

【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1月6日(2022.1.6)

【公表番号】特表2021-504310(P2021-504310A)

【公表日】令和3年2月15日(2021.2.15)

【年通号数】公開・登録公報2021-007

【出願番号】特願2020-526923(P2020-526923)

【国際特許分類】

C 0 7 D	401/14	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	31/04	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	7/04	(2006.01)
A 6 1 P	7/02	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	1/18	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	7/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 K	31/444	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D	401/14	C S P
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	31/04	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	7/04	
A 6 1 P	7/02	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	1/18	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	7/10	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 K	31/444	

【手続補正書】

【提出日】令和3年11月26日(2021.11.26)

【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

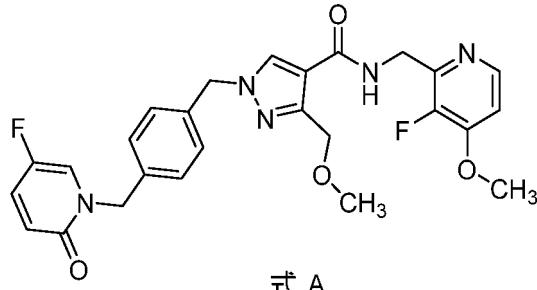
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

少なくとも以下の約10.4、15.6、16.7及び20.8における特性X線粉末回折ピーク(Cu K線、°2で表される)を示す、式A

【化1】



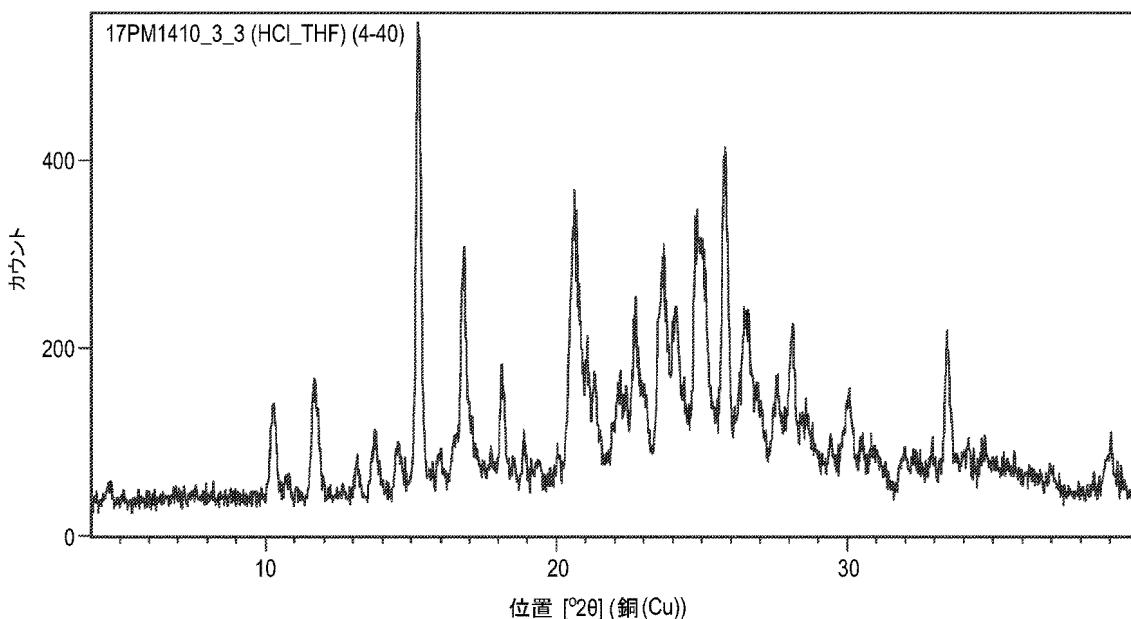
の化合物の塩酸塩の固体形態。

【請求項2】

図6:

【化2】

FIG. 6

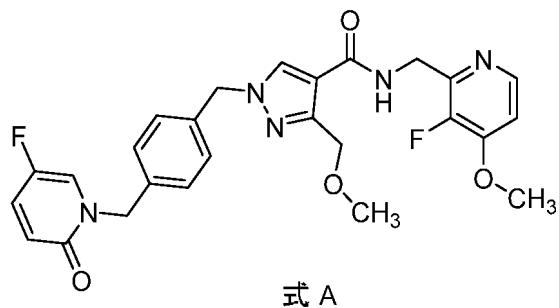


に示されるX線粉末回折パターンと実質的に同じX線粉末回折パターンを有する、請求項1に記載の固体形態。

【請求項3】

少なくとも以下の約11.6、14.7、18.1、20.1及び21.4における特性X線粉末回折ピーク(Cu K線、°2で表される)を示す、式A

【化 3】



式 A

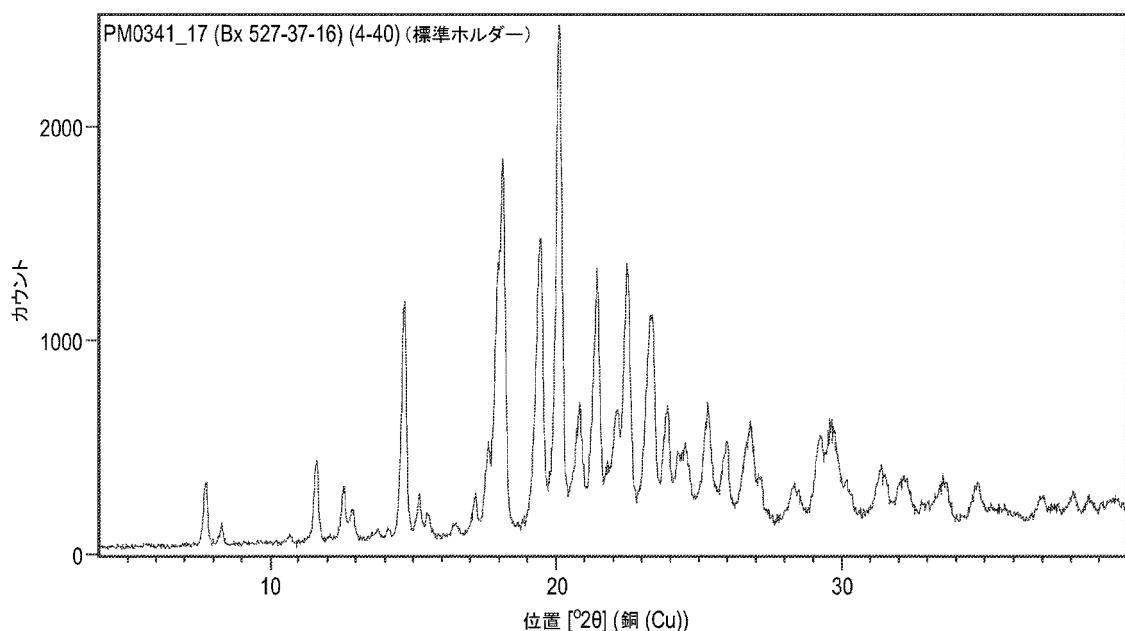
の化合物の固体形態。

【請求項 4】

・図 1 :

