

【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6月1日(2022.6.1)

【公開番号】特開2022-68321(P2022-68321A)

【公開日】令和4年5月9日(2022.5.9)

【年通号数】公開公報(特許)2022-080

【出願番号】特願2022-25300(P2022-25300)

【国際特許分類】

C 07 D 213/89(2006.01)

10

A 61 P 29/00(2006.01)

A 61 P 11/00(2006.01)

A 61 P 11/06(2006.01)

A 61 K 31/44(2006.01)

【F I】

C 07 D 213/89 C S P

A 61 P 29/00

A 61 P 11/00

A 61 P 11/06

A 61 K 31/44

20

【手続補正書】

【提出日】令和4年5月23日(2022.5.23)

【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】

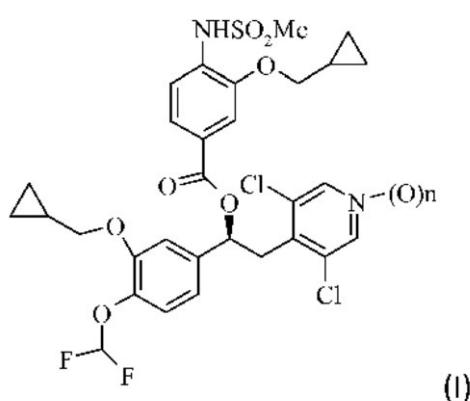
【特許請求の範囲】

【請求項1】

30

式(I)の化合物

【化1】



40

(式中、nは1であり、前記式(I)の化合物の結晶形態は、以下の特徴的なXRDピーク：7, 48; 7, 93; 10, 15; 10, 32; 12, 72; 13, 51; 16, 18; 16, 46; 18, 08; 18, 53; 18, 94; 8, 55; 17, 79; 19, 89; 19, 1; 20, 2; 21, 37; 22, 96; 23, 63; 24, 87; 26, 51; 28, 09; 28, 61及び25, 82±0.2度/2(CuK λ)を特徴とする)の結晶形態の製造方法であって、

50

前記式(Ⅰ)の化合物の懸濁液を固体が溶解するまで加熱するステップ、前記懸濁液を冷却するステップ、及び濾過し、乾燥するステップを含む、製造方法。

【請求項2】

容易に検出することができる不純物の総量が、5w/w%未満である、請求項1に記載の方法。

【請求項3】

容易に検出することができる不純物の総量が、2.5w/w%未満である、請求項1に記載の方法。

【請求項4】

容易に検出することができる不純物の総量が、1w/w%未満である、請求項1に記載の方法。 10

【請求項5】

容易に検出することができる不純物の総量が、0.5w/w%未満である、請求項1に記載の方法。

【請求項6】

結晶化度のパーセンテージが90w/w%以上である、請求項1~4のいずれか一項に記載の方法。

【請求項7】

結晶化度のパーセンテージが95w/w%より高い、請求項1~4のいずれか一項に記載の方法。 20

【請求項8】

前記式(Ⅰ)の化合物の懸濁液を、酢酸エチル/n-ヘプタン又は酢酸イソプロピルとともに、固体が溶解するまで、50~90の間の温度に加熱するステップ、及び前記懸濁液を、0~5の間に1~5時間冷却するステップを含む、請求項1~7のいずれか一項に記載の方法。

【請求項9】

前記式(Ⅰ)の化合物の懸濁液を、酢酸エチルとともに、固体が溶解するまで、50~90の間の温度に加熱するステップ、n-ヘプタンを加えるステップ、及び前記懸濁液を、2時間5に冷却するステップを含む、請求項1~7のいずれか一項に記載の方法。

【請求項10】

前記式(Ⅰ)の化合物の懸濁液を、酢酸イソプロピルとともに、固体が溶解するまで、50~90の間の温度に加熱するステップ、完全に溶解するまで、前記懸濁液を加熱して還流するステップ、及び0に冷却し、2時間攪拌するステップを含む、請求項1~7のいずれか一項に記載の方法。 30

