

【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3月26日(2020.3.26)

【公表番号】特表2019-512542(P2019-512542A)

【公表日】令和1年5月16日(2019.5.16)

【年通号数】公開・登録公報2019-018

【出願番号】特願2018-567022(P2018-567022)

【国際特許分類】

C 07 K 5/09 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 K 38/07 (2006.01)

【F I】

C 07 K	5/09	
A 61 P	43/00	1 0 5
A 61 K	38/07	

【手続補正書】

【提出日】令和2年2月13日(2020.2.13)

【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

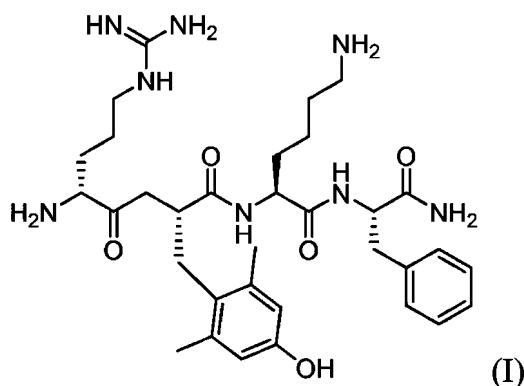
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

化合物Iのメシリ酸塩の結晶形態であって、

【化1】



(A) 6.0、10.4、11.0、12.0、14.9、19.3、20.4、及び
21.4の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、
又は

(B) 3.2、4.3、6.0、12.8、17.5、18.9、20.6、21.4、
及び22.7の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有
する、結晶形態。

【請求項2】

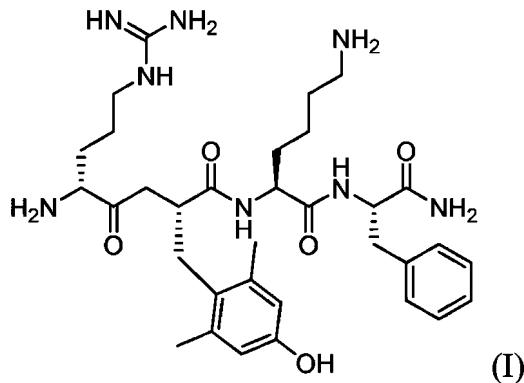
前記(A)の結晶形態において、6.0、10.4、11.0、12.0、14.9、
15.7、18.8、19.3、20.4、20.8、21.2、21.4、21.6、
22.0、22.5、22.9、25.9、及び26.4の2シータ(°2)値に、X

R P D パターンにおける特徴的ピークを有する、又は

前記 (B) の結晶形態において、3 . 2、4 . 3、6 . 0、12 . 0、12 . 4、12 . 8、14 . 6、15 . 8、15 . 9、17 . 5、18 . 4、18 . 9、19 . 4、19 . 8、20 . 1、20 . 6、21 . 4、22 . 7、23 . 2、23 . 8、24 . 8、25 . 4、及び26 . 1の2シータ(°2)値に、X R P D パターンにおける特徴的ピークを有する、請求項1に記載の結晶形態。

【請求項3】

化合物Iのトシリ酸塩の結晶形態であって、
【化2】



(A) 11 . 6、12 . 2、13 . 4、15 . 4、17 . 0、20 . 2、22 . 4、22 . 7、及び23 . 1の2シータ(°2)値に、X R P D パターンにおける特徴的ピークを有する、又は

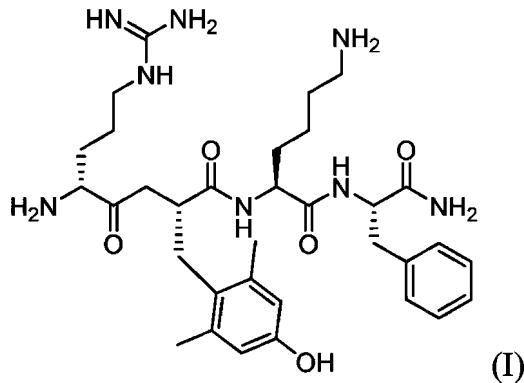
(B) 6 . 5、12 . 0、13 . 0、13 . 3、15 . 7、17 . 3、19 . 4、20 . 5、及び23 . 1の2シータ(°2)値に、X R P D パターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

【請求項4】

前記 (A) の結晶形態において、6 . 3、11 . 6、12 . 2、13 . 4、14 . 7、15 . 4、16 . 1、17 . 0、18 . 9、20 . 2、22 . 4、22 . 7、及び23 . 1の2シータ(°2)値に、X R P D パターンにおける特徴的ピークを有する、又は
前記 (B) の結晶形態において、6 . 5、11 . 6、11 . 8、12 . 0、13 . 0、13 . 3、15 . 0、15 . 7、15 . 9、17 . 3、19 . 4、19 . 6、20 . 5、22 . 4、22 . 8、23 . 1、及び23 . 7の2シータ(°2)値に、X R P D パターンにおける特徴的ピークを有する、請求項3に記載の結晶形態。

【請求項5】

化合物Iのフマル酸塩の結晶形態であって、
【化3】



(A) 3 . 6、12 . 0、16 . 0、21 . 2、23 . 0、23 . 3、24 . 7、24 . 9、及び25 . 7の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、

(B) 4 . 2、11 . 3、11 . 7、12 . 4、14 . 8、17 . 0、17 . 2、20 . 7、22 . 6、23 . 6、23 . 3、24 . 1、24 . 5、及び25 . 0の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、

