

【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 3 年 8 月 19 日 (2021.8.19)

【公表番号】特表 2020-529450 (P2020-529450A)

【公表日】令和 2 年 10 月 8 日 (2020.10.8)

【年通号数】公開・登録公報 2020-041

【出願番号】特願 2020-506341 (P2020-506341)

【国際特許分類】

C 07 C 39/23 (2006.01)

C 07 C 229/12 (2006.01)

C 07 C 37/84 (2006.01)

A 61 K 31/05 (2006.01)

A 61 P 25/18 (2006.01)

A 61 K 36/185 (2006.01)

A 61 K 47/22 (2006.01)

A 61 K 47/18 (2006.01)

【F I】

C 07 C 39/23

C 07 C 229/12

C 07 C 37/84

A 61 K 31/05

A 61 P 25/18

A 61 K 36/185

A 61 K 47/22

A 61 K 47/18

【手続補正書】

【提出日】令和 3 年 7 月 8 日 (2021.7.8)

【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】

2 - [ ( 1 R , 6 R ) - 6 - イソプロペニル - 3 - メチルシクロヘキサ - 2 - エン - 1 - イル ] - 5 - ペンチルベンゼン - 1 , 3 - ジオールと双性イオンコフォーマとの共結晶。

【請求項 2】

前記双性イオンコフォーマが、少なくとも 1 個の炭素原子、好ましくは 2 ~ 3 個の炭素原子により分離されるように、正に帯電した窒素基と、前記双性イオン上の該正に帯電した窒素基と遠位にある負に帯電した基とを含む、請求項 1 に記載の共結晶。

【請求項 3】

前記双性イオンコフォーマが、L - プロリン、ベタイン、L - カルニチン、及び D - プロリン、DL - プロリン、並びに ( 2 S , 3 a S , 7 a S ) - オクタヒドロ - 1 H - インドル - 2 - カルボン酸からなる群から選択される、請求項 1 又は 2 のいずれかに記載の共結晶。

【請求項 4】

前記双性イオンコフォーマが、L - プロリン、ベタイン、及び L - カルニチンからなる

群から選択される、請求項 1～3 のいずれかに記載の共結晶。

【請求項 5】

Cu-K 放射線、 $d = 1.5406$  において  $5.8$ 、 $11.1$ 、及び  $15.8 \pm 0.3$  度 (2 シータ) に特徴的なピークを含む X 線ディフラクトグラムを有することを特徴とする、2 - [(1R, 6R) - 6 - イソプロペニル - 3 - メチルシクロヘキサ - 2 - エン - 1 - イル] - 5 - ペンチルベンゼン - 1, 3 - ジオールと L - プロリンとの共結晶である、請求項 1～4 のいずれかに記載の共結晶。

【請求項 6】

Cu-K 放射線、 $d = 1.5406$  において  $7.4$ 、 $11.4$ 、及び  $21.2 \pm 0.3$  度 (2 シータ) に特徴的なピークを前記粉末 X 線ディフラクトグラム中に更に含むことを特徴とする、請求項 5 に記載の共結晶。

【請求項 7】

Cu-K 放射線、 $d = 1.5406$  において  $9.1$ 、 $10.7$ 、及び  $18.4 \pm 0.3$  度 (2 シータ) に特徴的なピークを含む X 線ディフラクトグラムを有することを特徴とする、2 - [(1R, 6R) - 6 - イソプロペニル - 3 - メチルシクロヘキサ - 2 - エン - 1 - イル] - 5 - ペンチルベンゼン - 1, 3 - ジオールとベタインとの共結晶である、請求項 1～4 のいずれかに記載の共結晶。

【請求項 8】

Cu-K 放射線、 $d = 1.5406$  において  $5.3$  及び  $13.0 \pm 0.3$  度 (2 シータ) に特徴的なピークを前記粉末 X 線ディフラクトグラム中に更に含むことを特徴とする、請求項 7 に記載の共結晶。

【請求項 9】

Cu-K 放射線、 $d = 1.5406$  において  $6.8$ 、 $11.3$ 、及び  $20.0 \pm 0.3$  度 (2 シータ) に特徴的なピークを含む X 線ディフラクトグラムを有することを特徴とする、2 - [(1R, 6R) - 6 - イソプロペニル - 3 - メチルシクロヘキサ - 2 - エン - 1 - イル] - 5 - ペンチルベンゼン - 1, 3 - ジオールと L - カルニチンとの共結晶である、請求項 1～4 のいずれかに記載の共結晶。

【請求項 10】

Cu-K 放射線、 $d = 1.5406$  において  $12.7$ 、 $13.6$ 、及び  $15.6$  並びにその  $\pm 0.3$  度 (2 シータ) に特徴的なピークを前記粉末 X 線ディフラクトグラム中に更に含むことを特徴とする、請求項 9 に記載の共結晶。

