

【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 0 7 D 249/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/505 (2006.01)

A 6 1 K 31/4192 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 249/10 C S P

A 6 1 K 31/505

A 6 1 K 31/4192

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 31/18

A 6 1 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 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、慢性骨髄性白血病又はA I D S 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。