【化 4】

FIG. 1

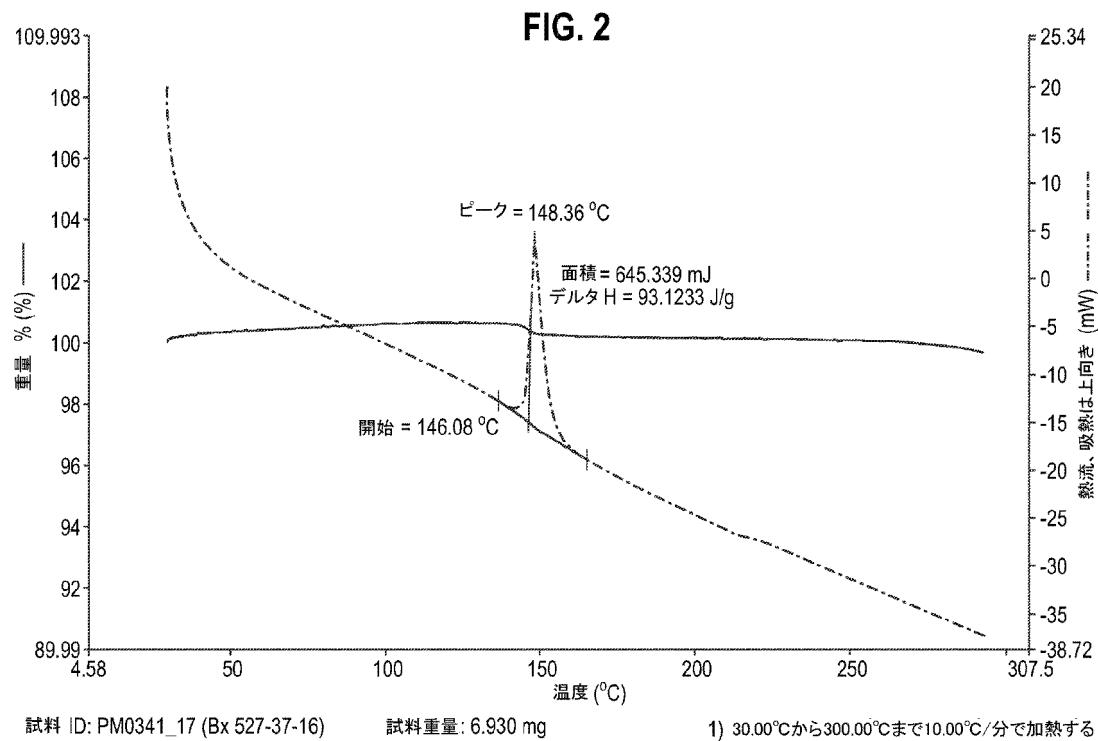


に示されるX線粉末回折パターンと実質的に同じX線粉末回折パターンを有する、

・STAサーモグラフにおいて 148 ± 3 に吸熱ピークを示す、及び／又は

・図 2 :

【化5】

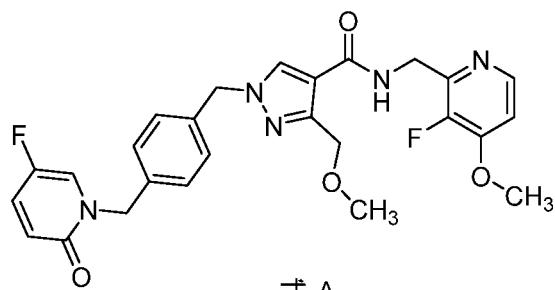


に示されるSTAサーモグラフと実質的に同じSTAサーモグラフを有する、請求項3に記載の固体形態。

【請求項5】

STAサーモグラフにおいて 148 ± 3 に吸熱ピークを示す、式A

【化6】

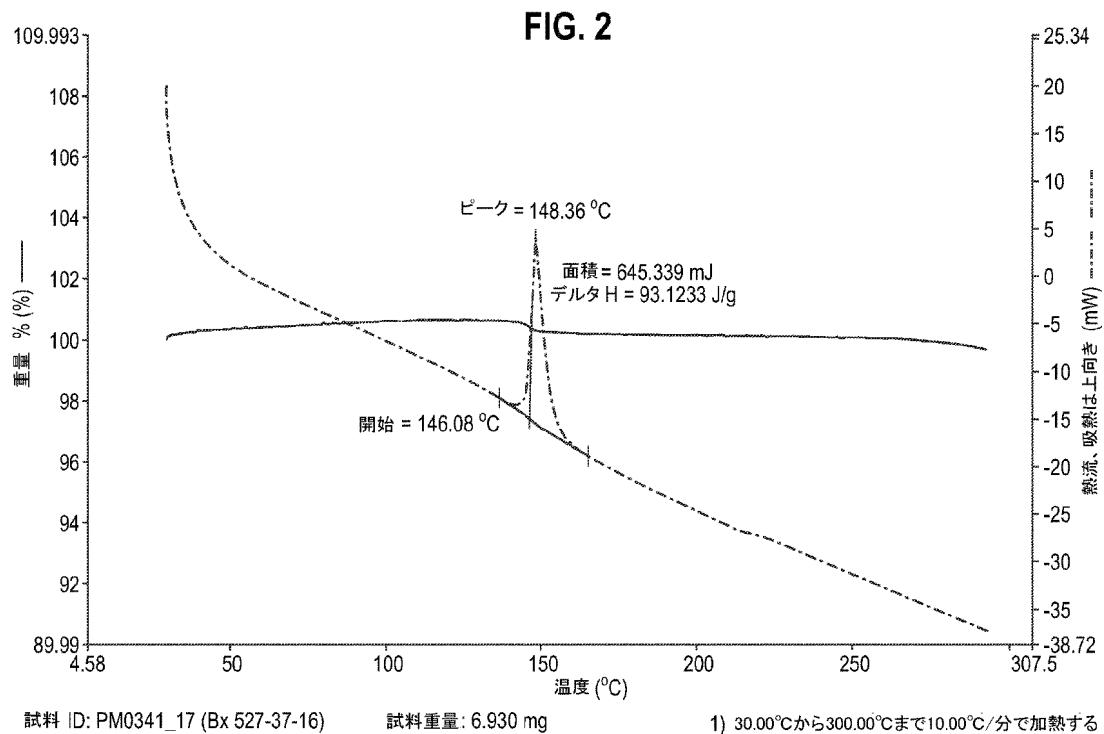


の化合物の固体形態。

【請求項6】

図2:

