

【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4年9月14日(2022.9.14)

【国際公開番号】WO2021/033729

【出願番号】特願2021-540972(P2021-540972)

【国際特許分類】

C 0 7 D 2 0 5 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 3 9 7 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

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

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

10

【 F I 】

C 0 7 D 2 0 5 / 0 4 C S P

A 6 1 K 3 1 / 3 9 7

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1

A 6 1 P 2 5 / 0 0

A 6 1 P 2 5 / 1 6

【手続補正書】

20

【提出日】令和4年9月6日(2022.9.6)

【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】

1 - [[(3 S) - 3 - メチル - 6 - (4 , 4 , 4 - トリフルオロプトキシ) - 3 , 4 - ジヒドロナフタレン - 2 - イル] メチル] アゼチジン - 3 - カルボン酸の塩。

30

【請求項2】

塩が一(4-ヒドロキシ安息香酸塩)である請求項1記載の化合物。

【請求項3】

結晶形態である請求項2記載の化合物。

【請求項4】

粉末X線回折スペクトルにおいて、少なくとも約6.9、約12.8、約13.9、および約24.7度の回折角(2θ)に回折ピークを有する、請求項3記載の結晶。

【請求項5】

粉末X線回折スペクトルにおいて、少なくとも約5.4、約6.9、約13.9、約18.1、約19.4、約19.8、約20.9、および約24.7度の回折角(2θ)に回折ピークを有する、請求項3記載の結晶。

40

【請求項6】

粉末X線回折スペクトルにおいて、約11.3、および約14.4度の回折角(2θ)に回折ピークを有さない、請求項4または請求項5記載の結晶。

【請求項7】

粉末X線回折スペクトルにおいて、約5.4、約6.9、約10.3、約12.8、約13.9、約15.0、約15.3、約15.9、約16.6、約16.8、約18.1、約19.4、約19.8、約20.9、約21.8、約22.7、約23.6、約24.7、約25.4、約25.8、約26.3、約26.7、約27.6、約27.8、約30.3、約33.4、および約34.2度の回折角(2θ)に回折ピークを有する、請

50

求項 3 ~ 6 のいずれか一項に記載の結晶。

【請求項 8】

図 7 に示される粉末 X 線回折スペクトルチャートの特徴とする、請求項 3 ~ 7 のいずれか一項に記載の結晶。

【請求項 9】

示差走査熱量測定において、オンセット温度が約 150 またはピーク温度が約 153 である吸熱ピークを有する、請求項 3 ~ 8 のいずれか一項に記載の結晶。

【請求項 10】

図 8 に示される示差走査熱量測定チャートの特徴とする、請求項 3 ~ 9 のいずれか一項に記載の結晶。

10

【請求項 11】

粉末 X 線回折スペクトルにおいて、少なくとも約 11.3 度の回折角 (2 θ) に回折ピークを有する、請求項 3 記載の結晶。

【請求項 12】

粉末 X 線回折スペクトルにおいて、少なくとも約 5.6、約 11.3、約 13.2、約 15.9、約 16.9、約 18.8、約 22.7、および約 24.2 度の回折角 (2 θ) に回折ピークを有する、請求項 3 または請求項 11 記載の結晶。

【請求項 13】

粉末 X 線回折スペクトルにおいて、約 5.6、約 7.0、約 7.9、約 11.3、約 12.3、約 13.2、約 13.9、約 15.9、約 16.9、約 17.4、約 17.9、約 18.4、約 18.8、約 19.4、約 19.9、約 20.4、約 21.0、約 21.2、約 21.9、約 22.7、約 23.2、約 23.4、約 24.2、約 25.2、約 26.5、約 27.5、約 29.1、約 29.8、約 30.5、および約 34.1 度の回折角 (2 θ) に回折ピークを有する、請求項 3、請求項 11 または請求項 12 記載の結晶。

