

【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9月30日(2021.9.30)

【公表番号】特表2020-533412(P2020-533412A)

【公表日】令和2年11月19日(2020.11.19)

【年通号数】公開・登録公報2020-047

【出願番号】特願2020-536496(P2020-536496)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/56 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 213/56 C S P

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 17/06

【手続補正書】

【提出日】令和3年8月20日(2021.8.20)

【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

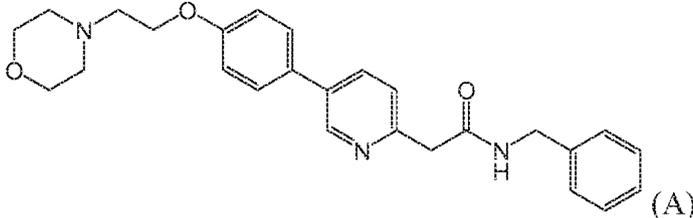
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

形態A、形態B及び形態Cから選択される、化合物Aの多形であって：



前記形態Aが、Cu K 照射を用いて、およそ4.3、17.0及び21.1°2 にX線粉末回折ピークを有することによって特徴付けられ、

前記形態Bが、Cu K 照射を用いて、およそ6.4、19.3及び19.9°2 にX線粉末回折ピークを有することによって特徴付けられ、及び

前記形態Cが、Cu K 照射を用いて、およそ7.9、17.2及び17.6°2 にX線粉末回折ピークを有することによって特徴付けられる、

化合物Aの多形。

【請求項2】

Cu K 照射を用いて、およそ6.4、7.2、19.3、19.9、21.6、22.1及び22.6°2 にX線粉末回折ピークを有することによって特徴付けられる、請求項1記載の形態B多形。

【請求項3】

Cu K 照射を用いて、およそ6.4、7.2、19.3、19.9、21.6、22.1、22.6、及び24.2°2にX線粉末回折ピークを有することによって特徴付けられる、請求項1記載の形態B多形

。

【請求項4】

図1、6、8、10、15又は20に記載されたものと実質的に同様のX線粉末回折パターンを有することによって特徴付けられる、請求項1記載の形態B多形。

【請求項5】

図15に記載されたものと実質的に同様のX線粉末回折パターンを有することによって特徴付けられる、請求項1記載の形態B多形。

【請求項6】

DSCによって測定された場合に、およそ133 ~ およそ138 で開始する吸熱性事象によって特徴付けられる、請求項1記載の形態B多形。

【請求項7】

DSCによって測定された場合に、およそ136 で開始する吸熱性事象によって特徴付けられる、請求項1記載の形態B多形。

【請求項8】

図16に記載されたものと実質的に同様のDSCサーモグラムによって特徴付けられる、請求項1記載の形態B多形。

【請求項9】

TGAによって測定された場合に、約33 ~ 約150 でのおよそ0.20%の重量減少によって特徴付けられる、請求項1記載の形態B多形。

【請求項10】

Cu K 照射を用いて、およそ5.8、7.9、8.7、17.2及び17.6°2 にX線粉末回折ピークを有することによって特徴付けられる、請求項1記載の形態C多形。

【請求項11】

図1又は2に記載されたものと実質的に同様のX線粉末回折パターンを有することによって特徴付けられる、請求項1記載の形態C多形。

【請求項12】

DSCによって測定された場合に、およそ136 ~ およそ140 で開始する吸熱性事象によって特徴付けられる、請求項1記載の形態C多形。

【請求項13】

図3に記載されたものと実質的に同様のDSCサーモグラムによって特徴付けられる、請求項1記載の形態C多形。

【請求項14】

TGAによって測定された場合に、約33 ~ 約150 でのおよそ0.18%の重量減少によって特徴付けられる、請求項1記載の形態C多形。

【請求項15】

Cu K 照射を用いて、およそ4.3、6.4、8.6、12.7、17.0及び21.1°2 にX線粉末回折ピークを有することによって特徴付けられる、請求項1記載の形態A多形。

【請求項16】

図1、5、7、9、11、13又は18に記載されたものと実質的に同様のX線粉末回折パターンを有することによって特徴付けられる、請求項1記載の形態A多形。

【請求項17】

DSCによって測定された場合に、およそ124 ~ およそ135 で開始する吸熱性事象によって特徴付けられる、請求項1記載の形態A多形。

【請求項18】

DSCによって測定された場合に、およそ135 ~ およそ139 で開始する吸熱性事象によって特徴付けられる、請求項1記載の形態A多形。

【請求項19】

DSCによって測定された場合に、およそ124 ~ およそ135 及びおよそ135 ~ およそ13

9 で開始する吸熱性事象によって特徴付けられる、請求項1記載の形態A多形。

【請求項20】

図12又は14に記載されたものと実質的に同様のDSCサーモグラムによって特徴付けられる、請求項1記載の形態A多形。

【請求項21】

TGAによって測定された場合に、約33 ~ 約150 でのおよそ0.36%の重量減少によって特徴付けられる、請求項1記載の形態A多形。

【請求項22】

請求項1~21のいずれか一項記載の多形と、薬学的に許容され得る担体又は賦形剤とを含む、薬学的組成物。

【請求項23】

請求項1記載の形態A多形を調製する方法であって、

メタノール若しくはエタノール中の化合物Aの濃縮された溶液中に逆溶媒の蒸気を拡散させること、

イソプロパノール、THFと水との混合物、若しくはアセトンとMTBEとの混合物中の化合物Aの溶液を徐冷すること、又は

クロロホルム、メタノール、アセトン、テトラヒドロフラン、ジオキサン、エタノール、2-Me-THF、酢酸エチル、若しくはジクロロメタン中の化合物Aの溶液に逆溶媒を添加すること

