

【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 07 D 401/14	(2006.01)
C 07 D 213/53	(2006.01)
A 61 K 31/444	(2006.01)
A 61 P 25/24	(2006.01)
A 61 P 25/22	(2006.01)
A 61 P 1/00	(2006.01)
A 61 K 47/20	(2006.01)
A 61 K 47/12	(2006.01)
A 61 K 47/10	(2006.01)
A 61 K 47/38	(2006.01)
A 61 K 47/02	(2006.01)

【F I】

C 07 D 401/14	C S P
C 07 D 213/53	
A 61 K 31/444	
A 61 P 25/24	
A 61 P 25/22	
A 61 P 1/00	
A 61 K 47/20	
A 61 K 47/12	
A 61 K 47/10	
A 61 K 47/38	
A 61 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 $5.2.3 \pm 0.2$ および $1.95.4 \pm 0.2$ 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

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-1H-[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2】

a) 化学シフト 5.4 ± 0.2 および 196.6 ± 0.2 ppmにおけるピークを有する固体 ${}^1\text{H}$ 核磁気共鳴スペクトル；

b) 1つのピークが $12.5\pm0.1^\circ$ であり、第2のピークが $15.8\pm0.1^\circ$ 、 $16.5\pm0.1^\circ$ 、 $19.1\pm0.1^\circ$ 、 $19.7\pm0.1^\circ$ 、 $21.5\pm0.1^\circ$ 、 $25.3\pm0.1^\circ$ 、 $27.7\pm0.1^\circ$ および $28.6\pm0.1^\circ$ (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 $12.5\pm0.1^\circ$ 、 $25.3\pm0.1^\circ$ 、 $27.7\pm0.1^\circ$ および $28.6\pm0.1^\circ$ (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-1H-[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-1H-[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-1H-[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-1H-[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-1H-[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 - ピ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。