

【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】

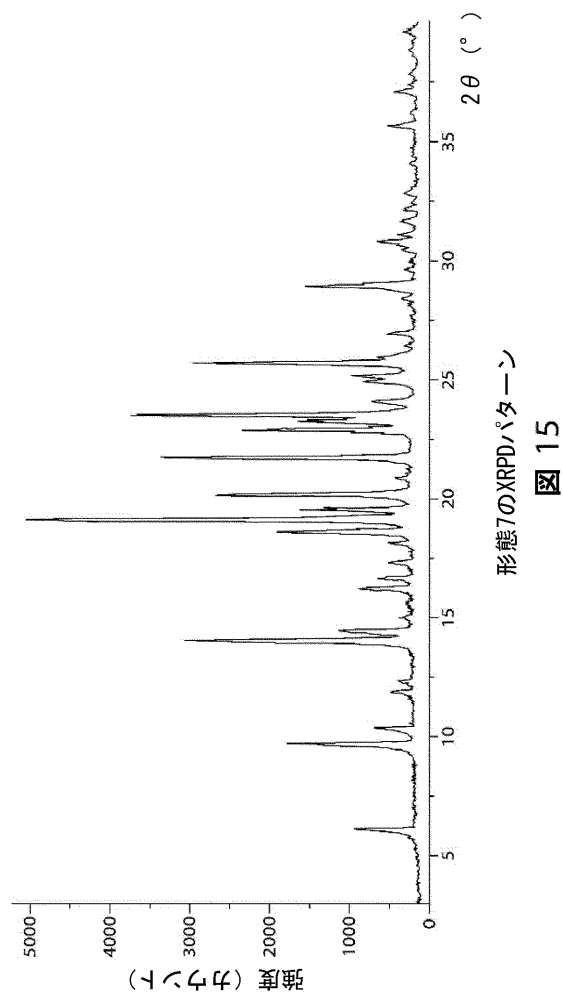
【請求項 1】

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-オールメタン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】



。

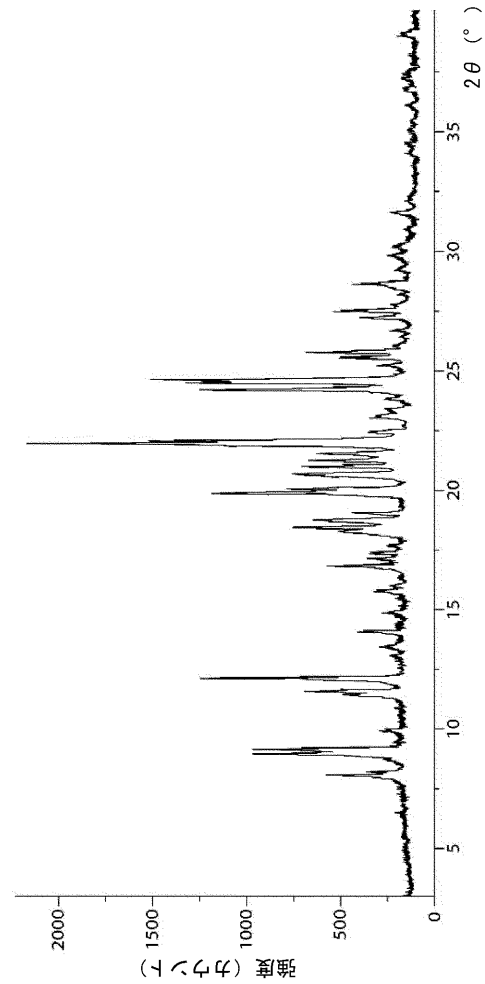
【請求項 3】

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-オールメタンス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】



