

【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1年10月10日(2019.10.10)

【公開番号】特開2019-142930(P2019-142930A)

【公開日】令和1年8月29日(2019.8.29)

【年通号数】公開・登録公報2019-035

【出願番号】特願2019-82794(P2019-82794)

【国際特許分類】

C 07 D 401/14 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 35/02 (2006.01)

A 61 K 31/444 (2006.01)

A 61 K 9/20 (2006.01)

【F I】

C 07 D 401/14 C S P

A 61 P 35/00

A 61 P 35/02

A 61 K 31/444

A 61 K 9/20

【手続補正書】

【提出日】令和1年7月31日(2019.7.31)

【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】

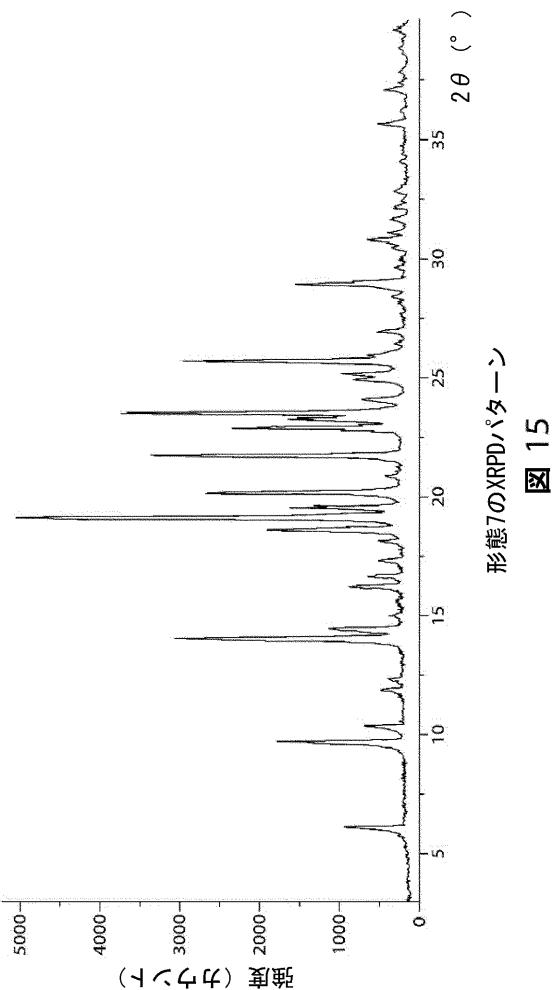
【請求項1】

2-メチル-1-[(4-[6-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]-6-{[2-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル]アミノ}-1,3,5-トリアジン-2-イル)アミノ]プロパン-2-オールメタノスルホナートの単離された結晶形であって、14.1、19.1、21.8、23.5、及び25.7°±0.2°の2角度でピークを有するX線粉末回折パターンを特徴とする、前記単離された結晶形。

【請求項2】

図15に示すX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項1記載の単離された結晶形：

【化1】



形態7のXRPDパターン
図15

。 【請求項3】

2-メチル-1-[(4-[6-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]-6-{[2-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル]アミノ}-1,3,5-トリアジン-2-イル)アミノ]プロパン-2-オールメタансルホナートの単離された結晶形であって、9.0、9.2、21.9、22.1、24.2、及び24.6°±0.2°の2角度でピークを有するX線粉末回折パターンを特徴とする、前記単離された結晶形。

