

【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 8 月 12 日 (2021.8.12)

【公開番号】特開 2021-73259 (P2021-73259A)

【公開日】令和 3 年 5 月 13 日 (2021.5.13)

【年通号数】公開・登録公報 2021-022

【出願番号】特願 2021-12440 (P2021-12440)

【国際特許分類】

C 07D 471/04 (2006.01)

A 61K 31/437 (2006.01)

A 61P 29/00 (2006.01)

A 61P 37/02 (2006.01)

A 61P 37/06 (2006.01)

A 61P 35/00 (2006.01)

A 61P 19/02 (2006.01)

A 61P 9/00 (2006.01)

A 61P 1/04 (2006.01)

A 61P 9/10 (2006.01)

A 61P 25/00 (2006.01)

A 61P 25/28 (2006.01)

A 61P 25/16 (2006.01)

A 61P 11/00 (2006.01)

A 61P 11/06 (2006.01)

A 61P 11/16 (2006.01)

A 61P 43/00 (2006.01)

A 61P 1/16 (2006.01)

A 61P 17/00 (2006.01)

A 61P 37/08 (2006.01)

A 61P 17/06 (2006.01)

A 61P 27/02 (2006.01)

A 61P 31/04 (2006.01)

A 61P 3/10 (2006.01)

A 61P 9/04 (2006.01)

A 61P 25/08 (2006.01)

【F I】

C 07D 471/04 1 0 7 E

C 07D 471/04 C S P

A 61K 31/437

A 61P 29/00

A 61P 37/02

A 61P 37/06

A 61P 35/00

A 61P 19/02

A 61P 29/00 1 0 1

A 61P 9/00

A 61P 1/04

A 61P 9/10 1 0 1

A 61P 25/00

A 61P 25/28

A 6 1 P 25/16  
 A 6 1 P 11/00  
 A 6 1 P 11/06  
 A 6 1 P 11/16  
 A 6 1 P 43/00 1 0 5  
 A 6 1 P 1/16  
 A 6 1 P 17/00  
 A 6 1 P 37/08  
 A 6 1 P 17/06  
 A 6 1 P 27/02  
 A 6 1 P 9/10  
 A 6 1 P 31/04  
 A 6 1 P 3/10  
 A 6 1 P 9/04  
 A 6 1 P 25/08

## 【手続補正書】

【提出日】令和3年7月5日(2021.7.5)

## 【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】

空間群  $P2(1)2(1)2(1)$  および以下に示す単位格子寸法を有する結晶の (3S) - テトラヒドロフラン - 3 - イル (4S) - 4 - イソプロピル - 1, 4, 6, 7 - テトラヒドロ - 5H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン - 5 - カルボキシレートメシレート塩:

【表 1】

a	8.75780(10) Å	$\alpha$	90°
b	9.70830(10) Å,	$\beta$	90° ,
c	20.6736(2) Å,	$\gamma$	90° ,

【請求項 2】

CuK 線を用いて測定した以下の 2 値: 21.948 を含む XRPD パターンを有する結晶の (3S) - テトラヒドロフラン - 3 - イル (4S) - 4 - イソプロピル - 1, 4, 6, 7 - テトラヒドロ - 5H - イミダゾ [4, 5 - c] ピリジン - 5 - カルボキシレートメシレート塩。

【請求項 3】

CuK 線を用いて測定した以下の 2 値: 17.744 および 21.948 を含む XRPD パターンを有する請求項 2 に記載の塩。

【請求項 4】

CuK 線を用いて測定した以下の 2 値: 17.744、20.886、21.948 を含む XRPD パターンを有する請求項 2 または請求項 3 に記載の塩。

【請求項 5】

CuK 線を用いて測定した以下の2 値：17.744、20.886、21.948、および9.851を含むXRPDパターンを有する請求項2から4のいずれか1項に記載の塩。

【請求項6】

CuK 線を用いて測定した以下の2 値：17.744、20.886、21.948、9.851および16.280を含むXRPDパターンを有する請求項2から5のいずれか1項に記載の塩。

【請求項7】

CuK 線を用いて測定した以下の2 値：9.851、16.280、17.097、17.744、19.694、20.443、20.886、21.948、22.112、23.194、23.653、24.144、27.084、27.283、および29.912を含むXRPDパターンを有する請求項2から6のいずれか1項に記載の塩。