形態8のXRPDパターン

図 17

。

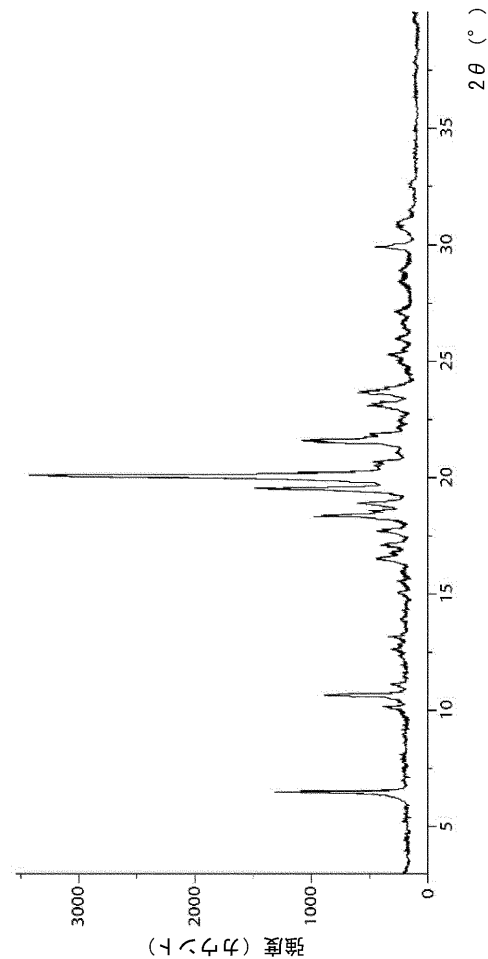
【請求項 5】

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-オールメタン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° ± 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 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XRPDパターン
図 19

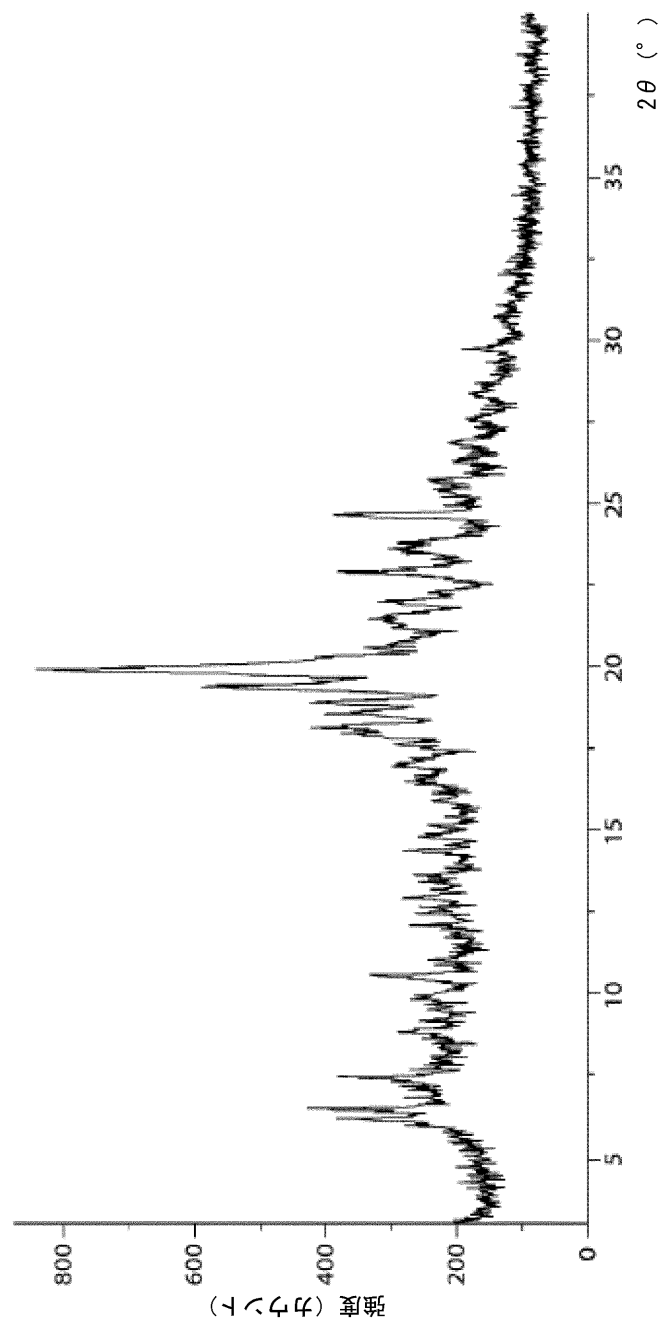
【請求項 7】

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-オールメタンス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° ± 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 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XRPDパターン

