

【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12月12日(2022.12.12)

【国際公開番号】WO2020/118113
 【公表番号】特表2022-511800(P2022-511800A)
 【公表日】令和4年2月1日(2022.2.1)
 【年通号数】公開公報(特許)2022-018
 【出願番号】特願2021-531047(P2021-531047)
 【国際特許分類】

10

C 0 7 D 3 0 7 / 8 0 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 K 3 1 / 3 4 3 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 P 1 9 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 K 4 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 K 3 1 / 5 1 9 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 K 3 1 / 4 2 6 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 K 3 1 / 4 4 3 9 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 K 3 1 / 0 4 7 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 K 3 1 / 3 8 1 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 K 3 1 / 3 5 1 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 K 3 1 / 5 2 2 (2 0 0 6 . 0 1)
 A 6 1 K 3 1 / 1 5 5 (2 0 0 6 . 0 1)

20

【 F I 】

C 0 7 D 3 0 7 / 8 0 C S P
 A 6 1 K 3 1 / 3 4 3
 A 6 1 P 1 9 / 0 6
 A 6 1 K 4 5 / 0 0
 A 6 1 K 3 1 / 5 1 9
 A 6 1 K 3 1 / 4 2 6
 A 6 1 K 3 1 / 4 4 3 9
 A 6 1 K 3 1 / 0 4 7
 A 6 1 K 3 1 / 3 8 1
 A 6 1 K 3 1 / 3 5 1
 A 6 1 K 3 1 / 5 2 2
 A 6 1 K 3 1 / 1 5 5

30

【手続補正書】

【提出日】令和4年12月2日(2022.12.2)

【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

40

【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】

(3, 5 - ジプロモ - 4 - ヒドロキシフェニル) (2 - (1 - ヒドロキシエチル) ベンゾフラン - 3 - イル - 4, 5, 6, 7 - d₄) メタノンの結晶形態またはその溶媒和物。

【請求項2】

(3, 5 - ジプロモ - 4 - ヒドロキシフェニル) (2 - (1 - ヒドロキシエチル) ベンゾフラン - 3 - イル - 4, 5, 6, 7 - d₄) メタノンの結晶形態は、以下の特性：

50

(a) 図 1 に示されるものと実質的に同じ X 線粉末回折 (X R P D) パターン、
 (b) 6 . 8 ° 2 - シータ、13 . 6 ° 2 - シータ、14 . 6 ° 2 - シータ、21 . 2 ° 2 - シータ、24 . 2 ° 2 - シータ、24 . 7 ° 2 - シータ、26 . 7 ° 2 - シータ、および 27 . 5 ° 2 - シータでの特徴的なピークを有する、X 線粉末回折 (X R P D) パターン、
 (c) 図 2 に示されるものに実質的に類似する熱重量分析 (T G A)、
 (d) 図 3 に示されるものに実質的に類似する D S C サーマグラム、
 (e) 約 147 での開始点を有する吸熱を伴う D S C サーマグラム、
 (f) 非吸湿性、または、
 (g) これらの組み合わせ、
 の少なくとも 1 つを有する形態 3 である、
 請求項 1 に記載の結晶形態。

10

【請求項 3】

結晶形態は、図 1 に示されるものと実質的に同じ X 線粉末回折 (X R P D) パターンを有する、請求項 2 に記載の結晶形態。

【請求項 4】

結晶形態は、6 . 8 ° 2 - シータ、13 . 6 ° 2 - シータ、14 . 6 ° 2 - シータ、21 . 2 ° 2 - シータ、24 . 2 ° 2 - シータ、24 . 7 ° 2 - シータ、26 . 7 ° 2 - シータ、および 27 . 5 ° 2 - シータでの特徴的なピークを有する、X 線粉末回折 (X R P D) パターンを有する、請求項 2 に記載の結晶形態。

20

【請求項 5】

結晶形態は、図 2 に示されるものに実質的に類似する熱重量分析 (T G A) を有する、請求項 2 に記載の結晶形態。

【請求項 6】

結晶形態は、図 3 に示されるものに実質的に類似する D S C サーマグラムを有する、請求項 2 に記載の結晶形態。

【請求項 7】

結晶形態は、約 147 での開始点を有する吸熱を伴う D S C サーマグラムを有する、請求項 2 に記載の結晶形態。

【請求項 8】

結晶形態は非吸湿性である、請求項 2 に記載の結晶形態。

30

【請求項 9】

結晶形態は、特性 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、および (f) を有すると特徴付けられる、請求項 2 に記載の結晶形態。

【請求項 10】

— (3 , 5 - ジブロモ - 4 - ヒドロキシフェニル) (2 - (1 - ヒドロキシエチル) ベンゾフラン - 3 - イル - 4 , 5 , 6 , 7 - d₄) メタノンの結晶形態は、以下の特性：

