

【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20年2月14日(2008.2.14)

【公表番号】特表2007-512237(P2007-512237A)

【公表日】平成19年5月17日(2007.5.17)

【年通号数】公開・登録公報2007-018

【出願番号】特願2006-536948(P2006-536948)

【国際特許分類】

C 07 F	9/38	(2006.01)
A 61 K	31/663	(2006.01)
A 61 P	19/08	(2006.01)
A 61 P	3/00	(2006.01)
A 61 P	19/10	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)

【F I】

C 07 F	9/38	E
A 61 K	31/663	
A 61 P	19/08	
A 61 P	3/00	
A 61 P	19/10	
A 61 P	35/00	

【手続補正書】

【提出日】平成19年12月21日(2007.12.21)

【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】

非晶性イバンドロネートナトリウム。

【請求項2】

水中、またはC1～C5アルコール及びアセトニトリルからなる群から選択される有機溶剤と水との混合物中、イバンドロネートナトリウムの溶液を噴霧乾燥する段階を含んで成る、非晶性イバンドロネートナトリウムの調製方法。

【請求項3】

a) 約4.7、5.0、17.2、18.3及び $19.5 \pm 0.2^\circ 2$ でのX-線反射により特徴づけられるイバンドロネートナトリウム結晶形；

b) 約4.8、9.3、18.5、23.1及び $36.1 \pm 0.2^\circ 2$ でのX-線反射により特徴づけられるイバンドロネートナトリウム結晶形；

c) 約4.6、4.8、5.3、9.3及び $34.7 \pm 0.2^\circ 2$ でのX-線反射により特徴づけられるイバンドロネートナトリウム結晶形；

d) 約4.9、5.1、6.0、20.0及び $36.4 \pm 0.2^\circ 2$ でのX-線反射により特徴づけられるイバンドロネートナトリウム結晶形；

e) 約4.7、9.2、17.4、18.4及び $19.9 \pm 0.2^\circ 2$ でのX-線反射により特徴づけられるイバンドロネートナトリウム結晶形；

f) 約4.8、5.7、17.3、19.5及び $26.0 \pm 0.2^\circ 2$ でのX-線反射により特徴づけられるイバンドロネートナトリウム結晶形；

- g) 約4.6、9.2、18.3、19.6及び $25.6 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられるイバンドロネートナトリウム結晶形；
- h) 約5.0、5.9、17.2、20.0及び $25.9 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられるイバンドロネートナトリウム結晶形；
- i) 約5.1、6.1、17.3、20.1及び $21.5 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられるイバンドロネートナトリウム結晶形；
- j) 約5.1、6.2、17.3、19.7及び $20.1 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられるイバンドロネートナトリウム結晶形；
- k) 約5.0、6.1、17.2、25.7及び $30.9 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられるイバンドロネートナトリウム結晶形；
- l) 約4.7、6.0、17.2、26.2及び $31.0 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられるイバンドロネートナトリウム結晶形；
- m) 約4.9、6.2、25.9、31.0及び $37.1 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられるイバンドロネートナトリウム結晶形；
- n) 約5.9、17.1、19.6、20.2及び $21.3 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられるイバンドロネートナトリウム結晶形；
- o) 約6.1、17.2、19.6、20.3及び $21.4 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられるイバンドロネートナトリウム結晶形；
- p) 約6.1、17.2、19.6、20.1及び $21.5 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられるイバンドロネートナトリウム結晶形；
- q) 約6.1、17.3、19.6、21.5及び $30.8 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられるイバンドロネートナトリウム結晶形；
- r) 約6.2、25.9、26.7、31.1及び $37.2 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられるイバンドロネートナトリウム結晶形；
- s) 約5.3、6.0、17.2、18.7及び $20.0 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられるイバンドロネートナトリウム結晶形；
- t) 約4.8、5.1、5.3、5.4及び $6.1 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられるイバンドロネートナトリウム結晶形；
- u) 約6.2、15.7、26.3、32.6及び $35.6 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられるイバンドロネートナトリウム結晶形から成る群から選択されたイバンドロネートナトリウム結晶形。

#### 【請求項4】

フォームCと称する、約4.7、5.0、17.2、18.3及び $19.5 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられ、そして約17.6、19.7、20.2、20.6及び $23.8 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射によりさらに特徴づけられる請求項3記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

#### 【請求項5】

図1に実質的に示されるような粉末x-線回折図を有する請求項4記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

#### 【請求項6】

前記結晶形がモノエタノラートである請求項4記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

#### 【請求項7】

フォームDと称する、約4.8、9.3、18.5、23.1及び $36.1 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられ、そして約15.3、19.9、26.3、27.2及び $30.4 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射によりさらに特徴づけられる請求項3記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