図 9

。

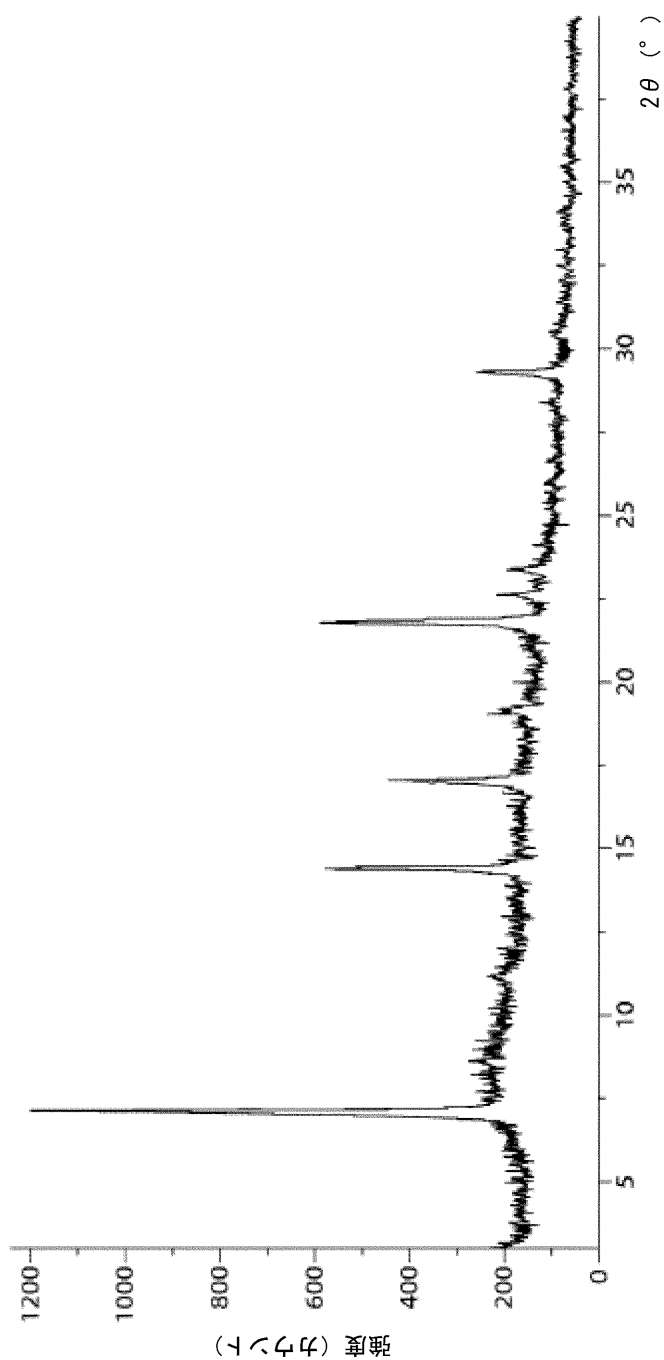
【請求項 9】

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-オールメタンス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° ± 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 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XRPDパターン

図 11

。

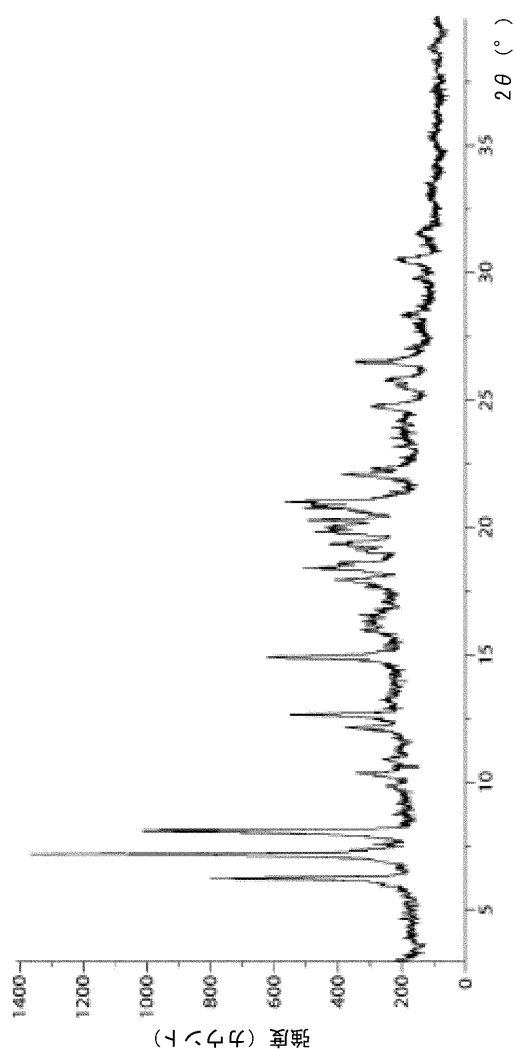
【請求項 1 1】

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-オールメタンス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° ± 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 1 2】

