

【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 1 月 7 日 (2021.1.7)

【公開番号】特開 2020-138960 (P2020-138960A)

【公開日】令和 2 年 9 月 3 日 (2020.9.3)

【年通号数】公開・登録公報 2020-036

【出願番号】特願 2020-21119 (P2020-21119)

【国際特許分類】

C 07 D 487/08 (2006.01)

A 61 K 31/4995 (2006.01)

A 61 P 17/02 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 P 17/00 (2006.01)

A 61 P 17/14 (2006.01)

A 61 P 37/08 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 487/08 C S P

A 61 K 31/4995

A 61 P 17/02

A 61 P 19/02

A 61 P 29/00 1 0 1

A 61 P 1/04

A 61 P 17/00

A 61 P 17/14

A 61 P 37/08

A 61 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 11 月 17 日 (2020.11.17)

【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】

((S) - 2 , 2 - ジフルオロシクロプロピル) ((1 R , 5 S) - 3 - (2 - ((1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) アミノ) ピリミジン - 4 - イル) - 3 , 8 - ジアザビシクロ [3 . 2 . 1] オクタン - 8 - イル) メタノンの結晶形態。

【請求項 2】

2 に関して、5 . 0、9 . 9、および 15 . 3 ° 2 ± 0 . 2 ° 2 でのピークを含む粉末 X 線回折パターンによって特徴付けられる、請求項 1 に記載の結晶形態。

【請求項 3】

2 に関して、5 . 0、9 . 9、15 . 3、および 19 . 7 ° 2 ± 0 . 2 ° 2 でのピークを含む粉末 X 線回折パターンによって特徴付けられる、請求項 1 に記載の結晶形態。

【請求項 4】

2 に関して、 5.0 、 9.9 、 15.3 、 16.8 および $19.7^\circ 2 \pm 0.2^\circ$ でのピークを含む粉末 X 線回折パターンによって特徴付けられる、請求項 1 に記載の結晶形態。

【請求項 5】

前記形態が、非吸湿性および無水である、請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の結晶形態。

【請求項 6】

前記形態が、実質的に純粋である、請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の結晶形態。

【請求項 7】

54.6 、 129.8 、および $124.9 \text{ ppm} \pm 0.2 \text{ ppm}$ からなる群から選択される固体 ^{13}C 核磁気共鳴化学シフトによって特徴付けられる、請求項 1 に記載の結晶形態。

【請求項 8】

1578 、 1605 、および $1566 \text{ cm}^{-1} \pm 2 \text{ cm}^{-1}$ での一組のラマンバンドによって特徴付けられる、請求項 1 に記載の結晶形態。

【請求項 9】

2 に関して、 5.0 、 9.9 、および $15.3^\circ 2 \pm 0.2^\circ 2$ でのピークを含む粉末 X 線回折パターン、ならびに 54.6 および $129 \text{ ppm} \pm 0.2 \text{ ppm}$ からなる群から選択される固体 ^{13}C 核磁気共鳴化学シフトによって特徴付けられる、請求項 1 に記載の結晶形態。

【請求項 10】

2 に関して、 5.0 、 9.9 、および $15.3^\circ 2 \pm 0.2^\circ 2$ でのピークを含む粉末 X 線回折パターン、ならびに $1578 \text{ cm}^{-1} \pm 2 \text{ cm}^{-1}$ での一組のラマンバンドによって特徴付けられる、請求項 1 に記載の結晶形態。

【請求項 11】

$1578 \text{ cm}^{-1} \pm 2 \text{ cm}^{-1}$ での一組のラマンバンド、ならびに 54.6 および $129 \text{ ppm} \pm 0.2 \text{ ppm}$ からなる群から選択される固体 ^{13}C 核磁気共鳴化学シフトによって特徴付けられる、請求項 1 に記載の結晶形態。

【請求項 12】

請求項 1 から 11 のいずれか一項に記載の結晶形態および薬学的に許容できる担体を含む、医薬組成物。

【請求項 13】

クリーム、経皮パッチ、軟膏、点眼薬、ローションおよびゲルから選択される局所製剤を含む、請求項 12 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

局所製剤が、約 0.1% ~ 約 5.0% (w/v) の結晶性 ($(S)-2$, 2 -ジフルオロシクロプロピル) - ($(1R, 5S)-3$ - (2 - (1 -メチル- $1H$ -ピラゾール- 4 -イル)アミノ) - ピリミジン- 4 -イル) - 3 , 8 -ジアザビシクロ[$3.2.1$]オクタン- 8 -イル)メタノンを含む、請求項 13 に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

狼瘡、リウマチ様関節炎、IBD、潰瘍性大腸炎、クローン病、白斑、脱毛症、乾癬、乾癬性関節炎、およびアトピー性皮膚炎からなる群から選択される疾患の治療のための、治療有効量の請求項 1 から 11 のいずれか一項に記載の結晶形態を含む、医薬組成物。

【請求項 16】

局所投与モードによって、白斑、脱毛症、乾癬およびアトピー性皮膚炎からなる群から選択される疾患を治療するための、治療有効量の請求項 1 から 11 のいずれか一項に記載の結晶形態を含む医薬組成物。

【請求項 17】

医薬品として使用するための、請求項 1 から 11 のいずれか一項に記載の結晶形態。

【請求項 18】

狼瘡、リウマチ様関節炎、IBD、潰瘍性大腸炎、クローン病、白斑、脱毛症、乾癬、乾癬性関節炎およびアトピー性皮膚炎からなる群から選択される、障害の治療に使用するための、請求項 1 から 11 のいずれか一項に記載の結晶形態。

【請求項 19】

狼瘡、リウマチ様関節炎、IBD、潰瘍性大腸炎、クローン病、白斑、脱毛症、乾癬、乾癬性関節炎およびアトピー性皮膚炎からなる群から選択される障害を治療するための医薬品を調製するための、請求項 1 から 11 のいずれか一項に記載の結晶形態の使用。

【請求項 20】

((2, 2 - ジフルオロシクロプロピル) - ((1R, 5S) - 3 - (2 - ((1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - イル) アミノ) - ピリミジン - 4 - イル) - 3, 8 - ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン - 8 - イル) メタノン) を適切な溶媒から再結晶化させることによって調製した、((S) - 2, 2 - ジフルオロシクロプロピル) ((1R, 5S) - 3 - (2 - ((1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - イル) アミノ) - ピリミジン - 4 - イル) - 3, 8 - ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン - 8 - イル) - メタノンの結晶形態。

【請求項 21】

その結晶形態を、経皮投与に適した賦形剤と組み合わせることによって調製した、((S) - 2, 2 - ジフルオロシクロプロピル) ((1R, 5S) - 3 - (2 - ((1 - メチル - 1H - ピラゾール - 4 - イル) アミノ) - ピリミジン - 4 - イル) - 3, 8 - ジアザビシクロ[3.2.1]オクタン - 8 - イル) メタノンの局所製剤。