(a) 図 4 に示されるものと実質的に同じ X 線粉末回折 (X R P D) パターン、
 (b) 8 . 3 ° 2 - シータ、10 . 7 ° 2 - シータ、16 . 6 ° 2 - シータ、19 . 7 ° 2 - シータ、23 . 7 ° 2 - シータ、25 . 0 ° 2 - シータ、25 . 6 ° 2 - シータ、および 27 . 1 ° 2 - シータでの特徴的なピークを有する、X 線粉末回折 (X R P D) パターン、
 (c) 図 5 に示されるものに実質的に類似する熱重量分析 (T G A)、
 (d) 図 6 に示されるものに実質的に類似する D S C サーマグラム、
 (e) 約 139 での開始点を有する吸熱を伴う D S C サーマグラム、
 (f) 非吸湿性、または、
 (g) これらの組み合わせ、
 の少なくとも 1 つを有する形態 2 である、請求項 1 に記載の結晶形態。

40

【請求項 11】

結晶形態は、図 4 に示されるものと実質的に同じ X 線粉末回折 (X R P D) パターンを

50

有する、請求項 10 に記載の結晶形態。

【請求項 12】

結晶形態は、 8.3° 2 - シータ、 10.7° 2 - シータ、 16.6° 2 - シータ、 19.7° 2 - シータ、 23.7° 2 - シータ、 25.0° 2 - シータ、 25.6° 2 - シータ、および 27.1° 2 - シータでの特徴的なピークを有する、X線粉末回折 (XRPD) パターンを有する、請求項 10 に記載の結晶形態。

【請求項 13】

結晶形態は、図 5 に示されるものに実質的に類似する熱重量分析 (TGA) を有する、請求項 10 に記載の結晶形態。

【請求項 14】

結晶形態は、図 6 に示されるものに実質的に類似する DSC サーモグラムを有する、請求項 10 に記載の結晶形態。

10

【請求項 15】

結晶形態は、約 139 での開始点を有する吸熱を伴う DSC サーモグラムを有する、請求項 10 に記載の結晶形態。

【請求項 16】

結晶形態は非吸湿性である、請求項 10 に記載の結晶形態。

【請求項 17】

結晶形態は、特性 (a)、(b)、(c)、(d)、(e)、および (f) を有すると特徴付けられる、請求項 10 に記載の結晶形態。

20

【請求項 18】

— (3, 5 - ジブプロモ - 4 - ヒドロキシフェニル) (2 - (1 - ヒドロキシエチル) ベンゾフラン - 3 - イル - 4, 5, 6, 7 - d₄) メタノンの結晶形態は、以下の特性：

(a) 図 7 に示されるものと実質的に同じ X線粉末回折 (XRPD) パターン、

(b) 5.6° 2 - シータ、 11.5° 2 - シータ、 13.8° 2 - シータ、 14.3° 2 - シータ、 17.0° 2 - シータ、 18.9° 2 - シータ、 27.9° 2 - シータ、および 31.4° 2 - シータでの特徴的なピークを有する、X線粉末回折 (XRPD) パターン、

(c) 図 8 に示されるものに実質的に類似する熱重量分析 (TGA)、

(d) 図 9 に示されるものに実質的に類似する DSC サーモグラム、

30

(e) 約 80 での開始点を有する吸熱を伴う DSC サーモグラム、または、

(f) これらの組み合わせ、

の少なくとも 1 つを有する形態 1 である、請求項 1 に記載の結晶形態。

【請求項 19】

結晶形態は、図 7 に示されるものと実質的に同じ X線粉末回折 (XRPD) パターンを有する、請求項 18 に記載の結晶形態。

【請求項 20】

結晶形態は、 5.6° 2 - シータ、 11.5° 2 - シータ、 13.8° 2 - シータ、 14.3° 2 - シータ、 17.0° 2 - シータ、 18.9° 2 - シータ、 27.9° 2 - シータ、および 31.4° 2 - シータでの特徴的なピークを有する、X線粉末回折 (XRPD) パターンを有する、請求項 18 に記載の結晶形態。

40

【請求項 21】

結晶形態は、図 8 に示されるものに実質的に類似する熱重量分析 (TGA) を有する、請求項 18 に記載の結晶形態。

【請求項 22】

結晶形態は、図 9 に示されるものに実質的に類似する DSC サーモグラムを有する、請求項 18 に記載の結晶形態。

【請求項 23】

結晶形態は、約 80 での開始点を有する吸熱を伴う DSC サーモグラムを有する、請求項 18 に記載の結晶形態。

50

【請求項 2 4】

結晶形態は、特性 (a)、(b)、(c)、(d)、および (e) を有すると特徴付けられる、請求項 1 8 に記載の結晶形態。

【請求項 2 5】

請求項 1 - 2 4 のいずれか 1 つの結晶形態と、薬学的に許容可能な担体、希釈剤、および賦形剤から選択される少なくとも 1 つの不活性成分とを含む医薬組成物。

【請求項 2 6】

高尿酸血症または痛風を処置するための医薬の製造における、請求項 1 - 2 4 のいずれか 1 つの結晶形態の使用。

10

20

30

40

50