

【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 5 月 10 日 (2022.5.10)

【公開番号】特開 2022-49005 (P2022-49005A)

【公開日】令和 4 年 3 月 28 日 (2022.3.28)

【年通号数】公開公報 (特許) 2022-054

【出願番号】特願 2021-148619 (P2021-148619)

【国際特許分類】

C 07 D 405/14 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 K 31/506 (2006.01)

【F I】

C 07 D 405/14 C S P

A 61 P 35/00

A 61 K 31/506

10

【手続補正書】

【提出日】令和 4 年 4 月 26 日 (2022.4.26)

【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】

- 126.1 および - 125.6 ppm \pm 0.2 ppm の共鳴 (ppm) 値を含む ^1H 固体 NMR スペクトルを有する、1, 5 - アンヒドロ - 3 - ({ 5 - クロロ - 4 - [4 - フルオロ - 2 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 1 - (プロパン - 2 - イル) - 1 H - ベンゾイミダゾール - 6 - イル] ピリミジン - 2 - イル } アミノ) - 2, 3 - ジデオキシ - D - threo - ペンチトール (PF - 07220060) - 水和物の結晶性形態 (形態 2) 。

30

【請求項 2】

9.6、11.8、および 14.7 $^{\circ}$ \pm 0.2 $^{\circ}$ の 2 値におけるピークを含む粉末 X 線回折 (P X R D) パターンを有する、PF - 07220060 - 水和物の結晶性形態 (形態 2) 。

【請求項 3】

12.4 $^{\circ}$ \pm 0.2 $^{\circ}$ の 2 値におけるピークをさらに含む P X R D パターンを有する、請求項 2 に記載の結晶性形態。

【請求項 4】

21.0 $^{\circ}$ \pm 0.2 $^{\circ}$ の 2 値におけるピークをさらに含む P X R D パターンを有する、請求項 2 または 3 に記載の結晶性形態。

40

【請求項 5】

1484、1555、および 1587 $\text{cm}^{-1} \pm 2 \text{cm}^{-1}$ の波数 (cm^{-1}) 値を含むラマンスペクトルを有する、請求項 2、3、または 4 に記載の結晶性形態。

【請求項 6】

1387 $\text{cm}^{-1} \pm 2 \text{cm}^{-1}$ の波数 (cm^{-1}) 値をさらに含むラマンスペクトルを有する、請求項 5 に記載の結晶性形態。

【請求項 7】

1395 $\text{cm}^{-1} \pm 2 \text{cm}^{-1}$ の波数 (cm^{-1}) 値をさらに含むラマンスペクトルを有

50

する、請求項 5 または 6 に記載の結晶性形態。

【請求項 8】

22.8 および 163.0 ppm \pm 0.2 ppm の共鳴 (ppm) 値を含む ^{13}C 固体 NMR スペクトルを有する、請求項 2 から 7 のいずれか一項に記載の結晶性形態。

【請求項 9】

50.3、109.8、および 129.1 ppm \pm 0.2 ppm からなる群から選択される 1 つ、2 つ、または 3 つの共鳴 (ppm) 値をさらに含む ^{13}C 固体 NMR スペクトルを有する、請求項 8 に記載の結晶性形態。

【請求項 10】

-126.1 ppm \pm 0.2 ppm の共鳴 (ppm) 値を含む ^{19}F 固体 NMR スペクトルを有する、請求項 2 から 9 のいずれか一項に記載の結晶性形態。 10

【請求項 11】

-125.6 ppm \pm 0.2 ppm の共鳴 (ppm) 値をさらに含む ^{19}F 固体 NMR スペクトルを有する、請求項 2 から 10 のいずれか一項に記載の結晶性形態。

【請求項 12】

22.8 および 163.0 ppm \pm 0.2 ppm の共鳴 (ppm) 値を含む ^{13}C 固体 NMR スペクトルを有する、PF-07220060-水和物の結晶性形態 (形態 2)。

【請求項 13】

50.3、109.8、および 129.1 ppm \pm 0.2 ppm からなる群から選択される 1 つ、2 つ、または 3 つの共鳴 (ppm) 値をさらに含む ^{13}C 固体 NMR スペクトルを有する、請求項 12 に記載の結晶性形態。 20

【請求項 14】

(a) 9.6、11.8、および 14.7 $^{\circ}2 \pm 0.2^{\circ}2$ の 2 値におけるピークを含む粉末 X 線回折 (PXRD) パターン、(b) 1484、1555、および 1587 $\text{cm}^{-1} \pm 2 \text{cm}^{-1}$ の波数 (cm^{-1}) 値を含むラマンスペクトル、(c) 22.8 および 163.0 ppm \pm 0.2 ppm の共鳴 (ppm) 値を含む ^{13}C 固体 NMR スペクトル、もしくは (d) -126.1 および -125.6 ppm \pm 0.2 ppm の共鳴 (ppm) 値を含む ^{19}F 固体 NMR スペクトル、または (a)、(b)、(c)、および (d) のいずれかの組合せを有する、PF-07220060-水和物の結晶性形態 (形態 2)。 30