#### 【請求項8】

図2に実質的に示されるような粉末x-線回折図を有する請求項7記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

#### 【請求項9】

フォームEと称する、約4.6、4.8、5.3、9.3及び $34.7 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により

特徴づけられ、そして約18.6, 23.3, 24.5, 27.1及び $30.1 \pm 0.2^\circ 2$  でのx-線反射によりさらに特徴づけられる請求項3記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項10】

図3に実質的に示されるような粉末x-線回折図を有する請求項9記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項11】

前記結晶形がヘミブタノラートである請求項9記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項12】

フォームFと称する、約4.9、5.1、6.0、20.0及び $36.4 \pm 0.2^\circ 2$  でのx-線反射により特徴づけられ、そして約18.6, 26.0, 28.5, 30.4及び $31.3 \pm 0.2^\circ 2$  でのx-線反射によりさらに特徴づけられる請求項3記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項13】

図4に実質的に示されるような粉末x-線回折図を有する請求項12記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項14】

フォームGと称する、約4.7、9.2、17.4、18.4及び $19.9 \pm 0.2^\circ 2$  でのx-線反射により特徴づけられ、そして約10.1, 15.2, 18.7, 26.3及び $27.1 \pm 0.2^\circ 2$  でのx-線反射によりさらに特徴づけられる請求項3記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項15】

図5に実質的に示されるような粉末x-線回折図を有する請求項14記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項16】

フォームHと称する、約4.8、5.7、17.3、19.5及び $26.0 \pm 0.2^\circ 2$  でのx-線反射により特徴づけられ、そして約18.5, 20.1, 23.8, 31.1及び $37.1 \pm 0.2^\circ 2$  でのx-線反射によりさらに特徴づけられる請求項3記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項17】

図6に実質的に示されるような粉末x-線回折図を有する請求項16記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項18】

フォームJと称する、約4.6、9.2、18.3、19.6及び $25.6 \pm 0.2^\circ 2$  でのx-線反射により特徴づけられ、そして約17.5, 18.9, 21.7, 22.9及び $29.5 \pm 0.2^\circ 2$  でのx-線反射によりさらに特徴づけられる請求項3記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項19】

図7に実質的に示されるような粉末x-線回折図を有する請求項18記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項20】

フォームKと称する、約5.0、5.9、17.2、20.0及び $25.9 \pm 0.2^\circ 2$  でのx-線反射により特徴づけられ、そして約18.5, 19.7, 21.4, 26.5及び $31.1 \pm 0.2^\circ 2$  でのx-線反射によりさらに特徴づけられる請求項3記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項21】

図8に実質的に示されるような粉末x-線回折図を有する請求項20記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項22】

フォームK2と称する、約5.1、6.1、17.3、20.1及び $21.5 \pm 0.2^\circ 2$  でのx-線反射により特徴づけられ、そして約18.6, 19.6, 26.1, 26.8及び $31.1 \pm 0.2^\circ 2$  でのx-線反射によりさらに特徴づけられる請求項3記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項23】

図9に実質的に示されるような粉末x-線回折図を有する請求項22記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

**【請求項 2 4】**

フォームK3と称する、約5.1、6.2、17.3、19.7及び $20.1 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられ、そして約18.5、21.5、23.8、25.8及び $31.1 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射によりさらに特徴づけられる請求項3記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

**【請求項 2 5】**

図10に実質的に示されるような粉末x-線回折図を有する請求項24記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

**【請求項 2 6】**

フォームQと称する、約5.0、6.1、17.2、25.7及び $30.9 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられ、そして約16.8、21.4、26.7、29.1及び $36.9 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射によりさらに特徴づけられる請求項3記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

**【請求項 2 7】**

図11に実質的に示されるような粉末x-線回折図を有する請求項26記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

**【請求項 2 8】**

フォームQ1と称する、約4.7、6.0、17.2、26.2及び $31.0 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられ、そして約19.5、21.4、25.8、29.1及び $37.1 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射によりさらに特徴づけられる請求項3記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

**【請求項 2 9】**

図12又は図12aに実質的に示されるような粉末x-線回折図を有する請求項28記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

**【請求項 3 0】**

フォームQ2と称する、約4.9、6.2、25.9、31.0及び $37.1 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられ、そして約16.9、17.3、19.0、26.6及び $29.2 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射によりさらに特徴づけられる請求項3記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

**【請求項 3 1】**

図13又は図13aに実質的に示されるような粉末x-線回折図を有する請求項30記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