(C) 4 . 6、11 . 2、14 . 6、19 . 9、20 . 5、24 . 2、24 . 6、及び25 . 2の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、

(D) 11 . 4、14 . 0、19 . 6、19 . 8、22 . 9、23 . 2、24 . 3、及び24 . 5の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、

(E) 12 . 3、21 . 0、23 . 2、24 . 0、24 . 7、25 . 0、25 . 4、26 . 0、26 . 4、及び27 . 5の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、

(F) 21 . 5、22 . 2、23 . 1、23 . 9、24 . 1、24 . 6、25 . 2、及び26 . 0の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、

(G) 6 . 6、12 . 3、13 . 6、16 . 0、19 . 2、19 . 6、20 . 4、21 . 0、21 . 1、22 . 3、23 . 2、24 . 0、25 . 3、及び26 . 0の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、又は

(H) 13 . 2、20 . 3、22 . 7、21 . 4、21 . 9、23 . 6、24 . 0、24 . 4、及び25 . 6の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

【請求項 6】

前記(A)の結晶形態において、3 . 6、7 . 2、11 . 1、12 . 0、13 . 2、16 . 0、17 . 9、18 . 3、19 . 0、19 . 4、21 . 2、23 . 0、23 . 3、24 . 7、24 . 9、25 . 7、26 . 1、及び28 . 6の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、

前記(B)の結晶形態において、4 . 2、5 . 3、10 . 3、11 . 3、11 . 7、12 . 0、12 . 4、12 . 7、13 . 0、13 . 3、14 . 8、15 . 5、15 . 8、16 . 1、17 . 0、17 . 2、18 . 1、20 . 7、21 . 2、22 . 0、22 . 3、22 . 6、23 . 6、23 . 3、24 . 1、24 . 5、25 . 0、25 . 6、26 . 0、及び28 . 6の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、

前記(C)の結晶形態において、4 . 6、11 . 2、14 . 6、19 . 3、19 . 9、20 . 3、20 . 5、22 . 8、23 . 1、23 . 3、23 . 6、24 . 2、24 . 3、24 . 6、25 . 2、25 . 6、26 . 5、及び27 . 3の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、

前記(D)の結晶形態において、11 . 4、13 . 3、14 . 0、16 . 0、16 . 2、19 . 6、19 . 8、21 . 6、22 . 4、22 . 9、23 . 2、23 . 6、24 . 3、24 . 5、25 . 6、及び26 . 6の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、

前記(E)の結晶形態において、6 . 6、12 . 0、12 . 3、13 . 1、13 . 6、16 . 1、19 . 6、20 . 5、21 . 0、21 . 5、23 . 2、24 . 0、24 . 7、25 . 0、25 . 4、26 . 0、26 . 4、27 . 5、28 . 0、及び28 . 7の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、

前記(F)の結晶形態において、13 . 4、16 . 3、18 . 5、21 . 5、22 . 2、23 . 1、23 . 6、23 . 9、24 . 1、24 . 6、25 . 2、26 . 0、26 . 9、及び28 . 9の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、

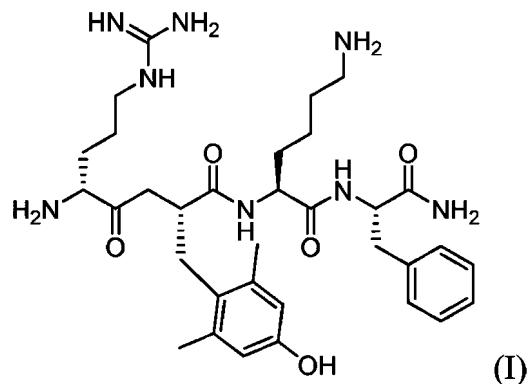
前記 (G) の結晶形態において、6.6、12.3、13.6、16.0、17.7、18.1、19.2、19.6、20.4、21.0、21.1、22.3、23.2、24.0、24.6、25.0、25.3、26.0、26.3、及び27.4の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、又は

前記 (H) の結晶形態において、9.4、11.2、13.2、18.6、20.3、21.4、21.7、21.9、22.7、23.2、23.6、24.0、24.4、25.6、26.8、及び28.5の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、請求項5に記載の結晶形態。

【請求項7】

化合物Iのコレステリル硫酸塩の結晶形態であって、

【化4】



(A) 5.0、5.8、11.9、12.3、12.6、16.1、16.8、及び17.0の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、又は

(B) 7.4、12.4、13.1、15.6、16.3、17.7、及び19.8の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

【請求項8】

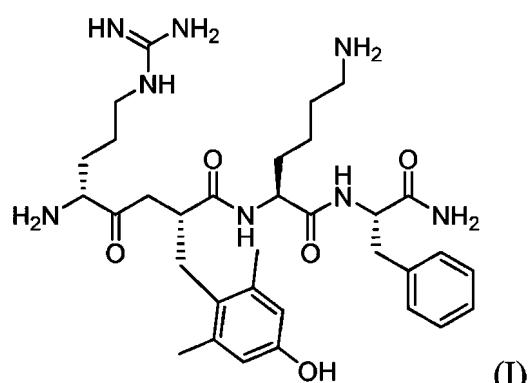
前記 (A) の結晶形態において、5.0、5.8、10.5、11.9、12.3、12.6、13.2、16.1、16.8、17.0、及び19.1の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、又は

