

【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5年12月13日(2023.12.13)

【公開番号】特開2023-171735(P2023-171735A)

【公開日】令和5年12月5日(2023.12.5)

【年通号数】公開公報(特許)2023-228

【出願番号】特願2023-143544(P2023-143544)

【国際特許分類】

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 5 0 2 5 (2 0 0 6 . 0 1)

10

【 F I 】

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 1 4 4

A 6 1 P 3 5 / 0 0

A 6 1 K 3 1 / 5 0 2 5

【手続補正書】

【提出日】令和5年11月28日(2023.11.28)

【手続補正1】

20

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

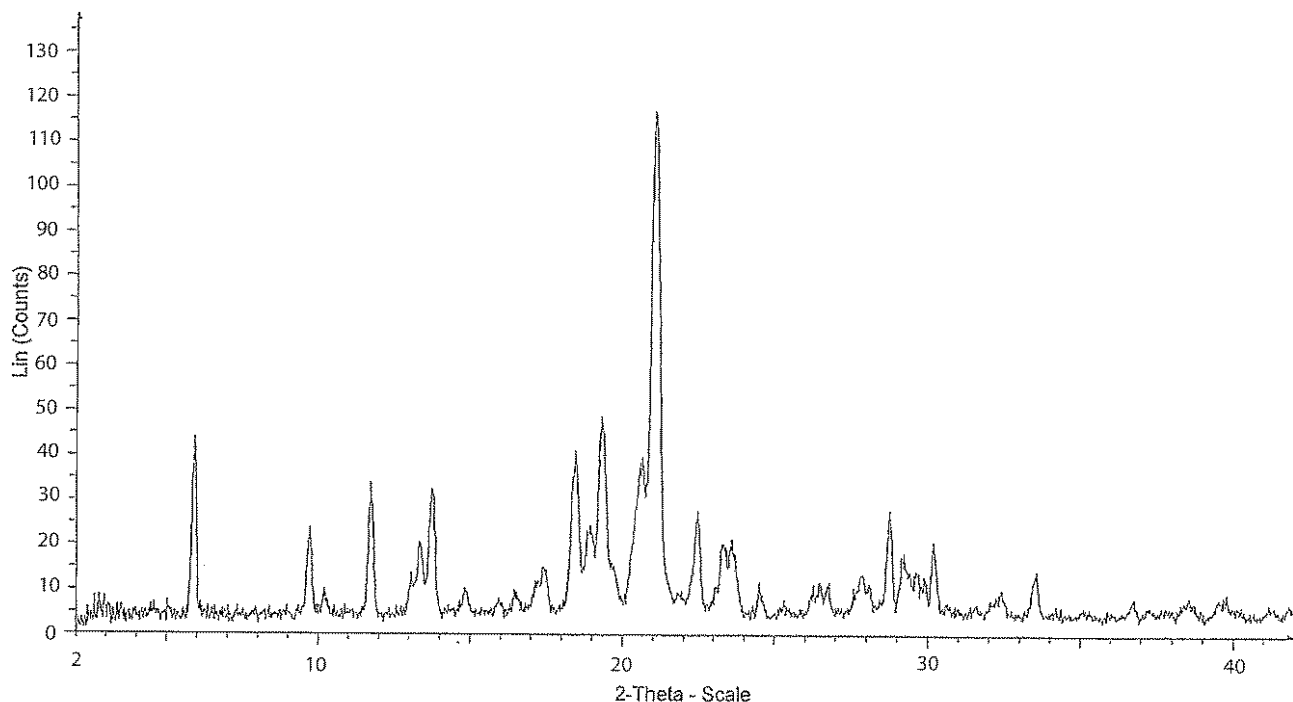
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

図1



30

40

に実質的に示されるX線回折(XRD)パターンを有する、3-{4-[(2R)-2-アミノプロポキシ]フェニル}-N-[(1R)-1-(3-フルオロフェニル)エチル]イミダゾ[1,2-b]ピリダジ

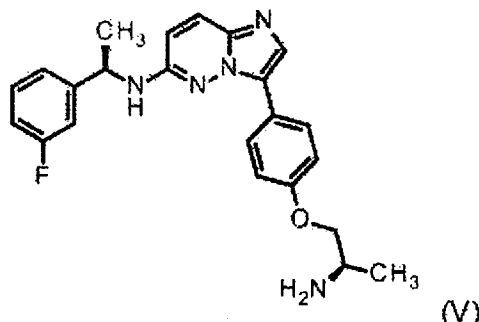
50

ン-6-アミン アジピン酸塩の結晶。

【請求項 2】

3-{4-[(2R)-2-アミノプロポキシ]フェニル}-N-[(1R)-1-(3-フルオロフェニル)エチル]イミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-アミン アジピン酸塩の結晶の製造方法であって、
(i)エタノール、水またはそれらの組合せ中の式(V)の化合物

