

【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21日(2024.10.21)

【国際公開番号】WO2022/078352

【公表番号】特表2023-546125(P2023-546125A)

【公表日】令和5年11月1日(2023.11.1)

【年通号数】公開公報(特許)2023-206

【出願番号】特願2023-523059(P2023-523059)

【国際特許分類】

10

C 0 7 D 4 0 5 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 4 3 9 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 / 1 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 3 / 1 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 7 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 1 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)

20

A 6 1 P 3 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 / 1 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 9 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 9 / 1 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 9 / 1 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 9 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 9 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 9 / 1 0 (2 0 0 6 . 0 1)

30

A 6 1 P 2 5 / 1 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 7 / 1 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 7 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 9 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 5 / 1 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 7 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 7 / 0 6 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 1 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 2 8 (2 0 0 6 . 0 1)

40

A 6 1 P 2 5 / 1 8 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 2 5 / 3 0 (2 0 0 6 . 0 1)

【 F I 】

C 0 7 D 4 0 5 / 1 4 C S P

A 6 1 K 3 1 / 4 4 3 9

A 6 1 P 3 / 1 0

A 6 1 P 2 5 / 0 0

A 6 1 P 1 3 / 1 2

A 6 1 P 2 7 / 0 2

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 0 5

50

A 6 1 P 11/00
A 6 1 P 3/04
A 6 1 P 1/14
A 6 1 P 3/06
A 6 1 P 1/16
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 43/00 1 1 1
A 6 1 P 9/00
A 6 1 P 9/10 1 0 1
A 6 1 P 9/12
A 6 1 P 9/04
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 9/10 1 0 3
A 6 1 P 3/00
A 6 1 P 19/02
A 6 1 P 19/10
A 6 1 P 25/16
A 6 1 P 27/12
A 6 1 P 15/00
A 6 1 P 7/02
A 6 1 P 19/06
A 6 1 P 15/10
A 6 1 P 17/00
A 6 1 P 17/06
A 6 1 P 1/04
A 6 1 P 25/28
A 6 1 P 25/18
A 6 1 P 25/30

10

20

【手続補正書】

30

【提出日】令和6年10月10日(2024.10.10)

【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】

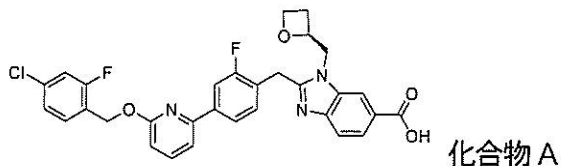
【特許請求の範囲】

【請求項1】

化合物Aの結晶形態Iであって、

【化1】

40



2 で 11.4° 、 12.7° 、 18.1° 、および $18.3^\circ \pm 0.2$ から選択されるピークを含む X 線粉末回折 (XRPD) パターンにより特徴づけられる、結晶形態 I。

【請求項2】

X 線粉末回折パターンが、2 で 4.9° 、 11.8° 、および $21.5^\circ \pm 0.2$ で

50

の 1 つまたは複数のピークをさらに含む、請求項 1 に記載の結晶形態 I。

【請求項 3】

X 線粉末回折パターンが、2θ で 15.8°、18.8°、および 23.0° ± 0.2° での 1 つまたは複数のピークをさらに含む、請求項 1 または 2 に記載の結晶形態 I。

【請求項 4】

X 線粉末回折パターンが、2θ で 4.9°、11.4°、11.8°、12.7°、15.8°、18.1°、18.3°、18.8°、21.5°、および 23.0° ± 0.2° でのピークを含む、請求項 1 に記載の結晶形態 I。

【請求項 5】

示差走査熱量計 (DSC) ピーク相転移温度 200 ± 3 °C により特徴づけられる、請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の結晶形態 I。 10