【請求項4】

図17に示すX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項3記載の単離された結晶形：

【化2】

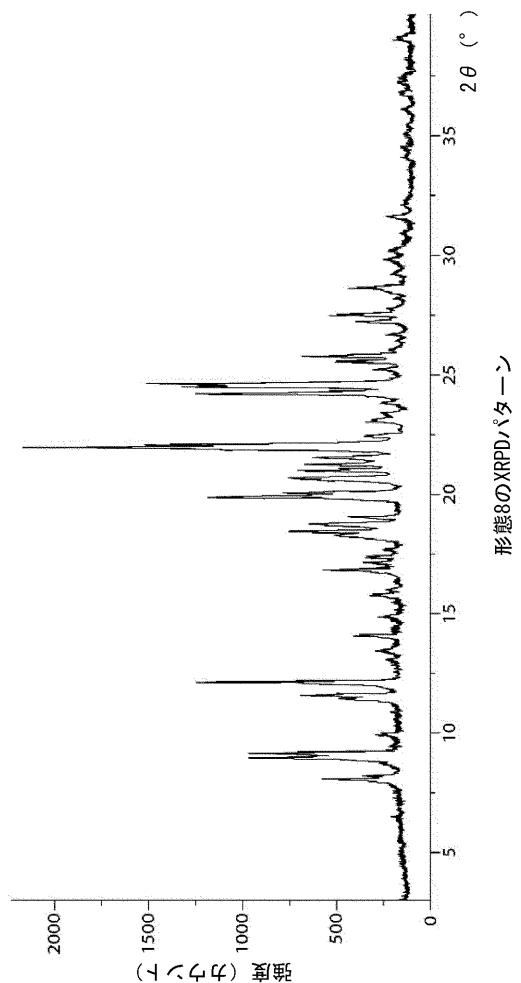


図 17

形態8のXRDパターン

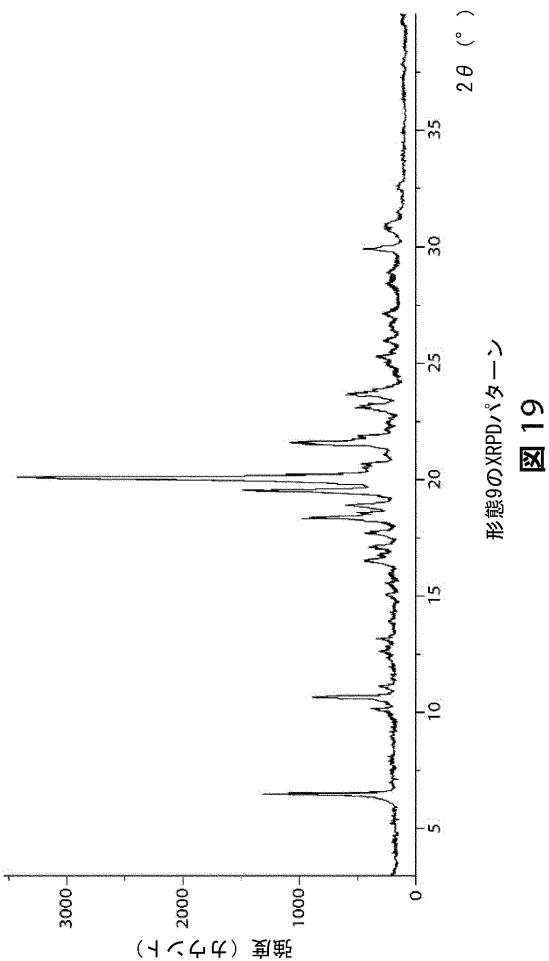
【請求項5】

2-メチル-1-[(4-[6-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]-6-{[2-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル]アミノ}-1,3,5-トリアジン-2-イル)アミノ]プロパン-2-オールメタノスルホナートの単離された結晶形であって、6.5、19.6、20.1、及び $21.6^\circ \pm 0.2^\circ$ の2角度でピークを有するX線粉末回折パターンを特徴とする、前記単離された結晶形。

