

【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】平成30年3月15日(2018.3.15)

【公表番号】特表2017-505347(P2017-505347A)

【公表日】平成29年2月16日(2017.2.16)

【年通号数】公開・登録公報2017-007

【出願番号】特願2016-568465(P2016-568465)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 P 7/06 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 401/04

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 P 7/06

【手続補正書】

【提出日】平成30年2月5日(2018.2.5)

【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

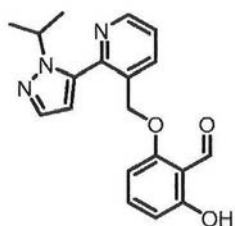
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

化合物 1：

【化 1】



化合物1

の結晶性無溶媒和物。

【請求項 2】

化合物 1 の溶媒和多形を実質的に含まない、請求項 1 に記載の結晶性無溶媒和物。

【請求項 3】

請求項 1 又は 2 に記載の結晶性無溶媒和物を含む組成物。

【請求項 4】

前記結晶性無溶媒和物が、フォーム I、フォーム II 又はマテリアル N のうちの 1 つ以上を含み、ここで、

フォーム I は、 12.82 、 15.74 、 16.03 、 16.63 、 17.60 、 25.14 、 25.82 及び 26.44 (各々 ± 0.2) から選択される少なくとも 1 つの粉末 X 線回折ピーク ($^{\circ}2\theta$ 、Cu K 線) によって特徴付けられ；

フォーム II は、 13.37 、 14.37 、 19.95 及び 23.92 (各々 ± 0.2) から選択される少なくとも 1 つの粉末 X 線回折ピーク ($^{\circ}2\theta$ 、Cu K 線) によっ

て特徴付けられ；及び

マテリアルNは、1 1 . 6 5、1 1 . 8 5、1 2 . 0 8、1 6 . 7 0、1 9 . 6 5及び2 3 . 4 8（各々±0 . 2）から選択される少なくとも1つの粉末X線回折ピーク（° 2、Cu K 線）によって特徴付けられる、請求項1又は2に記載の結晶性無溶媒和物。

【請求項5】

フォームIIを含む、請求項4に記載の結晶性無溶媒和物。

【請求項6】

マテリアルNを含む、請求項4に記載の結晶性無溶媒和物。

【請求項7】

化合物1の塩を溶媒中にスラリー化するステップと、前記化合物1塩を不均化させるステップであって、それにより前記結晶性無溶媒和物を形成するステップを含む、請求項1又は2に記載の結晶性無溶媒和物の調製方法。

【請求項8】

ヘモグロビンSの酸素親和性を増加させるための、請求項1又は2に記載の結晶性無溶媒和物を含む剤。

【請求項9】

ヘモグロビンSの酸素親和性を増加させるための、請求項3に記載の組成物。

【請求項10】

鎌状赤血球貧血に関連する酸素欠乏を治療するための、請求項1又は2に記載の結晶性無溶媒和物を含む剤。

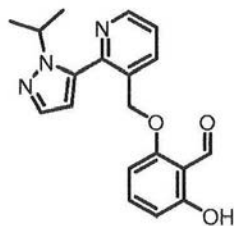
【請求項11】

鎌状赤血球貧血に関連する酸素欠乏を治療するための、請求項3に記載の組成物。

【請求項12】

化合物1：

【化2】



化合物1

の結晶性溶媒和物。

【請求項13】

化合物1の無溶媒和多形を実質的に含まない、請求項12に記載の結晶性溶媒和物。

【請求項14】

請求項12又は13に記載の結晶性溶媒和物を含む組成物。

【請求項15】

マテリアルE、マテリアルF、マテリアルG、マテリアルH、マテリアルJ、マテリアルK、マテリアルL、マテリアルM、マテリアルO又はマテリアルPのうちの1つ以上を含む、請求項12又は13に記載の結晶性溶媒和物。

【請求項16】

マテリアルEが、8 . 6 9、1 1 . 7 3、1 2 . 1 0、1 5 . 2 6、1 6 . 1 1、1 7 . 4 5、2 2 . 3 9、2 2 . 5 5及び2 3 . 7 0（各々±0 . 20）から選択される少なくとも1つ、2つ、又は3つの粉末X線回折ピーク（° 2、Cu K 線）によって特徴付けられ；

マテリアルFが、8 . 4 7、8 . 8 1、1 2 . 7 5、1 3 . 1 7、1 4 . 9 2、1 5 .

63、17.01、23.73、及び24.07(各々±0.20)から選択される少なくとも1つ、2つ、又は3つの粉末X線回折ピーク(°2θ、Cu K線)によって特徴付けられ；

マテリアルGが、8.47、11.45、12.62、14.66、15.69、17.01、18.47、20.32、22.61、23.08、23.43及び23.70(各々±0.20)から選択される少なくとも1つ、2つ、又は3つの粉末X線回折ピーク(°2θ、Cu K線)によって特徴付けられ；

マテリアルHが、8.61、11.67、15.33、16.28、17.28、22.58、23.51及び25.77(各々±0.20)から選択される少なくとも1つ、2つ、又は3つの粉末X線回折ピーク(°2θ、Cu K線)によって特徴付けられ；

マテリアルJが、8.52、8.88、12.79、15.04、15.61、17.11、22.81、23.87、24.17、24.62及び26.44(各々±0.20)から選択される少なくとも1つ、2つ、又は3つの粉末X線回折ピーク(°2θ、Cu K線)によって特徴付けられ；

マテリアルKが、8.52、8.83、11.35、15.04、15.74、17.11、23.46、23.58、24.08及び25.99(各々±0.20)から選択される少なくとも1つ、2つ、又は3つの粉末X線回折ピーク(°2θ、Cu K線)によって特徴付けられ；

マテリアルLが、8.61、8.78、11.67、14.94、15.28、16.14、17.30、22.75、23.71及び26.05(各々±0.20)から選択される少なくとも1つ、2つ、又は3つの粉末X線回折ピーク(°2θ、Cu K線)によって特徴付けられ；及び

マテリアルMが、7.74、10.05、12.82、15.33、16.80、20.82、21.14、25.80及び26.97(各々±0.20)から選択される少なくとも1つ、2つ、又は3つの粉末X線回折ピーク(°2θ、Cu K線)によって特徴付けられる、請求項15に記載の結晶性溶媒和物。

【請求項17】

化合物1の遊離塩基無溶媒和物を溶媒と接触させるステップを含む、請求項12又は13に記載の結晶性溶媒和物の調製方法。

【請求項18】

ヘモグロビンSの酸素親和性を増加させるための、請求項12又は13に記載の結晶性溶媒和物を含む剤。

【請求項19】

鎌状赤血球貧血に関連する酸素欠乏を治療するための、請求項12に記載の結晶性溶媒和物を含む剤。

【請求項20】

鎌状赤血球貧血を治療するための、請求項1若しくは2に記載の結晶性無溶媒和物又は請求項12若しくは13に記載の結晶性溶媒和物を含む剤。

【請求項21】

鎌状赤血球貧血を治療するための、請求項3又は14に記載の組成物。

【請求項22】

ヘモグロビンに関連する障害を治療するための、請求項1若しくは2に記載の結晶性無溶媒和物又は請求項12若しくは13に記載の結晶性溶媒和物を含む剤。

【請求項23】

ヘモグロビンに関連する障害を治療するための、請求項3又は14に記載の組成物。