

【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】令和2年10月8日(2020.10.8)

【公表番号】特表2019-526628(P2019-526628A)

【公表日】令和1年9月19日(2019.9.19)

【年通号数】公開・登録公報2019-038

【出願番号】特願2019-531594(P2019-531594)

【国際特許分類】

C 07 D 403/12 (2006.01)

A 61 P 1/16 (2006.01)

A 61 P 13/12 (2006.01)

A 61 K 31/4178 (2006.01)

【F I】

C 07 D 403/12 C S P

A 61 P 1/16

A 61 P 13/12

A 61 K 31/4178

【手続補正書】

【提出日】令和2年8月28日(2020.8.28)

【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

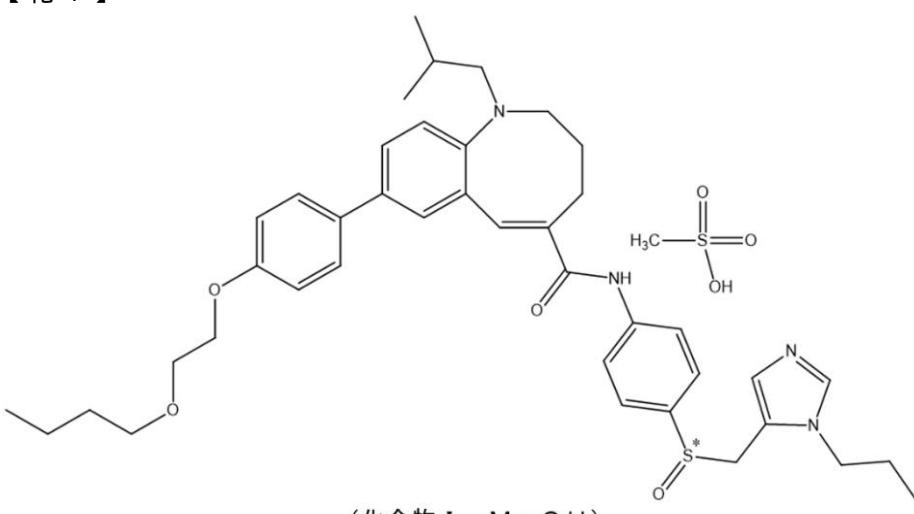
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記化合物

【化1】



の結晶形態であって、前記結晶形態が、

(a) 約4.0±0.2、約18.7±0.2、約19.1±0.2、約20.1±0.2

及び約21.7±0.2度の2シーゲルの値で表される特徴的なピークを伴うX線粉末回折パターンを有する、結晶形態A；

(b) 約4.0±0.2、約15.9±0.2、約17.8±0.2、約19.9±0.2

、約20.1±0.2、約21.5±0.2及び約21.6±0.2度の2シーゲルの値で

表される特徴的なピークを有するX線粉末回折パターンを有する、結晶形態B；または(c)約4.0±0.2、約10.0±0.2、約16.0±0.2、約18.7±0.2、約20.0±0.2及び約21.7±0.2度の2シータの値で表される特徴的なピークを伴うX線粉末回折パターンを有する、結晶形態Cである、結晶形態。

【請求項2】

請求項1に記載のいずれかの結晶形態及び薬学的に許容される賦形剤を含む薬学的組成物。

【請求項3】

化合物I-MsOHの非晶質形態。

【請求項4】

請求項3に記載の非晶質形態及び薬学的に許容される賦形剤を含む薬学的組成物。

【請求項5】

請求項1に記載の化合物I-MsOHの結晶形態Aを製造する方法であって、(a)化合物I-MsOHを適切な溶媒に懸濁してスラリーを形成すること、及び(b)化合物I-MsOHの結晶形態Aを単離すること、を含む、前記方法。

【請求項6】

請求項1に記載の化合物I-MsOHの結晶形態Aを製造する方法であって、(a)化合物I-MsOHを約5の温度で適切な溶媒に懸濁すること；(b)工程(a)の懸濁液を約50の温度に加熱すること；(c)化合物I-MsOHの結晶形態Aを単離すること；及び(d)単離された生成物を真空下で乾燥させ、生成物を細分化して約40で乾燥させること、

を含む、または

(i)化合物I-MsOHを約25の温度で適切な溶媒に懸濁すること；(ii)工程(i)の懸濁液を約50の温度に加熱すること；(iii)化合物I-MsOHの結晶形態Aを単離すること；及び(iv)単離された生成物を真空下で乾燥させ、生成物を細分化して約40で乾燥させること、