【請求項6】

図19に示すX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項5記載の単離された結晶形：

【化3】



形態9のXRDパターン
図19

。

【請求項7】

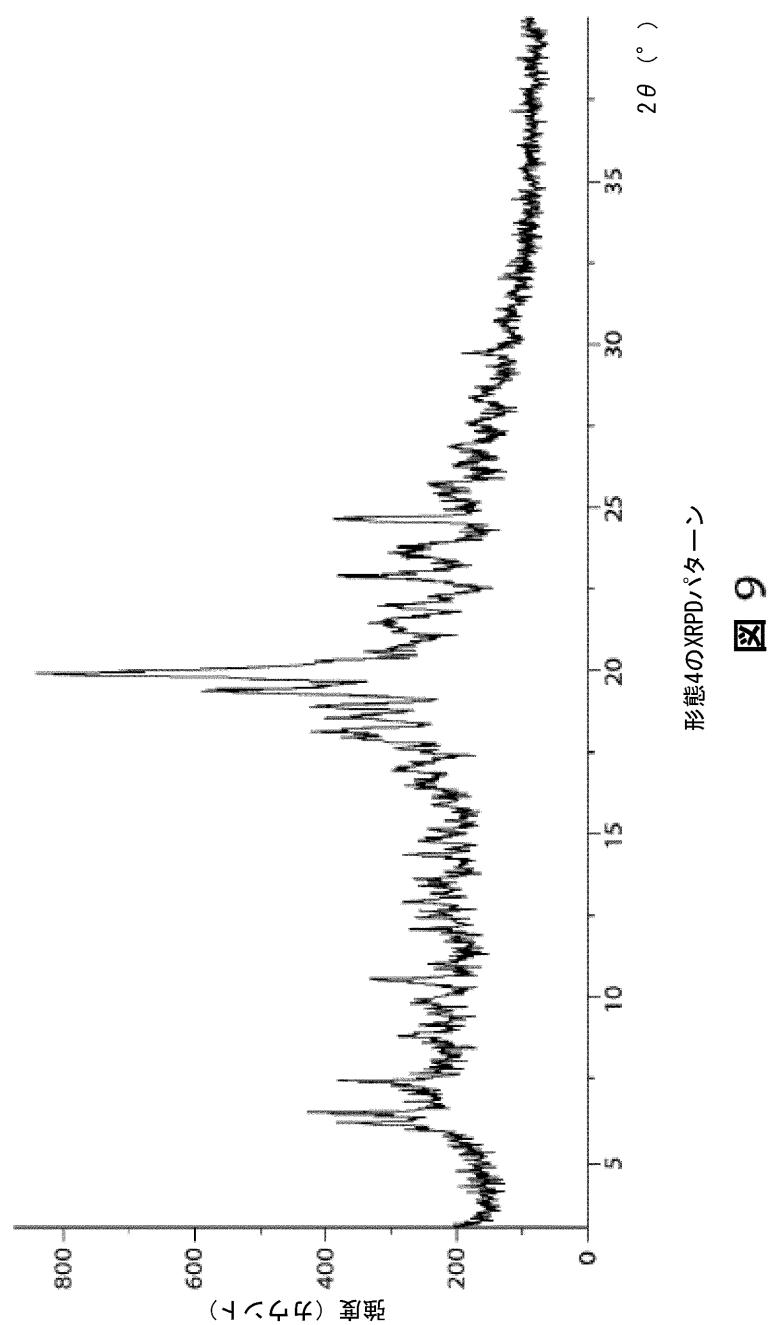
2-メチル-1-[(4-[6-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]-6-{[2-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル]アミノ}-1,3,5-トリアジン-2-イル)アミノ]プロパン-2-オールメタансルホナートの単離された結晶形であって、6.5、19.0、19.4、19.9、及び $24.7^\circ \pm 0.2^\circ$ の2角度でピークを有するX線粉末回折パターンを特徴とする、前記単離された結晶形。

