

【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 1 年 6 月 6 日 (2019.6.6)

【公表番号】特表 2018-516883 (P2018-516883A)

【公表日】平成 30 年 6 月 28 日 (2018.6.28)

【年通号数】公開・登録公報 2018-024

【出願番号】特願 2017-557899 (P2017-557899)

【国際特許分類】

C 0 7 C 211/40 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/13 (2006.01)

C 0 7 C 209/62 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C 211/40 C S P

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 31/13

C 0 7 C 209/62

【手続補正書】

【提出日】平成 31 年 4 月 25 日 (2019.4.25)

【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

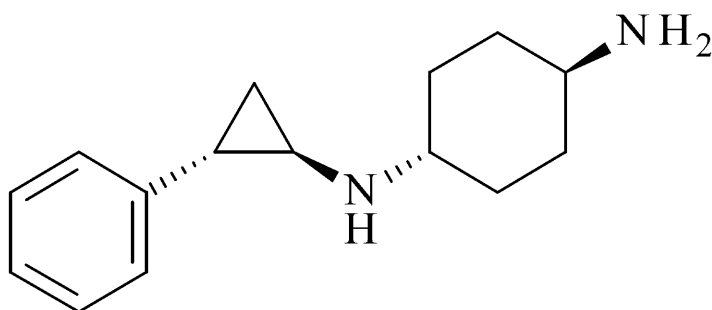
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

14.9°、16.0°及び24.8°(±0.2°)の回折角2シートにXRPDピークを含むXRPD回折パターンによって特徴付けられる、式(I)



(I)

の化合物の二塩酸塩の固体形態。

【請求項 2】

14.9°、16.0°、20.6°及び24.8°(±0.2°)の回折角2シートにXRPDピークを含むXRPD回折パターンによって特徴付けられる、請求項1に記載の固体形態。

【請求項 3】

14.9°、16.0°、20.6°、24.8°、25.7°及び31.5°(±0.2°)の回折角2シートにXRPDピークを含むXRPD回折パターンによって特徴付

けられる、請求項 1 又は 2 に記載の固体形態。

【請求項 4】

14.9°、16.0°、20.6°、24.8°、25.7°、31.5° 及び 35.9° (±0.2°) の回折角 2 シータに XRPD ピークを含む XRPD 回折パターンによって特徴付けられる、請求項 1 から 3 の何れか一項に記載の固体形態。

【請求項 5】

14.6°、14.9°、16.0°、17.7°、18.7°、19.4°、20.6°、21.7°、24.4°、24.8°、25.7°、31.5°、35.2° 及び 35.9° (±0.2°) の回折角 2 シータに XRPD ピークを含む XRPD 回折パターンによって特徴付けられる、請求項 1 から 4 の何れか一項に記載の固体形態。

【請求項 6】

以下の表 4、表 5、表 10 及び / 又は表 11 :

表 4	表 5	表 1 0	表 1 1
2 シー タ/°	2 シー タ/°	2 シー タ/°	2 シー タ/°
3.4	3.4	14.6	3.4
6.8	14.6	14.9	14.6
10.2	14.9	15.4	14.9
13.6	15.4	16.0	15.4
14.6	16.0	16.8	16.0
14.9	16.8	17.5	16.8
15.4	17.5	17.7	17.5
16.1	17.7	18.1	17.7
16.8	18.1	18.7	18.1
17.5	18.7	19.4	18.7
17.7	19.4	20.6	19.4
18.1	20.2	20.8	20.6
18.5	20.6	21.2	20.8
18.7	20.8	21.6	21.1
18.9	21.2	24.8	21.6
19.4	21.6	25.2	23.0
19.9	23.8	25.6	23.8
20.2	24.4	29.3	24.4
20.6	24.8	29.5	24.8
20.8	25.2	29.7	25.2
21.1	25.6	31.3	25.7
21.7	29.3	31.5	29.3
22.1	29.5	31.7	29.5
23.0	29.7	32.0	29.7
23.8	31.3	35.1	30.4
23.9	31.5	35.3	30.5
24.4	31.7	35.6	31.3
24.8	32.0	35.9	31.5
25.2	35.2	37.0	31.7
25.7	35.3	37.2	32.0
27.9	35.6	37.9	35.1
30.4	35.9		35.3
31.2	37.1		35.6
31.5	37.2		35.9
35.2			36.6
35.6			37.1
35.9			37.2
			37.9

に記載されている回折角 2 シー タ ( ± 0 . 2 ° ) に X R P D ピークを含む X R P D 回折パターンによって特徴付けられる、請求項 1 から 5 の何れか一項に記載の固体形態。

【請求項 7】

図 2、図 3、図 1 5 及び / 又は図 1 6 の X R P D 回折パターンによって特徴付けられる、請求項 1 から 6 の何れか一項に記載の固体形態。

【請求項 8】

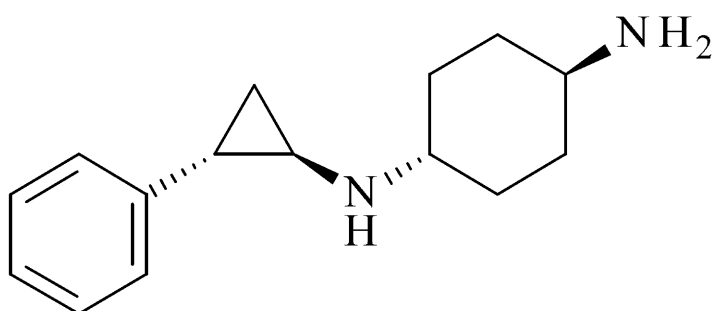
以下の表 ( $\pm 1 \text{ cm}^{-1}$ ) :