**【請求項 3 2】**

フォームQ3と称する、約5.9、17.1、19.6、20.2及び $21.3 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられ、そして約18.0、18.5、23.6、24.7及び $30.8 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射によりさらに特徴づけられる請求項3記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

**【請求項 3 3】**

図14に実質的に示されるような粉末x-線回折図を有する請求項32記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

**【請求項 3 4】**

フォームQ4と称する、約6.1、17.2、19.6、20.3及び $21.4 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられ、そして約16.9、18.1、18.5、23.7及び $24.8 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射によりさらに特徴づけられる請求項3記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

**【請求項 3 5】**

図15に実質的に示されるような粉末x-線回折図を有する請求項34記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

**【請求項 3 6】**

フォームQ5と称する、約6.1、17.2、19.6、20.1及び $21.5 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射により特徴づけられ、そして約16.8、24.7、25.7、29.0及び $30.9 \pm 0.2^\circ 2$ でのx-線反射によりさらに特徴づけられる請求項3記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

**【請求項 3 7】**

図16に実質的に示されるような粉末x-線回折図を有する請求項36記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

**【請求項 3 8】**

フォームQ6と称する、約6.1、17.3、19.6、21.5及び $30.8 \pm 0.2^\circ 2$ での $\times$ -線反射により特徴づけられ、そして約16.9、20.2、25.6、26.9及び $29.1 \pm 0.2^\circ 2$ での $\times$ -線反射によりさらに特徴づけられる請求項3記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項39】

図17に実質的に示されるような粉末 $\times$ -線回折図を有する請求項38記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項40】

フォームQQと称する、約6.2、25.9、26.7、31.1及び $37.2 \pm 0.2^\circ 2$ での $\times$ -線反射により特徴づけられ、そして約16.9、17.3、21.5、24.7及び $29.2 \pm 0.2^\circ 2$ での $\times$ -線反射によりさらに特徴づけられる請求項3記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項41】

図18に実質的に示されるような粉末 $\times$ -線回折図を有する請求項40記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項42】

100 $\mu$ 以下の粒度分布を有する請求項40記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項43】

60 $\mu$ 以下の粒度分布を有する請求項42記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項44】

フォームRと称する、約5.3、6.0、17.2、18.7及び $20.0 \pm 0.2^\circ 2$ での $\times$ -線反射により特徴づけられ、そして約20.5、25.0、26.5、29.1及び $31.0 \pm 0.2^\circ 2$ での $\times$ -線反射によりさらに特徴づけられる請求項3記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項45】

図19に実質的に示されるような粉末 $\times$ -線回折図を有する請求項44記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項46】

前記結晶形がヘミエタノラートである請求項44記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項47】

フォームSと称する、約4.8、5.1、5.3、5.4及び $6.1 \pm 0.2^\circ 2$ での $\times$ -線反射により特徴づけられ、そして約10.5、21.0、26.3、33.0及び $38.2 \pm 0.2^\circ 2$ での $\times$ -線反射によりさらに特徴づけられる請求項3記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項48】

図20又は図20aに実質的に示されるような粉末 $\times$ -線回折図を有する請求項47記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項49】

前記結晶形がヘミエタノラートである請求項47記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項50】

フォームTと称する、約6.2、15.7、26.3、32.6及び $35.6 \pm 0.2^\circ 2$ での $\times$ -線反射により特徴づけられ、そして約17.6、19.4、26.9、31.7及び $38.7 \pm 0.2^\circ 2$ での $\times$ -線反射によりさらに特徴づけられる請求項3記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項51】

図21に実質的に示されるような粉末 $\times$ -線回折図を有する請求項50記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

【請求項52】

結晶性イバンドロネートナトリウム溶媒化合物。

【請求項53】

結晶性イバンドロネートナトリウムアルコラート。

【請求項54】

結晶性イバンドロネートナトリウムエタノラート。

**【請求項 5 5】**

前記エタノラートがモノエタノラートである請求項52記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

**【請求項 5 6】**

前記エタノラートがヘミエタノラートである請求項52記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

**【請求項 5 7】**

結晶性イバンドロネートナトリウムブタノラート。

**【請求項 5 8】**

前記ブタノラートがヘミブタノラートである請求項57記載のイバンドロネートナトリウム結晶形。

**【請求項 5 9】**

請求項1又は58記載のイバンドロネートナトリウム及び医薬的に許容できるキャリヤーを含んで成る医薬組成物。

**【請求項 6 0】**

前記C1～C5アルコールがエタノールまたはイソプロパノールである、請求項2に記載の方法。