。

【請求項8】

図9に示すX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項7記載の単離された結晶形：

【化4】



形態4のXRDパターン

図9

。

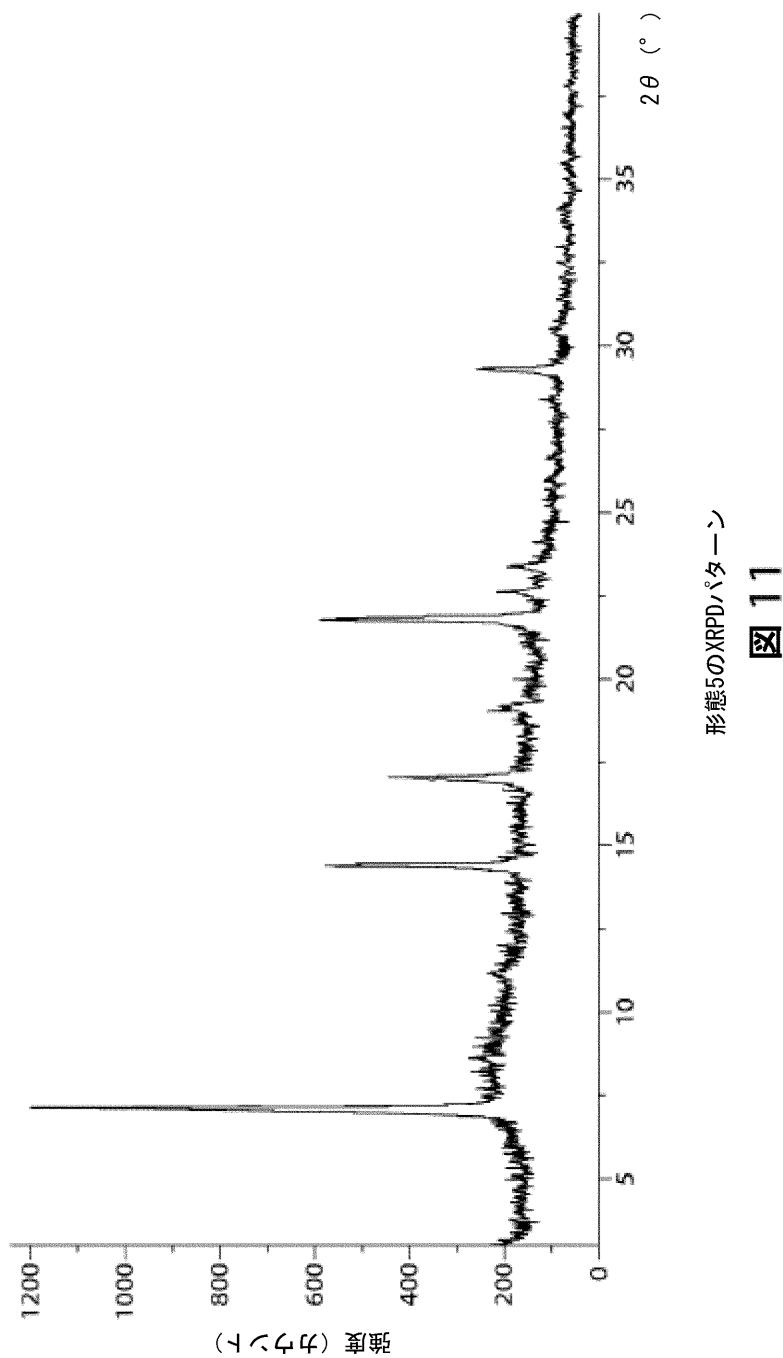
【請求項9】

2-メチル-1-[(4-[6-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]-6-{[2-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル]アミノ}-1,3,5-トリアジン-2-イル)アミノ]プロパン-2-オールメタансルホナートの単離された結晶形であって、7.1、14.5、17.1、及び $21.8^\circ \pm 0.2^\circ$ の2角度でピークを有するX線粉末回折パターンを特徴とする、前記単離された結晶形。

