

【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2年9月24日(2020.9.24)

【公表番号】特表2019-527708(P2019-527708A)
 【公表日】令和1年10月3日(2019.10.3)
 【年通号数】公開・登録公報2019-040
 【出願番号】特願2019-506673(P2019-506673)
 【国際特許分類】

C 0 7 D 405/04 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4035 (2006.01)
 A 6 1 P 3/04 (2006.01)
 A 6 1 P 3/10 (2006.01)
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)
 A 6 1 P 37/00 (2006.01)
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 405/04 C S P
 A 6 1 K 31/4035
 A 6 1 P 3/04
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 37/00
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】令和2年8月7日(2020.8.7)

【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

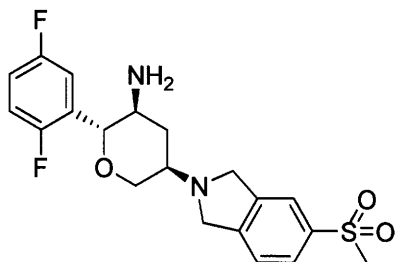
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iで表される化合物の結晶であって、

【化1】



そのX線回折パターンにおいて、 $2\theta = 16.4^\circ$ 、 21.8° 、 25.3° 、及び $26.0^\circ \pm 0.2^\circ$ に回折ピークを有する、結晶。

【請求項2】

そのX線回折パターンにおいて、 $2\theta = 16.4^\circ$ 、 19.4° 、 21.2° 、 $21.$

8°、25.3°、及び26.0° ± 0.2°に回折ピークを有する、請求項1に記載の式Iで表される化合物の結晶。

【請求項3】

そのX線回折パターンにおいて、2θ = 13.0°、16.4°、18.5°、19.4°、21.2°、21.8°、25.3°、及び26.0° ± 0.2°に回折ピークを有する、請求項1に記載の式Iで表される化合物の結晶。

【請求項4】

DSCにより特徴付けられる場合、開始温度193.3 ± 5、及びピーク温度195.2 ± 5を有する、請求項1に記載の式Iで表される化合物の結晶。

【請求項5】

X線回折ピークが下記の特徴を有する、請求項1～4のいずれか1項に記載の式Iで表される化合物の結晶。

【表1】

番号	2θ ± 0.2 (°)	相対強度 (%)	番号	2θ ± 0.2 (°)	相対強度 (%)
1	12.3	3	13	22.8	5
2	13.0	8	14	24.8	7
3	15.0	5	15	25.3	17
4	16.4	18	16	26.0	39
5	17.2	5	17	26.4	4
6	17.6	3	18	27.5	4
7	18.5	9	19	27.9	6
8	19.4	12	20	28.8	4
9	21.2	16	21	30.4	7
10	21.8	100	22	30.9	4
11	22.1	9	23	32.0	6
12	22.5	11	---	---	---

【請求項6】

結晶組成物の50重量%以上を占める請求項1～5のいずれか1項に記載の式Iで表される化合物の結晶を含む、結晶組成物。

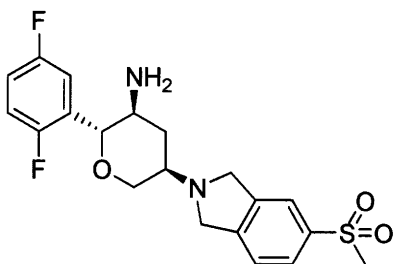
【請求項7】

結晶組成物の80重量%以上を占める請求項1～5のいずれか1項に記載の式Iで表される化合物の結晶を含む、請求項6に記載の結晶組成物。

【請求項8】

式Iで表される化合物のリン酸塩であって、

【化2】



I

式Iで表される化合物とリン酸とのモル比は、1 : 0.5 ~ 2である、式Iで表される化合物のリン酸塩。

【請求項9】

式Iで表される化合物とリン酸とのモル比は、1 : 1である、請求項8に記載の式Iで

表される化合物のリン酸塩。

【請求項 10】

請求項 9 に記載の式 I で表される化合物のリン酸塩の結晶であって、

X 線回折パターンにおいて、 $2\theta = 6.4^\circ$ 、 11.9° 、 18.2° 、 21.7° 、 22.1° 、 22.9° 、及び $23.2^\circ \pm 0.2^\circ$ に回折ピークを有する、式 I で表される化合物のリン酸塩の結晶。

【請求項 11】

X 線回折パターンにおいて、 $2\theta = 6.4^\circ$ 、 11.9° 、 16.5° 、 17.5° 、

18.2° 、 18.6° 、 21.7° 、 22.1° 、 22.9° 、及び $23.2^\circ \pm 0.2^\circ$ に回折ピークを有する、請求項 10 に記載の式 I で表される化合物のリン酸塩の結晶。

【請求項 12】

X 線回折パターンにおいて、 $2\theta = 6.4^\circ$ 、 10.1° 、 11.9° 、 16.5° 、

17.5° 、 18.2° 、 18.6° 、 19.8° 、 21.7° 、 22.1° 、 22.9° 、 23.2° 、及び $23.8^\circ \pm 0.2^\circ$ に回折ピークを有する、請求項 10 に記載の式 I で表される化合物のリン酸塩の結晶。

