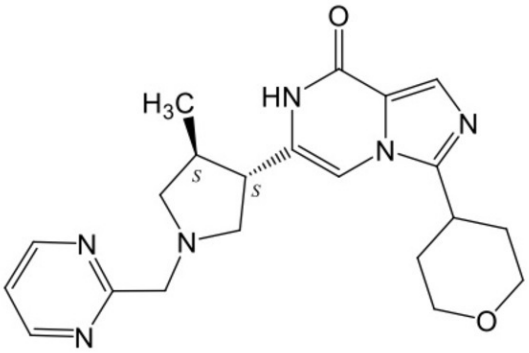
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和5年4月4日(2023.4.4)

【国際公開番号】WO2019/226944
【公表番号】特表2021-526134(P2021-526134A)
【公表日】令和3年9月30日(2021.9.30)
【出願番号】特願2020-564326(P2020-564326)
【国際特許分類】
C07D487/04(2006.01)
A61K 31/4985(2006.01)
A61P 43/00(2006.01)
A61P 7/06(2006.01)
【ＦＩ】
C07D487/04 144
C07D487/04 CSP
A61K 31/4985
A61P 43/00 111
A61P 7/06

【手続補正書】
【提出日】令和5年3月24日(2023.3.24)
【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】
６－［（３Ｓ，４Ｓ）－４－メチル－１－（ピリミジン－２－イルメチル）ピロリジン－３－イル］－３－テトラヒドロピラン－４－イル－７Ｈ－イミダゾ［１，５－ａ］ピラジン－８－オンの一水和物結晶形態。
【化１】



（化合物１）
【請求項２】
前記一水和物結晶形態がＭＨ１であり、約９．１、１１．５、１６．２、１６．７、１８．２、１８．９、１９．８、２２．６、および２６．４°２θの２θ角度、それぞれ±０．２°２θのピークを含むＸＲＰＤパターンを有する、請求項１に記載の一水和物結晶形態。

【請求項３】
前記一水和物結晶形態がＭＨ１であり、実質的に図２Ａに示されるようなＸＲＰＤパターンを有する、請求項１に記載の一水和物結晶形態。
【請求項４】
前記一水和物結晶形態がＭＨ２であり、約９．０、１１．６、１５．０、１６．０、１８．６、１９．１、２０．４、および２０．６°２θの２θ角度、それぞれ±０．２°２θのピークを含むＸＲＰＤパターンを有する、請求項１に記載の一水和物結晶形態。
【請求項５】
前記一水和物結晶形態がＭＨ２であり、実質的に図７に示されるようなＸＲＰＤパターンを有する、請求項１に記載の一水和物結晶形態。
【請求項６】
請求項１－５のいずれか１項に記載の治療上有効な量の一水和物結晶形態、および薬学的に許容される賦形剤を含む医薬組成物。
【請求項７】
化合物１と、酢酸ｎ－プロピル、酢酸イソプロピル、アニソール、メチルイソブチルケトン、クメン、イソプロパノール、２－メチルテトラヒドロフラン、およびそれらの組み合わせを含む群から選択される溶媒を含む溶液から、一水和物結晶形態を沈殿させる工程を含む、化合物１の一水和物結晶形態を調製するためのプロセス。
【請求項８】
請求項１－５のいずれか１項に記載の一水和物結晶形態を患者に投与する工程を含む、患者のＰＤＥ９活性を阻害する方法。
【請求項９】
化合物１の一水和物形態１（ＭＨ１）を調製するためのプロセスであって、
（ｉ）溶液を得るために、化合物１を第１の溶媒に溶解する工程、
（ｉｉ）混合物を得るために、第２の溶媒を加える工程、および
（ｉｉｉ）固形物を得るために、混合物を濾過する工程を含み、
ここで、第１および第２の溶媒はそれぞれ、酢酸イソプロピル、エタノール、テトラヒドロフラン、水、ジクロロメタン、アセトニトリル、アニソール、メチルイソブチルケトン、ニトロメタン、１，２－ジメトキシエタン、メチルエチルケトン、ｎ－ヘプタン、１，４－ジオキサン、ｎ－酢酸プロピル、２－プロパノール、アセトン、クメン、Ｎ，Ｎ－ジメチルホルムアミド、ジメチルスルホキシド、およびそれらの組み合わせから、個別に選択されるプロセス。
【請求項１０】
化合物１の一水和物形態２（ＭＨ２）を調製するためのプロセスであって、
ａ．懸濁液を得るために、第１の溶媒系を用いて化合物１またはＭＨ１を処理する工程、
ｂ．固形物を得るために、懸濁液を濾過する工程、
ｃ．ヘプタンを用いて固形物を洗浄する工程、および
ｄ．ＭＨ２を得るために、乾燥して溶媒を除去する工程を含み、
ここで、前記溶媒は、水と、酢酸エチル（ＥｔＯＡｃ）または酢酸メチル（ＭｅＯＡｃ）の混合物であって、２％（ｖ／ｖ）ＥｔＯＡｃ／水、２．７％（ｖ／ｖ）ＥｔＯＡｃ／水、および７．５％（ｖ／ｖ）ＭｅＯＡｃ／水から選択されるプロセス。