前記 (B) の結晶形態において、7.4、12.4、13.1、13.4、14.4、15.6、16.3、17.7、19.5、及び19.8の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、請求項7に記載の結晶形態。

【請求項9】

化合物Iのシュウ酸塩の結晶形態であって、

【化5】



(A) 5.0、7.3、13.4、17.3、21.3、22.5、22.9、及び 24.7 の 2 シーダ (°2) 値に、XRPD パターンにおける特徴的ピーカーを有する、又は

(B) 3.8、4.3、8.1、19.8、20.7、22.3、24.9、及び 25.6 の 2 シーダ (°2) 値に、XRPD パターンにおける特徴的ピーカーを有する、結晶形態。

【請求項 10】

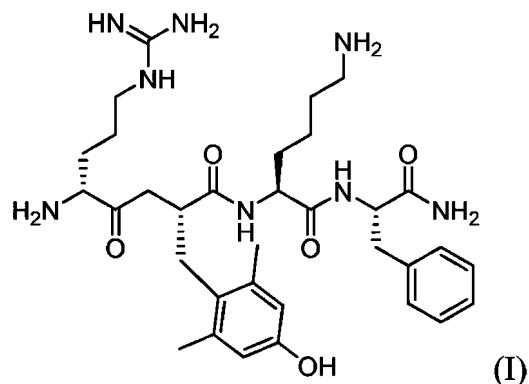
前記(A)の結晶形態において、 5.0、7.3、12.2、13.2、13.4、15.0、16.2、17.3、18.6、20.1、21.3、22.5、22.9、23.3、24.4、及び24.7の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、又は

前記(B)の結晶形態において、3.8、4.3、7.0、8.1、18.2、18.3、19.1、19.8、20.3、20.7、21.1、22.3、22.8、23.2、23.5、24.0、24.6、24.9、及び25.6の2シータ(°2)値にXRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、請求項9に記載の結晶形態。

【請求項 11】

化合物 I のエシル酸塩の結晶形態であつて、

【化 6】



(A) 5 . 4 、 9 . 8 、 10 . 8 、 18 . 8 、 19 . 7 、 21 . 1 、 21 . 8 、 及び 22 . 3 の 2 シーダ (° 2) 値に、 X R P D パターンにおける特徴的ピーカを有する、又は

(B) 5.4、10.8、11.0、14.5、17.3、18.7、19.6、21.0、21.4、及び22.1の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

【請求項 12】

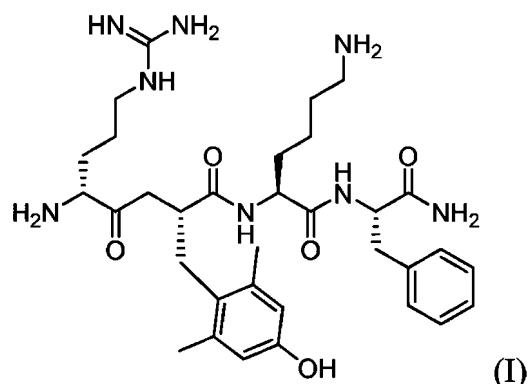
前記(A)の結晶形態において、 5 . 4 . 9 . 8 . 1 0 . 8 . 1 1 . 8 . 1 4 . 4 . 1
 5 . 1 . 1 5 . 6 . 1 7 . 2 . 1 7 . 7 . 1 8 . 8 . 1 9 . 0 . 1 9 . 7 . 2 1 . 1 . 2
 1 . 5 . 2 1 . 8 . 及び 2 2 . 3 の 2 シー θ 値に、 X R P D パターンにおける
 特徴的ピークを有する、又は

前記(B)の結晶形態において、5.4、9.7、10.8、11.0、14.5、15.0、16.0、17.3、17.7、18.7、19.6、21.0、21.4、22.1、及び24.0の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、請求項11に記載の結晶形態。

【請求項 1 3】

化合物 I の安息香酸塩の結晶形態であって、

【化7】



5 . 1、10 . 2、13 . 2、14 . 0、20 . 4、21 . 9、及び25 . 3の2シータ(°2)値に、X R P D パターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

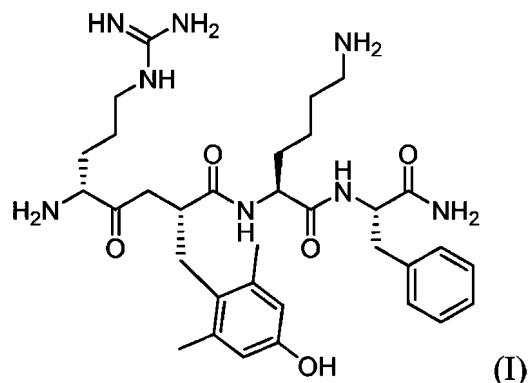
【請求項14】

5 . 1、10 . 2、11 . 9、13 . 2、13 . 8、14 . 0、16 . 0、16 . 7、20 . 4、21 . 9、23 . 1、23 . 5、24 . 5、及び25 . 3の2シータ(°2)値に、X R P D パターンにおける特徴的ピークを有する、請求項13に記載の結晶形態。
。

【請求項15】

化合物Iのコハク酸塩の結晶形態であって、

【化8】



4 . 2、5 . 1、6 . 6、9 . 9、14 . 1、18 . 0、及び24 . 1の2シータ(°2)値に、X R P D パターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