20

【請求項 14】

図 9 に示される粉末 X 線回折スペクトルチャートの特徴とする、請求項 3、または請求項 11 ~ 13 のいずれか一項に記載の結晶。

【請求項 15】

示差走査熱量測定において、オンセット温度が約 154 またはピーク温度が約 158 である吸熱ピークを有する、請求項 3、または請求項 11 ~ 14 のいずれか一項に記載の結晶。

30

【請求項 16】

図 10 に示される示差走査熱量測定チャートの特徴とする、請求項 3 または請求項 11 ~ 15 のいずれか一項に記載の結晶。

【請求項 17】

塩がトリプトファン塩である請求項 1 記載の化合物。

【請求項 18】

結晶形態である請求項 17 記載の化合物。

【請求項 19】

粉末 X 線回折スペクトルにおいて、少なくとも約 8.0、約 9.7、約 16.0、約 17.0、約 18.9、約 19.1、約 22.2、および約 24.6 度の回折角 (2 θ) に回折ピークを有する、請求項 18 記載の結晶。

40

【請求項 20】

粉末 X 線回折スペクトルにおいて、約 8.0、約 9.7、約 12.8、約 15.6、約 16.0、約 16.6、約 17.0、約 17.3、約 17.6、約 18.2、約 18.6、約 18.9、約 19.1、約 19.6、約 20.9、約 21.3、約 21.7、約 21.9、約 22.2、約 22.6、約 23.4、約 23.8、約 24.6、約 25.3、約 25.7、約 26.2、約 26.6、約 27.1、約 27.4、約 27.9、約 28.2、約 28.7、約 29.1、約 29.9、約 30.2、約 30.9、約 32.0、約 32.2、約 32.5、約 33.1、約 34.1、約 34.5、および約 34.8 度の回折角

50

(2) に回折ピークを有する、請求項 1 8 または請求項 1 9 記載の結晶。

【請求項 2 1】

図 1 5 に示される粉末 X 線回折スペクトルチャートの特徴とする、請求項 1 8 ~ 2 0 のいずれか一項に記載の結晶。

【請求項 2 2】

示差走査熱量測定において、オンセット温度が約 1 7 8 またはピーク温度が約 1 8 3 である吸熱ピークを有する、請求項 1 8 ~ 2 1 のいずれか一項に記載の結晶。

【請求項 2 3】

示差走査熱量測定において、オンセット温度が約 1 8 5 またはピーク温度が約 1 8 7 である発熱ピークを有する、請求項 1 8 ~ 2 2 のいずれか一項に記載の結晶。

10

【請求項 2 4】

図 1 6 に示される示差走査熱量測定チャートの特徴とする、請求項 1 8 ~ 2 3 のいずれか一項に記載の結晶。

【請求項 2 5】

塩がヘミコハク酸塩である請求項 1 記載の化合物。

【請求項 2 6】

結晶形態である請求項 2 5 記載の化合物。

【請求項 2 7】

粉末 X 線回折スペクトルにおいて、少なくとも約 6 . 4、約 6 . 9、約 1 2 . 9、約 1 3 . 8、約 1 7 . 2、約 1 8 . 1、約 1 9 . 3、約 2 3 . 9、および約 2 4 . 3 度の回折角 (2) に回折ピークを有する、請求項 2 6 記載の結晶。

