

【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 3 年 8 月 12 日 (2021.8.12)

【公表番号】特表 2020-525475 (P2020-525475A)

【公表日】令和 2 年 8 月 27 日 (2020.8.27)

【年通号数】公開・登録公報 2020-034

【出願番号】特願 2019-572102 (P2019-572102)

【国際特許分類】

C 07D 401/06 (2006.01)

A 61K 31/4439 (2006.01)

A 61P 25/08 (2006.01)

A 61P 25/20 (2006.01)

A 61P 25/04 (2006.01)

A 61P 25/16 (2006.01)

A 61P 25/18 (2006.01)

A 61P 25/22 (2006.01)

A 61P 25/24 (2006.01)

A 61P 25/28 (2006.01)

A 61P 25/30 (2006.01)

A 61P 25/00 (2006.01)

A 61P 9/12 (2006.01)

A 61P 9/00 (2006.01)

A 61P 9/10 (2006.01)

A 61P 35/00 (2006.01)

A 61P 3/10 (2006.01)

【F I】

C 07D 401/06 C S P

A 61K 31/4439

A 61P 25/08

A 61P 25/20

A 61P 25/04

A 61P 25/16

A 61P 25/18

A 61P 25/22

A 61P 25/24

A 61P 25/28

A 61P 25/30

A 61P 25/00

A 61P 9/12

A 61P 9/00

A 61P 9/10

A 61P 35/00

A 61P 3/10

【手続補正書】

【提出日】令和 3 年 6 月 30 日 (2021.6.30)

【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】

a. 粉末 X 線回折ダイアグラムにおける以下の屈折角 2θ : 4.7° 、 14.1° 及び 20.1° におけるピークの存在 ; 又は、

b. 粉末 X 線回折ダイアグラムにおける以下の屈折角 2θ : 12.8° 、 18.0° 及び 18.3° におけるピークの存在 ;

により特徴づけられる、N - [1 - (5 - シアノ - ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - [4 - (1 - トリフルオロメチル - シクロプロピル) - フェニル] - アセタミドの結晶形。

【請求項 2】

a. 粉末 X 線回折ダイアグラムにおける以下の屈折角 2θ : 4.7° 、 9.3° 、 14.1° 、 20.1° 及び 24.7° におけるピークの存在 ; 又は、

b. 粉末 X 線回折ダイアグラムにおける以下の屈折角 2θ : 12.4° 、 12.8° 、 15.7° 、 18.0° 及び 18.3° におけるピークの存在 ;

により特徴づけられる、請求項 1 に記載の N - [1 - (5 - シアノ - ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - [4 - (1 - トリフルオロメチル - シクロプロピル) - フェニル] - アセタミドの結晶形。

【請求項 3】

粉末 X 線回折ダイアグラムにおける以下の屈折角 2θ : 4.7° 、 14.1° 及び 20.1° におけるピークの存在により特徴づけられる、請求項 1 に記載の N - [1 - (5 - シアノ - ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - [4 - (1 - トリフルオロメチル - シクロプロピル) - フェニル] - アセタミドの結晶形。

【請求項 4】

粉末 X 線回折ダイアグラムにおける以下の屈折角 2θ : 4.7° 、 9.3° 、 12.0° 、 14.1° 、 16.3° 、 18.4° 、 20.1° 、 21.8° 、 24.7° 及び 28.6° におけるピークの存在により特徴づけられる、請求項 1 に記載の N - [1 - (5 - シアノ - ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - [4 - (1 - トリフルオロメチル - シクロプロピル) - フェニル] - アセタミドの結晶形。

【請求項 5】

粉末 X 線回折ダイアグラムにおける以下の屈折角 2θ : 12.8° 、 18.0° 及び 18.3° におけるピークの存在により特徴づけられる、請求項 1 に記載の N - [1 - (5 - シアノ - ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - [4 - (1 - トリフルオロメチル - シクロプロピル) - フェニル] - アセタミドの結晶形。

【請求項 6】

粉末 X 線回折ダイアグラムにおける以下の屈折角 2θ : 10.9° 、 12.4° 、 12.8° 、 13.2° 、 15.7° 、 16.3° 、 18.0° 、 18.3° 、 21.1° 及び 29.3° におけるピークの存在により特徴づけられる、請求項 1 に記載の N - [1 - (5 - シアノ - ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - [4 - (1 - トリフルオロメチル - シクロプロピル) - フェニル] - アセタミドの結晶形。