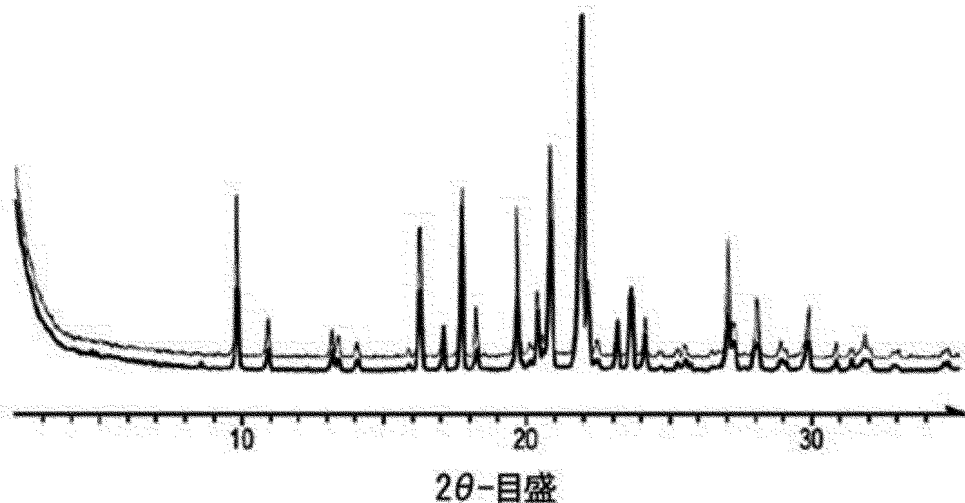
【請求項8】

表2および/または表3に提示したXRPDパターンを有する請求項2から7のいずれか1項に記載の塩。

【表2】

角度(2 $\theta$ °)	強度 (%)	角度(2 $\theta$ °)	強度 (%)
8.549	3.7	22.112	22.5
9.851	24.2	22.444	4.5
10.899	7.2	23.194	14.5
12.295	2.3	23.653	21.9
13.198	6.9	24.144	11.8
13.393	4.9	24.714	3.3
14.083	4.2	25.292	4.1
15.897	3.2	25.590	5.3
16.280	23.7	25.810	4.3
17.097	13.7	26.526	4.0
17.744	47.0	26.765	4.0
18.289	7.4	27.084	17.2
19.694	21.5	27.283	10.5
20.180	4.2	27.662	3.4
20.443	18.1	28.159	9.8
20.597	7.3	28.996	5.3
20.886	42.8	29.135	4.1
21.948	100.0	29.912	10.5
		30.868	5.0

【表 3】



## 【請求項 9】

95%より高い純度を有する請求項1から8のいずれか1項に記載の塩。

## 【請求項 10】

99%より高い純度を有する請求項1から8のいずれか1項に記載の塩。

## 【請求項 11】

99.5%より高い純度を有する請求項1から8のいずれか1項に記載の塩。

## 【請求項 12】

95%より高い鏡像異性純度を有する請求項1から11のいずれか1項に記載の塩。

## 【請求項 13】

99%より高い鏡像異性純度を有する請求項1から11のいずれか1項に記載の塩。

## 【請求項 14】

99.5%より高い鏡像異性純度を有する請求項1から11のいずれか1項に記載の塩

## 【請求項 15】

請求項1から14のいずれか1項に記載の塩および1種以上の適切な賦形剤を含む医薬用組成物。

## 【請求項 16】

炎症、炎症性疾患、免疫若しくは自己免疫疾患、または腫瘍成長の阻害の治療における、あるいは治療のための薬剤の製造における使用のための請求項1から14のいずれか1項に記載の塩を含む、医薬用組成物。

## 【請求項 17】

前記炎症、または炎症性疾患、または免疫若しくは自己免疫疾患は、関節炎（関節リウマチ、若年性関節リウマチ、変形性関節炎、乾癬性関節炎を含む）、滑膜炎、血管炎、シェーグレン疾患、腸の炎症と関係している状態（クローン病、潰瘍性大腸炎、炎症性大腸炎および過敏性腸症候群を含む）、アテローム性動脈硬化症、多発性硬化症、アルツハイマー病、血管性認知症、パーキンソン病、脳アミロイド血管症、皮質下梗塞および白質脳症を伴う常染色体優性脳動脈症、肺炎症疾患（ぜんそく、慢性閉塞性肺疾患、および呼吸窮迫症候群を含む）、線維性疾患（特発性肺線維症、心臓線維症、肝線維症、および全身性硬化症（強皮症）を含む）、皮膚の炎症性疾患（接触性皮膚炎、アトピー性皮膚炎、および乾癬を含む）、眼の炎症性疾患（加齢性黄斑変性症、ブドウ膜炎、および糖尿病性網膜症を含む）、全身性炎症反応症候群、敗血症、肝臓の炎症性および/または自己免疫性疾患（自己免疫性肝炎、原発性胆汁性肝硬変、アルコール性肝臓疾患、硬化性胆管炎、および自己免疫性胆管炎を含む）、糖尿病（1型または2型）および/またはその合併症、慢性心不全、鬱血性心不全、虚血症（脳卒中、および虚血 - 再灌流障害を含む）若しくは

心筋梗塞および／またはその合併症、あるいはてんかんである、請求項 16 に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

リウマチ性関節炎、変形性関節炎、肝線維症、慢性閉塞性肺疾患、多発性硬化症、シェーグレン疾患、アルツハイマー病、パーキンソン病、炎症性大腸炎または血管性認知症から選択される疾患の治療のための請求項 16 に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

(3S)-テトラヒドロフラン-3-イル(4S)-4-イソプロピル-1,4,6,7-テトラヒドロ-5H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン-5-カルボキシレートの遊離塩基からメシレート塩を形成することによる結晶の(3S)-テトラヒドロフラン-3-イル(4S)-4-イソプロピル-1,4,6,7-テトラヒドロ-5H-イミダゾ[4,5-c]ピリジン-5-カルボキシレートメシレート塩の製造方法。

【請求項 20】

前記メシレート塩は、遊離塩基にメタンスルホン酸を加えて形成される請求項 19 に記載の方法。