

【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6年7月17日(2024.7.17)

【国際公開番号】WO2022/011391

【公表番号】特表2023-533040(P2023-533040A)

【公表日】令和5年8月1日(2023.8.1)

【年通号数】公開公報(特許)2023-143

【出願番号】特願2023-501229(P2023-501229)

【国際特許分類】

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 5 1 9 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 5 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

10

【 F I 】

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 1 4 3

A 6 1 K 3 1 / 5 1 9

A 6 1 P 3 5 / 0 2

A 6 1 P 3 5 / 0 0

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1

20

【手続補正書】

【提出日】令和6年7月8日(2024.7.8)

【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】

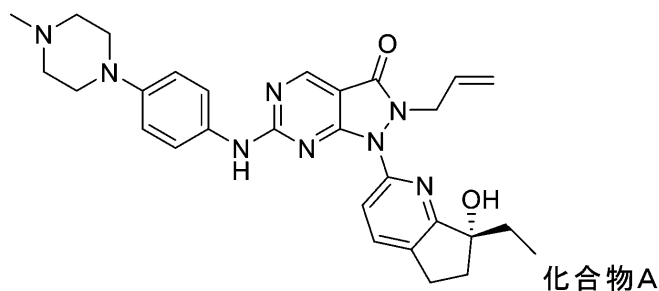
【特許請求の範囲】

30

【請求項1】

(R) - 2 - アリル - 1 - (7 - エチル - 7 - ヒドロキシ - 6 , 7 - ジヒドロ - 5 H - シクロペンタ [b] ピリジン - 2 - イル) - 6 - ((4 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) フェニル) アミノ) - 1 , 2 - ジヒドロ - 3 H - ピラゾロ [3 , 4 - d] ピリミジン - 3 - オン (化合物 A) ;

【化1】



40

であって、

結晶性遊離塩基形態又は薬学的に許容される塩形態である、

化合物。

【請求項2】

化合物Aの遊離塩基形態A、化合物Aの遊離塩基形態B、化合物Aの遊離塩基形態C、化

50

化合物 A の遊離塩基形態 D、化合物 A の遊離塩基形態 E、化合物 A の遊離塩基形態 F、化合物 A の遊離塩基形態 G、化合物 A の遊離塩基形態 H、化合物 A の遊離塩基形態 I 及び化合物 A の遊離塩基形態 J からなる群から選択される化合物 A の結晶性遊離塩基形態である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

アジピン酸塩形態 A、HCl 塩形態 A、HCl 塩形態 B、硫酸塩形態 A、硫酸塩形態 B、メシル酸塩形態 A、マレイン酸塩形態 A、リン酸塩形態 A、酒石酸塩形態 A、トシル酸塩形態 A、ムチン酸塩形態 A 及び馬尿酸塩形態 A からなる群から選択される化合物 A の薬学的に許容される塩形態である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

X線粉末回折パターンにおける 1 つ以上のピークによって特徴付けられるアジピン酸塩形態 A であり、前記 1 つ以上のピークが、 $15.40 \text{ 度} 2 \pm 0.2 \text{ 度} 2$ 、 $16.58 \text{ 度} 2 \pm 0.2 \text{ 度} 2$ 、 $22.12 \text{ 度} 2 \pm 0.2 \text{ 度} 2$ 及び $22.88 \text{ 度} 2 \pm 0.2 \text{ 度} 2$ からなる群から選択される、請求項 3 に記載の化合物。

10

【請求項 5】

X線粉末回折パターンにおける 1 つ以上のピークによって特徴付けられる遊離塩基形態 E であり、前記 1 つ以上のピークが、 $6.20 \text{ 度} 2 \pm 0.2 \text{ 度} 2$ 、 $12.40 \text{ 度} 2 \pm 0.2 \text{ 度} 2$ 、 $18.96 \text{ 度} 2 \pm 0.2 \text{ 度} 2$ 及び $22.62 \text{ 度} 2 \pm 0.2 \text{ 度} 2$ からなる群から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 6】

図 3 1 に示される代表的な X線粉末回折パターンに対応する X線粉末回折パターンスペクトルを有する遊離塩基形態 E である、請求項 5 に記載の化合物。

20

【請求項 7】

前記遊離塩基形態 E が、約 $105 \sim 125$ の範囲の吸熱を含む DSC サーモグラムによって特徴付けられる、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 8】

前記遊離塩基形態 E が、約 115 での吸熱を含む DSC サーモグラムによって特徴付けられる、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 9】

前記遊離塩基形態 E が、約 28 から約 150 に加熱したときの約 3.8% の重量損失によって特徴付けられる、請求項 5 に記載の化合物。

30

【請求項 10】

前記遊離塩基形態 E が、図 3 2 に示される代表的な DSC 及び / 又は TGA サーモグラムに対応する DSC 及び / 又は TGA サーモグラムを有する、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 11】

前記遊離塩基形態 E が、水和物である、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 12】

X線粉末回折パターンにおける 1 つ以上のピークによって特徴付けられる遊離塩基形態 F であり、前記 1 つ以上のピークが、 $5.14 \text{ 度} 2 \pm 0.2 \text{ 度} 2$ 、 $6.24 \text{ 度} 2 \pm 0.2 \text{ 度} 2$ 、 $10.19 \text{ 度} 2 \pm 0.2 \text{ 度} 2$ 及び $12.40 \text{ 度} 2 \pm 0.2 \text{ 度} 2$ からなる群から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

40

【請求項 13】

前記遊離塩基形態 F が、図 3 3 に示される代表的な X線粉末回折パターンに対応する X線粉末回折パターンスペクトルを有する、請求項 1 2 に記載の化合物。