【請求項 15】

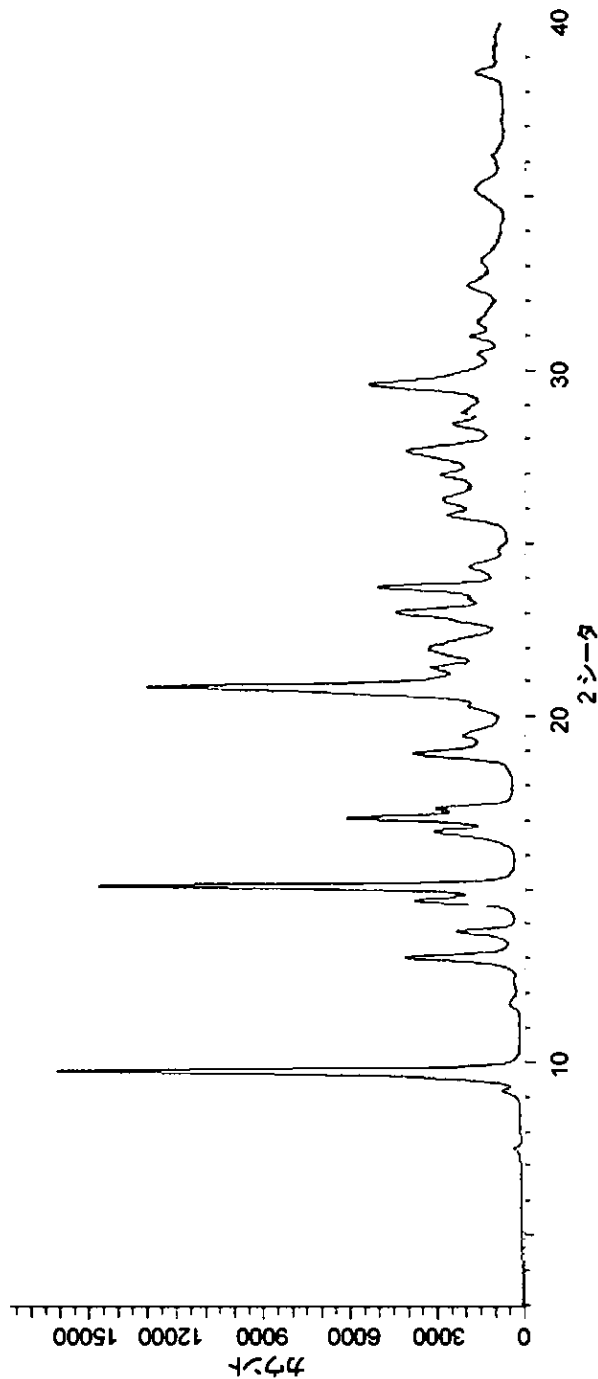
(a) 8.5、10.1、および 13.8 $^{\circ}2 \pm 0.2^{\circ}2$ の 2 値におけるピークを含む粉末 X 線回折 (PXRD) パターン、(b) 1436、1465、および 1566 $\text{cm}^{-1} \pm 2 \text{cm}^{-1}$ の波数 (cm^{-1}) 値を含むラマンスペクトル、(c) 54.7、112.6、および 132.8 ppm \pm 0.2 ppm の共鳴 (ppm) 値を含む ^{13}C 固体 NMR スペクトル、もしくは (d) -132.4 および -131.1 ppm \pm 0.2 ppm の共鳴 (ppm) 値を含む ^{19}F 固体 NMR スペクトル、または (a)、(b)、(c)、および (d) の 2 つ以上のいずれかの組合せを有する、PF-07220060 の無水結晶性形態 (形態 6)。 40

【請求項 16】

図 17 に

【化 1】

図 17



におけるのと本質的に同じ粉末X線回折（PXRD）パターンを有する、PF-07220060の無水結晶性形態（形態11）。

【請求項17】

実質的に純粋である、請求項1から16のいずれか一項に記載の結晶性形態。

【請求項18】

- $127.5 \text{ ppm} \pm 0.5 \text{ ppm}$ の共鳴（ppm）値を含む ^{19}F 固体NMRスペクトルを有する、PF-07220060の非晶性形態（形態8）。

【請求項19】

20.9、49.3、および $116.6 \text{ ppm} \pm 0.5 \text{ ppm}$ の共鳴（ppm）値を含む ^{13}C 固体NMRスペクトルを有する、請求項18の非晶性形態。

【請求項 20】

約 $4 \sim 40^\circ \pm 0.5^\circ$ の回折角 (2θ) における P X R D ピークを有する、請求項 18 または 19 に記載の非晶性形態。

【請求項 21】

請求項 1 から 17 のいずれか一項に記載の結晶性形態または請求項 18 から 20 のいずれか一項に記載の非晶性形態と、薬学的に許容できる担体または賦形剤とを含む医薬組成物。

【請求項 22】

がん処置を必要とする対象においてがん処置に用いるための、請求項 21 に記載の医薬組成物。

10

【請求項 23】

がんが、乳がん、前立腺がん、肺がん、肝臓がん、腎臓がん、膀胱がん、卵巣がん、腹膜がん、卵管がん、子宮頸がん、子宮がん、膵臓がん、胃がん、結腸直腸がん、食道がん、頭頸部がん、精巣がん、副腎がん、皮膚がん、脳腫瘍、肉腫、およびリンパ腫からなる群から選択される、請求項 22 に記載の医薬組成物。

20

30

40

50