【化 7】

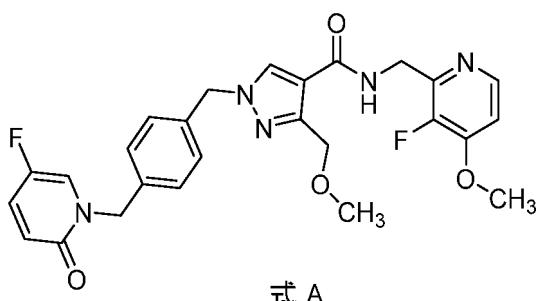


に示されるSTAサーモグラフと実質的に同じSTAサーモグラフを有する、請求項5に記載の固体形態。

【請求項7】

少なくとも以下の約5.7、9.9、13.0、15.0及び17.2における特性X線粉末回折ピーク(Cu K線、°2で表される)を示す、式A

【化8】



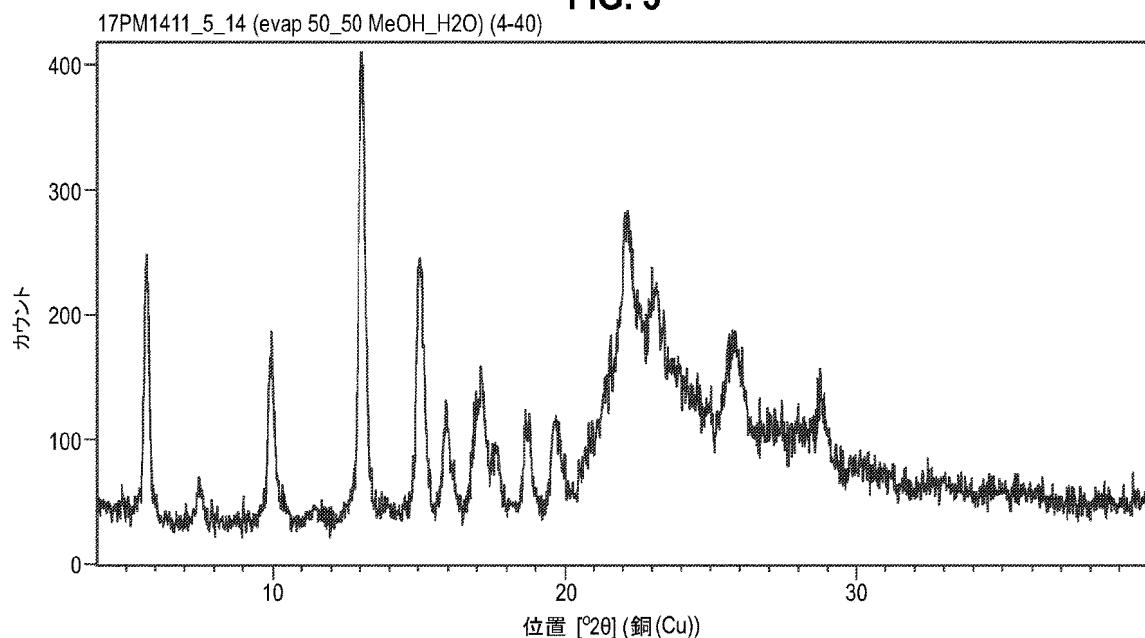
の化合物の固体形態。

【請求項8】

図3：

【化 9】

FIG. 3

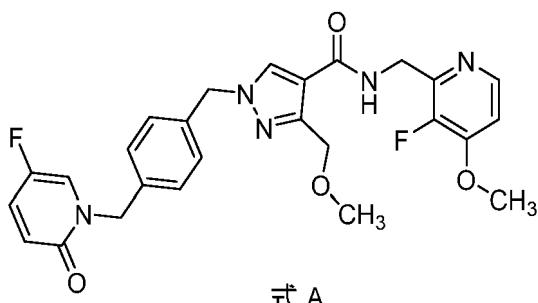


に示されるX線粉末回折パターンと実質的に同じX線粉末回折パターンを有する、請求項7に記載の固体形態。

【請求項 9】

少なくとも以下の約7.0、10.0、12.5、14.0、16.0及び18.0における特性X線粉末回折ピーク(Cu K線、°2で表される)を示す、式A

【化 10】



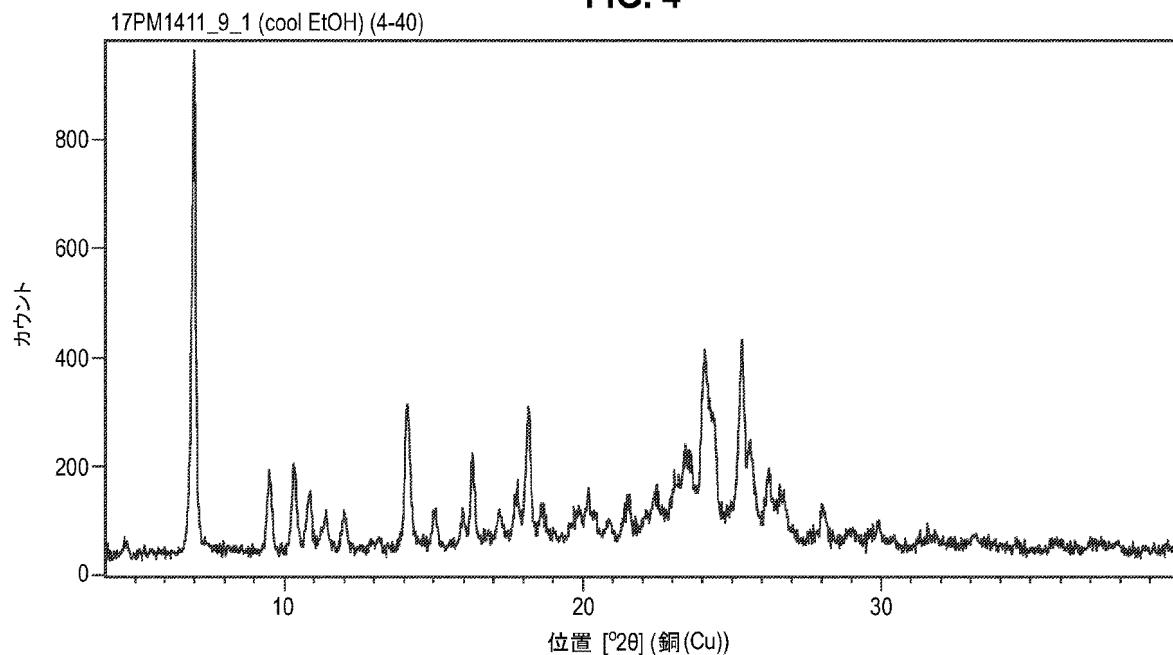
の化合物の固体形態。

【請求項 10】

図4：

【化11】

FIG. 4

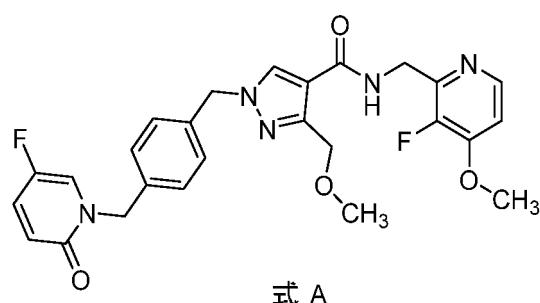


に示されるX線粉末回折パターンと実質的に同じX線粉末回折パターンを有する、請求項9に記載の固体形態。

【請求項11】

少なくとも以下の約4.8、9.5、11.0、14.3及び15.3における特性X線粉末回折ピーク(Cu K線、 $^{\circ}$ で表される)を示す、式A

【化12】



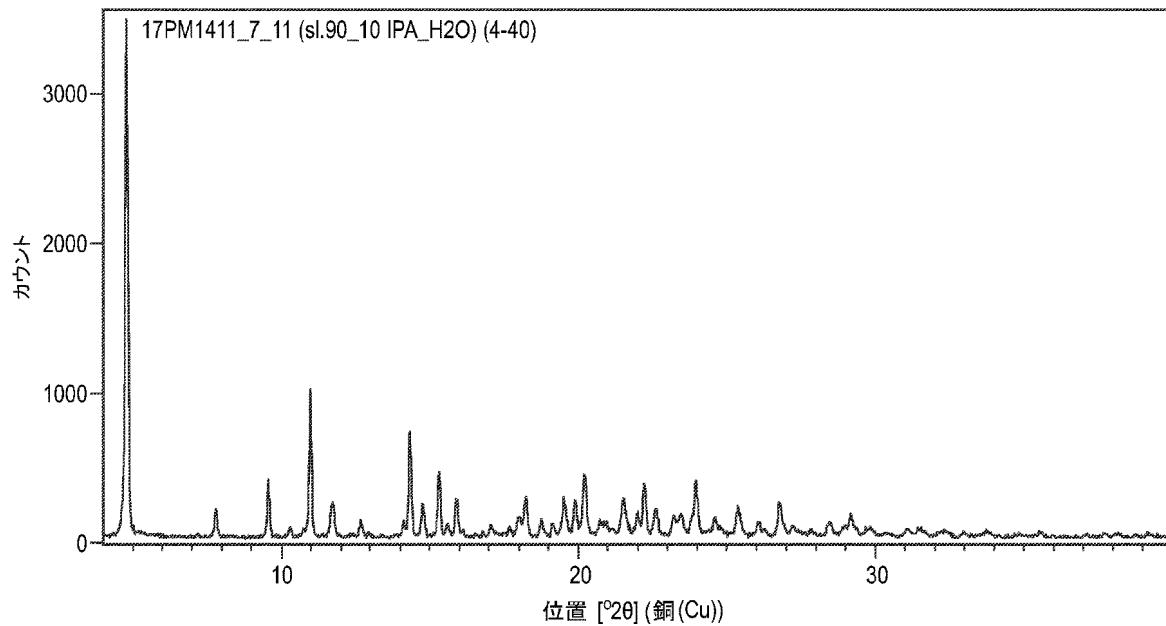
の化合物の固体形態。

【請求項12】

図5：

【化13】

FIG. 5



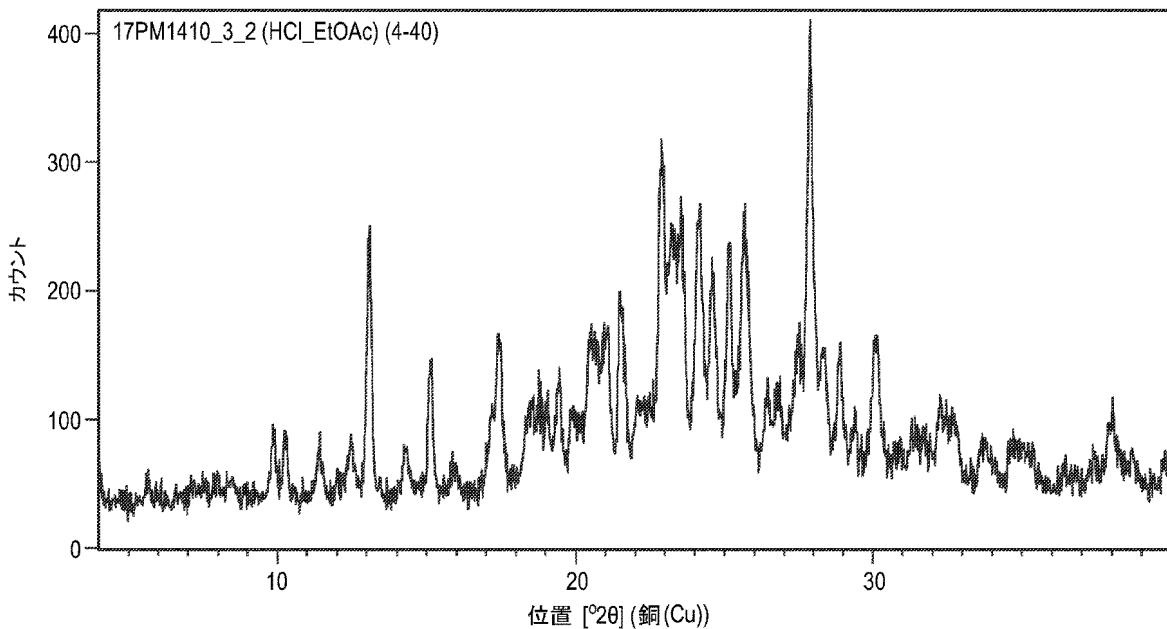
に示されるX線粉末回折パターンと実質的に同じX線粉末回折パターンを有する、請求項
1_1に記載の固体形態。

