

【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 0 7 C 233/63 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

C 0 7 C 231/24 (2006.01)

A 6 1 K 31/198 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C 233/63

A 6 1 P 3/10

C 0 7 C 231/24

A 6 1 K 31/198

C 0 7 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って；

(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ルカルボニル) - 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。