【請求項10】

図11に示すX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項9記載の単離された結晶形：

【化5】



形態5のXRDパターン
図11

。

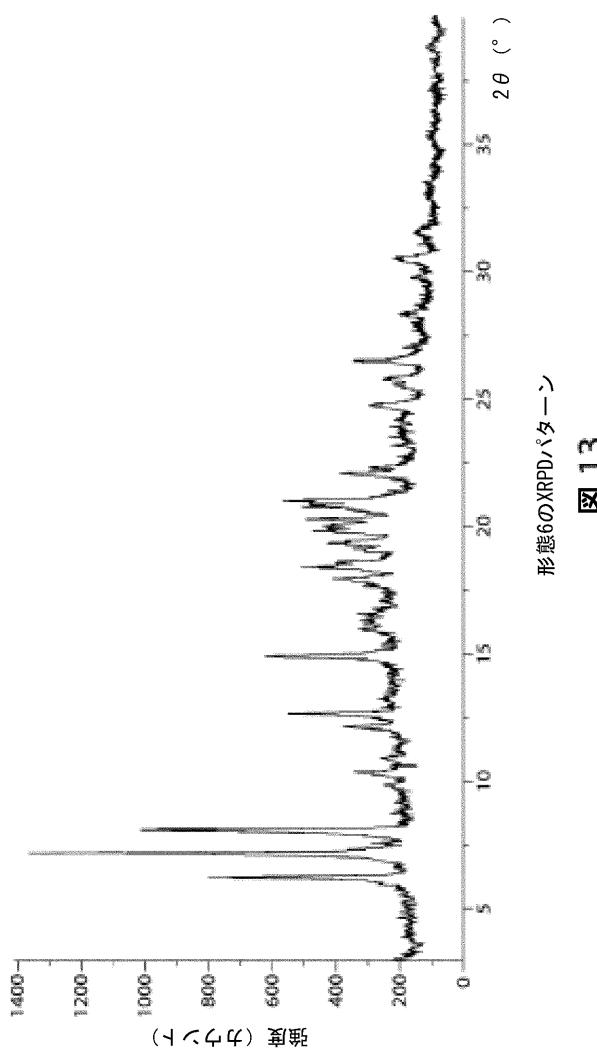
【請求項11】

2-メチル-1-[(4-[6-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]-6-{[2-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル]アミノ}-1,3,5-トリアジン-2-イル)アミノ]プロパン-2-オールメタансルホナートの単離された結晶形であって、6.3、7.2、8.1、12.7、及び $14.9^\circ \pm 0.2^\circ$ の2角度でピークを有するX線粉末回折パターンを特徴とする、前記単離された結晶形。

【請求項12】

図13に示すX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項11記載の単離された結晶形：

【化6】



【請求項13】

2-メチル-1-[(4-[6-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]-6-{[2-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル]アミノ}-1,3,5-トリアジン-2-イル)アミノ]プロパン-2-オールメタансルホナートの単離された結晶形であって、6.7、9.1、10.8、19.9、及び $21.9^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ の2角度でピークを有するX線粉末回折パターンを特徴とする、前記単離された結晶形。