を含む、方法。

【請求項24】

請求項1記載の形態B多形を調製する方法であって、

クロロホルム中で化合物Aを泥状物化すること、

メタノール若しくはクロロホルム中の化合物Aの濃縮された溶液中に逆溶媒の蒸気を拡散させること、

アセトン、酢酸イソプロピル、2-Me-THF、酢酸エチル、アセトニトリル、若しくはクロロホルムとヘプタンとの混合物中の化合物Aの溶液を徐冷すること、又は

クロロホルム、メタノール、アセトン、若しくはアセトニトリル中の化合物Aの溶液に逆溶媒を添加すること

を含む、方法。

【請求項25】

請求項1記載の形態C多形を調製する方法であって、

メタノール、エタノール、イソプロパノール、アセトン、MIBK、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、テトラヒドロフラン、2-Me-THF、ジオキサン、MTBE、アセトニトリル、ジクロロメタン、クロロホルム、トルエン、ヘプタン、水、若しくはこれらの混合物中で化合物Aを泥状物化すること、

溶媒の蒸気を化合物Aの固体形態と相互作用させること、

ジクロロメタン中の化合物Aの濃縮された溶液中に逆溶媒の蒸気を拡散させること、

トルエン、MIBK、若しくはメタノールとトルエンとの混合物中の化合物Aの溶液を徐冷すること、又は

ポリマーの存在下で溶媒中の化合物Aの溶液を結晶化させること

を含む、方法。

【請求項26】

対象におけるSrcチロシンキナーゼが役割を果たす疾病又は症状を処置又は予防するための薬学的組成物であって、請求項1~21のいずれか一項記載の多形を含む、薬学的組成物。

【請求項27】

Srcチロシンキナーゼが役割を果たす疾病又は症状の処置又は予防を必要とする対象中のSrcチロシンキナーゼが役割を果たす疾病又は症状の処置又は予防のための医薬の製造における請求項1~21のいずれか一項記載の多形の使用。

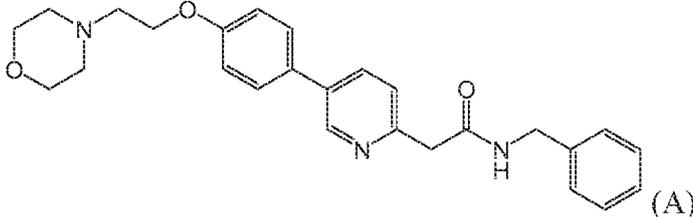
【手続補正2】【補正対象書類名】明細書【補正対象項目名】0022【補正方法】変更【補正の内容】

【0022】

本開示の他の特徴及び利点は、以下の詳細な説明及び特許請求の範囲から明らかとなるであろう。

【本発明1001】

形態A、形態B及び形態Cから選択される、化合物Aの多形であって：



前記形態Aが、Cu K 照射を用いて、およそ4.3、17.0及び21.1°² にX線粉末回折ピークを有することによって特徴付けられ、

前記形態Bが、Cu K 照射を用いて、およそ6.4、19.3及び19.9°² にX線粉末回折ピークを有することによって特徴付けられ、及び

前記形態Cが、Cu K 照射を用いて、およそ7.9、17.2及び17.6°² にX線粉末回折ピークを有することによって特徴付けられる、

化合物Aの多形。

【本発明1002】

Cu K 照射を用いて、およそ4.3、6.4、8.6、12.7、17.0及び21.1°² にX線粉末回折ピークを有することによって特徴付けられる、本発明1001の形態A多形。

【本発明1003】

図1、5、7、9、11、13又は18に記載されたものと実質的に同様のX線粉末回折パターンを有することによって特徴付けられる、本発明1001の形態A多形。

【本発明1004】

DSCによって測定された場合に、およそ124 ~およそ135 で開始する吸熱性事象によって特徴付けられる、本発明1001の形態A多形。

【本発明1005】

DSCによって測定された場合に、およそ135 ~およそ139 で開始する吸熱性事象によって特徴付けられる、本発明1001の形態A多形。

【本発明1006】

DSCによって測定された場合に、およそ124 ~およそ135 及びおよそ135 ~およそ139 で開始する吸熱性事象によって特徴付けられる、本発明1001の形態A多形。