【請求項 11】

Cu-K 放射線、 $d = 1.5406$  において  $5.7$ 、 $11.2$ 、及び  $15.7 \pm 0.3$  度 (2 シータ) に特徴的なピークを含む X 線ディフラクトグラムを有することを特徴とする、2 - [(1R, 6R) - 6 - イソプロペニル - 3 - メチルシクロヘキサ - 2 - エン - 1 - イル] - 5 - ペンチルベンゼン - 1, 3 - ジオールと D - プロリンとの共結晶である、請求項 1～3 のいずれかに記載の共結晶。

【請求項 12】

Cu-K 放射線、 $d = 1.5406$  において  $11.5$  及び  $21.1 \pm 0.3$  度 (2 シータ) に特徴的なピークを前記粉末 X 線ディフラクトグラム中に更に含むことを特徴とする、請求項 11 に記載の共結晶。

【請求項 13】

Cu-K 放射線、 $d = 1.5406$  において  $5.7$ 、 $11.1$ 、及び  $15.7 \pm 0.3$  度 (2 シータ) に特徴的なピークを含む X 線ディフラクトグラムを有することを特徴とする、2 - [(1R, 6R) - 6 - イソプロペニル - 3 - メチルシクロヘキサ - 2 - エン - 1 - イル] - 5 - ペンチルベンゼン - 1, 3 - ジオールと DL - プロリンとの共結晶である、請求項 1～3 のいずれかに記載の共結晶。

【請求項 14】

Cu-K 放射線、 $d = 1.5406$  において  $11.4$  及び  $21.0 \pm 0.3$  度 (2 シータ) に特徴的なピークを前記粉末 X 線ディフラクトグラム中に更に含むことを特徴と

する、請求項 13 に記載の共結晶。

【請求項 15】

Cu - K 放射線、 $\lambda = 1.5406$  において  $4.4$ 、 $6.2$ 、及び  $8.3 \pm 0.3$  度（2シータ）に特徴的なピークを含む X 線ディフラクトグラムを有することを特徴とする、2 - [ (1R, 6R) - 6 - イソプロペニル - 3 - メチルシクロヘキサ - 2 - エン - 1 - イル ] - 5 - ペンチルベンゼン - 1, 3 - ジオールと (2S, 3aS, 7aS) - オクタヒドロ - 1H - インドール - 2 - カルボン酸との共結晶である、請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の共結晶。

【請求項 16】

Cu - K 放射線、 $\lambda = 1.5406$  において  $10.0$ 、 $13.3$ 、及び  $16.0 \pm 0.3$  度（2シータ）に特徴的なピークを前記粉末 X 線ディフラクトグラム中に更に含むことを特徴とする、請求項 15 に記載の共結晶。

【請求項 17】

請求項 1 ~ 16 のいずれかに定義される共結晶の調製方法であって、

(c) 2 - [ (1R, 6R) - 6 - イソプロペニル - 3 - メチルシクロヘキサ - 2 - エン - 1 - イル ] - 5 - ペンチルベンゼン - 1, 3 - ジオールとコフォーマとを有機溶媒と共にスラリー化する工程、並びに

(d) このようにして得られた共結晶を単離する工程、を含む、方法。

【請求項 18】

2 - [ (1R, 6R) - 6 - イソプロペニル - 3 - メチルシクロヘキサ - 2 - エン - 1 - イル ] - 5 - ペンチルベンゼン - 1, 3 - ジオールの精製方法であって、

(e) そのような反応条件下で請求項 1 ~ 16 のいずれかに定義された共結晶を解離させて、2 - [ (1R, 6R) - 6 - イソプロペニル - 3 - メチルシクロヘキサ - 2 - エン - 1 - イル ] - 5 - ペンチルベンゼン - 1, 3 - ジオールを得る工程、並びに

(f) このようにして得られた 2 - [ (1R, 6R) - 6 - イソプロペニル - 3 - メチルシクロヘキサ - 2 - エン - 1 - イル ] - 5 - ペンチルベンゼン - 1, 3 - ジオールを単離する工程、

を含む、方法。

【請求項 19】

(c) 2 - [ (1R, 6R) - 6 - イソプロペニル - 3 - メチルシクロヘキサ - 2 - エン - 1 - イル ] - 5 - ペンチルベンゼン - 1, 3 - ジオールとコフォーマとを有機溶媒と共にスラリー化する工程、並びに

(d) このようにして得られた共結晶を単離する工程、  
を更に含む、請求項 18 に記載の方法

【請求項 20】

薬学的有効量の、2 - [ (1R, 6R) - 6 - イソプロペニル - 3 - メチルシクロヘキサ - 2 - エン - 1 - イル ] - 5 - ペンチルベンゼン - 1, 3 - ジオールと請求項 1 ~ 16 のいずれかに定義される「薬学的に許容されるコフォーマ」との共結晶と共に、1 又は複数の薬学的に許容される賦形剤又は担体を含む、医薬組成物。

【請求項 21】

炎症、精神病、又は痙攣で生じる疾患又は状態の予防及び / 又は治療のための医薬の製造のための、2 - [ (1R, 6R) - 6 - イソプロペニル - 3 - メチルシクロヘキサ - 2 - エン - 1 - イル ] - 5 - ペンチルベンゼン - 1, 3 - ジオールと、請求項 1 ~ 16 のいずれかに定義されるコフォーマとの共結晶の使用。