

【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6年10月24日(2024.10.24)

【公開番号】特開2024-67008(P2024-67008A)

【公開日】令和6年5月16日(2024.5.16)

【年通号数】公開公報(特許)2024-089

【出願番号】特願2023-186694(P2023-186694)

【国際特許分類】

C 07 D 311/60(2006.01)

10

A 61 K 31/352(2006.01)

A 61 P 35/00(2006.01)

A 61 P 35/02(2006.01)

A 61 P 35/04(2006.01)

A 61 P 15/00(2006.01)

A 61 P 43/00(2006.01)

【F I】

C 07 D 311/60 C S P

A 61 K 31/352

20

A 61 P 35/00

A 61 P 35/02

A 61 P 35/04

A 61 P 15/00

A 61 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】令和6年10月16日(2024.10.16)

【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

30

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

2 - [[(1R)-1-(3,6-ジメチル-4-オキソ-2-フェニル-クロメン-8-イル)エチル]アミノ]安息香酸のトロメタミン塩。

【請求項2】

6 . 4 ° ± 0 . 2 °、8 . 4 ° ± 0 . 2 °、10 . 9 ° ± 0 . 2 °、11 . 8 ° ± 0 . 2 °、13 . 0 ° ± 0 . 2 °、16 . 5 ° ± 0 . 2 °、16 . 9 ° ± 0 . 2 °、22 . 1 ° ± 0 . 2 °、23 . 0 ° ± 0 . 2 °、及び24 . 9 ° ± 0 . 2 °から選択される回折角2シータに少なくとも1つのピークを有する、CuKa線を用いたX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項1に記載のトロメタミン塩。

【請求項3】

8 . 4 ° ± 0 . 2 °、10 . 9 ° ± 0 . 2 °、16 . 9 ° ± 0 . 2 °、及び22 . 1 ° ± 0 . 2 °から選択される少なくとも1つのピークとともに6 . 4 ° ± 0 . 2 °の回折角2シータにピークを有する、CuKa線を用いたX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項1に記載のトロメタミン塩。

【請求項4】

8 . 4 ° ± 0 . 2 °、10 . 9 ° ± 0 . 2 °、16 . 9 ° ± 0 . 2 °及び22 . 1 ° ± 0 . 2 °のピークとともに6 . 4 ° ± 0 . 2 °の回折角2シータにピークを有する、Cu

50

Ka線を用いたX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項1に記載のトロメタミン塩。

【請求項5】

179.0、158.7、151.7、149.7、136.3、134.7、132.9、129.3、127.4、125.2、121.7、117.0、115.5、115.2、110.4、64.1、63.2、45.3、22.6、20.3、及び11.6 ppm(それぞれ±0.2 ppm)から選択される、グリシン(176.5 ppmにおける外部基準)を基準とする少なくとも1つのピークを含む¹³C固体NMR(100.6 MHz)スペクトルを特徴とする、請求項4に記載のトロメタミン塩。

【請求項6】

179.0、129.3、63.2、20.3、及び11.6 ppm(それぞれ±0.2 ppm)にて、グリシン(176.5 ppmにおける外部基準)を基準とするピークを含む¹³C固体NMR(100.6 MHz)スペクトルを特徴とする、請求項4に記載のトロメタミン塩。 10

【請求項7】

10.6°±0.2°、13.2°±0.2°、14.5°±0.2°、15.9°±0.2°、及び17.4°±0.2°から選択される回折角2シータに少なくとも1つのピークを有する、CuKa線を用いたX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項1に記載のトロメタミン塩。

【請求項8】

10.6°±0.2°、17.4°±0.2°、13.2°±0.2°、及び14.5°±0.2°から選択される少なくとも1つのピークとともに15.9°±0.2°の回折角2シータにピークを有する、CuKa線を用いたX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項1に記載のトロメタミン塩。 20

【請求項9】

10.6°±0.2°、13.2°±0.2°、14.5°±0.2°、15.9°±0.2°及び17.4°±0.2°の回折角2シータにピークを有する、CuKa線を用いたX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項1に記載のトロメタミン塩。

【請求項10】

6.3°±0.2°、11.1°±0.2°、12.6°±0.2°、17.1°±0.2°及び18.9°±0.2°から選択される回折角2シータに少なくとも1つのピークを有する、CuKa線を用いたX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項1に記載のトロメタミン塩。 30

【請求項11】

12.6°±0.2°、17.1°±0.2°、6.3°±0.2°、及び18.9°±0.2°から選択される少なくとも1つのピークとともに、11.1°±0.2°の回折角2シータにピークを有する、CuKa線を用いたX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項1に記載のトロメタミン塩。

【請求項12】

6.3°±0.2°、11.1°±0.2°、12.6°±0.2°、17.1°±0.2°及び18.9°±0.2°の回折角2シータにピークを有する、CuKa線を用いたX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項1に記載のトロメタミン塩。 40