【請求項14】

図21に示すX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項13記載の単離された結晶形：

【化7】

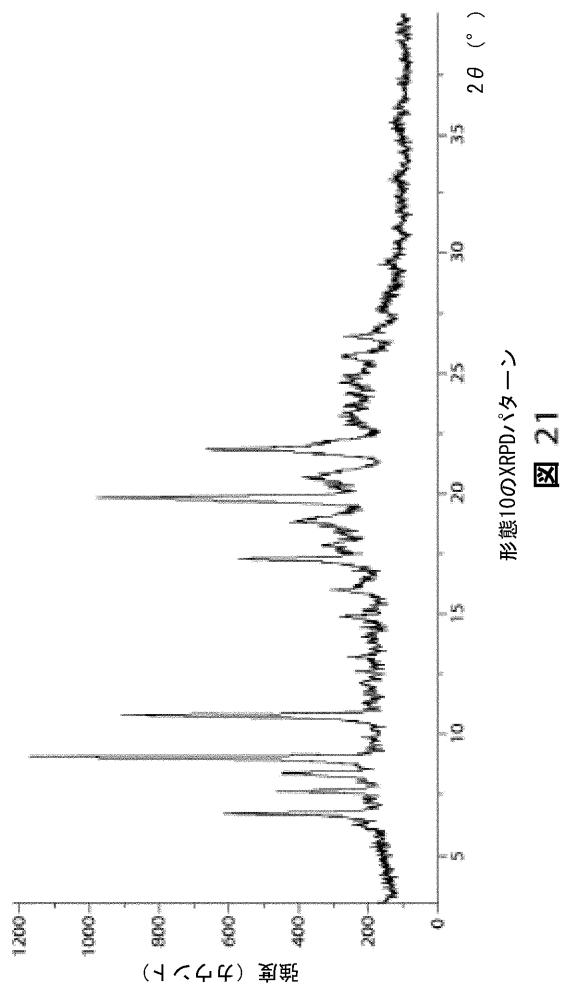


図 21

形態10のXRDパターン

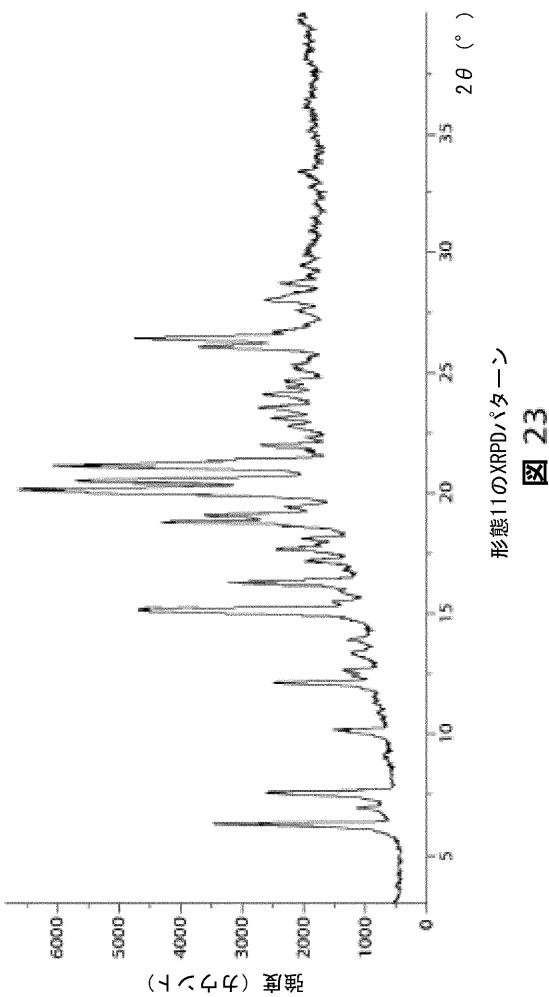
【請求項15】

2-メチル-1-[(4-[6-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]-6-{[2-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル]アミノ}-1,3,5-トリアジン-2-イル)アミノ]プロパン-2-オールメタンスルホナートの単離された結晶形であって、6.3、20.0、20.2、20.5、21.2、及び26.5° ± 0.2° の2角度でピークを有するX線粉末回折パターンを特徴とする、前記単離された結晶形。

【請求項16】

図23に示すX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項15記載の単離された結晶形：

【化8】



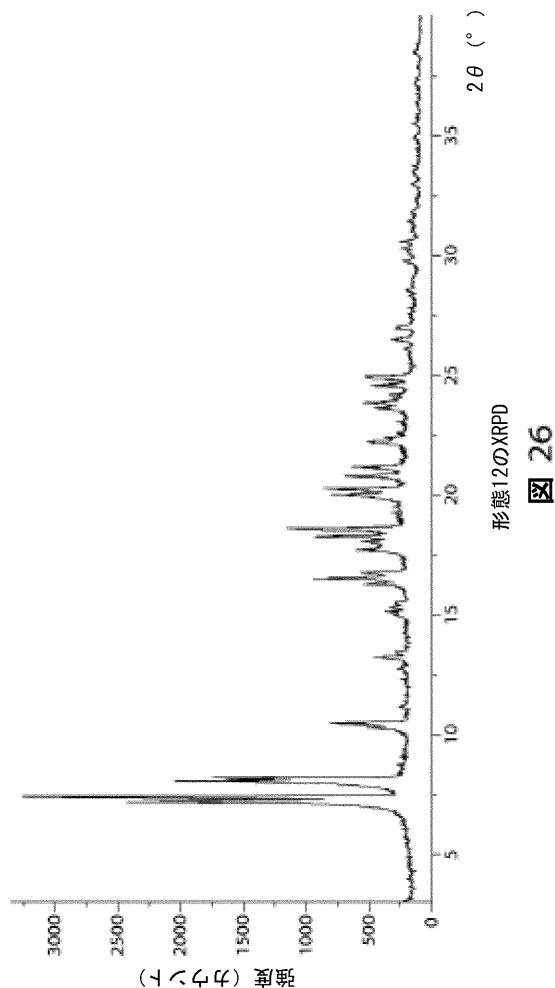
【請求項17】

2-メチル-1-[(4-[6-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]-6-{[2-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル]アミノ}-1,3,5-トリアジン-2-イル)アミノ]プロパン-2-オールメタノスルホナートの単離された結晶形であって、7.2、7.4、8.0、8.2、16.5、及び18.6° ± 0.2° の2 角度でピークを有するX線粉末回折パターンを特徴とする、前記単離された結晶形。

