

【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19年7月5日(2007.7.5)

【公表番号】特表2007-500233(P2007-500233A)

【公表日】平成19年1月11日(2007.1.11)

【年通号数】公開・登録公報2007-001

【出願番号】特願2006-533430(P2006-533430)

【国際特許分類】

**C 0 7 C 233/43 (2006.01)**

**C 0 7 C 231/24 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/136 (2006.01)**

**A 6 1 K 9/72 (2006.01)**

**A 6 1 K 45/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/573 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/5685 (2006.01)**

**A 6 1 P 11/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 11/06 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 C 233/43 C S P

C 0 7 C 231/24

A 6 1 K 31/136

A 6 1 K 9/72

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 31/573

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 31/5685

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 11/06

【手続補正書】

【提出日】平成19年5月16日(2007.5.16)

【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】

結晶性N-〔2-〔4-((R)-2-ヒドロキシ-2-フェニルエチルアミノ)フェニル〕エチル〕-(R)-2-ヒドロキシ-2-(3-ホルムアミド-4-ヒドロキシフェニル)エチルアミン塩酸塩。

【請求項2】

6.00±0.2、7.99±0.2、9.98±0.2、15.98±0.2、24.05±0.2、24.53±0.2、25.35±0.2、26.08±0.2、26.77±0.2、28.13±0.2、34.31±0.2および38.49±0.2からなる群より選択される2の値において、2つ以上の回折ピークを有するX線粉末回折パターンにより特徴付けられる、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 3】

15.98 ± 0.2、24.05 ± 0.2、26.08 ± 0.2 および 28.13 ± 0.2 からなる群より選択される 2 の値において、2 つ以上の回折ピークを有する X 線粉末回折パターンにより特徴付けられる、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 4】

ピーク位置が、図 1 に示されるパターンのピーク位置と実質的に一致する X 線粉末回折パターンにより特徴付けられる、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 5】

約 699  $\text{cm}^{-1}$ 、約 788  $\text{cm}^{-1}$ 、約 810  $\text{cm}^{-1}$ 、約 827  $\text{cm}^{-1}$ 、約 875  $\text{cm}^{-1}$ 、約 970  $\text{cm}^{-1}$ 、約 1026  $\text{cm}^{-1}$ 、約 1056  $\text{cm}^{-1}$ 、約 1080  $\text{cm}^{-1}$ 、約 1101  $\text{cm}^{-1}$ 、約 1213  $\text{cm}^{-1}$ 、約 1296  $\text{cm}^{-1}$ 、約 1374  $\text{cm}^{-1}$ 、約 1441  $\text{cm}^{-1}$ 、約 1546  $\text{cm}^{-1}$ 、約 1596  $\text{cm}^{-1}$ 、約 1660  $\text{cm}^{-1}$ 、約 3371  $\text{cm}^{-1}$  および約 3553  $\text{cm}^{-1}$  において有意な吸収帯を有する赤外吸収スペクトルを有する、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 6】

約 200 で吸熱熱流の開始を示す差次的走査測熱トレースにより特徴付けられる、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 7】

約 95 と 115 との間の吸熱特徴、および約 200 での吸熱熱流の開始を示す、差次的走査測熱トレースにより特徴付けられる、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 8】

図 2 に示されるトレースと実質的に一致する差次的走査測熱トレースにより特徴付けられる、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 9】

請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物の治療有効量、および薬学的に受容可能なキャリアを含む、薬学的組成物。

## 【請求項 10】

前記組成物が、1 種以上の他の治療剤の治療有効量をさらに含み、ここで該他の治療剤はコルチコステロイド、抗コリン作用薬または PDE 4 インヒビターである、請求項 9 に記載の薬学的組成物。

## 【請求項 11】

前記組成物が、吸入による投与のために処方される、請求項 9 に記載の薬学的組成物。

## 【請求項 12】

請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む組成物であって、該組成物は、6 - ジフルオロ - 17 - [(2 - フラニルカルボニル)オキシ] - 11 - ヒドロキシ - 16 - メチル - 3 - オキソ - アンドロスタ - 1,4 - ジエン - 17 - カルボチオ酸 S - フルオロメチルエステルと組合せて投与されることを意図される、組成物。

## 【請求項 13】

請求項 1 に記載の化合物を調製するためのプロセスであって、該プロセスは、以下：

(a) N - {2 - [4 - ((R) - 2 - ヒドロキシ - 2 - フェニルエチルアミノ)フェニル]エチル} - (R) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (3 - ホルムアミド - 4 - ヒドロキシフェニル)エチルアミンを、極性溶媒中に溶解させ、第 1 の溶液を形成する工程；および

(b) 約 0.9 モル当量と約 1 モル当量との間の塩酸を添加して第 2 の溶液を形成する工程であって、該溶液から、請求項 1 に記載の化合物が形成される、工程、を包含する、プロセス。

## 【請求項 14】

請求項 1 に記載の化合物を調製するためのプロセスであって、該プロセスは、以下：

(a) N - {2 - [4 - ((R) - 2 - ヒドロキシ - 2 - フェニルエチルアミノ)フェニル]エチル} - (R) - 2 - ヒドロキシ - 2 - (3 - ホルムアミド - 4 - ヒドロキシフェニル)エチルアミンを、極性溶媒中に溶解させ、第 1 の溶液を形成する工程；および

(b) 約 5 と約 6 との間の pH で、モル過剰の無機塩化合物の水溶液を添加して第 2 の溶液を形成する工程であって、該溶液から、請求項 1 に記載の化合物が形成される、工程、  
を包含する、プロセス。

【請求項 15】

喘息または慢性閉塞性肺疾患を処置するための組成物であって、該組成物は、請求項 1 ～ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、組成物。