物またはその塩を製造する工程、
 (工程2)式(5)で表される化合物またはその塩を酸化して、式(6)：
 【化6】



10

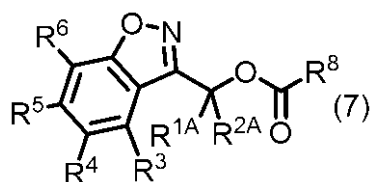
[式中、 R^{1A} 、 R^{2A} 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 および R^7 は、上記と同じ基を表す。]
 で表される化合物またはその塩を製造する工程、
 (工程3)式(6)で表される化合物またはその塩の R^7 を除去してスルホンアミド化して、式(2)で表される化合物またはその製薬学的に許容される塩を製造する工程。

【請求項14】

以下の工程を含む、請求項13に記載の製造方法；

(工程4a)式(7)：

【化7】



20

[式中、 R^{1A} 、 R^{2A} 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および R^6 は、請求項21と同じ基を表し、 R^8 は、 C_{1-6} アルキル(該アルキルはハロゲン、水酸基、 C_{3-6} シクロアルキル及び C_{1-3} アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されているもよい)、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキルカルボニロキシメトキシを表す。]
 で表される化合物またはその塩を、リパーゼ、エステラーゼ、アミダーゼ、またはプロテアーゼから選択される加水分解酵素を用いて光学選択的に加水分解し、式(3)で表される化合物を製造する工程。

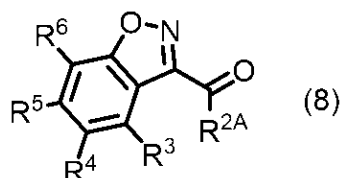
30

【請求項15】

R^{1A} が水素であり、以下の工程を含む、請求項13に記載の製造方法；

(工程4b)式(8)：

【化8】



40

[式中、 R^{2A} 、 R^3 、 R^4 、 R^5 および R^6 は、請求項21と同じ基を表す。]
 で表される化合物またはその塩を、還元酵素、およびNADHまたはNADPHから選択される補酵素を用いて光学選択的に還元し、式(3)で表される化合物を製造する工程。

【請求項16】

R^7 が、2-ベンゾチアゾイルである、請求項13~15のいずれかに記載の製造方法。

【請求項17】

R^8 が、メチルであり、加水分解酵素が、リパーゼである、請求項14または16に記載の製造方法。

50

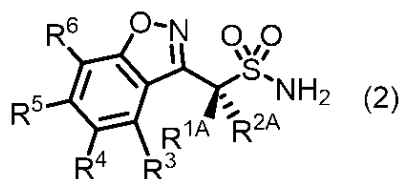
【請求項 18】

R^{2A}が、メチルであり、還元酵素が、カルボニル還元酵素またはアルコール脱水素酵素である、請求項 15 または 16 に記載の製造方法。

【請求項 19】

式 (2) :

【化 9】



10

[式中、

R^{1A}は、水素、ハロゲン、C₁-6アルキル（該アルキルはハロゲン、水酸基、C₃-6シクロアルキル及びC₁-3アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい）、又はC₃-6シクロアルキル（該シクロアルキルはハロゲン、水酸基、C₁-3アルキル及びC₁-3アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい）を表し、

R^{2A}は、ハロゲン、C₁-6アルキル（該アルキルはハロゲン、水酸基、C₃-6シクロアルキル及びC₁-3アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい）、又はC₃-6シクロアルキル（該シクロアルキルはハロゲン、水酸基、C₁-3アルキル及びC₁-3アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい）を表し、ここにおいて、R^{1A}とR^{2A}は、異なる置換基であり、

20

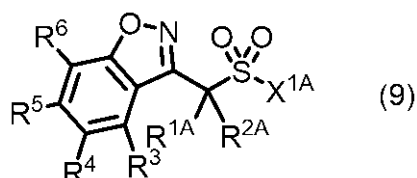
R³、R⁴、R⁵及びR⁶は、同一又は異なって、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、C₁-6アルキル（該アルキルはハロゲン、水酸基、C₃-6シクロアルキル及びC₁-3アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい）、C₃-6シクロアルキル（該シクロアルキルはハロゲン、水酸基、C₁-3アルキル及びC₁-3アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい）、又はC₁-6アルコキシ（該アルコキシはハロゲン、水酸基、C₃-6シクロアルキル及びC₁-3アルコキシからなる群から独立して選択される1~3個の置換基で置換されていてもよい）を表す。]