【請求項13】

図7：

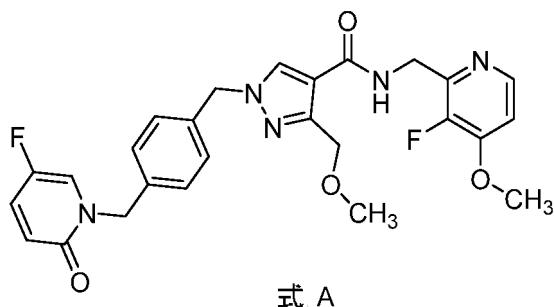
【化14】

FIG. 7



に示されるX線粉末回折パターンと実質的に同じX線粉末回折パターンを有する、式A

【化15】



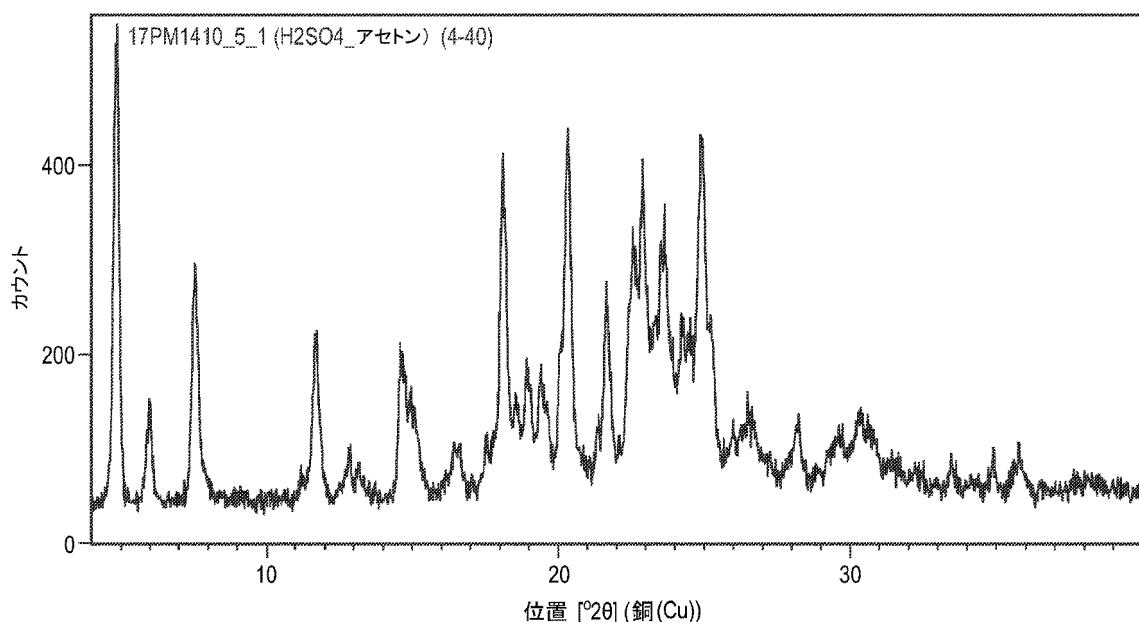
の化合物の塩酸塩の固体形態。

【請求項14】

図8：

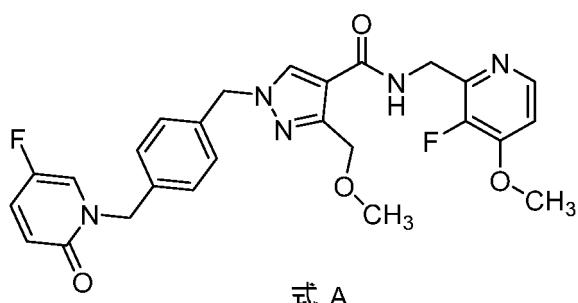
【化16】

FIG. 8



に示されるX線粉末回折パターンと実質的に同じX線粉末回折パターンを有する、式A

【化17】



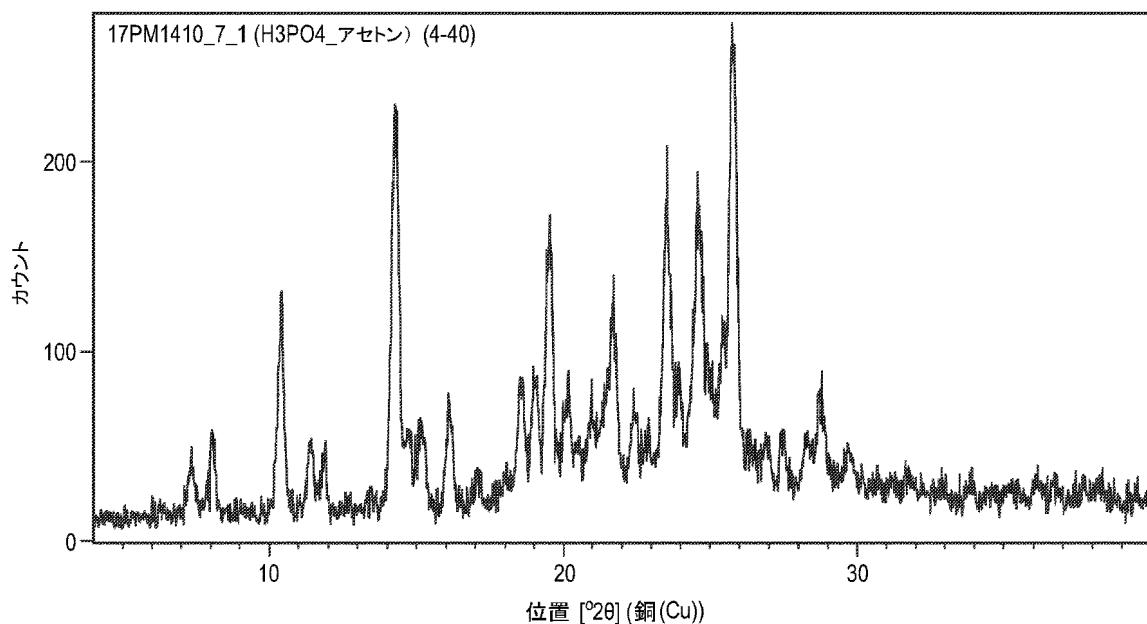
の化合物の硫酸塩の固体形態。

【請求項15】

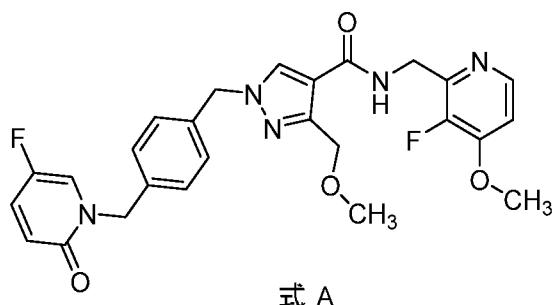
図9：

【化18】

FIG. 9



に示される X 線粉末回折パターンと実質的に同じ X 線粉末回折パターンを有する、式 A