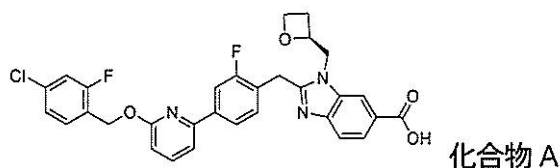
【請求項 6】

化合物 A の少なくとも 90 重量 % が結晶形態 I である、請求項 1 から 5 のいずれか一項に記載の結晶形態 I。

【請求項 7】

化合物 A の結晶形態 I I であって、

【化 2】



20

2θ で 11.4°、12.0°、12.9°、18.6°、および 20.4° ± 0.2° から選択されるピークを含む X 線粉末回折パターンにより特徴づけられる、結晶形態 I I。

【請求項 8】

X 線粉末回折パターンが、2θ で 18.1° および / または 21.5° ± 0.2° でのピークを含まない、請求項 7 に記載の結晶形態 I I。

【請求項 9】

X 線粉末回折パターンが、2θ で 4.9°、7.7°、15.8°、および 25.9° ± 0.2° での 1 つまたは複数のピークをさらに含む、請求項 7 または 8 に記載の結晶形態 I I。 30

【請求項 10】

2θ で 4.9°、7.7°、11.4°、12.0°、12.9°、15.8°、18.6°、20.4°、および 25.9° ± 0.2° でのピークを含む X 線粉末回折パターンにより特徴づけられる、請求項 7 から 9 のいずれか一項に記載の結晶形態 I I。

【請求項 11】

示差走査熱量計 (DSC) ピーク相転移温度 205 ± 3 °C により特徴づけられる、請求項 7 から 10 のいずれか一項に記載の結晶形態 I I。 40

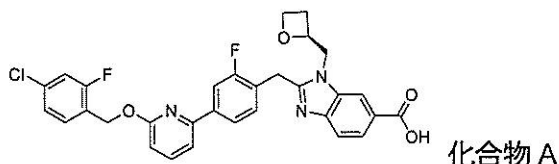
【請求項 12】

化合物 A の少なくとも 90 重量 % が結晶形態 I I である、請求項 7 から 11 のいずれか一項に記載の結晶形態 I I。

【請求項 13】

化合物 A の結晶形態 I I I であって、

【化 3】



2 で 9.8° 、 13.3° 、 17.3° 、および $18.1^\circ \pm 0.2$ から選択されるピークを含む X 線粉末回折パターンにより特徴づけられる、結晶形態 I I I。

10

【請求項 14】

X 線粉末回折パターンが、2 で 11.7° 、 14.2° 、 24.7° 、 26.3 および $27.7^\circ \pm 0.2$ での 1 つまたは複数のピークをさらに含む、請求項 13 に記載の結晶形態 I I I。

【請求項 15】

2 で 9.8° 、 11.7° 、 13.3° 、 14.2° 、 17.3° 、 18.1° 、 24.7° 、 26.3° 、および $27.7^\circ \pm 0.2$ でのピークを含む X 線粉末回折パターンにより特徴づけられる、請求項 13 に記載の結晶形態 I I I。

【請求項 16】

示差走査熱量計 (DSC) ピーク相転移温度 204 ± 3 により特徴づけられる、請求項 13 から 15 のいずれか一項に記載の結晶形態 I I I。

20

【請求項 17】

水和物である、請求項 13 から 16 のいずれか一項に記載の結晶形態 I I I。

【請求項 18】

化合物 A の少なくとも 90 重量 % が結晶形態 I I I である、請求項 13 から 17 のいずれか一項に記載の結晶形態 I I I。

【請求項 19】

請求項 1 から 18 のいずれか一項に記載の化合物 A の結晶形態、および薬学的に許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 20】

