

【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25年10月10日(2013.10.10)

【公表番号】特表2013-503861(P2013-503861A)

【公表日】平成25年2月4日(2013.2.4)

【年通号数】公開・登録公報2013-006

【出願番号】特願2012-527868(P2012-527868)

【国際特許分類】

C 07 D 249/10 (2006.01)  
 A 61 K 31/505 (2006.01)  
 A 61 K 31/4192 (2006.01)  
 A 61 P 35/00 (2006.01)  
 A 61 P 27/02 (2006.01)  
 A 61 P 35/02 (2006.01)  
 A 61 P 31/18 (2006.01)  
 A 61 P 37/08 (2006.01)

【F I】

C 07 D 249/10 C S P  
 A 61 K 31/505  
 A 61 K 31/4192  
 A 61 P 35/00  
 A 61 P 27/02  
 A 61 P 35/02  
 A 61 P 31/18  
 A 61 P 37/08

【手続補正書】

【提出日】平成25年8月23日(2013.8.23)

【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】

5 - アミノ - 1 - ( 4 - ( 4 - クロロベンゾイル ) - 3 , 5 - ジクロロベンジル ) - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - カルボキサミドの1型又は2型多形体。

【請求項2】

1 : 1 ~ 1 : 4 の範囲でオロチン酸がイオン結合している、オロチン酸と結合された5 - アミノ - 1 - ( 4 - ( 4 - クロロベンゾイル ) - 3 , 5 - ジクロロベンジル ) - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - カルボキサミドの1型又は2型多形体。

【請求項3】

前記塩基 : 酸比が、1 : 1 ~ 1 : 4 の範囲である、請求項2に記載の多形体。

【請求項4】

前記塩基 : 酸比が、0 . 7 : 1 . 3 である、請求項2に記載の多形体。

【請求項5】

オロチン酸と結合された5 - アミノ - 1 - ( 4 - ( 4 - クロロベンゾイル ) - 3 , 5 - ジクロロベンジル ) - 1 , 2 , 3 - トリアゾール - 4 - カルボキサミドの1型多形体の製造方法であって、前記オロチン酸が1 : 1 ~ 1 : 4 の範囲でイオン結合しており、以下の

工程、

ジフェニルホスホリルアジドを3, 5-ジクロロ-4-(4'-クロロベンゾイル)ベンジルアルコールと反応させて3, 5-ジクロロ-4-(4-クロロベンゾイル)ベンジルアジドを得る工程、

2-シアノアセトアミドを3, 5-ジクロロ-4-(4-クロロベンゾイル)ベンジルアジドと反応させて、5-アミノ-1-(4-(4-クロロベンゾイル))-3, 5-ジクロロベンゾイル)-1, 2, 3-トリアゾール-4-カルボキサミドを得る工程、及び

オロチン酸を5-アミノ-1-(4-(4-クロロベンゾイル))-3, 5-ジクロロベンジル)-1, 2, 3-トリアゾール-4-カルボキサミドと反応させる工程、  
を含むことを特徴とする、方法。

**【請求項6】**

5-アミノ-1-(4-(4-クロロベンゾイル))-3, 5-ジクロロベンジル)-1, 2, 3-トリアゾール-4-カルボキサミドの1型多形体の製造方法であって、以下の工程、

ジフェニルホスホリルアジドを3, 5-ジクロロ-4-(4'-クロロベンゾイル)ベンジルアルコールと反応させて3, 5-ジクロロ-4-(4-クロロベンゾイル)ベンジルアジドを得る工程、及び

2-シアノアセトアミドを3, 5-ジクロロ-4-(4-クロロベンゾイル)ベンジルアジドと反応させて、5-アミノ-1-(4-(4-クロロベンゾイル))-3, 5-ジクロロベンジル)-1, 2, 3-トリアゾール-4-カルボキサミドを得る工程、  
を含むことを特徴とする、方法。

**【請求項7】**

オロチン酸と結合された5-アミノ-1-(4-(4-クロロベンゾイル))-3, 5-ジクロロベンジル)-1, 2, 3-トリアゾール-4-カルボキサミドの2型多形体の製造方法であって、前記オロチン酸が1:1~1:4の範囲でイオン結合しており、以下の工程、

ジフェニルホスホリルアジドを3, 5-ジクロロ-4-(4'-クロロベンゾイル)ベンジルアルコールと反応させて3, 5-ジクロロ-4-(4-クロロベンゾイル)ベンジルアジドを得る工程、

2-シアノアセトアミドを3, 5-ジクロロ-4-(4-クロロベンゾイル)ベンジルアジドと反応させて、5-アミノ-1-(4-(4-クロロベンゾイル))-3, 5-ジクロロベンジル)-1, 2, 3-トリアゾール-4-カルボキサミドを得る工程、及び

オロチン酸を5-アミノ-1-(4-(4-クロロベンゾイル))-3, 5-ジクロロベンジル)-1, 2, 3-トリアゾール-4-カルボキサミドと反応させる工程、  
を含むことを特徴とする、方法。

**【請求項8】**

5-アミノ-1-(4-(4-クロロベンゾイル))-3, 5-ジクロロベンジル)-1, 2, 3-トリアゾール-4-カルボキサミドの2型多形体の製造方法であって、以下の工程、

ジフェニルホスホリルアジドを3, 5-ジクロロ-4-(4'-クロロベンゾイル)ベンジルアルコールと反応させて3, 5-ジクロロ-4-(4-クロロベンゾイル)ベンジルアジドを得る工程、

2-シアノアセトアミドを3, 5-ジクロロ-4-(4-クロロベンゾイル)ベンジルアジドと反応させて、5-アミノ-1-(4-(4-クロロベンゾイル))-3, 5-ジクロロベンジル)-1, 2, 3-トリアゾール-4-カルボキサミドを得る工程、  
を含むことを特徴とする、方法。

**【請求項9】**

薬剤としての使用のための、請求項1~4のいずれか1項に記載の多形体又は請求項5~8のいずれか1項に記載の方法によって製造される多形体。

**【請求項10】**

固形癌、黄斑変性症、網膜症、慢性骨髓性白血病又はAIDSの治療における使用のための、請求項1～4のいずれか1項に記載の多形体又は請求項5～8のいずれか1項に記載の方法によって製造される多形体。