【化19】



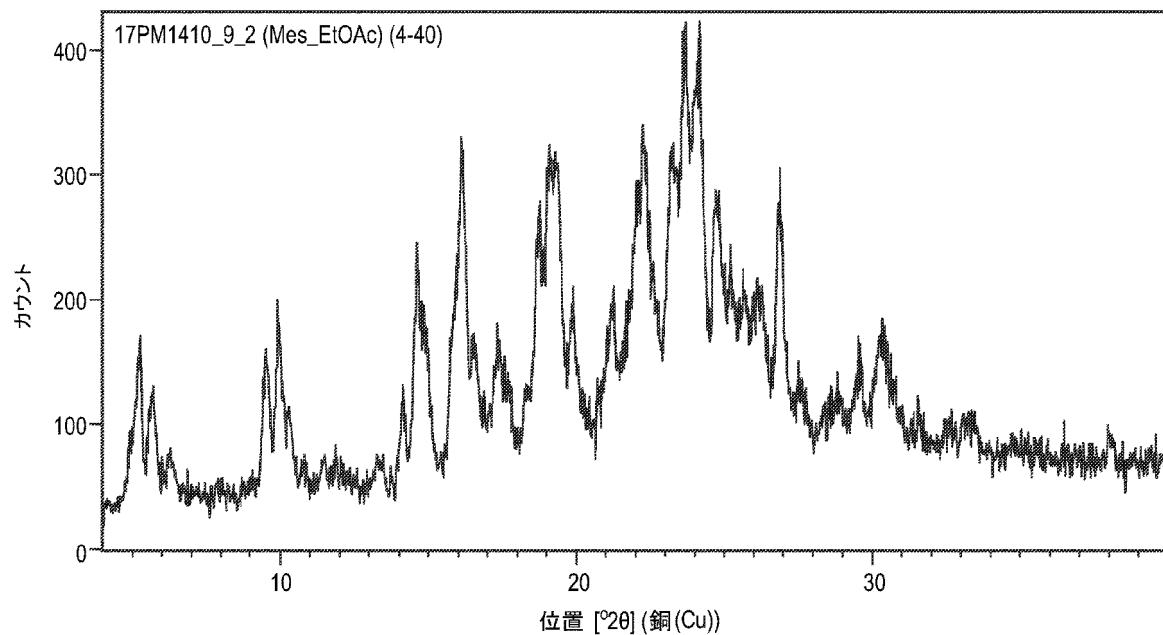
の化合物のリン酸塩の固体形態。

【請求項 1 6】

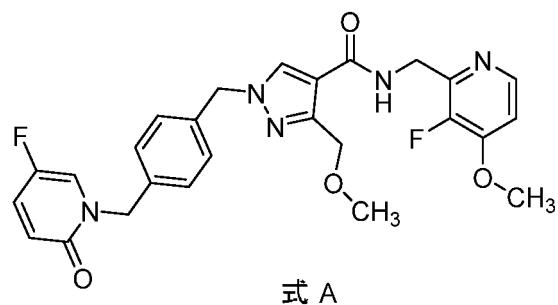
図 1 0 :

【化 2 0】

FIG. 10



に示される X 線粉末回折パターンと実質的に同じ X 線粉末回折パターンを有する、式 A
【化 2 1】



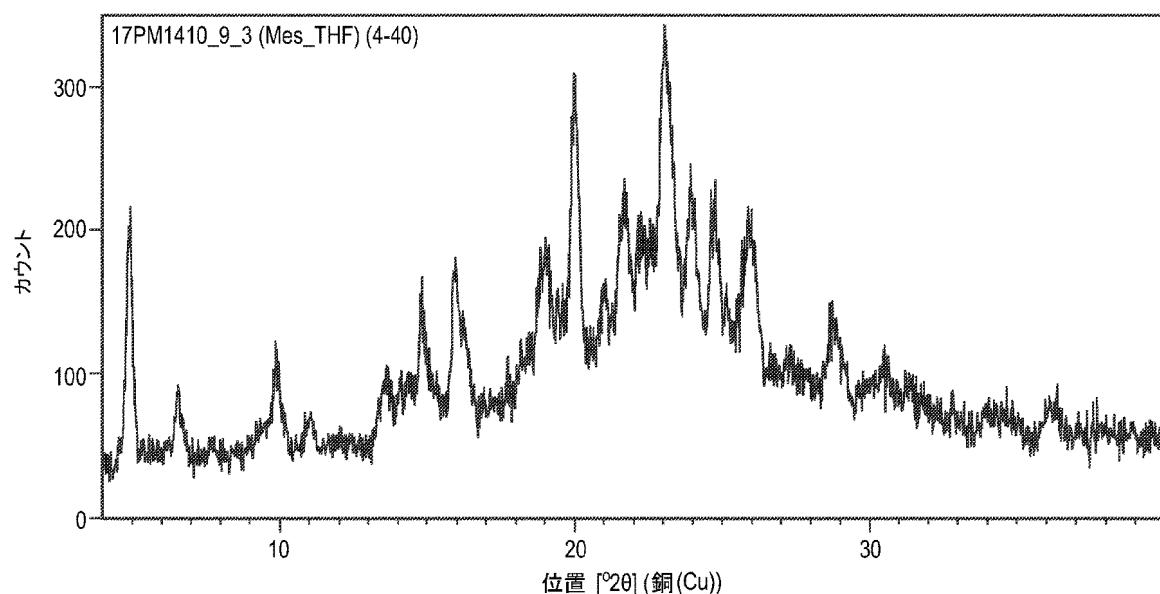
の化合物のメシリ酸塩の固体形態。

【請求項 1 7】

図 1 1 :

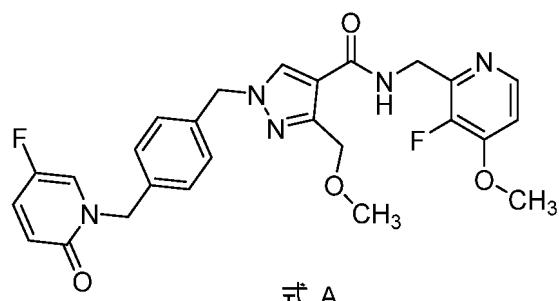
【化 2 2】

FIG. 11



に示されるX線粉末回折パターンと実質的に同じX線粉末回折パターンを有する、式A

【化 2 3】



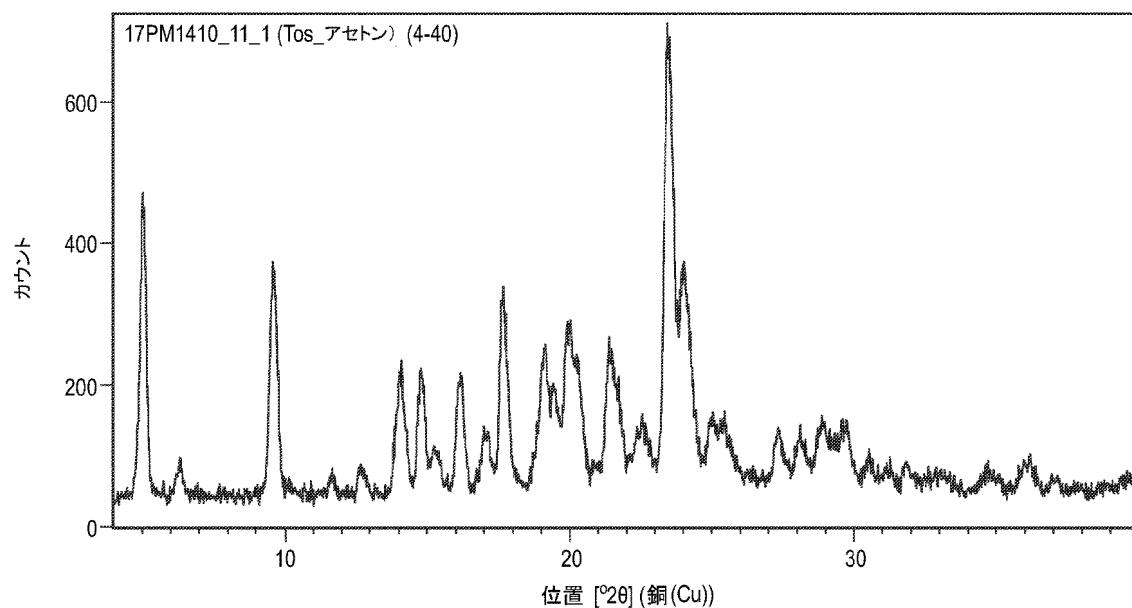
の化合物のメシリ酸塩の固体形態。

【請求項 1 8】

図 1 2 :