30

疾患または状態を治療または予防するための医薬組成物であって、治療有効量の請求項 1 から 18 のいずれか一項に記載の化合物 A の結晶形態を含み、

疾患または状態が、T1D、T2DM、糖尿病前症、特発性 T1D、LADA、EOD、YOAD、MODY、栄養不良関連糖尿病、妊娠糖尿病、高血糖、インスリン抵抗性、肝インスリン抵抗性、耐糖能異常、糖尿病性神経障害、糖尿病性腎症、腎疾患、糖尿病性網膜症、脂肪細胞機能障害、内臓脂肪蓄積、睡眠時無呼吸、肥満、摂食障害、他の薬剤の使用による体重増加、過剰な糖渴望、脂質異常症、高インスリン血症、NAFLD、NASH、線維症、肝硬変、肝細胞癌、心血管疾患、粥状硬化症、冠動脈疾患、末梢血管疾患、高血圧、内皮機能障害、血管コンプライアンス障害、うっ血性心不全、心筋梗塞、脳卒中、出血性脳卒中、虚血性脳卒中、外傷性脳損傷、肺高血圧、血管形成術後の再狭窄、間欠性跛行、食後脂血症、代謝性アシドーシス、ケトーシス、関節炎、骨粗しょう症、パーキンソン病、左室肥大、末梢動脈疾患、黄斑変性症、白内障、糸球体硬化症、慢性腎不全、メタボリックシンドローム、シンドローム X、月経前症候群、狭心症、血栓症、粥状硬化症、一過性脳虚血発作、血管再狭窄、糖代謝異常、空腹時血漿血糖異常の状態、高尿酸血症、痛風、勃起障害、皮膚および結合組織障害、乾癬、足部潰瘍、潰瘍性大腸炎、高アポ B リポタンパク血症、アルツハイマー病、統合失調症、認知障害、炎症性腸疾患、短腸症候群、クローン病、大腸炎、過敏性腸症候群、多嚢胞性卵巣症候群、または依存症である、医薬組成物。

40

【請求項 21】

疾患または状態を治療するための医薬を必要とする対象における疾患または状態を治療

50

するための医薬の製造における、治療有効量の、請求項 1 から 18 のいずれか一項に記載の化合物 A の結晶形態、またはその医薬組成物の使用であって、疾患または状態が、T1D、T2DM、糖尿病前症、特発性 T1D、LADA、EOD、YOAD、MODY、栄養不良関連糖尿病、妊娠糖尿病、高血糖、インスリン抵抗性、肝インスリン抵抗性、耐糖能異常、糖尿病性神経障害、糖尿病性腎症、腎疾患、糖尿病性網膜症、脂肪細胞機能障害、内臓脂肪蓄積、睡眠時無呼吸、肥満、摂食障害、他の薬剤の使用による体重増加、過剰な糖渴望、脂質異常症、高インスリン血症、NAFLD、NASH、線維症、肝硬変、肝細胞癌、心血管疾患、粥状硬化症、冠動脈疾患、末梢血管疾患、高血圧、内皮機能障害、血管コンプライアンス障害、うっ血性心不全、心筋梗塞、脳卒中、出血性脳卒中、虚血性脳卒中、外傷性脳損傷、肺高血圧、血管形成術後の再狭窄、間欠性跛行、食後脂血症、代謝性アシドーシス、ケトーシス、関節炎、骨粗しょう症、パーキンソン病、左室肥大、末梢動脈疾患、黄斑変性症、白内障、糸球体硬化症、慢性腎不全、メタボリックシンドローム、シンドローム X、月経前症候群、狭心症、血栓症、粥状硬化症、一過性脳虚血発作、血管再狭窄、糖代謝異常、空腹時血漿血糖異常の状態、高尿酸血症、痛風、勃起障害、皮膚および結合組織障害、乾癬、足部潰瘍、潰瘍性大腸炎、高アポ B リポタンパク血症、アルツハイマー病、統合失調症、認知障害、炎症性腸疾患、短腸症候群、クローン病、大腸炎、過敏性腸症候群、多嚢胞性卵巣症候群、または依存症である、使用。

10

20

30

40

50