【請求項16】

4 . 2、5 . 1、6 . 6、8 . 0、9 . 9、10 . 3、13 . 1、14 . 1、14 . 6、17 . 6、18 . 0、18 . 5、19 . 0、19 . 9、20 . 8、22 . 2、22 . 4、23 . 4、及び24 . 1の2シータ(°2)値に、X R P D パターンにおける特徴的ピークを有する、請求項15に記載の結晶形態。

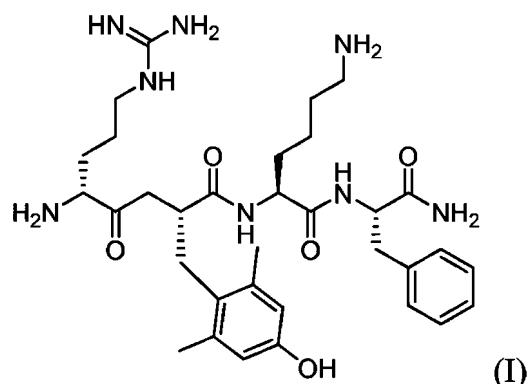
【請求項17】

請求項1 ~ 16 のいずれか1項に記載の結晶形態を含む、組成物。

【請求項18】

化合物Iを含む医薬組成物を作製するプロセスであって、

【化9】



請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の結晶形態を溶解させる工程を含む、プロセス。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0004

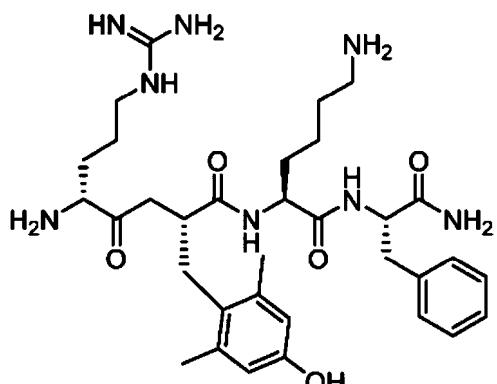
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0004】

本発明は、化合物Ⅰの塩を特徴とする：

【化1】



(I; MTP-131; D-Arg-Dmt-Lys-Phe-NH₂)

化合物Ⅰは、過剰なROS生成により生じる酸化的傷害から器官を保護するのを助け、さらに正常なATP産生を回復させることにより、ミトコンドリア疾患プロセスに影響を及ぼすことが示されている。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0243

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0243】

【表28】

表28. MTP-131トリル酸塩、パターン2のシミュレーションされたXRPD2θディフラクトグラム

	位置 [°2θ]	FWHM	d間隔 [Å]	高さ[cts]	面積[cts*°2θ]	相対強度[%]
1	6.5499	0.120	1361.24	13.4840	8507.75	84.60
2	7.0786	0.096	680.42	12.4779	5315.76	52.86
3	9.0752	0.096	328.28	9.7367	2564.66	25.50
4	11.5768	0.096	294.80	7.6377	2303.15	22.90
5	11.9091	0.072	232.29	7.4253	2419.71	24.06
6	12.0299	0.096	541.85	7.3510	4233.19	42.09
7	12.5679	0.120	248.93	7.0375	1555.79	15.47
8	13.1228	0.096	821.13	6.7412	6415.1	63.79
9	13.3092	0.096	698.76	6.6472	5459.09	54.28
10	14.1871	0.096	131.66	6.2377	1028.61	10.23
11	14.4172	0.072	266.65	6.1387	2777.57	27.62
12	14.5545	0.096	365.94	6.0811	2858.91	28.43
13	14.7572	0.144	251.09	5.9981	1307.76	13.00
14	15.1094	0.120	592.42	5.8590	3702.59	36.82
15	15.8496	0.096	1217.01	5.5870	9507.91	94.54
16	15.9777	0.072	830.34	5.5425	8649.42	86.01
17	17.4741	0.120	1497.64	5.0711	9360.24	93.08
18	17.7285	0.072	232.80	4.9989	2425.04	24.11
19	19.5391	0.096	1024.46	4.5396	8003.59	79.59
20	19.7411	0.096	1016.14	4.4936	7938.61	78.94
21	20.0464	0.072	205.14	4.4258	2136.84	21.25
22	20.1613	0.144	479.44	4.4009	2497.07	24.83
23	20.5588	0.072	191.56	4.3167	1995.47	19.84
24	20.7283	0.120	924.72	4.2817	5779.52	57.47
25	21.3456	0.096	910.95	4.1593	7116.77	70.77
26	22.1097	0.120	304.25	4.0172	1901.53	18.91
27	22.5050	0.096	391.10	3.9476	3055.44	30.38
28	22.9420	0.096	506.23	3.8734	3954.95	39.33
29	23.2455	0.120	1609.04	3.8235	10056.52	100.00
30	23.4775	0.120	365.65	3.7862	2285.33	22.72
31	23.9349	0.120	1080.26	3.7149	6751.62	67.14
32	24.3856	0.096	331.44	3.6472	2589.41	25.75
33	24.5609	0.096	259.52	3.6216	2027.48	20.16
34	25.1486	0.072	167.93	3.5383	1749.28	17.39
35	25.2940	0.096	295.35	3.5183	2307.4	22.94
36	25.5145	0.096	247.46	3.4883	1933.3	19.22
37	25.6168	0.072	185.57	3.4747	1933.05	19.22
38	25.8367	0.096	349.62	3.4456	2731.41	27.16
39	26.1158	0.144	208.44	3.4094	1085.62	10.80
40	26.3529	0.096	210.87	3.3792	1647.39	16.38
41	26.5878	0.096	163.87	3.3499	1280.27	12.73
42	26.8797	0.096	163.85	3.3142	1280.09	12.73
43	27.7376	0.072	105.35	3.2136	1097.43	10.91
44	28.4171	0.072	123.79	3.1383	1289.49	12.82
45	28.5966	0.096	411.07	3.1190	3211.5	31.93
46	28.9173	0.096	172.59	3.0851	1348.36	13.41
47	29.8379	0.072	153.78	2.9920	1601.87	15.93

