

【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)

10

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

20

【手続補正書】

【提出日】令和4年4月26日(2022.4.26)

【手続補正1】

20

【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

- 1 2 6 . 1 および - 1 2 5 . 6 p p m ± 0 . 2 p p m の共鳴 (p p m) 値を含む 1 9 F 固体 N M R 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 - t h r e o - ペンチトール (P F - 0 7 2 2 0 0 6 0) 一水和物の結晶性形態 (形態 2) 。

30

【請求項2】

9 . 6 、 1 1 . 8 、 および 1 4 . 7 ° 2 ± 0 . 2 ° 2 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、 P F - 0 7 2 2 0 0 6 0 一水和物の結晶性形態 (形態 2) 。

30

【請求項3】

1 2 . 4 ° 2 ± 0 . 2 ° 2 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。

40

【請求項4】

2 1 . 0 ° 2 ± 0 . 2 ° 2 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】

1 4 8 4 、 1 5 5 5 、 および 1 5 8 7 c m - 1 ± 2 c m - 1 の波数 (c m - 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】

1 3 8 7 c m - 1 ± 2 c m - 1 の波数 (c m - 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】

1 3 9 5 c m - 1 ± 2 c m - 1 の波数 (c m - 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 ± 0.2 ppm の共鳴 (ppm) 値を含む 13C 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 ± 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 13C 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 ± 0.2 ppm の共鳴 (ppm) 値を含む 19F 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 ± 0.2 ppm の共鳴 (ppm) 値をさらに含む 19F 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 ± 0.2 ppm の共鳴 (ppm) 値を含む 13C 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 ± 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 13C 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° 2 ± 0.2° 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 cm⁻¹ ± 2 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 ± 0.2 ppm の共鳴 (ppm) 値を含む 13C 固体 NMR スペクトル、もしくは (d) -126.1 および -125.6 ppm ± 0.2 ppm の共鳴 (ppm) 値を含む 19F 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】

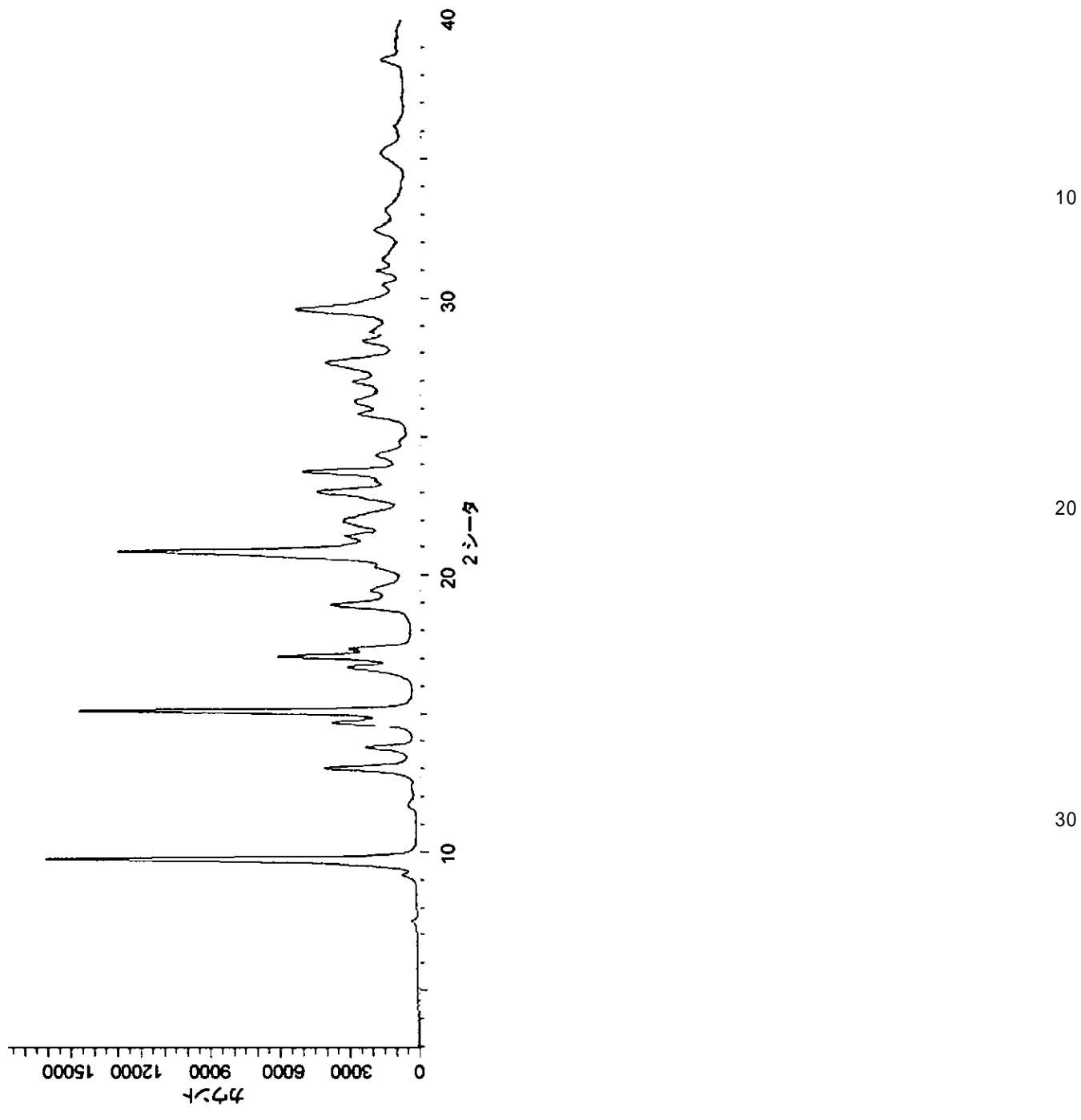
(a) 8.5、10.1、および 13.8° 2 ± 0.2° 2 の 2 値におけるピークを含む粉末 X 線回折 (PXRD) パターン、(b) 1436、1465、および 1566 cm⁻¹ ± 2 cm⁻¹ の波数 (cm⁻¹) 値を含むラマンスペクトル、(c) 54.7、112.6、および 132.8 ppm ± 0.2 ppm の共鳴 (ppm) 値を含む 13C 固体 NMR スペクトル、もしくは (d) -132.4 および -131.1 ppm ± 0.2 ppm の共鳴 (ppm) 値を含む 19F 固体 NMR スペクトル、または (a)、(b)、(c)、および (d) の 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）。

【請求項 16】

図 17 :

【化1】

図17



におけるのと本質的に同じ粉末X線回折(P X R D)パターンを有する、P F - 0 7 2 2 0 0 6 0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 ppm ± 0.5 ppmの共鳴(ppm)値を含む19F固体NMRスペクトルを有する、P F - 0 7 2 2 0 0 6 0の非晶性形態(形態8)。

【請求項19】

20.9、49.3、および116.6 ppm ± 0.5 ppmの共鳴(ppm)値を含む13C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 2 0】

約 4 ~ 約 40 ° 2 ± 0 . 5 ° 2 の回折角 (2) における P X R D ピークを有する、請求項 1 8 または 1 9 に記載の非晶性形態。

【請求項 2 1】

請求項 1 から 1 7 のいずれか一項に記載の結晶性形態または請求項 1 8 から 2 0 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。

10

【請求項 2 2】

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 2 1 に記載の医薬組成物。

20

【請求項 2 3】

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、脾臓がん、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 2 2 に記載の医薬組成物。

30

40

50