

【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 2 年 12 月 24 日 (2020.12.24)

【公表番号】特表 2019-537596 (P2019-537596A)

【公表日】令和 1 年 12 月 26 日 (2019.12.26)

【年通号数】公開・登録公報 2019-052

【出願番号】特願 2019-523672 (P2019-523672)

【国際特許分類】

C 07 D 295/205 (2006.01)

A 61 P 25/04 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 25/06 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 K 31/496 (2006.01)

【F I】

C 07 D 295/205 C S P

A 61 P 25/04

A 61 P 29/00

A 61 P 25/06

A 61 P 19/02

A 61 P 29/00 1 0 1

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 K 31/496

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 11 月 10 日 (2020.11.10)

【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】

1, 1, 1, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロプロパン - 2 - イル 4 - (2 - (ピロリジン - 1 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピペラジン - 1 - カルボキシラートの結晶形態、或いはその薬学的に許容可能な塩、又は溶媒和物。

【請求項 2】

1, 1, 1, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロプロパン - 2 - イル 4 - (2 - (ピロリジン - 1 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピペラジン - 1 - カルボキシラートは遊離塩基である、請求項 1 に記載の結晶形態。

【請求項 3】

1, 1, 1, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロプロパン - 2 - イル 4 - (2 - (ピロリジン - 1 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル)ベンジル)ピペラジン - 1 - カルボキシラート遊離塩基の結晶形態は、 $7.8^\circ 2$ -シート、 $12.0^\circ 2$ -シート、 $18.5^\circ 2$ -シート、 $19.0^\circ 2$ -シート、 $19.6^\circ 2$ -シート、及び $21.2^\circ 2$ -シートでの特徴的なピークを備えた、X 線粉末回折 (XRPD) パターンを持つ、請求項 2 に記載の結晶形態。

【請求項 4】

1, 1, 1, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロプロパン - 2 - イル 4 - (2 - (ピロリジン - 1 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル) ベンジル) ピペラジン - 1 - カルボキシレートは、一塩酸塩、ビス塩酸塩、フマル酸塩、ベシル酸塩、又はメシル酸塩；又はその溶媒和物である、請求項 1 に記載の結晶形態。

【請求項 5】

1, 1, 1, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロプロパン - 2 - イル 4 - (2 - (ピロリジン - 1 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル) ベンジル) ピペラジン - 1 - カルボキシレートの薬学的に許容可能な塩は、一塩酸塩、又はその溶媒和物である、請求項 4 に記載の結晶形態。

【請求項 6】

1, 1, 1, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロプロパン - 2 - イル 4 - (2 - (ピロリジン - 1 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル) ベンジル) ピペラジン - 1 - カルボキシレート一塩酸塩の結晶形態は、6 . 4 ° 2 - シータ、14 . 9 ° 2 - シータ、16 . 9 ° 2 - シータ、18 . 4 ° 2 - シータ、及び 20 . 9 ° 2 - シータでの特徴的なピークを備えた、X 線粉末回折 (X R P D) パターンを有する形態 1 である、請求項 5 に記載の結晶形態。

【請求項 7】

1, 1, 1, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロプロパン - 2 - イル 4 - (2 - (ピロリジン - 1 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル) ベンジル) ピペラジン - 1 - カルボキシレート一塩酸塩の結晶形態は、8 . 6 ° 2 - シータ、14 . 3 ° 2 - シータ、15 . 6 ° 2 - シータ、19 . 0 ° 2 - シータ、19 . 8 ° 2 - シータ、及び 20 . 7 ° 2 - シータでの特徴的なピークを備えた、X 線粉末回折 (X R P D) パターンを有する形態 2 である、請求項 5 に記載の結晶形態。

【請求項 8】

1, 1, 1, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロプロパン - 2 - イル 4 - (2 - (ピロリジン - 1 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル) ベンジル) ピペラジン - 1 - カルボキシレートの薬学的に許容可能な塩は、ビス塩酸塩、又はその溶媒和物である、請求項 4 に記載の結晶形態。

【請求項 9】

1, 1, 1, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロプロパン - 2 - イル 4 - (2 - (ピロリジン - 1 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル) ベンジル) ピペラジン - 1 - カルボキシレートビス塩酸塩の結晶形態は、6 . 4 ° 2 - シータ、12 . 0 ° 2 - シータ、12 . 5 ° 2 - シータ、14 . 3 ° 2 - シータ、18 . 5 ° 2 - シータ、及び 22 . 8 ° 2 - シータでの特徴的なピークを備えた、X 線粉末回折 (X R P D) パターンを持つ、請求項 8 に記載の結晶形態。

【請求項 10】

1, 1, 1, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロプロパン - 2 - イル 4 - (2 - (ピロリジン - 1 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル) ベンジル) ピペラジン - 1 - カルボキシレートの薬学的に許容可能な塩は、フマル酸塩、又はその溶媒和物である、請求項 4 に記載の結晶形態。

【請求項 11】

1, 1, 1, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロプロパン - 2 - イル 4 - (2 - (ピロリジン - 1 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル) ベンジル) ピペラジン - 1 - カルボキシレートフマル酸塩の結晶形態は、13 . 6 ° 2 - シータ、14 . 1 ° 2 - シータ、14 . 3 ° 2 - シータ、20 . 0 ° 2 - シータ、及び 21 . 9 ° 2 - シータでの特徴的なピークを備えた、X 線粉末回折 (X R P D) パターンを持つ、請求項 10 に記載の結晶形態。

【請求項 12】

1, 1, 1, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロプロパン - 2 - イル 4 - (2 - (ピロリジン - 1 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル) ベンジル) ピペラジン - 1 - カルボキシレートの薬学的に許容可能な塩は、メシル酸塩、又はその溶媒和物である、請求項 4 に記載の

結晶形態。

【請求項 1 3】

1, 1, 1, 3, 3, 3 - ヘキサフルオロプロパン - 2 - イル 4 - (2 - (ピロリジン - 1 - イル) - 4 - (トリフルオロメチル) ベンジル) ピペラジン - 1 - カルボキシラートメシル酸塩の結晶形態は、8 . 6 ° 2 - シータ、12 . 4 ° 2 - シータ、14 . 6 ° 2 - シータ、16 . 5 ° 2 - シータ、17 . 7 ° 2 - シータ、及び 19 . 7 ° 2 - シータでの特徴的なピークを備えた、X 線粉末回折 (X R P D) パターンを持つ、請求項 1 2 に記載の結晶形態。

【請求項 1 4】

請求項 1 乃至 1 3 の何れか 1 つに記載の結晶形態、或いはその薬学的に許容可能な塩又は溶媒和物、ならびに、薬学的に許容可能な担体、希釈剤、及び賦形剤から選択された少なくとも 1 つの不活性成分を含む、医薬組成物。