最後に、本発明の好ましい実施態様を項分け記載する。[実施態様1]化合物Iの塩の結晶形態であつて、

【化3】

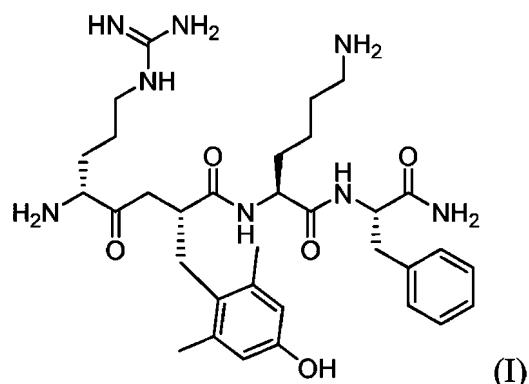


表1～20のいずれか1つに記載される2θ値に、XRDパターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

[実施態様2]

化合物Iの塩の結晶形態であって、

【化4】

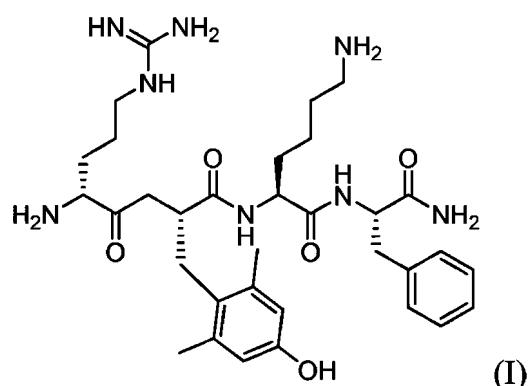


図1～26のいずれか1つに記載されるXRDパターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

[実施態様3]

表11～18のいずれか1つに記載される2θ値に、XRDパターンにおける特徴的ピークを有する、実施態様1に記載の結晶形態。

[実施態様4]

表5、6、9及び10のいずれか1つに記載される2θ値に、XRDパターンにおける特徴的ピークを有する、実施態様1に記載の結晶形態。

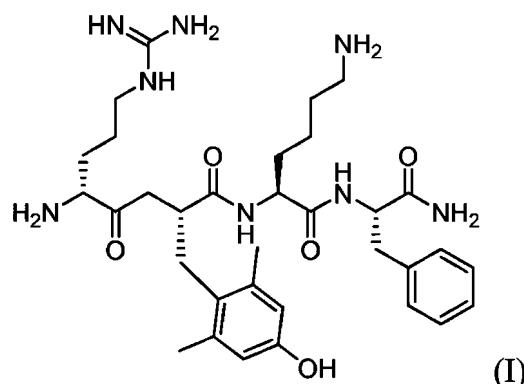
[実施態様5]

表1、2、3、4、7、8、19及び20のいずれか1つに記載される2θ値に、XRDパターンにおける特徴的ピークを有する、実施態様1に記載の結晶形態。

[実施態様6]

化合物Iのメシリル酸塩の結晶形態であって、

【化5】



6 . 0、10 . 4、11 . 0、12 . 0、14 . 9、19 . 3、20 . 4、及び21 . 4の2シータ(°2)値に、X R P Dパターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

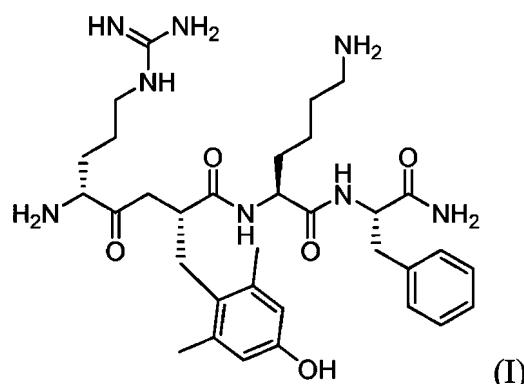
[実施態様7]

6 . 0、10 . 4、11 . 0、12 . 0、14 . 9、15 . 7、18 . 8、19 . 3、20 . 4、20 . 8、21 . 2、21 . 4、21 . 6、22 . 0、22 . 5、22 . 9、25 . 9、及び26 . 4の2シータ(°2)値に、X R P Dパターンにおける特徴的ピークを有する、実施態様6に記載の結晶形態。

[実施態様8]

化合物Iのメシリ酸塩の結晶形態であって、

【化6】



3 . 2、4 . 3、6 . 0、12 . 8、17 . 5、18 . 9、20 . 6、21 . 4、及び22 . 7の2シータ(°2)値に、X R P Dパターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