【請求項 13】

結晶組成物の 50 重量%以上を占める請求項 10 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の式 I で表される化合物のリン酸塩の結晶を含む、結晶組成物。

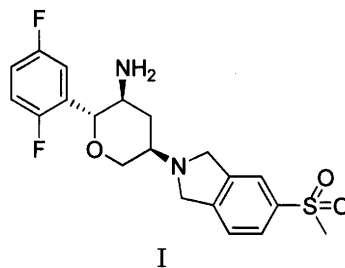
【請求項 14】

結晶組成物の 80 重量%以上を占める請求項 10 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の式 I で表される化合物のリン酸塩の結晶を含む、請求項 13 に記載の結晶組成物。

【請求項 15】

式 I で表される化合物のフマル酸塩であって、

【化 3】



式 I で表される化合物とフマル酸とのモル比は、 $1 : 0.5 \sim 2$ である、式 I で表される化合物のフマル酸塩。

【請求項 16】

式 I で表される化合物とフマル酸とのモル比は、 $1 : 0.5$ である、請求項 15 に記載の式 I で表される化合物のフマル酸塩。

【請求項 17】

請求項 16 に記載の式 I で表される化合物のフマル酸塩の結晶であって、

X 線回折パターンにおいて、 $2\theta = 20.67^\circ \pm 0.2^\circ$ に回折ピークを有する、式 I で表される化合物のフマル酸塩の結晶。

【請求項 18】

結晶組成物の 50 重量%以上を占める請求項 17 に記載の式 I で表される化合物のフマル酸塩の結晶を含む、結晶組成物。

【請求項 19】

結晶組成物の 80 重量%以上を占める請求項 17 に記載の式 I で表される化合物のフマル酸塩の結晶を含む、請求項 18 に記載の結晶組成物。

【請求項 20】

治療有効量の請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の結晶、又は請求項 6 若しくは 7 に記載の結晶組成物、

或いは治療有効量の請求項 8 若しくは 9 に記載のリン酸塩、又は請求項 10 ~ 12 のいずれか 1 項に記載のリン酸塩の結晶、又は請求項 13 若しくは 14 に記載の結晶組成物、

或いは治療有効量の請求項 15 若しくは 16 に記載のフマル酸塩、又は請求項 17 に記載のフマル酸塩の結晶、又は請求項 18 若しくは 19 に記載の結晶組成物を含む、医薬組成物。

【請求項 21】

D P P - I V 阻害から恩恵を受ける疾患の治療又は予防に使用される、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の結晶、又は請求項 6 若しくは 7 に記載の結晶組成物、又は請求項 8 若しくは 9 に記載のリン酸塩、又は請求項 10 ~ 12 のいずれか 1 項に記載のリン酸塩の結晶、又は請求項 13 若しくは 14 に記載の結晶組成物、又は請求項 15 若しくは 16 に記載のフマル酸塩、又は請求項 17 に記載のフマル酸塩の結晶、又は請求項 18 若しくは 19 に記載の結晶組成物、又は請求項 20 に記載の医薬組成物。

【請求項 22】

D P P - I V 阻害から恩恵を受ける疾患の治療又は予防に使用され、前記 D P P - I V 阻害から恩恵を受ける疾患は、インスリン抵抗性、高血糖症、I I 型糖尿病、糖尿病性脂質異常症、耐糖能異常、空腹時血糖異常、代謝性アシドーシス、ケトーシス、食欲調節、肥満、種々の癌、神経系障害、及び免疫系障害からなる群から選ばれる、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の結晶、又は請求項 6 若しくは 7 に記載の結晶組成物、又は請求項 8 若しくは 9 に記載のリン酸塩、又は請求項 10 ~ 12 のいずれか 1 項に記載のリン酸塩の結晶、又は請求項 13 若しくは 14 に記載の結晶組成物、又は請求項 15 若しくは 16 に記載のフマル酸塩、又は請求項 17 に記載のフマル酸塩の結晶、又は請求項 18 若しくは 19 に記載の結晶組成物、又は請求項 20 に記載の医薬組成物。

【請求項 23】

D P P - I V 阻害から恩恵を受ける疾患の治療又は予防に使用され、前記 D P P - I V 阻害から恩恵を受ける疾患は、I I 型糖尿病、及び肥満からなる群から選ばれる、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の結晶、又は請求項 6 若しくは 7 に記載の結晶組成物、又は請求項 8 若しくは 9 に記載のリン酸塩、又は請求項 10 ~ 12 のいずれか 1 項に記載のリン酸塩の結晶、又は請求項 13 若しくは 14 に記載の結晶組成物、又は請求項 15 若しくは 16 に記載のフマル酸塩、又は請求項 17 に記載のフマル酸塩の結晶、又は請求項 18 若しくは 19 に記載の結晶組成物、又は請求項 20 に記載の医薬組成物。