図13に示すX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項 1 1 記載の単離された結晶形：

【化 6】



形態6のXRPDパターン

図 13

。

【請求項 1 3】

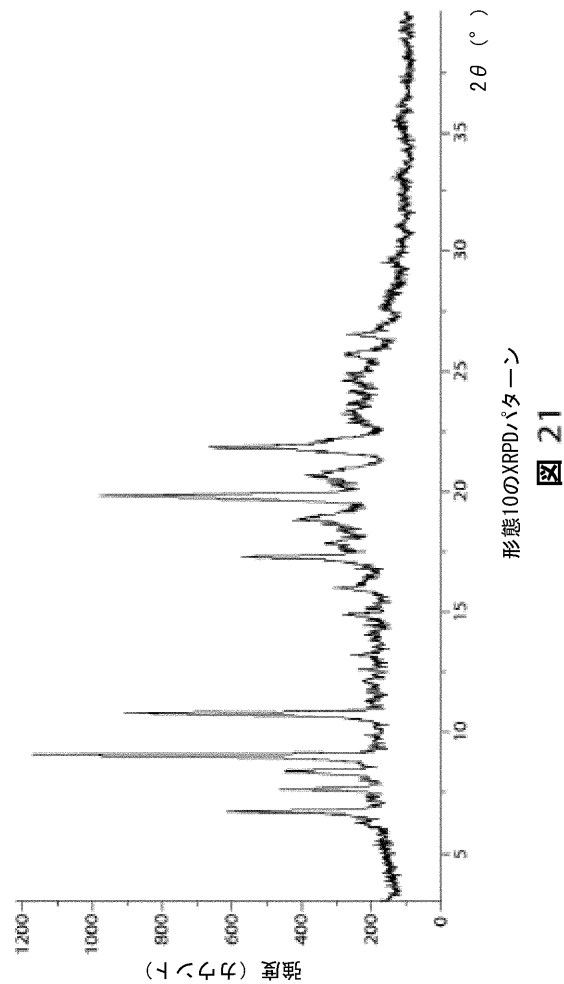
2-メチル-1-[(4-[6-(トリフルオロメチル)ピリジン-2-イル]-6-{[2-(トリフルオロメチル)ピリジン-4-イル]アミノ}-1,3,5-トリアジン-2-イル)アミノ]プロパン-2-オールメタンスルホナートの単離された結晶形であって、6.7、9.1、10.8、19.9、及び21.9° ± 0.2° の2 角度でピークを有するX線粉末回折パターンを特徴とする、前記単離された結晶形