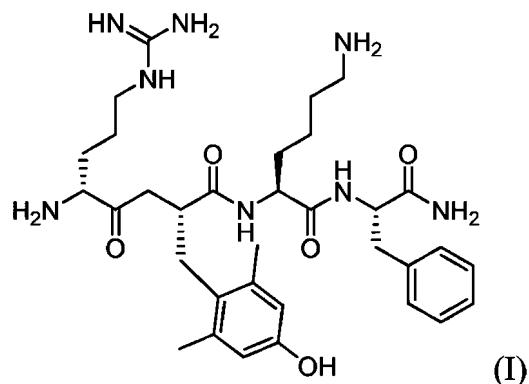
[実施態様9]

3 . 2、4 . 3、6 . 0、12 . 0、12 . 4、12 . 8、14 . 6、15 . 8、15 . 9、17 . 5、18 . 4、18 . 9、19 . 4、19 . 8、20 . 1、20 . 6、21 . 4、22 . 7、23 . 2、23 . 8、24 . 8、25 . 4、及び26 . 1の2シータ(°2)値に、X R P Dパターンにおける特徴的ピークを有する、実施態様8に記載の結晶形態。

[実施態様10]

化合物Iのトリル酸塩の結晶形態であって、

【化7】



11.6、12.2、13.4、15.4、17.0、20.2、22.4、22.7
及び23.1の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

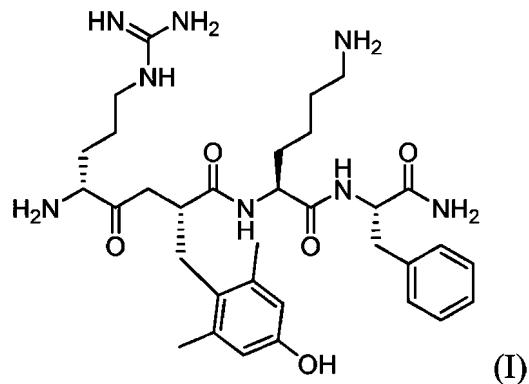
[実施態様11]

6.3、11.6、12.2、13.4、14.7、15.4、16.1、17.0、
18.9、20.2、22.4、22.7、及び23.1の2シータ(°2)値に、X
RPDパターンにおける特徴的ピークを有する、実施態様10に記載の結晶形態。

[実施態様12]

化合物Iのトシリル酸塩の結晶形態であって、

【化8】



6.5、12.0、13.0、13.3、15.7、17.3、19.4、20.5、
及び23.1の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有す
る、結晶形態。

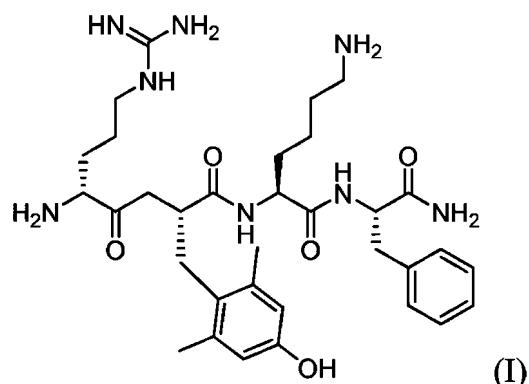
[実施態様13]

6.5、11.6、11.8、12.0、13.0、13.3、15.0、15.7、
15.9、17.3、19.4、19.6、20.5、22.4、22.8、23.1、
及び23.7の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有す
る、実施態様12に記載の結晶形態。

[実施態様14]

化合物Iのフマル酸塩の結晶形態であって、

【化9】



3 . 6、12 . 0、16 . 0、21 . 2、23 . 0、23 . 3、24 . 7、24 . 9、
及び25 . 7の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

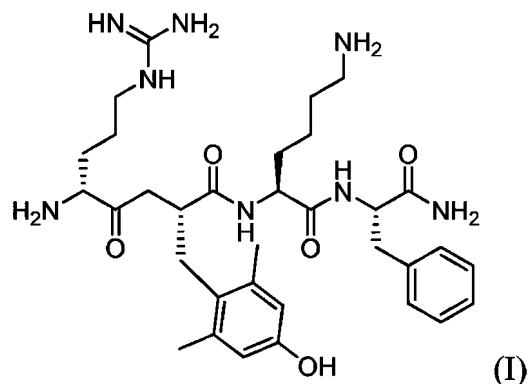
[実施態様15]

3 . 6、7 . 2、11 . 1、12 . 0、13 . 2、16 . 0、17 . 9、18 . 3、1
9 . 0、19 . 4、21 . 2、23 . 0、23 . 3、24 . 7、24 . 9、25 . 7、2
6 . 1、及び28 . 6の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピー
クを有する、実施態様14に記載の結晶形態。

[実施態様16]

化合物Iのフマル酸塩の結晶形態であって、

【化10】



4 . 2、11 . 3、11 . 7、12 . 4、14 . 8、17 . 0、17 . 2、20 . 7、
22 . 6、23 . 6、23 . 3、24 . 1、24 . 5、及び25 . 0の2シータ(°2)
値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