【請求項 14】

前記遊離塩基形態 F が、約 $163 \sim 171$ の範囲の吸熱を含む DSC サーモグラムによって特徴付けられる、請求項 1 2 に記載の化合物。

【請求項 15】

前記遊離塩基形態 F が、約 167 での吸熱を含む DSC サーモグラムによって特徴付けられる、請求項 1 2 に記載の化合物。

50

【請求項 16】

前記遊離塩基形態 F が、約 22 から約 150 に加熱したときの約 0.9% の重量損失によって特徴付けられる、請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 17】

前記遊離塩基形態 F が、図 34 に示される代表的な DSC 及び / 又は TGA サーモグラムに対応する DSC 及び / 又は TGA サーモグラムを有する、請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 18】

前記遊離塩基形態 F が、無水物である、請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 19】

X線粉末回折パターンにおける 1 つ以上のピークによって特徴付けられる遊離塩基形態 J であり、前記 1 つ以上のピークが、 $6.08 \text{度} 2 \pm 0.2 \text{度} 2$ 、 $10.58 \text{度} 2 \pm 0.2 \text{度} 2$ 、 $19.42 \text{度} 2 \pm 0.2 \text{度} 2$ 、 $21.93 \text{度} 2 \pm 0.2 \text{度} 2$ 及び $23.23 \text{度} 2 \pm 0.2 \text{度} 2$ からなる群から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 20】

前記遊離塩基形態 J が、図 40 に示される代表的な X線粉末回折パターンに対応する X線粉末回折パターンスペクトルを有する、請求項 19 に記載の化合物。

【請求項 21】

前記遊離塩基形態 J が、無水物である、請求項 19 に記載の化合物。

【請求項 22】

有効量の請求項 1 ~ 21 のいずれか一項に記載の化合物と、薬学的に許容される担体、希釈剤、賦形剤、又はこれらの組み合わせと、を含む、医薬組成物。

【請求項 23】

悪性増殖又は腫瘍を寛解又は治療するための医薬の製造における、請求項 1 ~ 21 のいずれか一項に記載の化合物の有効量の使用であって、

前記悪性増殖又は腫瘍が、乳がん、子宮頸がん、卵巣がん、子宮がん、膣がん、外陰がん、脳がん、脳頸部がん、食道がん、甲状腺がん、小細胞がん、非小細胞がん、肺がん、胃がん、胆嚢 / 胆管がん、肝がん、膵臓がん、結腸がん、直腸がん、絨毛がん、子宮体がん、子宮頸部がん、腎盂 / 尿管がん、膀胱がん、前立腺がん、陰茎がん、精巣がん、胎児がん、ウィルムスがん、皮膚がん、悪性黒色腫、神経芽細胞腫、骨肉腫、ユーイング腫瘍、軟部肉腫、急性白血病、慢性リンパ性白血病、慢性骨髄球性白血病、真性多血症、悪性リンパ腫、多発性骨髄腫、ホジキンリンパ腫及び非ホジキンリンパ腫からなる群から選択されるがん

に起因する、

使用。

【請求項 24】

前記がんが、乳がん、子宮頸がん、卵巣がん、子宮がん、膣がん又は外陰がんである、請求項 23 に記載の使用。

【請求項 25】

悪性増殖又は腫瘍の寛解又は治療に使用するための、請求項 1 ~ 21 のいずれか一項に記載の化合物を含む医薬組成物であって、

前記悪性増殖又は腫瘍が、乳がん、子宮頸がん、卵巣がん、子宮がん、膣がん、外陰がん、脳がん、脳頸部がん、食道がん、甲状腺がん、小細胞がん、非小細胞がん、肺がん、胃がん、胆嚢 / 胆管がん、肝がん、膵臓がん、結腸がん、直腸がん、絨毛がん、子宮体がん、子宮頸部がん、腎盂 / 尿管がん、膀胱がん、前立腺がん、陰茎がん、精巣がん、胎児がん、ウィルムスがん、皮膚がん、悪性黒色腫、神経芽細胞腫、骨肉腫、ユーイング腫瘍、軟部肉腫、急性白血病、慢性リンパ性白血病、慢性骨髄球性白血病、真性多血症、悪性リンパ腫、多発性骨髄腫、ホジキンリンパ腫及び非ホジキンリンパ腫からなる群から選択されるがん

に起因する、

医薬組成物。

【請求項 26】

医薬組成物。

10

20

30

40

50

前記がんが、乳がん、子宮頸がん、卵巣がん、子宮がん、膣がん又は外陰がんである、請求項 2.5 に記載の医薬組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0159

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0159】

いくつかの実施形態では、化合物 A の遊離塩基形態 E は、DSC 及び / 又は TGA サーモグラムによって特徴付けられることができる。いくつかの実施形態では、化合物 A の遊離塩基形態 E は、約 28 ーから約 150 ーに加熱したときの約 3.8% の重量損失によって特徴付けられることができる。いくつかの実施形態では、化合物 A の遊離塩基形態 E は、約 105 ー ~ 約 125 ー の範囲の吸熱によって特徴付けられることができる。いくつかの実施形態では、化合物 A の遊離塩基形態 E は、約 110 ー ~ 約 118 ー の範囲の吸熱によって特徴付けられることができる。いくつかの実施形態では、化合物 A の遊離塩基形態 E は、約 115.2 ーでの吸熱によって特徴付けられることができる。いくつかの実施形態では、化合物 A の遊離塩基形態 E は、図 32 の DSC 及び / 又は TGA サーモグラムを有し得る。

10

20

30

40

50