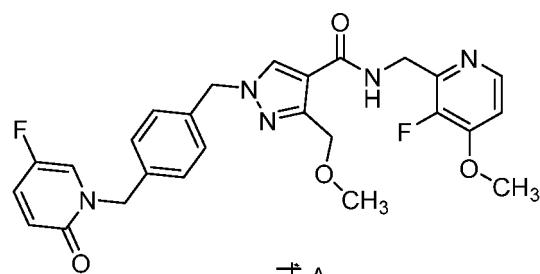
【化 2 4】

FIG. 12



に示される X 線粉末回折パターンと実質的に同じ X 線粉末回折パターンを有する、式 A

【化 2 5】



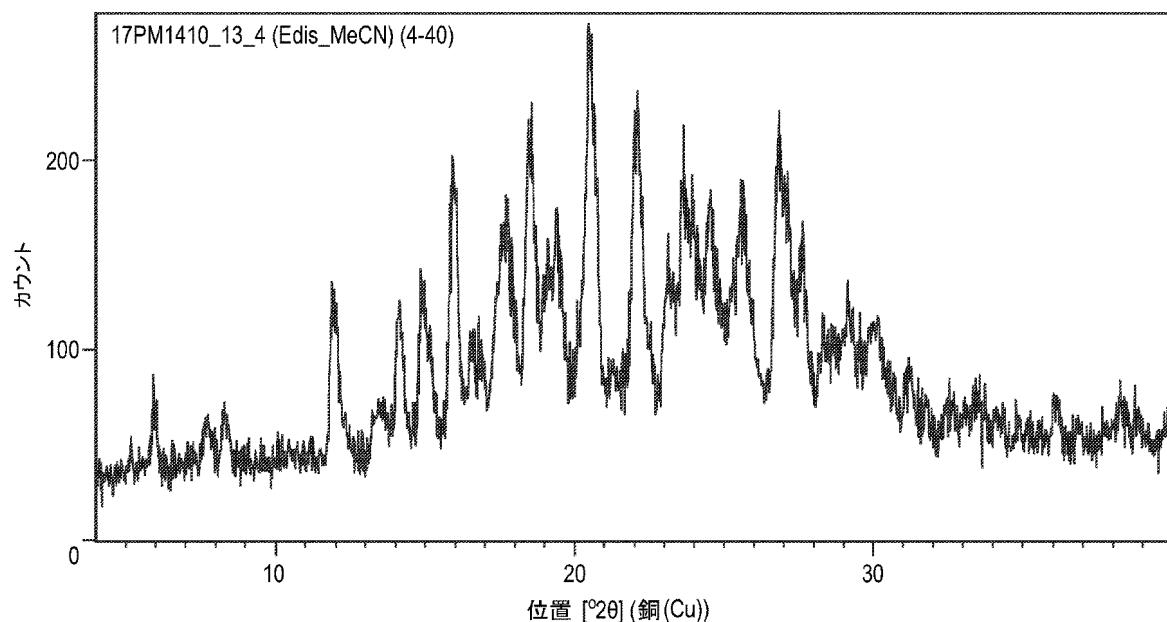
の化合物のトシリル酸塩の固体形態。

【請求項 1 9】

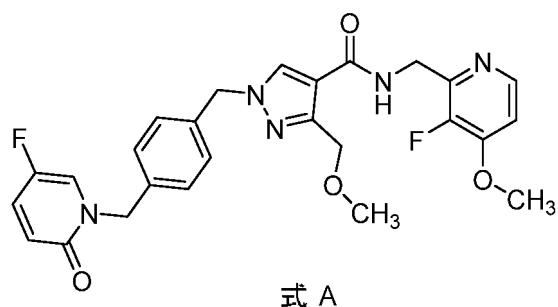
図 1 3 :

【化 2 6】

FIG. 13



に示される X 線粉末回折パターンと実質的に同じ X 線粉末回折パターンを有する、式 A
【化 2 7】



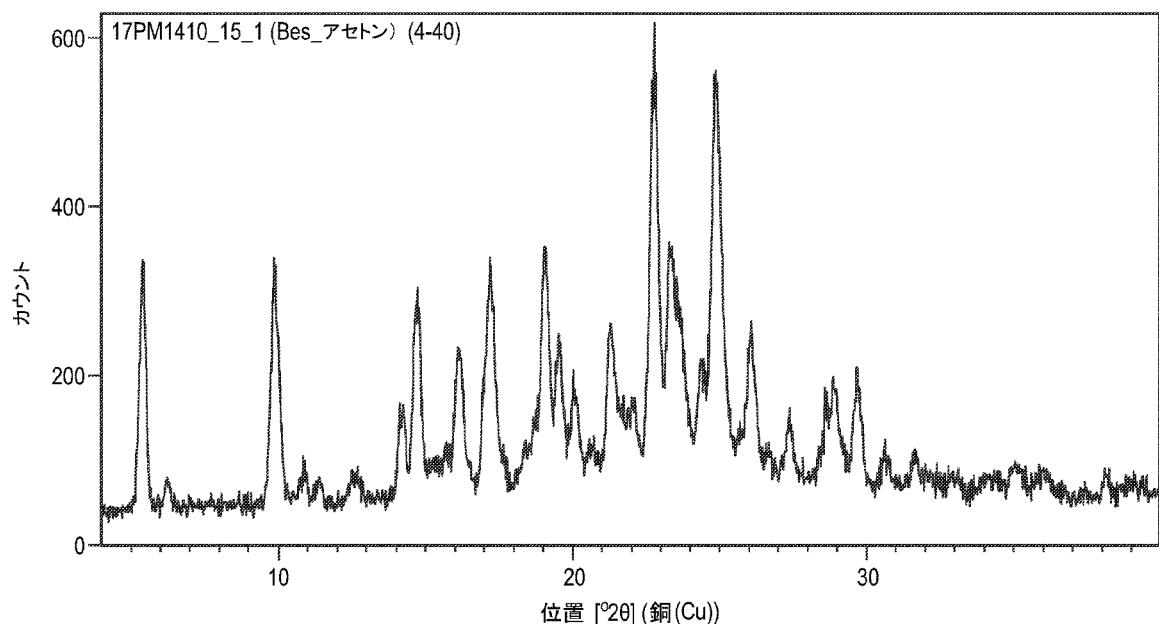
の化合物のエジシル酸塩の固体形態。

【請求項 2 0】

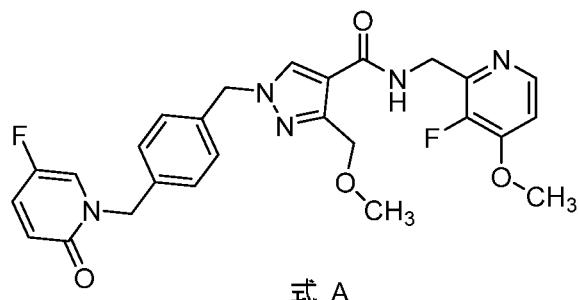
図 1 4 :

