

【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4年9月13日(2022.9.13)

【国際公開番号】WO2020/051538
 【公表番号】特表2021-536511(P2021-536511A)
 【公表日】令和3年12月27日(2021.12.27)
 【出願番号】特願2021-538163(P2021-538163)
 【国際特許分類】

C 0 7 D 4 0 1 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1) 10
 A 6 1 K 3 1 / 5 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 1 / 1 6 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 3 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 3 / 1 0 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 1 1 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 1 3 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 1 3 / 1 2 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 1 7 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 1 9 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1) 20
 A 6 1 P 2 1 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 2 1 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 2 7 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 3 7 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 2 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 K 9 / 2 0 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 K 9 / 4 8 (2 0 0 6 . 0 1)

【 F I 】
 C 0 7 D 4 0 1 / 1 4 C S P 30
 A 6 1 K 3 1 / 5 0 6
 A 6 1 P 1 / 1 6
 A 6 1 P 3 / 0 6
 A 6 1 P 3 / 1 0
 A 6 1 P 9 / 0 0
 A 6 1 P 1 1 / 0 0
 A 6 1 P 1 3 / 0 2
 A 6 1 P 1 3 / 1 2
 A 6 1 P 1 7 / 0 0
 A 6 1 P 1 9 / 0 2 40
 A 6 1 P 2 1 / 0 0
 A 6 1 P 2 1 / 0 4
 A 6 1 P 2 7 / 0 2
 A 6 1 P 3 7 / 0 2
 A 6 1 P 2 9 / 0 0 1 0 1
 A 6 1 P 2 9 / 0 0
 A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1
 A 6 1 K 9 / 2 0
 A 6 1 K 9 / 4 8

【手続補正書】

【提出日】令和4年9月5日(2022.9.5)

【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

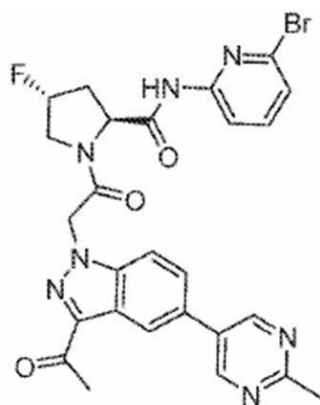
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

【化15】

10



化合物1

20

5.1 ± 0.2°、7.8 ± 0.2°、13.5 ± 0.2°、14.0 ± 0.2°、15.4 ± 0.2°、15.6 ± 0.2°、18.6 ± 0.2°、20.5 ± 0.2°、20.7 ± 0.2°及び23.4 ± 0.2°から選択された、少なくとも5つの2θ値を含む、粉末X線回折(PXRD)パターンによって特性決定される、単離された化合物1の結晶形態II。

【請求項2】

30

前記PXRDパターンが、5.1 ± 0.2°、7.8 ± 0.2°、13.5 ± 0.2°、14.0 ± 0.2°、15.4 ± 0.2°、15.6 ± 0.2°、18.6 ± 0.2°、20.5 ± 0.2°、20.7 ± 0.2°及び23.4 ± 0.2°から選択された、少なくとも6つの2θ値を含む、請求項1に記載の単離された結晶形態II。

【請求項3】

前記PXRDパターンが、5.1 ± 0.2°、7.8 ± 0.2°、13.5 ± 0.2°、14.0 ± 0.2°、15.4 ± 0.2°、15.6 ± 0.2°、18.6 ± 0.2°、20.5 ± 0.2°、20.7 ± 0.2°及び23.4 ± 0.2°から選択された、少なくとも7つの2θ値を含む、請求項1に記載の単離された結晶形態II。

【請求項4】

40

前記PXRDパターンが、5.1 ± 0.2°、7.8 ± 0.2°、13.5 ± 0.2°、14.0 ± 0.2°、15.4 ± 0.2°、15.6 ± 0.2°、18.6 ± 0.2°、20.5 ± 0.2°、20.7 ± 0.2°及び23.4 ± 0.2°から選択された、少なくとも8つの2θ値を含む、請求項1に記載の単離された結晶形態II。

【請求項5】

前記PXRDパターンが、5.1 ± 0.2°、7.8 ± 0.2°、13.5 ± 0.2°、14.0 ± 0.2°、15.4 ± 0.2°、15.6 ± 0.2°、18.6 ± 0.2°、20.5 ± 0.2°、20.7 ± 0.2°及び23.4 ± 0.2°から選択された、少なくとも9つの2θ値を含む、請求項1に記載の単離された結晶形態II。

【請求項6】

50

前記 P X R D パターンが、 $5.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $7.8 \pm 0.2^\circ$ 、 $13.5 \pm 0.2^\circ$ 、 $14.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $15.4 \pm 0.2^\circ$ 、 $15.6 \pm 0.2^\circ$ 、 $18.6 \pm 0.2^\circ$ 、 $20.5 \pm 0.2^\circ$ 、 $20.7 \pm 0.2^\circ$ 及び $23.4 \pm 0.2^\circ$ から選択された、2 値を含む、請求項 1 に記載の単離された結晶形態 I I。

【請求項 7】

前記 P X R D パターンが、少なくとも $5.1 \pm 0.2^\circ$ の 2 値を含む、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の単離された結晶形態 I I。

【請求項 8】

前記 P X R D パターンが、少なくとも $14.0 \pm 0.2^\circ$ の 2 値を含む、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の単離された結晶形態 I I。

10

【請求項 9】

前記 P X R D パターンが、少なくとも $15.4 \pm 0.2^\circ$ の 2 値を含む、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の単離された結晶形態 I I。

【請求項 10】

図 4 C の特徴的な 2 値を有する P X R D パターンを特徴とする、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の単離された結晶形態 I I。

【請求項 11】

示差走査熱量測定 (D S C) で約 $40 \sim 125 \pm 20$ の吸熱がある、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の単離された結晶形態 I I。

【請求項 12】

示差走査熱量測定 (D S C) で約 155 の吸熱がある、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の単離された結晶形態 I I。

20

【請求項 13】

固体剤形送達のための薬学的に許容される賦形剤中に、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の前記単離された結晶形態 I I を含む、医薬組成物。

【請求項 14】

補体因子 D 介在性障害の治療を必要とする対象における、補体因子 D 介在性障害の治療のための医薬組成物であって、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の単離された結晶形態 I I を、所望により固形剤形送達のための薬学的に許容される賦形剤中に含む、医薬組成物。

30

【請求項 15】

前記対象がヒトである、請求項 14 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

それを必要とする対象の補体因子 D 介在性障害の治療のための薬剤の製造における、所望により固体剤形送達のための薬学的に許容される賦形剤中の、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の単離された結晶形態 I I またはその医薬組成物の使用。

【請求項 17】

前記対象がヒトである、請求項 16 に記載の使用。

40

50