【化 1】



10

またはその塩を、アジピン酸と混合して、第 1 の混合物を形成する工程；ならびに
(ii) 第 1 の混合物をろ過して、濾液および3-{4-[(2R)-2-アミノプロポキシ]フェニル}-
N-[(1R)-1-(3-フルオロフェニル)エチル]イミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-アミン アジピン酸塩の結晶を得る工程
を含む、方法。

20

【請求項 3】

(iii) 工程(ii)の濾液を、3-{4-[(2R)-2-アミノプロポキシ]フェニル}-N-[(1R)-1-(3-フルオロフェニル)エチル]イミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-アミンの溶液に添加し、第 2 の混合物を生成する工程；
(iv) 第 2 の混合物に水を添加し、第 3 の混合物を生成する工程；

(v) 第 3 の混合物に種結晶を添加し、種結晶入り混合物を生成する工程；

(vi) 該種結晶入り混合物を冷却する工程；および

(vii) 工程(vi)の混合物をろ過して、3-{4-[(2R)-2-アミノプロポキシ]フェニル}-N-[(1R)-1-(3-フルオロフェニル)エチル]イミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-アミン アジピン酸塩の結晶を得る工程

30

をさらに含む、請求項 2 記載の方法。

【請求項 4】

工程(ii)および/または(vii)で得られた3-{4-[(2R)-2-アミノプロポキシ]フェニル}-
N-[(1R)-1-(3-フルオロフェニル)エチル]イミダゾ[1,2-b]ピリダジン-6-アミン アジピン酸塩の結晶を乾燥する工程をさらに含む、請求項 2 または 3 記載の方法。

【請求項 5】

乾燥する工程が、外温 40 度で実施される、請求項 4 記載の方法。

【請求項 6】

乾燥する工程が、減圧下で外温 40 度で実施される、請求項 4 または 5 記載の方法。

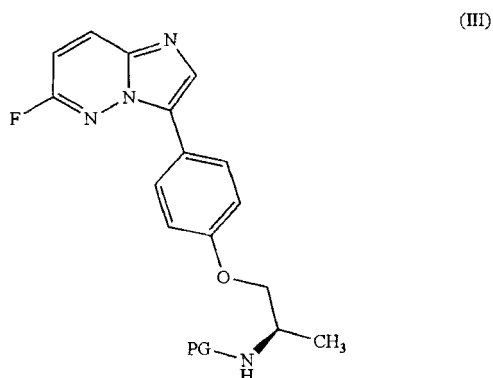
40

【請求項 7】

式(V)の化合物またはその塩が、
(i)式(III)

50

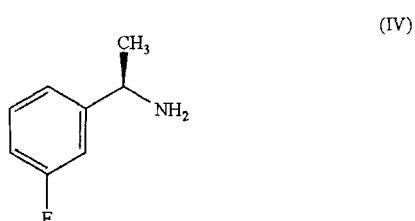
【化 2】



10

(式中、PGは、窒素原子の保護基を示す)
の化合物またはその塩と、式(IV)

【化 3】



20

の化合物またはその塩を反応させる工程；および
(ii)窒素原子上のPGを脱保護する工程
により製造されたものである、請求項2記載の方法。

【請求項 8】

保護基がtert-ブチルカルボネートである、請求項7記載の方法。

【請求項 9】

工程(i)が溶媒中で生じる、請求項7記載の方法。

【請求項 10】

溶媒がジメチルスルホキシドである、請求項9記載の方法。

30

【請求項 11】

工程(i)が高い温度で生じる、請求項7記載の方法。

【請求項 12】

工程(i)が95 ~ 99 で生じる、請求項7記載の方法。

【請求項 13】

工程(ii)が溶媒中で生じる、請求項7記載の方法。

【請求項 14】

溶媒がエタノールである、請求項13記載の方法。

【請求項 15】

工程(ii)が高い温度で生じる、請求項7記載の方法。

40

【請求項 16】

工程(ii)が65 ~ 70 で生じる、請求項7記載の方法。

【請求項 17】

工程(ii)が酸との反応をさらに含む、請求項7記載の方法。

【請求項 18】

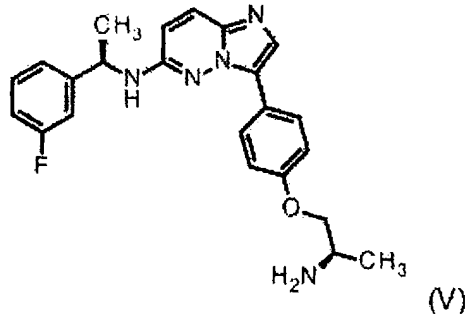
酸が塩酸である、請求項7記載の方法。

【請求項 19】

工程(ii)の脱保護する工程が、式(V)

50

【化 4】



10

の化合物またはその塩を提供する、請求項 7 記載の方法。

【請求項 20】

塩が二塩酸塩である、請求項 19 記載の方法。

20

30

40

50