

【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18年6月1日(2006.6.1)

【公表番号】特表2005-522503(P2005-522503A)

【公表日】平成17年7月28日(2005.7.28)

【年通号数】公開・登録公報2005-029

【出願番号】特願2003-583994(P2003-583994)

【国際特許分類】

C 07 C 233/63 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

C 07 C 231/24 (2006.01)

A 61 K 31/198 (2006.01)

【F I】

C 07 C 233/63

A 61 P 3/10

C 07 C 231/24

A 61 K 31/198

C 07 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成18年4月10日(2006.4.10)

【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】

約108の融点を有するナテグリニドの結晶形；またはその溶媒和物。

【請求項2】

請求項1の結晶形の製造方法であつて；

(a) ナテグリニドが周囲温度で容易に溶ける第1の溶媒に任意の形態のナテグリニドを溶かして溶液を形成させること；

(b) 該溶液を、第1の溶媒と混和可能であり、かつ、ナテグリニドが僅かにしか溶けない第2の溶媒で処理し、請求項1の結晶の沈澱を生じさせること；ならびに

(c) 請求項1の沈澱した結晶形を単離および乾燥すること

を含んでなる方法。

【請求項3】

請求項1の結晶形の沈澱を、攪拌、冷却またはナテグリニドの種晶の添加により生じさせる、請求項2に記載の方法。

【請求項4】

周囲温度が、室温から溶媒の沸点までの範囲である、請求項2に記載の方法。

【請求項5】

請求項1の結晶形を、大気圧または減圧下で、室温から70までの範囲の温度にて乾燥する、請求項2に記載の方法。

【請求項6】

第1の溶媒がエタノールおよびトルエンの混合物である、請求項2に記載の方法。

【請求項7】

第2の溶媒がヒドロキシプロピルメチルセルロースを含有する水である、請求項6に記

載の方法。

【請求項 8】

第1の溶媒が50%（容積）のエタノールを含有し；第2の溶媒が1%のヒドロキシプロピルメチルセルロースを含有し；そして第1の溶媒と第2の溶媒の容積比が1:7である、請求項7に記載の方法。

【請求項 9】

周囲温度が室温であり；そしての結晶形を、減圧下で室温から50°の範囲の温度にて乾燥する、請求項8に記載の方法。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0001

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0001】

本発明は、N-(トランス-4-イソプロピルシクロヘキシリカルボニル)-D-フェニルアラニン（ナテグリニドとしても知られる）の異なる結晶形の製造方法に関する。特に、本発明は、本明細書においてナテグリニドの結晶形のR'-型結晶と称されるナテグリニドの結晶を形成させること、またはナテグリニドの結晶形に関する。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0006

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0006】

本発明の1つの実施態様において、R'-型のナテグリニドの結晶形は、ナテグリニドが周囲温度で容易に溶ける溶媒にナテグリニドを溶かして溶液を形成させること、該溶液を、第1の溶媒と混和可能であり、かつ、ナテグリニドが僅かにしか溶けない別の溶媒で処理し、ナテグリニドのR'-型結晶の沈澱を生じさせること、ナテグリニド（水和物、メタノラート、エタノラートおよびアセトナートのような溶媒和物を含む）の沈澱した結晶形を単離および乾燥することを含む方法により製造され得る。