を含む、または

(1)適切な溶媒中の化合物I-MsOHの溶液に貧溶媒を添加して、結晶形態Aを沈殿させること；及び

(2)化合物I-MsOHの結晶形態Aを単離すること、

を含む、または

(A)適切な溶媒中の化合物I-MsOHの溶液に貧溶媒を添加して、結晶形態Aに転化する油を形成すること；及び

(B)化合物I-MsOHの結晶形態Aを単離すること、

を含む、または

(I)化合物I-MsOHを適切な溶媒に溶解すること；

(II)工程(I)の溶液から前記適切な溶媒の一部を蒸発させること；及び

(III)化合物I-MsOHの結晶形態Aを単離すること、

を含む、または

()化合物I-MsOHを適切な溶媒に懸濁すること；

()工程()の懸濁液を粉碎すること；及び

()化合物I-MsOHの結晶形態Aを単離すること、

を含む、前記方法。

【請求項7】

工程(a)、工程(i)、工程(1)、工程(A)、工程(I)または工程()における前記化合物I-MsOHが、非晶質化合物I-MsOHを含む、請求項6に記載の方

法。

- (a) 化合物 I - M s O H を適切な溶媒に懸濁すること；
- (b) 工程 (a) の懸濁液を粉碎すること；及び
- (c) 化合物 I - M s O H の結晶形態 A を単離すること、

【請求項 8】

請求項 1 に記載の化合物 I - M s O H の結晶形態 B を製造する方法であって、
 (a) 化合物 I - M s O H を適切な溶媒に懸濁すること、及び
 (b) 前記溶媒中の化合物 I - M s O H の結晶形態 B の懸濁液を形成すること、
を含む、または
 (i) 化合物 I - M s O H を適切な溶媒に溶解すること；
 (ii) 工程 (i) の溶液に適切な貧溶媒を添加すること；及び
 (iii) 化合物 I - M s O H の結晶形態 B の懸濁液を形成すること、
を含む、前記方法。

【請求項 9】

工程 (a) または工程 (i) における前記化合物 I - M s O H が、非晶質化合物 I - M s O H を含む、請求項 8 に記載の方法。

【請求項 10】

請求項 1 に記載の化合物 I - M s O H の結晶形態 C を製造する方法であって、
 (a) 化合物 I - M s O H の結晶形態 B の懸濁液を濾過すること；及び
 (b) 前記濾過された生成物を真空下で乾燥させ、生成物を細分化して周囲条件で乾燥
 せること、
を含む、または
 (i) 化合物 I - M s O H の結晶形態 B の懸濁液を濾過すること；及び
 (ii) 前記濾過された生成物を真空下で乾燥させ、生成物を細分化して 20 未満で乾
 燥せること、
を含む、または
 (1) 化合物 I - M s O H の結晶形態 B の懸濁液を濾過すること；及び
 (2) 前記濾過された生成物を真空下で乾燥させ、生成物を細分化し、凍結乾燥せ
 ること、
を含む、前記方法。

【請求項 11】

請求項 3 に記載の化合物 I - M s O H の非晶質形態を製造する方法であって、
 (a) 化合物 I - M s O H を適切な溶媒に溶解すること；
 (b) 工程 (a) の溶液から前記適切な溶媒の一部を蒸発させること；及び
 (c) 化合物 I - M s O H の非晶質形態を単離すること、
を含む、または
 (i) 化合物 I - M s O H を適切な溶媒に溶解すること；
 (ii) 工程 (i) の溶液を凍結乾燥せること；及び
 (iii) 化合物 I - M s O H の非晶質形態を単離すること、
を含む、前記方法。

【請求項 12】

線維症または線維性疾患もしくは状態の治療のための医薬の製造における、請求項 1 に
 記載の化合物 I - M s O H の結晶形態の使用。

【請求項 13】

線維症または線維性疾患もしくは状態の治療のための医薬の製造における、請求項 3 に
 記載の化合物 I - M s O H の非晶質形態の使用。

【請求項 14】

前記線維症または線維性疾患もしくは状態が、肝線維症または腎線維症である、請求項
 1 2 または 1 3 に記載の使用。

【請求項 15】

前記肝線維症が、非アルコール性脂肪性肝炎（NASH）または非アルコール性脂肪性肝疾患（NAFLD）に関連する、請求項1-4に記載の使用。