【化 2 8】

FIG. 14



に示されるX線粉末回折パターンと実質的に同じX線粉末回折パターンを有する、式A
【化 2 9】

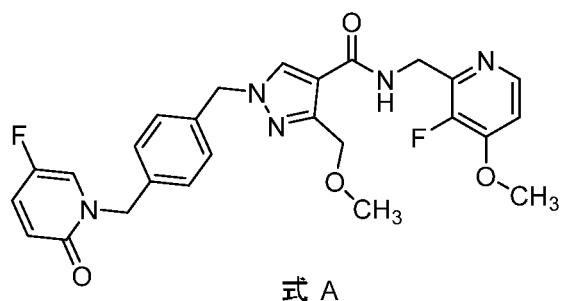


の化合物のベシル酸塩の固体形態。

【請求項 2 1】

少なくとも以下の約9.6、13.2、15.4、18.0及び20.7における特性X線粉末回折ピーク(Cu K線、°2θで表される)を示す、式A

【化 3 0】



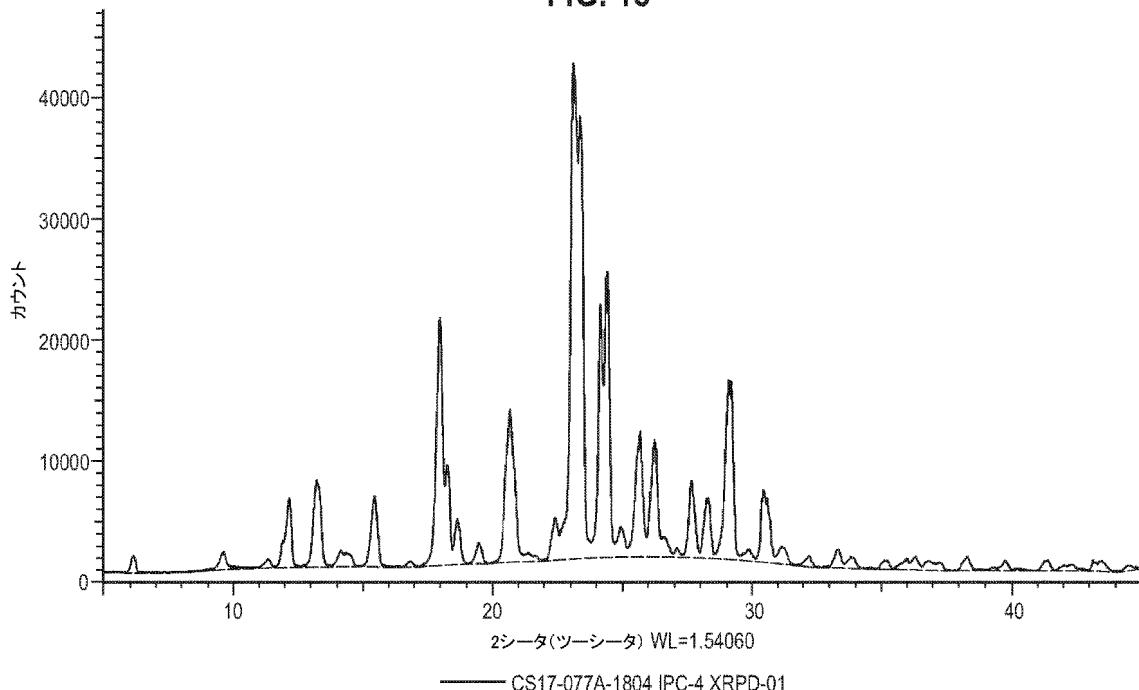
の化合物の固体形態。

【請求項 2 2】

- ・図15：

【化31】

FIG. 15



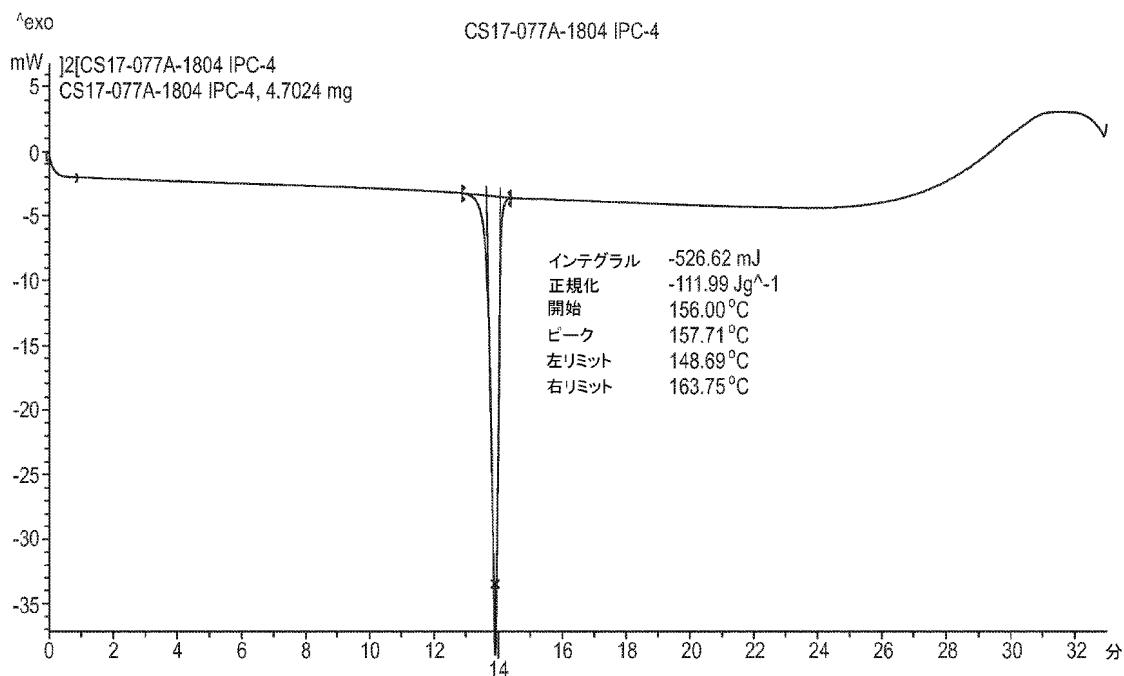
に示されるX線粉末回折パターンと実質的に同じX線粉末回折パターンを有する、

・ D S C サーモグラフにおいて 158 ± 3 に吸熱ピークを示す、及び / 又は

・ 図16：

【化32】

FIG. 16

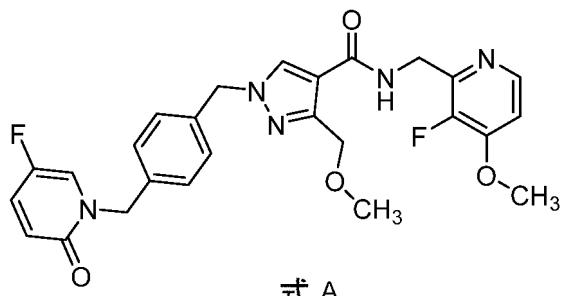


に示されるD S C サーモグラフと実質的に同じD S C サーモグラフを有する、請求項21に記載の固体形態。

【請求項23】

少なくとも以下の約 10.0、10.7、12.4、13.9 及び 16.6 における特性 X 線粉末回折ピーク (Cu K 線、°2 で表される) を示す、式 A

【化 3 3】



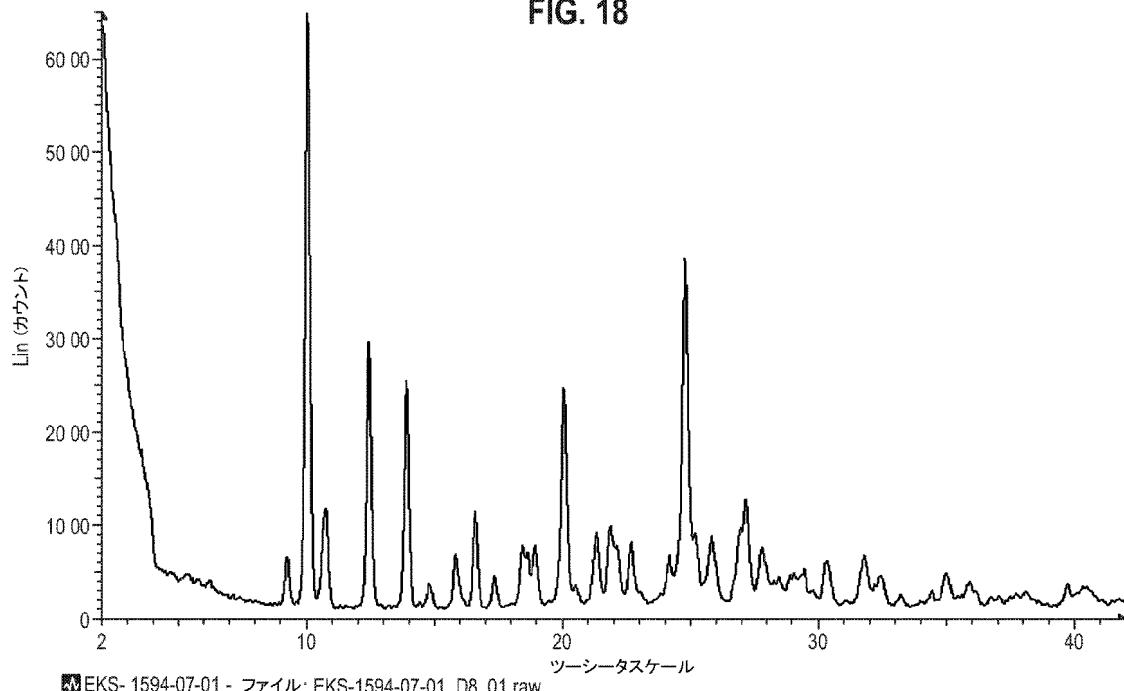
の化合物の塩酸塩の固体形態。

【請求項 2 4】

・図 18 :