。

【請求項 1 4】

図21に示すX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項 1 3 記載の単離された結晶形：

【化 7】



。

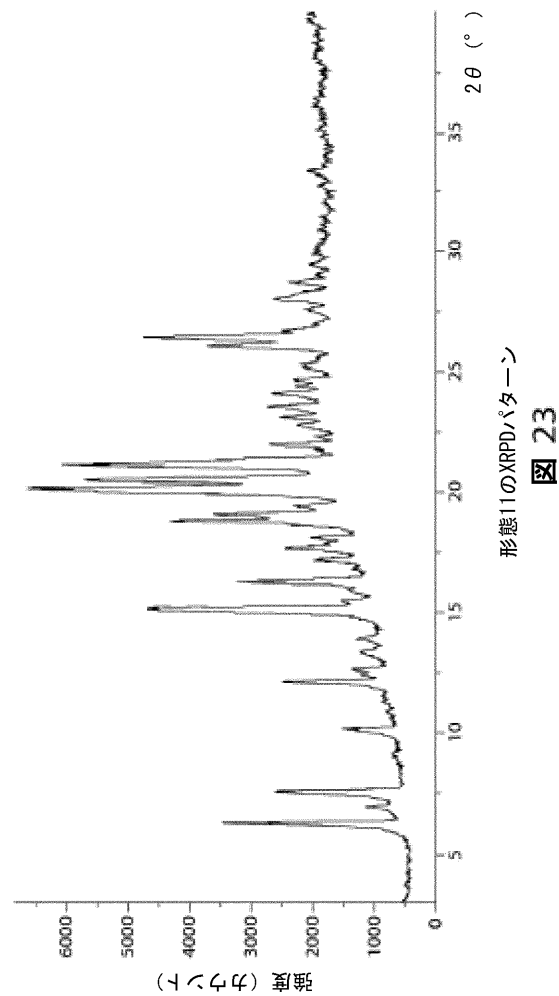
【請求項 1 5】

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 1 6】

図23に示すX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項 1 5 記載の単離された結晶形：

【化 8】



。

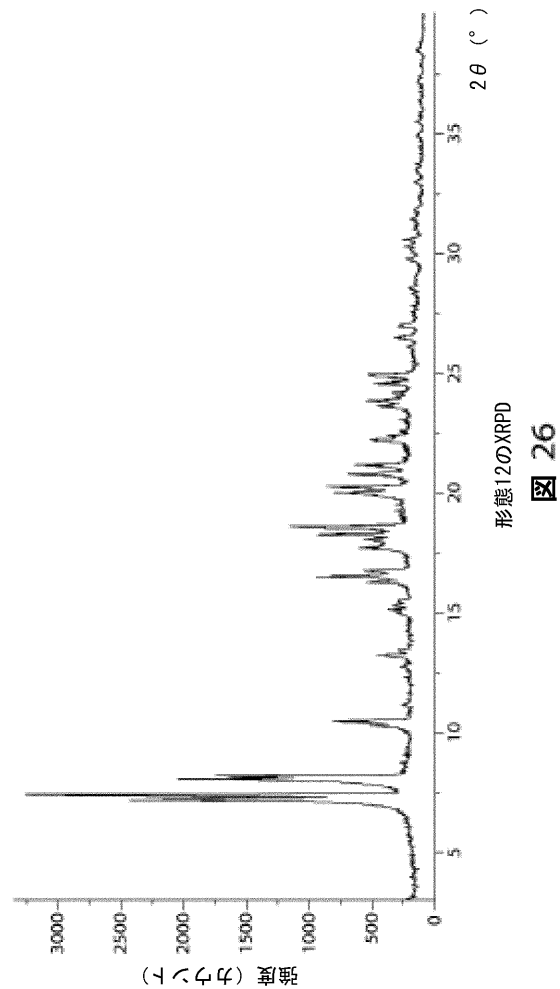
【請求項 17】

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-オールメタン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】



