

【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 10 月 18 日 (2007.10.18)

【公表番号】特表 2007-509143 (P2007-509143A)

【公表日】平成 19 年 4 月 12 日 (2007.4.12)

【年通号数】公開・登録公報 2007-014

【出願番号】特願 2006-536635 (P2006-536635)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 213/53 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 401/14 C S P

C 0 7 D 213/53

A 6 1 K 31/444

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 1/00

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/02

【手続補正書】

【提出日】平成 19 年 8 月 29 日 (2007.8.29)

【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) 化学シフト 52.3 ± 0.2 および 195.4 ± 0.2 ppm におけるピークを有する固体 ^{13}C 核磁気共鳴スペクトル；

b) 1 つのピークが $12.1 \pm 0.1^\circ$ であり、第 2 のピークが $8.3 \pm 0.1^\circ$ 、 $14.3 \pm 0.1^\circ$ 、 $16.6 \pm 0.1^\circ$ 、 $16.9 \pm 0.1^\circ$ および $18.5 \pm 0.1^\circ$ (2) からなる群から選択される、少なくとも 2 つのピークを有する、X 線粉末回折パターン；および

c) 少なくとも $8.3 \pm 0.1^\circ$ 、 $12.1 \pm 0.1^\circ$ 、 $16.6 \pm 0.1^\circ$ 、 $16.9 \pm 0.1^\circ$ および $18.5 \pm 0.1^\circ$ (2) のピークを有する、X 線粉末回折パター

ン

のうち少なくとも一つによって特徴付けられる、{ 2 - [1 - (3 , 5 - ビストリフルオロメチルベンジル) - 5 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - [1 , 2 , 3] トリアゾル - 4 - イル] ピリジン - 3 - イル } - (2 - クロロフェニル) メタノンの結晶形態 I V。

【請求項 2】

a) 化学シフト 54.3 ± 0.2 および 196.6 ± 0.2 ppm におけるピークを有する固体 ^{13}C 核磁気共鳴スペクトル；

b) 1 つのピークが $12.5 \pm 0.1^\circ$ であり、第 2 のピークが $15.8 \pm 0.1^\circ$ 、 $16.5 \pm 0.1^\circ$ 、 $19.1 \pm 0.1^\circ$ 、 $19.7 \pm 0.1^\circ$ 、 $21.5 \pm 0.1^\circ$ 、 $25.3 \pm 0.1^\circ$ 、 $27.7 \pm 0.1^\circ$ および $28.6 \pm 0.1^\circ$ (2) からなる群から選択される、少なくとも 2 つのピークを有する、X 線粉末回折パターン；および

c) 少なくとも $12.5 \pm 0.1^\circ$ 、 $25.3 \pm 0.1^\circ$ 、 $27.7 \pm 0.1^\circ$ および $28.6 \pm 0.1^\circ$ (2) のピークを有する、X 線粉末回折パターン

のうち少なくとも一つによって特徴付けられる、{ 2 - [1 - (3 , 5 - ビストリフルオロメチルベンジル) - 5 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - [1 , 2 , 3] トリアゾル - 4 - イル] ピリジン - 3 - イル } - (2 - クロロフェニル) メタノンの結晶形態 V。

【請求項 3】

(2 - クロロフェニル) - [2 - (2 - ヒドロキシ - 2 - ピリジン - 4 - イル - ビニル) ピリジン - 3 - イル] メタノンである化合物またはその塩。

【請求項 4】

{ 2 - [1 - (3 , 5 - ビストリフルオロメチルベンジル) - 5 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - [1 , 2 , 3] トリアゾル - 4 - イル] ピリジン - 3 - イル } - (2 - クロロフェニル) メタノンである化合物を製造する方法であって、(2 - クロロフェニル) - [2 - (2 - ヒドロキシ - 2 - ピリジン - 4 - イル - ビニル) ピリジン - 3 - イル] メタノンまたはそのリン酸塩と、1 - アジドメチル - 3 , 5 - ビストリフルオロメチルベンゼンとを、適切な塩基および溶媒の存在下において反応させるステップを含む、方法。

【請求項 5】

{ 2 - [1 - (3 , 5 - ビストリフルオロメチルベンジル) - 5 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - [1 , 2 , 3] トリアゾル - 4 - イル] ピリジン - 3 - イル } - (2 - クロロフェニル) メタノンを溶媒から結晶化させるステップを含む、請求項 1 の化合物を製造する方法。

【請求項 6】

{ 2 - [1 - (3 , 5 - ビストリフルオロメチルベンジル) - 5 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - [1 , 2 , 3] トリアゾル - 4 - イル] ピリジン - 3 - イル } - (2 - クロロフェニル) メタノンを溶液媒介相転位によって結晶化させるステップを含む、請求項 1 の化合物を製造する方法。

【請求項 7】

{ 2 - [1 - (3 , 5 - ビストリフルオロメチルベンジル) - 5 - ピリジン - 4 - イル - 1 H - [1 , 2 , 3] トリアゾル - 4 - イル] ピリジン - 3 - イル } - (2 - クロロフェニル) メタノンを溶媒と不活性溶媒との混合物から結晶化させるステップを含む、請求項 2 の化合物を製造する方法。

【請求項 8】

薬学的に許容される 1 つ以上の担体、希釈剤または賦形剤との組合せにおいて、請求項 1 または 2 のいずれか 1 項の結晶化合物を含む、医薬組成物。

【請求項 9】

陰イオン界面活性剤および酸を含む、請求項 8 記載の組成物。

【請求項 10】

ラウリル硫酸ナトリウム、マンニトール、微結晶性セルロース、ヒドロキシプロピルセルロース、コロイド状二酸化ケイ素、クロスカルメロース・ナトリウムおよびステアリン酸のうち少なくとも 1 つを含む、請求項 8 または 9 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 11】

{ 2 - [1 - (3 , 5 - ビストリフルオロメチルベンジル) - 5 - ピリジン - 4 - イル
- 1 H - [1 , 2 , 3] トリアゾル - 4 - イル] ピリジン - 3 - イル } - (2 - クロロフ
ェニル) メタノンの結晶形態 I V を 含む、請求項 8 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の組成物
。