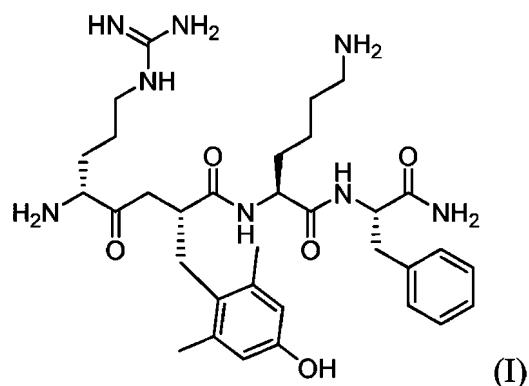
[実施態様17]

4 . 2、5 . 3、10 . 3、11 . 3、11 . 7、12 . 0、12 . 4、12 . 7、1
3 . 0、13 . 3、14 . 8、15 . 5、15 . 8、16 . 1、17 . 0、17 . 2、1
8 . 1、20 . 7、21 . 2、22 . 0、22 . 3、22 . 6、23 . 6、23 . 3、2
4 . 1、24 . 5、25 . 0、25 . 6、26 . 0、及び28 . 6の2シータ(°2)
値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、実施態様16に記載の結晶形態
。

[実施態様18]

化合物Iのフマル酸塩の結晶形態であって、

【化11】



4 . 6、11 . 2、14 . 6、19 . 9、20 . 5、24 . 2、24 . 6、及び25 . 2の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

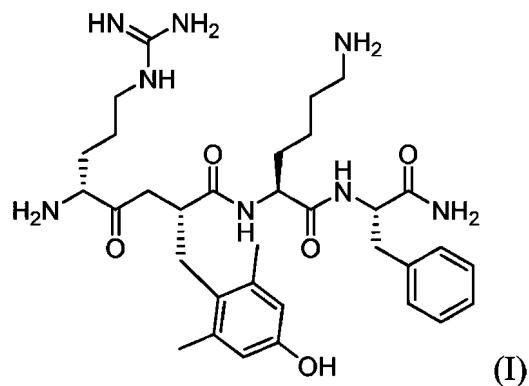
[実施態様19]

4 . 6、11 . 2、14 . 6、19 . 3、19 . 9、20 . 3、20 . 5、22 . 8、23 . 1、23 . 3、23 . 6、24 . 2、24 . 3、24 . 6、25 . 2、25 . 6、26 . 5、及び27 . 3の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、実施態様18に記載の結晶形態。

[実施態様20]

化合物Iのフマル酸塩の結晶形態であって、

【化12】



11 . 4、14 . 0、19 . 6、19 . 8、22 . 9、23 . 2、24 . 3、及び24 . 5の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

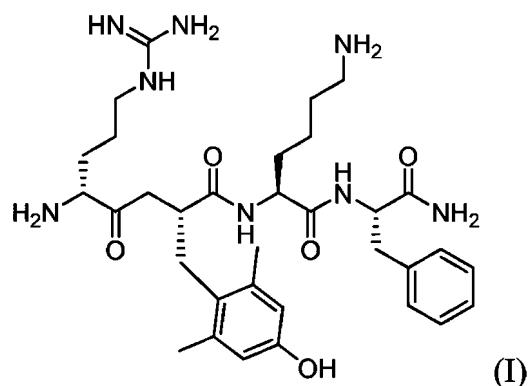
[実施態様21]

11 . 4、13 . 3、14 . 0、16 . 0、16 . 2、19 . 6、19 . 8、21 . 6、22 . 4、22 . 9、23 . 2、23 . 6、24 . 3、24 . 5、25 . 6、及び26 . 6の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、実施態様20に記載の結晶形態。

[実施態様22]

化合物Iのフマル酸塩の結晶形態であって、

【化13】



12.3、21.0、23.2、24.0、24.7、25.0、25.4、26.0、26.4、及び27.5の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

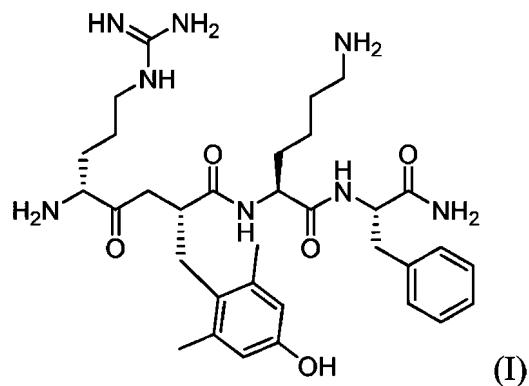
[実施態様23]

6.6、12.0、12.3、13.1、13.6、16.1、19.6、20.5、21.0、21.5、23.2、24.0、24.7、25.0、25.4、26.0、26.4、27.5、28.0、及び28.7の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、実施態様22に記載の結晶形態。

[実施態様24]

化合物Iのフマル酸塩の結晶形態であって、

【化14】



21.5、22.2、23.1、23.9、24.1、24.6、25.2、及び26.0の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

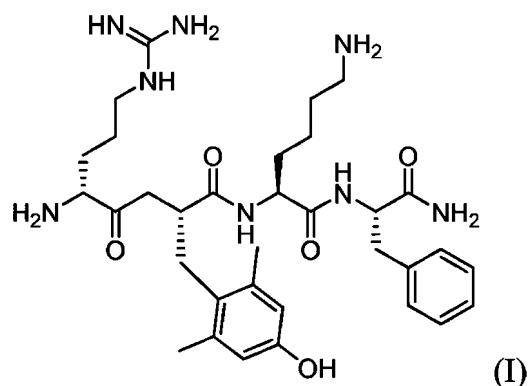
[実施態様25]