【請求項11】

請求項1~10のいずれか一項に記載の方法により得られる、式(Ⅰ)の化合物(式中、nは1であり、以下の特徴的なXRDピーク:7,48;7,93;10,15;10,32;12,72;13,51;16,18;16,46;18,08;18,53;18,94;8,55;17,79;19,89;19,1;20,2;21,37;22,96;23,63;24,87;26,51;28,09;28,61及び25,82±0.2度/2(CuK λ)を特徴とする)の結晶形態。 40

【請求項12】

結晶化度のパーセンテージが90%以上である、請求項11に記載の結晶形態。

【請求項13】

結晶化度のパーセンテージが95%以上である、請求項11に記載の結晶形態。

【請求項14】

容易に検出することができる不純物の総量が、5w/w%未満である、請求項11に記載の結晶形態。

【請求項15】

容易に検出することができる不純物の総量が、2.5w/w%未満である、請求項11に 50

記載の結晶形態。

【請求項 16】

容易に検出することができる不純物の総量が、1.0w/w%未満である、請求項11に記載の結晶形態。

【請求項 17】

容易に検出することができる不純物の総量が、0.5w/w%未満である、請求項11に記載の結晶形態。

【請求項 18】

適切な担体又はビヒクルと組み合わせて請求項11～17のいずれか一項に定義される結晶形態を含む吸入又は鼻腔投与用の医薬組成物。

10

【請求項 19】

炎症性又は閉塞性の呼吸器疾患の予防及び/又は治療に使用するための請求項11～17のいずれか一項に定義される結晶形態。

【請求項 20】

前記炎症性又は閉塞性の呼吸器疾患は、喘息又は慢性閉塞性肺疾患(COPD)である、請求項19に記載の使用のための結晶形態。

【請求項 21】

炎症性又は閉塞性の呼吸器疾患の予防及び/又は治療に関する医薬の製造における、請求項11～17のいずれか一項に定義される結晶形態の使用。

20

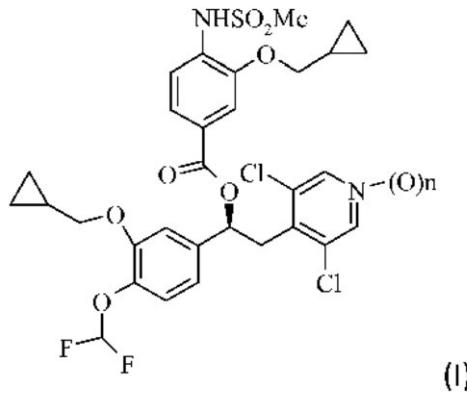
【請求項 22】

前記炎症性又は閉塞性の呼吸器疾患は、喘息又は慢性閉塞性肺疾患(COPD)である、請求項21に記載の使用。

【請求項 23】

式(I)の化合物の結晶形態の溶媒和化合物。

【化2】



30

(式中、nは1であり、溶媒としてのエタノールから得られる)

【請求項 24】

以下の特徴的なXRDピーク：7, 45; 7, 87; 8, 51; 10, 12; 10, 28; 12, 66; 13, 29; 13, 45; 14, 95; 16, 14; 16, 34; 17, 05; 17, 74; 18, 05; 18, 48; 18, 88; 19, 05; 19, 33; 19, 85; 20, 18; 20, 65; 21, 3; 22, 96; 23, 55; 23, 87; 24, 41; 24, 66; 24, 88; 25, 62; 25, 82; 26, 45; 28, 12及び28, 53±0.2度/2を特徴とする、請求項23に記載の溶媒和化合物。

40

【請求項 25】

錠剤、カプセル剤、散剤、持続性放出製剤、軟膏剤、ゲル剤、クリーム剤、坐剤、点眼剤、経皮パッチ、シロップ剤、液剤、懸濁剤、エアロゾル剤、ネブライザー用液剤、鼻腔用スプレー剤から選択される剤形の請求項18に記載の医薬組成物。

【請求項 26】

50

カプセル剤の剤形の請求項 2 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 7】

吸入用の乾燥散剤としての請求項 2 5 に記載の医薬組成物。

10

20

30

40

50