30

で表される化合物またはその製薬学的に許容される塩の製造方法であって、下記の工程 1~2 を含む製造方法；

(工程 1) 式 (9) :

【化 10】

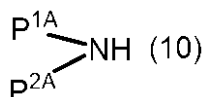


40

[式中、R^{1A}、R^{2A}、R³、R⁴、R⁵、およびR⁶は、上記と同じ基を表し、X^{1A}は、ハロゲンを表す。]

で表される化合物またはその塩と式 (10) :

【化 11】

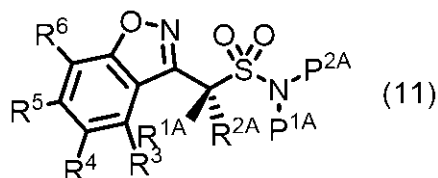


50

[式中、 P^{1A} は、2 - インダノール - 1 - イル、2 - フェニルエタン - 1 - オール - 2 - イル、または 3 - メチルブタン - 1 - オール - 2 - イルを表し、 P^{2A} は、水素またはベンジル（該基は、ベンゼン環上に、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシからなる群から独立して選択される 1 ~ 5 個の置換基で置換されていてもよい）を表す。]

で表される光学活性化合物またはその塩を反応させてジアステレオマー分割をして、式 (11) :

【化 12】



10

[式中、 R^{1A} 、 R^{2A} 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 P^{1A} 、および P^{2A} は、上記と同じ基を表す。]

で表される化合物またはその塩を製造する工程、

(工程 2) 式 (11) で表される化合物またはその塩を脱保護して、式 (2) で表される化合物またはその製薬学的に許容される塩を製造する工程。

20

【請求項 20】

R^{1A} が、水素であり、 R^{2A} が、メチルである、請求項 19 に記載の製造方法。

【請求項 21】

P^{1A} が、2 - インダノール - 1 - イルであり、 P^{2A} が、水素である、請求項 19 または 20 に記載の製造方法。

【請求項 22】

X 線粉末回折において、 $5.7^\circ \pm 0.2^\circ$ 、および $17.3^\circ \pm 0.2^\circ$ に回折角 (2°) ピークを有する、形態 I の結晶形態の (1R) - 1 - (1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) エタン - 1 - スルホンアミド。

【請求項 23】

X 線粉末回折において、 $5.7^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $14.1^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $17.3^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $19.1^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $19.3^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $21.6^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $22.5^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $23.1^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $23.3^\circ \pm 0.2^\circ$ 、および $26.5^\circ \pm 0.2^\circ$ から選択される 4 つ以上の回折角 (2°) ピークを有する、形態 I の結晶形態の (1R) - 1 - (1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) エタン - 1 - スルホンアミド。

30

【請求項 24】

X 線粉末回折において、 $8.7^\circ \pm 0.2^\circ$ 、および $17.6^\circ \pm 0.2^\circ$ に回折角 (2°) ピークを有する、形態 II の結晶形態の (1R) - 1 - (1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) エタン - 1 - スルホンアミド。

【請求項 25】

X 線粉末回折において、 $8.7^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $13.5^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $15.5^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $17.6^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $20.3^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $21.6^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $22.6^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $26.2^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $26.8^\circ \pm 0.2^\circ$ 、および $35.2^\circ \pm 0.2^\circ$ から選択される 4 つ以上の回折角 (2°) ピークを有する、形態 II の結晶形態の (1R) - 1 - (1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) エタン - 1 - スルホンアミド。

40

【請求項 26】

X 線粉末回折において、 $11.1^\circ \pm 0.2^\circ$ 、および $20.3^\circ \pm 0.2^\circ$ に回折角 (2°) ピークを有する、形態 III の結晶形態の (1R) - 1 - (1, 2 - ベンゾオキサゾール - 3 - イル) エタン - 1 - スルホンアミド。

【請求項 27】

50

X線粉末回折において、 $11.1^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $13.8^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $17.0^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $20.3^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $21.4^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $22.1^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $22.4^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $24.8^\circ \pm 0.2^\circ$ 、 $26.3^\circ \pm 0.2^\circ$ 、および $27.9^\circ \pm 0.2^\circ$ から選択される4つ以上の回折角(2°)ピークを有する、形態IIIの結晶形態の(1R)-1-(1,2-ベンゾオキサゾール-3-イル)エタン-1-スルホンアミド。

10

20

30

40

50