【請求項18】

図26に示すX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項17記載の単離された結晶形：

【化9】



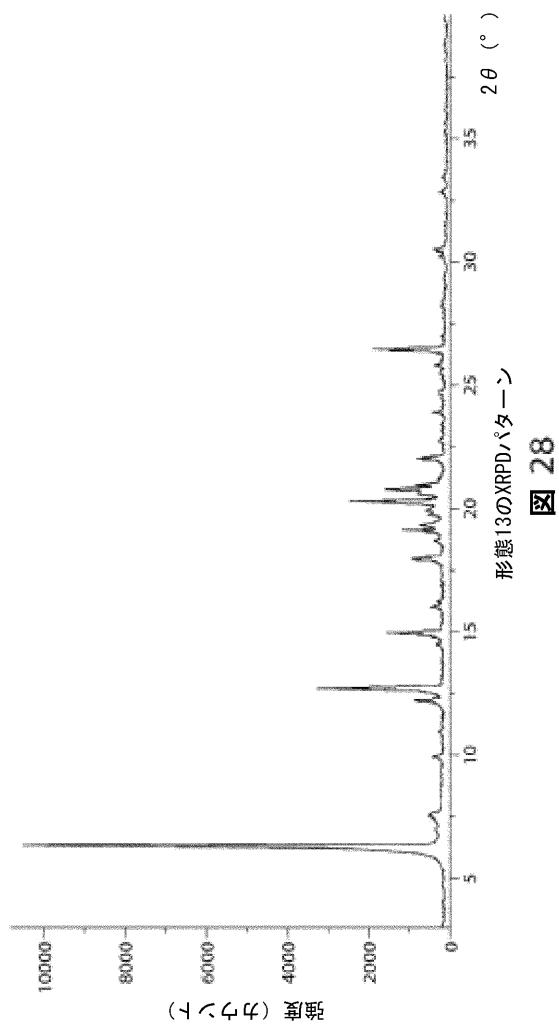
。 【請求項 19】

2-メチル-1-[(4-[6-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]-6-{[2-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル]アミノ}-1,3,5-トリアジン-2-イル)アミノ]プロパン-2-オールメタンスルホナートの単離された結晶形であって、6.3、12.7、及び20.3° ± 0.2° の2 角度でピークを有するX線粉末回折パターンを特徴とする、前記単離された結晶形。

【請求項 20】

図28に示すX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項 19 記載の単離された結晶形：

【化10】



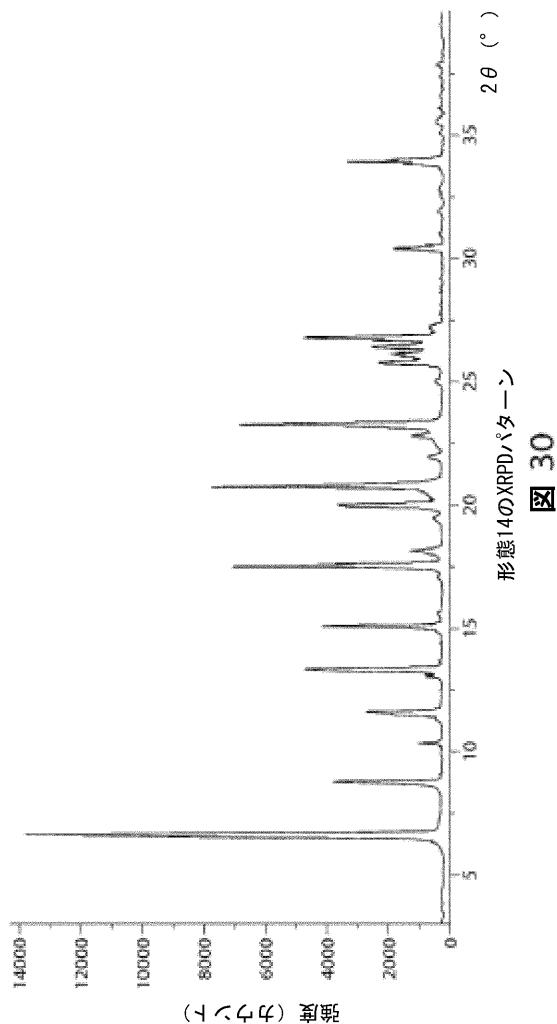
【請求項21】

2-メチル-1-[(4-[6-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]-6-{[2-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル]アミノ}-1,3,5-トリアジン-2-イル)アミノ]プロパン-2-オールメタノスルホナートの単離された結晶形であって、6.6、17.5、20.8、及び $23.3^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ の2角度でピークを有するX線粉末回折パターンを特徴とする、前記単離された結晶形。

