

【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24年12月27日(2012.12.27)

【公開番号】特開2012-176989(P2012-176989A)

【公開日】平成24年9月13日(2012.9.13)

【年通号数】公開・登録公報2012-037

【出願番号】特願2012-137788(P2012-137788)

【国際特許分類】

C 07 D 413/04 (2006.01)

A 61 K 31/4709 (2006.01)

A 61 P 11/00 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 413/04 C S P

A 61 K 31/4709

A 61 P 11/00

A 61 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成24年11月9日(2012.11.9)

【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

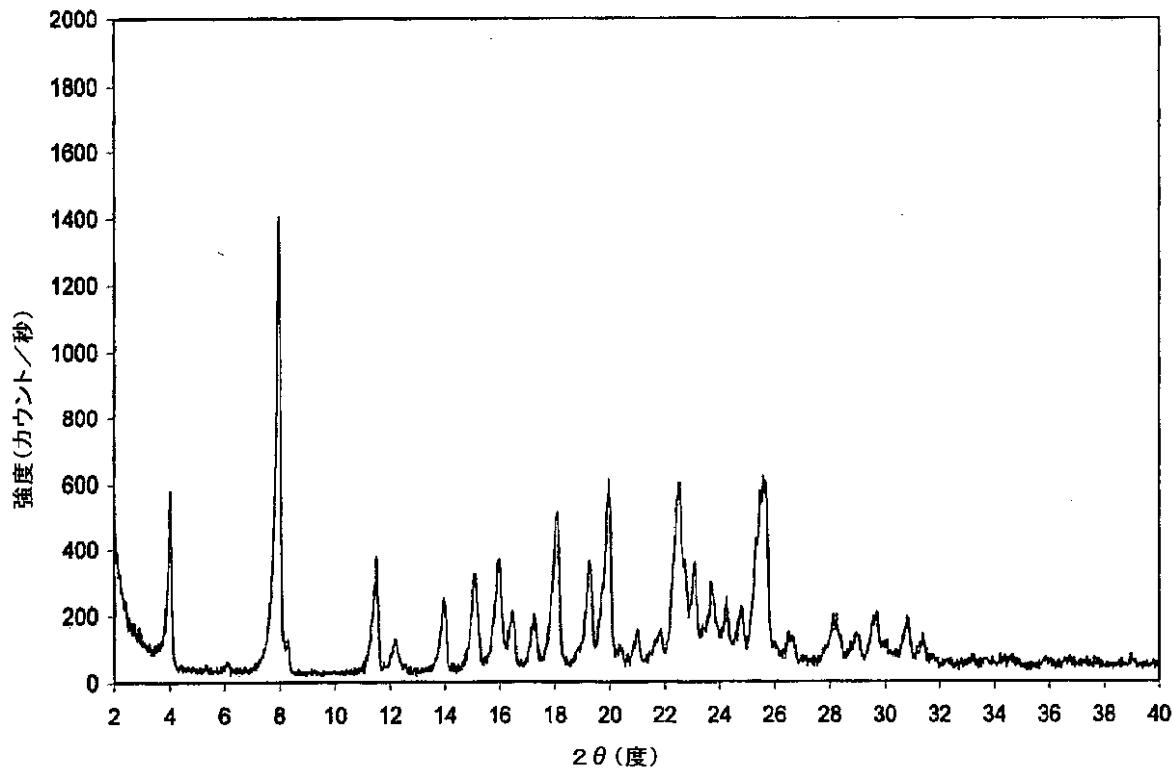
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

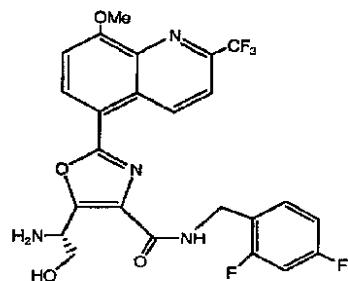
以下：

【化1】



のX線粉末回折パターン特性を持つ結晶性フマル酸塩である、化合物Iの結晶性塩

【化2】



式 I

【請求項2】

(a) アセトニトリル50ml中に、式Iの構造を有する遊離塩基化合物の一定分量を懸濁させるステップと、

(b) ステップ「a」で形成された懸濁液を、60まで加熱するステップと、

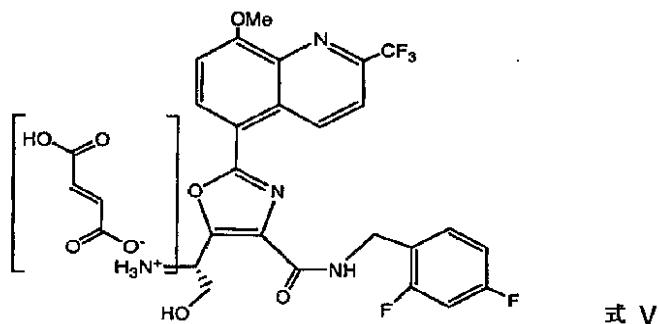
(c) 加熱された懸濁液と、少なくとも1当量のフマル酸とを混合するステップと、

(d) ステップ「c」で調製された混合物を、懸濁材料が溶解する温度にまで加熱するステップと、

(e) ステップ「d」で調製された溶液を、2時間にわたり周囲温度まで冷却して、沈殿物を得るステップと、

(f) 沈殿物を収集し、50の温度の真空炉内で乾燥するステップと
を含む、式Iの化合物の結晶性フマル酸塩(式Vの構造を有する5-(1(S)-アミノ-2-ヒドロキシエチル)-N-[(2,4-ジフルオロフェニル)-メチル]-2-[8-メトキシ-2-(トリフルオロメチル)-5-キノリン]-4-オキサゾールカルボキサミドフマル酸塩化合物)を作製するための方法

【化3】



【請求項3】

前記加熱ステップ「d」において、混合物が少なくとも80の温度に加熱され、冷却ステップ「e」において、周囲温度が25である、請求項2に記載の方法。

【請求項4】

回折角(2、全ての値は±0.2の精度を反映する)、格子面「d」間隔(オングストローム)、および相対ピーク強度('RI')に関して表された表IIIに示されるX線粉末回折パターンによって特徴付けられる、上述の方法により調製された式V-(1(S)-アミノ-2-ヒドロキシエチル)-N-[(2,4-ジフルオロフェニル)-メチル]-2-[8-メトキシ-2-(トリフルオロメチル)-5-キノリン]-4-オキサゾールカルボキサミドの結晶性フマル酸塩

【表3】

表 III

回折角 (2θ, ± 0.2)	RI	格子面間隔 (Å, ± 0.04)
8.0	強い	11.04
19.9	中	4.46
22.5	中	3.95
25.6	中	3.48