波数 ( $\text{cm}^{-1}$ )	波数 ( $\text{cm}^{-1}$ )	波数 ( $\text{cm}^{-1}$ )
2689	1530	952
2656	1517	935
2568	1500	924
2516	1466	912
2476	1392	881
2434	1208	834
2081	1124	762
2045	1111	756
1611	1080	744
1590	1044	690
	1028	

に示される I R スペクトルにおける特徴的なバンド ( $\text{cm}^{-1}$ ) によって特徴付けられる、請求項 1 から 7 の何れか一項に記載の固体形態。

【請求項 9】

ラマンスペクトルにおける  $1225 \text{ cm}^{-1}$  ( $\pm 1 \text{ cm}^{-1}$ ) のバンドによって特徴付けられる、式 (I)



(I)

の化合物の二塩酸塩の固体形態。

【請求項 10】

ラマンスペクトルにおける  $1225 \text{ cm}^{-1}$  ( $\pm 1 \text{ cm}^{-1}$ ) のバンドによって特徴付けられる、請求項 1 から 8 の何れか一項に記載の固体形態。

【請求項 11】

ラマンスペクトルにおける  $1225 \text{ cm}^{-1}$  及び  $745 \text{ cm}^{-1}$  ( $\pm 1 \text{ cm}^{-1}$ ) の特徴的なバンドによって特徴付けられる、請求項 9 又は 10 に記載の固体形態。

【請求項 12】

ラマンスペクトルにおける  $1225 \text{ cm}^{-1}$ 、 $745 \text{ cm}^{-1}$ 、 $207 \text{ cm}^{-1}$ 、及び  $106 \text{ cm}^{-1}$  ( $\pm 1 \text{ cm}^{-1}$ ) の特徴的なバンドによって特徴付けられる、請求項 9 から 11 の何れか一項に記載の固体形態。

【請求項 13】

以下の表 ( $\pm 1 \text{ cm}^{-1}$ ) :

波数シフト ( $\text{cm}^{-1}$ )	波数シフト ( $\text{cm}^{-1}$ )	波数シフト ( $\text{cm}^{-1}$ )
3089	1446	757
3069	1377	745
3053	1312	619
3040	1262	497
3013	1225	477
2952	1209	448
2935	1180	387
2910	1155	277
2881	1073	207
2867	1041	140
1606	1003	106
1583	914	77
1501	881	58
1487	831	
1473	791	

に記載されているラマンスペクトルに特徴的なバンドを含むラマンスペクトルによって特徴付けられる、請求項 9 から 12 の何れか一項に記載の固体形態。

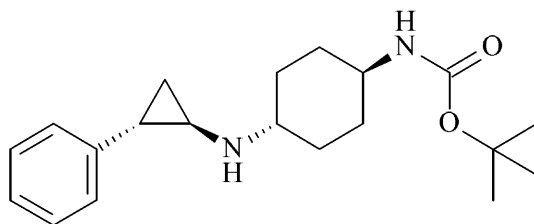
【請求項 14】

少なくとも 90 % (w/w) の純度で、特定の固体形態で存在する、請求項 1 から 13 の何れか一項に記載の固体形態。

【請求項 15】

請求項 1 から 14 の何れか一項に記載の固体形態の調製のための方法であって、反応工程：

a) 式 BOC - (I)



BOC-(I)

の化合物の溶媒への溶解；

b) HCl の溶液の添加；

c) 高温における水の添加；

d) 温度の漸減による生成物の結晶化を含む方法。

【請求項 16】

工程 a) における溶媒が C<sub>1</sub> - 7 アルコールである；及び / 又は

工程 a) における溶媒が 1 - プロパノールである；及び / 又は

工程 b) における溶液が水溶液である；及び / 又は

工程 b) において 2 ~ 20 当量の HCl が添加される；及び / 又は

工程 c) において少なくとも 5 当量の水が添加される；及び / 又は

工程 c) が 50 を超える温度で行なわれる；及び / 又は

工程 d) における温度が - 20 ~ 周囲温度の間の最終温度に下げられる；及び / 又は

工程 d) における温度が 1 ~ 100 / 時間の速度で下げられる、請求項 15 に記載の

方法。

【請求項 17】

請求項 1 から 14 の何れか一項に記載の固体形態並びに薬学的に許容される賦形剤を含む薬学的組成物。

【請求項 18】

請求項 1 から 14 の何れか一項に記載の固体形態を含む治療活性物質。

【請求項 19】

LSD1に関連する疾患又はLSD1阻害剤によって調節される疾患の治療又は予防における使用のための、請求項 17 に記載の薬学的組成物。

【請求項 20】

LSD1に関連する疾患又はLSD1阻害剤によって調節される疾患の治療又は予防に有用な医薬の調製のための、請求項 1 から 14 の何れか一項に記載の固体形態の使用。

【請求項 21】

疾患ががんである請求項 19 に記載の薬学的組成物又は請求項 20 に記載の使用。