【請求項13】

2-[[(1R)-1-(3,6-ジメチル-4-オキソ-2-フェニル-クロメン-8-イル)エチル]アミノ]安息香酸のエルブミン塩。

【請求項14】

6.5°±0.2°、10.5°±0.2°、11.1°±0.2°、15.2°±0.2°、15.9°±0.2°、17.6°±0.2°、18.0°±0.2°、19.3°±0.2°、21.5°±0.2°、22.2°±0.2°、22.7°±0.2°及び26.3°±0.2°から選択される回折角2シータに少なくとも1つのピークを有する、CuKa線を用いたX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項13に記載のエル 50

ブミン塩。

【請求項 15】

10.5° ± 0.2°、15.2° ± 0.2°、18.0° ± 0.2°、及び19.3° ± 0.2°から選択される少なくとも1つのピークとともに、11.1° ± 0.2°の回折角2シータにピークを有する、CuKa線を用いたX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項13に記載のエルブミン塩。

【請求項 16】

10.5° ± 0.2°、15.2° ± 0.2°、18.0° ± 0.2°及び19.3° ± 0.2°のピークとともに、11.1° ± 0.2°の回折角2シータにピークを有する、CuKa線を用いたX線粉末回折パターンを特徴とする、請求項13に記載のエルブミン塩。10

【請求項 17】

177.4、174.8、159.8、151.7、149.5、134.0、132.6、130.7、130.3、129.0、128.1、123.1、122.4、19.4、116.8、115.9、112.3、53.0、47.5、27.4、23.3、21.3、及び11.3 ppm(それぞれ±0.2 ppm)から選択される、グリシン(176.5 ppmにおける外部基準)を基準とする少なくとも1つのピークを含む¹³C固体NMR(100.6 MHz)スペクトルを特徴とする、請求項16に記載のエルブミン塩。

【請求項 18】

177.4、132.6、27.4、21.3、及び11.3 ppm(それぞれ±0.2 ppm)に、グリシン(176.5 ppmにおける外部基準)を基準とするピークを含む¹³C固体NMR(100.6 MHz)スペクトルを特徴とする、請求項16に記載のエルブミン塩。20

【請求項 19】

請求項1~12のいずれか一項に記載のトロメタミン塩又は請求項13~18のいずれか一項に記載のエルブミン塩と、薬学的に許容される担体とを含む医薬組成物。

【請求項 20】

ホスホイノシチド3-キナーゼ(P13K)を阻害するため、請求項19に記載の医薬組成物。30

【請求項 21】

変異型ホスホイノシチド3-キナーゼ(P13K)に関連する疾患の治療に使用するための、請求項19に記載の医薬組成物。

【請求項 22】

前記P13KがP13Kである、請求項21に記載の医薬組成物。

【請求項 23】

前記P13KがH1047R変異を有する、請求項21に記載の医薬組成物。

【請求項 24】

前記疾患が癌である、請求項21に記載の医薬組成物。

【請求項 25】

前記癌が、子宮内膜癌、胃癌、白血病、リンパ腫、肉腫、結腸直腸癌、肺癌、卵巣癌、皮膚癌、頭頸部癌、乳癌、脳癌、又は前立腺癌である、請求項24に記載の医薬組成物。40

【請求項 26】

前記癌が乳癌である、請求項24に記載の医薬組成物。

【請求項 27】

前記癌が、ホルモン受容体陽性(HR+)、ヒト上皮成長因子受容体2陰性(HER2-)進行性又は転移性乳癌である、請求項24に記載の医薬組成物。

【請求項 28】

前記疾患が、CLOVES症候群(先天性脂肪腫性過成長、血管奇形、表皮母斑、脊柱側弯症/骨格及び脊髄症候群)、又はPIK3CA関連過成長症候群(PROS)である50

、請求項 2 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 9】

7 . 0 ° ± 0 . 2 ° 、 9 . 7 ° ± 0 . 2 ° 、 11 . 9 ° ± 0 . 2 ° 、 14 . 9 ° ± 0 . 2 ° 、 及び 17 . 4 ° ± 0 . 2 ° から選択される回折角 2 シータに少なくとも 1 つのピークを有する、CuKa 線を用いた X 線粉末回折パターンを特徴とする、結晶性 2 - [[(1R) - 1 - (3 , 6 -ジメチル - 4 -オキソ - 2 -フェニル -クロメン - 8 -イル)エチル]アミノ] 安息香酸。

【請求項 3 0】

7 . 4 ° ± 0 . 2 ° 、 8 . 5 ° ± 0 . 2 ° 、 10 . 6 ° ± 0 . 2 ° 、 13 . 4 ° ± 0 . 2 ° 、 及び 15 . 7 ° ± 0 . 2 から選択される回折角 2 シータに少なくとも 1 つのピークを有する、CuKa 線を用いた X 線粉末回折パターンを特徴とする、結晶性 2 - [[(1R) - 1 - (3 , 6 -ジメチル - 4 -オキソ - 2 -フェニル -クロメン - 8 -イル)エチル]アミノ] 安息香酸。 10