

【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3年3月25日(2021.3.25)

【公開番号】特開2020-83892(P2020-83892A)

【公開日】令和2年6月4日(2020.6.4)

【年通号数】公開・登録公報2020-022

【出願番号】特願2019-212064(P2019-212064)

【国際特許分類】

C 07 D 307/93 (2006.01)

A 61 K 31/5585 (2006.01)

A 61 P 9/12 (2006.01)

【F I】

C 07 D 307/93 C S P

A 61 K 31/5585

A 61 P 9/12

【誤訳訂正書】

【提出日】令和3年2月15日(2021.2.15)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

ベラプロスト-314d・一水和物。

【請求項2】

結晶形である、請求項1に記載のベラプロスト-314d・一水和物。

【請求項3】

結晶形が、 $6.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $12.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $13.9 \pm 0.2^\circ$ 、 $16.9 \pm 0.2^\circ$ 、 $19.4 \pm 0.2^\circ$ 及び $21.6 \pm 0.2^\circ$ の2反射角で6つの最も強い特徴的なピークを示すX線粉末回折(XRPD)パターンを有するA型である、請求項2に記載のベラプロスト-314d・一水和物。

【請求項4】

XRPDパターンが、以下の2反射角： $8.8 \pm 0.2^\circ$ 、 $18.4 \pm 0.2^\circ$ 、 $18.9 \pm 0.2^\circ$ 、 $20.3 \pm 0.2^\circ$ 、 $21.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $21.8 \pm 0.2^\circ$ 、 $23.3 \pm 0.2^\circ$ 、 $24.9 \pm 0.2^\circ$ 及び $28.0 \pm 0.2^\circ$ に特徴的なピークをさらに含む、請求項3に記載のベラプロスト-314d・一水和物。

【請求項5】

50.5 ± 1 のピーク開始温度及び 55.4 ± 1 及び 63.0 ± 1 のピーク最大値を有する2つの吸熱ピークを含む示差走査熱量測定(DSC)サーモグラムパターンを有する、請求項3に記載のベラプロスト-314d・一水和物。

【請求項6】

結晶形が、以下の2反射角： $6.5 \pm 0.2^\circ$ 、 $13.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $18.2 \pm 0.2^\circ$ 、 $19.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $20.1 \pm 0.2^\circ$ 、及び $20.9 \pm 0.2^\circ$ でその6つの最も強い特徴的ピークを示すXRPDパターンを有するB型である、請求項2に記載のベラプロスト-314d・一水和物。

【請求項7】

XRPDパターンが、以下の2反射角： $8.7 \pm 0.2^\circ$ 、 $13.8 \pm 0.2^\circ$ 、 1

$5.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $15.9 \pm 0.2^\circ$ 、 $22.4 \pm 0.2^\circ$ 、 $23.7 \pm 0.2^\circ$ 、 $26.2 \pm 0.2^\circ$ 、 $27.5 \pm 0.2^\circ$ 及び $28.5 \pm 0.2^\circ$ における特徴的なピークをさらに含む、請求項6に記載のベラプロスト-314d・一水和物。

【請求項 8】

50.9 ± 1 のピーク開始温度及び 56.4 ± 1 及び 64.2 ± 1 のピーク最大を有する 2 つの吸熱ピークを含む DSC サーモグラムパターンを有する、請求項6に記載のベラプロスト-314d・一水和物。

【請求項 9】

結晶形が、以下からなる群から選択される、請求項 2 に記載のベラプロスト-314d・一水和物：

(a) $6.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $12.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $13.9 \pm 0.2^\circ$ 、 $16.9 \pm 0.2^\circ$ 、 $19.4 \pm 0.2^\circ$ 及び $21.6 \pm 0.2^\circ$ の 2 反射角で 6 つの最も強い特徴ピークを示す粉末 X 線回析 (XRPD) 図を有する A 型；

(b) $6.5 \pm 0.2^\circ$ 、 $13.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $18.2 \pm 0.2^\circ$ 、 $19.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $20.1 \pm 0.2^\circ$ 及び $20.9 \pm 0.2^\circ$ の 2 反射角で 6 つの最も強い特徴ピークを示す XRPD 図を有する B 型；及び

(c) これらの混合物。

【請求項 10】

結晶形が 30 ± 5 未満の温度で A 型であり、結晶が 30 ± 5 を超える温度で B 型である、請求項 9 に記載のベラプロスト-314d・一水和物。

【請求項 11】

以下の工程を含む、ベラプロスト-314d・一水和物結晶を調製するための方法：

ベラプロスト-314d を、メタノール、エタノール、プロパノール、ブタノール、アセトニトリル、テトラヒドロフラン、1,4-ジオキサン、ジメチルスルホキシド、ジメチルアセトアミド、ジメチルホルムアミド及びこれらの混合物からなる群より選択される第 1 の溶媒に溶解して、均一溶液を形成する工程；

温度を低下させ、及び / 又は第 2 の溶媒を添加し、ここで第 2 の溶媒は水であり、沈殿物が形成されるまで攪拌する工程。

【請求項 12】

以下の工程をさらに含む、請求項 11 に記載の方法：

第 2 の溶媒又は第 1 の溶媒と第 2 の溶媒との混合物を添加して沈殿物を洗浄する工程；沈殿物を濾過して除去し、場合により沈殿を乾燥させる工程。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0035

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0035】

本発明において、ベラプロスト-314d・一水和物の結晶形は、以下からなる群から選択される：

(a) $6.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $12.1 \pm 0.2^\circ$ 、 $13.9 \pm 0.2^\circ$ 、 $16.9 \pm 0.2^\circ$ 、 $19.4 \pm 0.2^\circ$ 及び $21.6 \pm 0.2^\circ$ の 2 反射角で 6 つの最も強い特徴ピークを示す粉末 X 線回析 (XRPD) 図を有する A 型；

(b) $6.5 \pm 0.2^\circ$ 、 $13.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $18.2 \pm 0.2^\circ$ 、 $19.0 \pm 0.2^\circ$ 、 $20.1 \pm 0.2^\circ$ 及び $20.9 \pm 0.2^\circ$ の 2 反射角で 6 つの最も強い特徴ピークを示す XRPD 図を有する B 型；及び

(c) これらの混合物。