【請求項 7】

a. 約 5 vol. のトルエン中に N - [1 - (5 - シアノ - ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - [4 - (1 - トリフルオロメチル - シクロプロピル) - フェニル] - アセタミドを有する懸濁液を、還流下で溶解するまで加熱する工程 ;

b. 上記溶液を 1 ~ 5 時間以内に約 25°C に冷却する工程 ;

c. 0°C に冷却する工程 ; 及び

d. 得られた固体残渣を単離する工程 ;

により得ることができる、N - [1 - (5 - シアノ - ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H

- ピラゾール - 3 - イル] - 2 - [4 - (1 - トリフルオロメチル - シクロプロピル) - フェニル] - アセタミドの結晶形。

【請求項 8】

粉末 X 線回折ダイアグラムにおける以下の屈折角 2θ : 4.7° 、 14.1° 及び 20.1° におけるピークの存在により特徴づけられる、請求項 7 に記載の N - [1 - (5 - シアノ - ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - [4 - (1 - トリフルオロメチル - シクロプロピル) - フェニル] - アセタミドの結晶形。

【請求項 9】

示唆走査熱量測定 (DSC) サーマグラムの 147 ± 2 における吸熱ピークの存在により特徴づけられる、請求項 7 又は 8 に記載の結晶形。

【請求項 10】

医薬として使用するための、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の N - [1 - (5 - シアノ - ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - [4 - (1 - トリフルオロメチル - シクロプロピル) - フェニル] - アセタミドの結晶形。

【請求項 11】

活性成分としての請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の N - [1 - (5 - シアノ - ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - [4 - (1 - トリフルオロメチル - シクロプロピル) - フェニル] - アセタミド及び少なくとも 1 種の薬学的に許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 12】

てんかん；睡眠障害；睡眠失調；炎症性疼痛、神経因性疼痛、末梢性疼痛及び抹消性軸索損傷に関連する慢性痛から選択される疼痛；本態性振戦、パーキンソン病、統合失調症、鬱病、不安症、精神病、神経変性障害、自閉症及び薬物依存から選択される神経性障害；高血圧、不整脈、心房細動、うっ血性心不全及び心臓ブロックから選択される心血管障害；癌；糖尿病；並びに糖尿病性ニューロパシーから選択される疾患又は障害の治療において使用するための、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の N - [1 - (5 - シアノ - ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - [4 - (1 - トリフルオロメチル - シクロプロピル) - フェニル] - アセタミドの結晶形又は請求項 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

てんかんの治療において使用するための、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の N - [1 - (5 - シアノ - ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - [4 - (1 - トリフルオロメチル - シクロプロピル) - フェニル] - アセタミドの結晶形又は請求項 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

前記 N - [1 - (5 - シアノ - ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - [4 - (1 - トリフルオロメチル - シクロプロピル) - フェニル] - アセタミドの結晶形が、

a . 粉末 X 線回折ダイアグラムにおける以下の屈折角 2θ : 4.7° 、 14.1° 及び 20.1° におけるピークの存在；又は、

b . 粉末 X 線回折ダイアグラムにおける以下の屈折角 2θ : 12.8° 、 18.0° 及び 18.3° におけるピークの存在；

により特徴づけられる、

請求項 12 又は 13 に記載の結晶形又は医薬組成物。

【請求項 15】

前記 N - [1 - (5 - シアノ - ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - 2 - [4 - (1 - トリフルオロメチル - シクロプロピル) - フェニル] - アセタミドの結晶形が、

粉末 X 線回折ダイアグラムにおける以下の屈折角 2θ : 4.7° 、 14.1° 及び 20.1° におけるピークの存在；

により特徴づけられる、請求項 1 2 又は 1 3 に記載の結晶形又は医薬組成物。

【請求項 1 6】

前記 N - [1 - (5 - シアノ - ピリジン - 2 - イルメチル) - 1 H - ピラゾール - 3 - イ
ル] - 2 - [4 - (1 - トリフルオロメチル - シクロプロピル) - フェニル] - アセタミ
ドの結晶形が、

示唆走査熱量測定 (D S C) サーマグラム 147 ± 2 における吸熱ピークの存在によ
り特徴づけられる、

請求項 1 2 ~ 1 4 のいずれか 1 項に記載の結晶形又は医薬組成物。