。

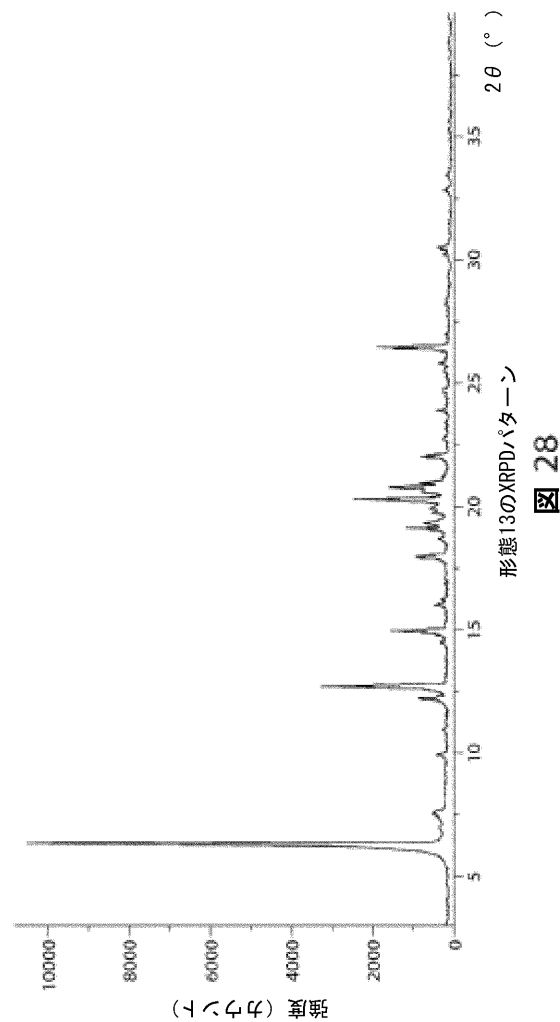
【請求項 19】

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 1 0】



。

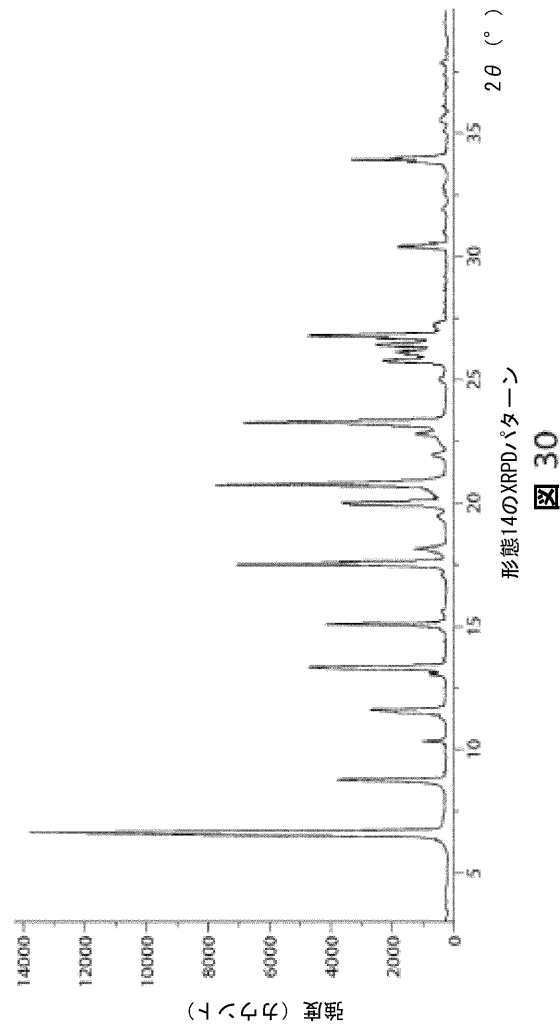
【請求項 2 1】

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-オールメタン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° ± 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 2】

図30に示すX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項 2 1 記載の単離された結晶形：

【化 1 1】



。

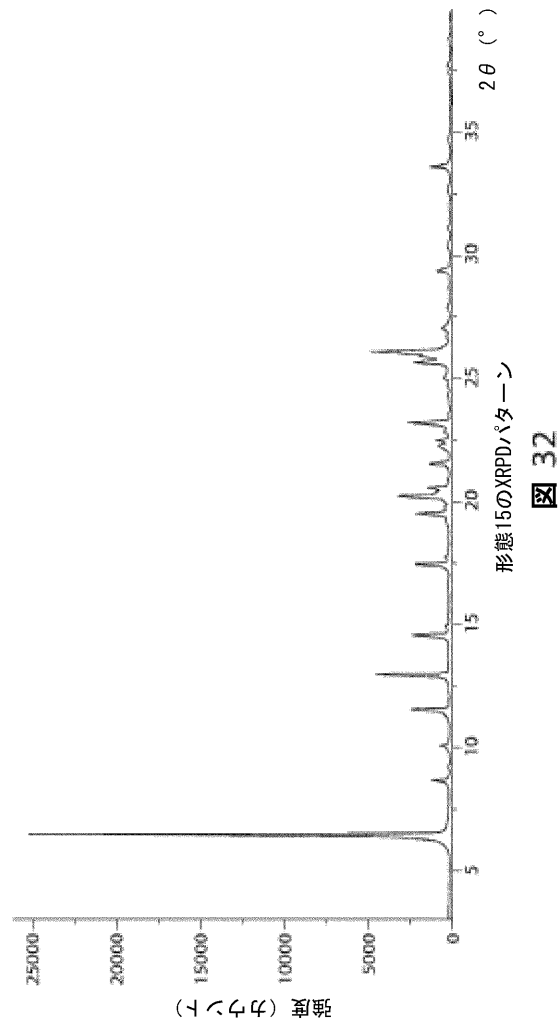
【請求項 2 3】

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-オールメタン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° ± 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 4】

図32に示すX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項 2 3 記載の単離された結晶形：

【化 1 2】



【請求項 2 5】

それぞれ IDH2 の変異対立遺伝子の存在を特徴とする、急性骨髄性白血病、骨髄異形成症候群、慢性骨髄単球性白血病、骨髄性肉腫、多発性骨髄腫、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 ～ 2 4 のいずれか一項記載の単離された結晶形の使用。

【請求項 2 6】

前記進行性血液系悪性腫瘍が、急性骨髄性白血病である、請求項 2 5 記載の使用。

【請求項 2 7】

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髄性白血病である、請求項 2 6 記載の使用。

【請求項 2 8】

前記進行性血液系悪性腫瘍が、骨髄異形成症候群である、請求項 2 5 記載の使用。

【請求項 2 9】

前記進行性血液系悪性腫瘍が、慢性骨髄単球性白血病である、請求項 2 5 記載の使用。

【請求項 3 0】

前記進行性血液系悪性腫瘍が、リンパ腫である、請求項 2 5 記載の使用。

【請求項 3 1】

前記薬剤が、急性骨髄性白血病の第一、第二、第三、又は第四選択治療として投与される、請求項 2 5 ～ 2 7 のいずれか一項記載の使用。

【請求項 3 2】

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。