20

【請求項 2 8】

粉末 X 線回折スペクトルにおいて、約 6 . 1、約 6 . 4、約 6 . 9、約 1 2 . 9、約 1 3 . 8、約 1 6 . 6、約 1 7 . 2、約 1 8 . 1、約 1 8 . 3、約 1 8 . 7、約 1 9 . 3、約 1 9 . 9、約 2 0 . 5、約 2 0 . 7、約 2 1 . 0、約 2 1 . 4、約 2 1 . 9、約 2 2 . 1、約 2 2 . 7、約 2 3 . 0、約 2 3 . 6、約 2 3 . 9、約 2 4 . 3、約 2 4 . 6、約 2 5 . 2、約 2 5 . 8、約 2 6 . 0、約 2 7 . 4、約 2 7 . 5、約 2 7 . 8、約 2 8 . 7、約 2 9 . 5、約 3 0 . 2、約 3 0 . 5、約 3 0 . 8、約 3 1 . 3、約 3 1 . 7、約 3 2 . 3、約 3 2 . 5、約 3 3 . 8、約 3 4 . 1、約 3 4 . 5、および約 3 4 . 9 度の回折角 (2) に回折ピークを有する、請求項 2 6 または請求項 2 7 記載の結晶。

30

【請求項 2 9】

図 1 7 に示される粉末 X 線回折スペクトルチャートの特徴とする、請求項 2 6 ~ 2 8 のいずれか一項に記載の結晶。

【請求項 3 0】

示差走査熱量測定において、オンセット温度が約 1 1 1 またはピーク温度が約 1 1 4 である吸熱ピークを有する、請求項 2 6 ~ 2 9 のいずれか一項に記載の結晶。

【請求項 3 1】

示差走査熱量測定において、オンセット温度が約 1 3 7 またはピーク温度が約 1 4 0 である吸熱ピークを有する、請求項 2 6 ~ 3 0 のいずれか一項に記載の結晶。

【請求項 3 2】

図 1 8 に示される示差走査熱量測定チャートの特徴とする、請求項 2 6 ~ 3 1 のいずれか一項に記載の結晶。

40

【請求項 3 3】

1 - [[(3 S) - 3 - メチル - 6 - (4 , 4 , 4 - トリフルオロプロキシ) - 3 , 4 - ジヒドロナフタレン - 2 - イル] メチル] アゼチジン - 3 - カルボン酸の結晶。

【請求項 3 4】

粉末 X 線回折スペクトルにおいて、少なくとも約 6 . 5、約 7 . 8、約 8 . 6、および約 1 1 . 6 度の回折角 (2) に回折ピークを有する、請求項 3 3 記載の結晶。

【請求項 3 5】

粉末 X 線回折スペクトルにおいて、約 6 . 5、約 7 . 8、約 8 . 6、約 1 1 . 6、約 1

50

3.0、約13.1、約15.2、約15.8、約17.0、約17.3、約18.8、約18.9、約19.3、約20.9、約21.1、約21.3、約22.8、約23.3、約23.6、約23.8、約24.0、約24.9、約25.8、約26.4、約27.1、約27.9、約29.8、約30.4、約30.7、約31.6、約32.0、および約34.0度の回折角(2θ)に回折ピークを有する、請求項33または請求項34記載の結晶。

【請求項36】

図1に示される粉末X線回折スペクトルチャートの特徴とする、請求項33～35のいずれか一項に記載の結晶。

【請求項37】

示差走査熱量測定において、オンセット温度が約128℃またはピーク温度が約133℃である吸熱ピークを有する、請求項33～36のいずれか一項に記載の結晶。

10

【請求項38】

図2に示される示差走査熱量測定チャートの特徴とする、請求項33～37のいずれか一項に記載の結晶。

【請求項39】

請求項1～38のいずれか一項に記載の化合物と薬学的に許容される担体とを含有する医薬組成物。

【請求項40】

S1P5介在性疾患の予防および/または治療剤である、請求項39記載の医薬組成物

20

【請求項41】

S1P5介在性疾患が、神経変性疾患である請求項40記載の医薬組成物。

【請求項42】

神経変性疾患が、多系統萎縮症またはパーキンソン病である請求項41記載の医薬組成物。

【請求項43】

請求項1～38のいずれか一項に記載の化合物を含有するS1P5介在性疾患の予防および/または治療剤。

【請求項44】

S1P5介在性疾患の予防および/または治療剤を製造するための請求項1～38のいずれか一項に記載の化合物の使用。

30

40

50