【本発明1007】

図12又は14に記載されたものと実質的に同様のDSCサーモグラムによって特徴付けられる、本発明1001の形態A多形。

【本発明1008】

TGAによって測定された場合に、約33 ~約150 でのおよそ0.36%の重量減少によって特徴付けられる、本発明1001の形態A多形。

【本発明1009】

Cu K 照射を用いて、およそ6.4、7.2、19.3、19.9、21.6、22.1及び22.6°² にX線粉末回折ピークを有することによって特徴付けられる、本発明1001の形態B多形。

【本発明1010】

図1、6、8、10、15又は20に記載されたものと実質的に同様のX線粉末回折パターンを有することによって特徴付けられる、本発明1001の形態B多形。

[本発明1011]

DSCによって測定された場合に、およそ133 ~ およそ138 で開始する吸熱性事象によって特徴付けられる、本発明1001の形態B多形。

[本発明1012]

図16に記載されたものと実質的に同様のDSCサーモグラムによって特徴付けられる、本発明1001の形態B多形。

[本発明1013]

TGAによって測定された場合に、約33 ~ 約150 でのおよそ0.20%の重量減少によって特徴付けられる、本発明1001の形態B多形。

[本発明1014]

Cu K 照射を用いて、およそ5.8、7.9、8.7、17.2及び17.6°2 にX線粉末回折ピークを有することによって特徴付けられる、本発明1001の形態C多形。

[本発明1015]

図1又は2に記載されたものと実質的に同様のX線粉末回折パターンを有することによって特徴付けられる、本発明1001の形態C多形。

[本発明1016]

DSCによって測定された場合に、およそ136 ~ およそ140 で開始する吸熱性事象によって特徴付けられる、本発明1001の形態C多形。

[本発明1017]

図3に記載されたものと実質的に同様のDSCサーモグラムによって特徴付けられる、本発明1001の形態C多形。

[本発明1018]

TGAによって測定された場合に、約33 ~ 約150 でのおよそ0.18%の重量減少によって特徴付けられる、本発明1001の形態C多形。

[本発明1019]

本発明1001の多形と、薬学的に許容され得る担体又は賦形剤とを含む、薬学的組成物。

[本発明1020]

本発明1001の形態A多形を調製する方法であって、

メタノール若しくはエタノール中の化合物Aの濃縮された溶液中に逆溶媒の蒸気を拡散させること、

イソプロパノール、THFと水との混合物、若しくはアセトンとMTBEとの混合物中の化合物Aの溶液を徐冷すること、又は

クロロホルム、メタノール、アセトン、テトラヒドロフラン、ジオキサン、エタノール、2-Me-THF、酢酸エチル、若しくはジクロロメタン中の化合物Aの溶液に逆溶媒を添加すること

を含む、方法。

[本発明1021]

本発明1001の形態B多形を調製する方法であって、

クロロホルム中で化合物Aを泥状物化すること、

メタノール若しくはクロロホルム中の化合物Aの濃縮された溶液中に逆溶媒の蒸気を拡散させること、

アセトン、酢酸イソプロピル、2-Me-THF、酢酸エチル、アセトニトリル、若しくはクロロホルムとヘプタンとの混合物中の化合物Aの溶液を徐冷すること、又は

クロロホルム、メタノール、アセトン、若しくはアセトニトリル中の化合物Aの溶液に逆溶媒を添加すること

を含む、方法。

[本発明1022]

本発明1001の形態C多形を調製する方法であって、

メタノール、エタノール、イソプロパノール、アセトン、MIBK、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、テトラヒドロフラン、2-Me-THF、ジオキサン、MTBE、アセトニトリル、ジクロ

ロメタン、クロロホルム、トルエン、ヘプタン、水、若しくはこれらの混合物中で化合物Aを泥状物化すること、

溶媒の蒸気を化合物Aの固体形態と相互作用させること、

ジクロロメタン中の化合物Aの濃縮された溶液中に逆溶媒の蒸気を拡散させること、

トルエン、MIBK、若しくはメタノールとトルエンとの混合物中の化合物Aの溶液を徐冷すること、又は

ポリマーの存在下で溶媒中の化合物Aの溶液を結晶化させることを含む、方法。

[本発明1023]

Srcチロシンキナーゼが役割を果たす疾病又は症状を処置又は予防する方法であって、Srcチロシンキナーゼが役割を果たす疾病又は症状を処置又は予防することを必要とする対象に、本発明1001の多形を投与することを含む、方法。

[本発明1024]

Srcチロシンキナーゼが役割を果たす疾病又は症状を処置又は予防することを必要とする対象中のSrcチロシンキナーゼが役割を果たす疾病又は症状を処置又は予防するための、本発明1001の多形。

[本発明1025]

Srcチロシンキナーゼが役割を果たす疾病又は症状の処置又は予防を必要とする対象中のSrcチロシンキナーゼが役割を果たす疾病又は症状の処置又は予防のための医薬の製造において使用するための本発明1001の多形。

[本発明1026]

Srcチロシンキナーゼが役割を果たす疾病又は症状の処置又は予防を必要とする対象中のSrcチロシンキナーゼが役割を果たす疾病又は症状の処置又は予防のための医薬の製造における本発明1001の多形の使用。