【化 3 4】

FIG. 18



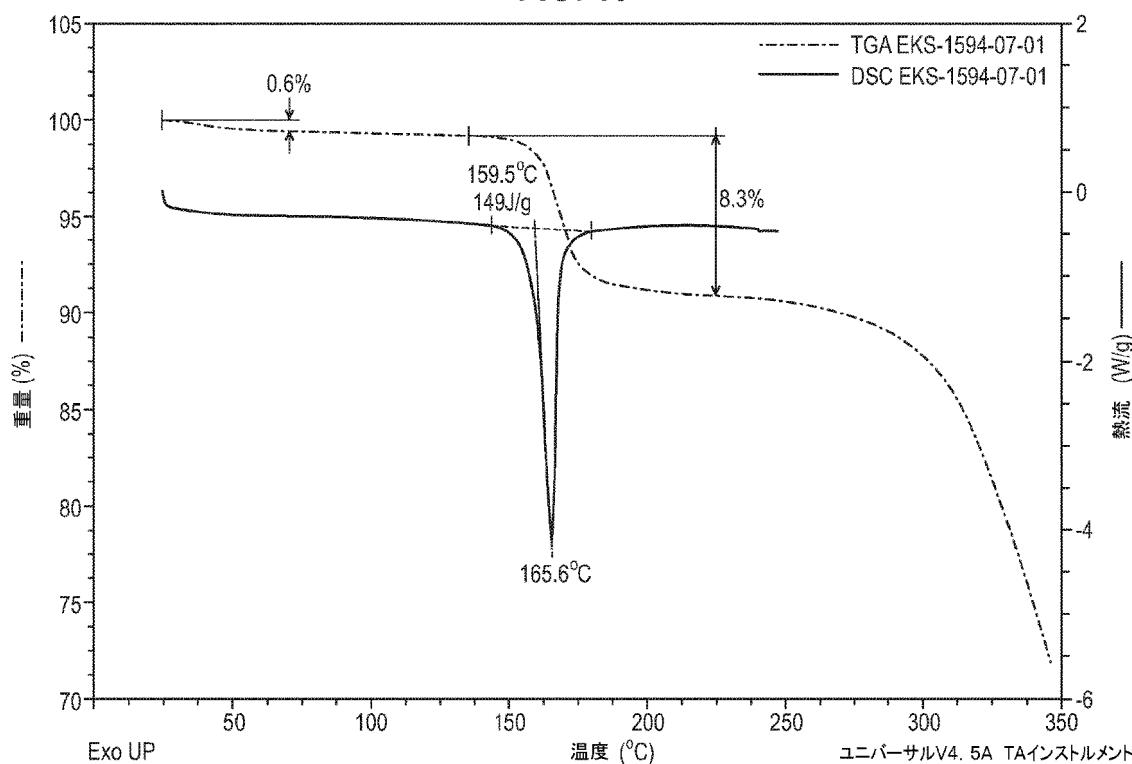
に示される X 線粉末回折パターンと実質的に同じ X 線粉末回折パターンを有する、

・ D S C サーモグラフにおいて 166 ± 3 に吸熱ピークを示す、及び / 又は

・図 19 :

【化35】

FIG. 19



に示される TGA / DSC サーモグラフと実質的に同じ TGA / DSC サーモグラフを有する、請求項 23 に記載の固体形態。

【請求項 25】

請求項 1 ~ 24 のいずれか一項に記載の固体形態並びに薬学的に許容される補助剤、希釈剤及び / 又は担体を含む医薬組成物。

【請求項 26】

血漿カリクレインにより媒介される疾患又は状態の処置方法において使用するための医薬組成物であって、請求項 1 ~ 24 のいずれか一項に記載の固体形態を含み、当該方法が、そのような処置を必要とする哺乳動物に、治療有効量の、請求項 1 ~ 24 のいずれか一項に記載の固体形態を投与することを含む、医薬組成物。

【請求項 27】

前記血漿カリクレインにより媒介される疾患又は状態が、視力障害、糖尿病性網膜症、糖尿病性網膜症に伴う網膜血管透過性、糖尿病黄斑浮腫、遺伝性血管性浮腫、網膜静脈閉塞症、糖尿病、肺炎、脳出血、腎症、心筋症、神経障害、炎症性腸疾患、関節炎、炎症、敗血症性ショック、低血圧症、がん、成人呼吸促迫症候群、播種性血管内凝固、心肺バイパス手術中の血管凝固及び外科術後の出血から選択される、請求項 26 に記載の医薬組成物。

【請求項 28】

前記血漿カリクレインにより媒介される疾患又は状態が、糖尿病性網膜症に伴う網膜血管透過性、糖尿病黄斑浮腫及び遺伝性血管性浮腫から選択される、請求項 26 に記載の医薬組成物。

【請求項 29】

前記血漿カリクレインにより媒介される疾患又は状態が、糖尿病性網膜症に伴う網膜血管透過性及び糖尿病黄斑浮腫から選択される、請求項 26 に記載の医薬組成物。

【請求項 30】

前記血漿カリクレインにより媒介される疾患又は状態が、遺伝性血管性浮腫である、請

求項 2 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 1】

前記血漿カリクレインにより媒介される疾患又は状態が、糖尿病黄斑浮腫である、請求項 2 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 2】

前記固体形態が、患者の眼球領域中への注射に適した形態で投与される、請求項 2 9 又は 3 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 3】

前記固体形態が、硝子体内注射に適した形態で投与される、請求項 3 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 3 4】

請求項 3 ~ 6 又は 2 1 ~ 2 2 のいずれか一項に記載の固体形態の調製のための方法であって、式 A の化合物と溶媒又は溶媒の混合物との混合物から前記固体形態を結晶化することを含む方法。

【請求項 3 5】

(a) 前記溶媒又は溶媒の混合物がイソプロパノールを含む、又は

(b) 前記溶媒がイソプロパノールである、又は

(c) 前記溶媒又は溶媒の混合物がアセトニトリルを含む、又は

(d) 前記溶媒がアセトニトリルである、請求項 3 4 に記載の方法。

【請求項 3 6】

前記混合物が約 60 ~ 85 の温度に加熱される、請求項 3 4 ~ 3 5 のいずれか一項に記載の方法。

【請求項 3 7】

加熱後、前記混合物が約 0 ~ 40 の温度に冷却される、請求項 3 6 に記載の方法。

【請求項 3 8】

請求項 1 ~ 2 、 1 3 及び 2 3 ~ 2 4 のいずれか一項に記載の固体形態の調製のための方法であって、溶媒又は溶媒の混合物中の式 A の化合物の塩酸塩の溶液から前記固体形態を結晶化することを含む方法。

【請求項 3 9】

前記溶媒又は溶媒の混合物が、

(a) メタノール、エタノール、イソプロパノール、アセトン、メチルエチルケトン、テトラヒドロフラン及びアセトニトリルからなる群から選択される溶媒、又は

(b) メタノール、エタノール、イソプロパノール及びアセトニトリルからなる群から選択される溶媒を含む、請求項 3 8 に記載の方法。