【請求項22】

図30に示すX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項21記載の単離された結晶形：

【化11】



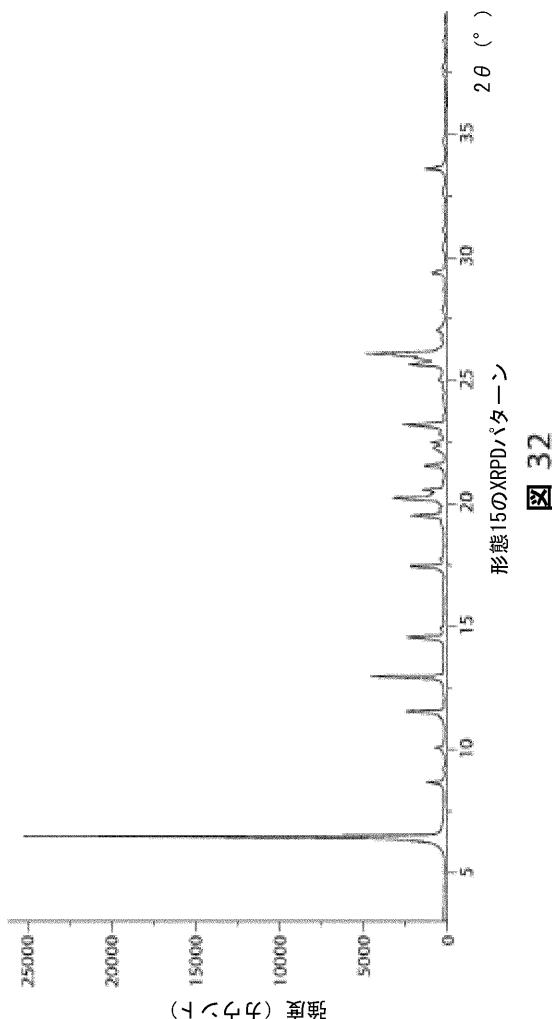
【請求項23】

2-メチル-1-[(4-[6-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]-6-{[2-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル]アミノ}-1,3,5-トリアジン-2-イル)アミノ]プロパン-2-オールメタノスルホナートの単離された結晶形であって、6.4、12.9、20.2、及び $26.1^{\circ} \pm 0.2^{\circ}$ の2角度でピークを有するX線粉末回折パターンを特徴とする、前記単離された結晶形。

【請求項24】

図32に示すX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項23記載の単離された結晶形：

【化12】



。

【請求項25】

それぞれIDH2の変異対立遺伝子の存在を特徴とする、急性骨髓性白血病、骨髓異形成症候群、慢性骨髓単球性白血病、骨髓性肉腫、多発性骨髓腫、及びリンパ腫から選択される進行性血液系悪性腫瘍を治療するための薬剤の製造のための請求項1～24のいずれか一項記載の単離された結晶形の使用。

【請求項26】

前記進行性血液系悪性腫瘍が、急性骨髓性白血病である、請求項25記載の使用。

【請求項27】

前記進行性血液系悪性腫瘍が、再発性又は原発性難治性急性骨髓性白血病である、請求項26記載の使用。

【請求項28】

前記進行性血液系悪性腫瘍が、骨髓異形成症候群である、請求項25記載の使用。

【請求項29】

前記進行性血液系悪性腫瘍が、慢性骨髓単球性白血病である、請求項25記載の使用。

【請求項30】

前記進行性血液系悪性腫瘍が、リンパ腫である、請求項25記載の使用。

【請求項31】

前記薬剤が、急性骨髓性白血病の第一、第二、第三、又は第四選択治療として投与される、請求項25～27のいずれか一項記載の使用。

【請求項32】

前記薬剤が、前記結晶形を30mg～300mg遊離塩基等価強度、1日1回又は1日2回の投与量で送達するように投与される、請求項25～29のいずれか一項記載の使用。

【請求項33】

前記投与量が、75mg、1日1回又は1日2回である、請求項32記載の使用。

【請求項34】

前記投与量が、100mg、1日1回又は1日2回である、請求項32記載の使用。

【請求項35】

前記投与量が、150mg、1日1回又は1日2回である、請求項32記載の使用。

【請求項36】

前記投与量が、200mg、1日1回又は1日2回である、請求項32記載の使用。

【請求項37】

前記薬剤が、経口剤形である、請求項32記載の使用。

【請求項38】

前記経口剤形が、錠剤である、請求項37記載の使用。

【請求項39】

前記投与量が、1日1回投与される、請求項32記載の使用。

【請求項40】

前記投与量が、1日2回投与される、請求項32記載の使用。

【請求項41】

請求項1～24のいずれか一項記載の単離された結晶形を含む、医薬組成物。