13.4、16.3、18.5、21.5、22.2、23.1、23.6、23.9、24.1、24.6、25.2、26.0、26.9、及び28.9の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、実施態様24に記載の結晶形態。

[実施態様26]

化合物Iのフマル酸塩の結晶形態であって、

【化15】



6 . 6、12 . 3、13 . 6、16 . 0、19 . 2、19 . 6、20 . 4、21 . 0、
21 . 1、22 . 3、23 . 2、24 . 0、25 . 3、及び26 . 0の2シータ(°2)
)値に、X R P D パターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

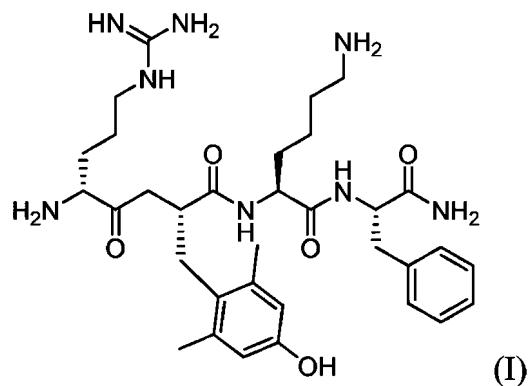
[実施態様27]

6 . 6、12 . 3、13 . 6、16 . 0、17 . 7、18 . 1、19 . 2、19 . 6、
20 . 4、21 . 0、21 . 1、22 . 3、23 . 2、24 . 0、24 . 6、25 . 0、
25 . 3、26 . 0、26 . 3、及び27 . 4の2シータ(°2)値に、X R P D パターン
における特徴的ピークを有する、実施態様26に記載の結晶形態。

[実施態様28]

化合物Iのフマル酸塩の結晶形態であって、

【化16】



13 . 2、20 . 3、22 . 7、21 . 4、21 . 9、23 . 6、24 . 0、24 . 4
、及び25 . 6の2シータ(°2)値に、X R P D パターンにおける特徴的ピークを有
する、結晶形態。

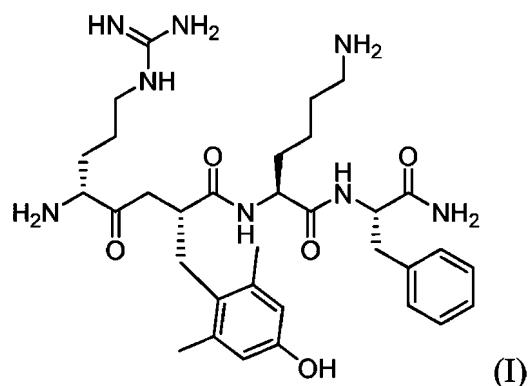
[実施態様29]

9 . 4、11 . 2、13 . 2、18 . 6、20 . 3、21 . 4、21 . 7、21 . 9、
22 . 7、23 . 2、23 . 6、24 . 0、24 . 4、25 . 6、26 . 8、及び28 .
5の2シータ(°2)値に、X R P D パターンにおける特徴的ピークを有する、実施態
様28に記載の結晶形態。

[実施態様30]

化合物Iのコレステリル硫酸塩の結晶形態であって、

【化17】



5 . 0、5 . 8、11 . 9、12 . 3、12 . 6、16 . 1、16 . 8、及び17 . 0の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

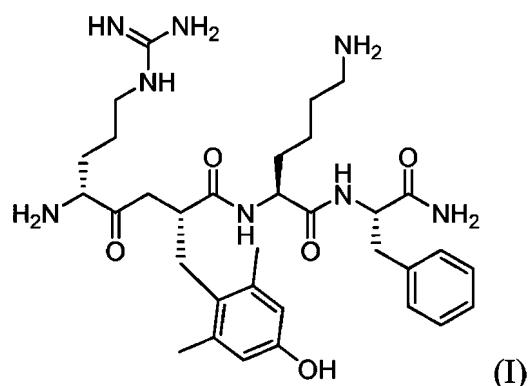
[実施態様31]

5 . 0、5 . 8、10 . 5、11 . 9、12 . 3、12 . 6、13 . 2、16 . 1、16 . 8、17 . 0、及び19 . 1の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、実施態様30に記載の結晶形態。

[実施態様32]

化合物Iのコレステリル硫酸塩の結晶形態であって、

【化18】



7 . 4、12 . 4、13 . 1、15 . 6、16 . 3、17 . 7、及び19 . 8の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

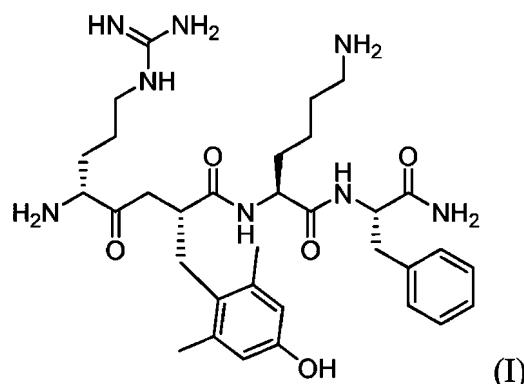
[実施態様33]

7 . 4、12 . 4、13 . 1、13 . 4、14 . 4、15 . 6、16 . 3、17 . 7、19 . 5、及び19 . 8の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、実施態様32に記載の結晶形態。

[実施態様34]

化合物Iのシュウ酸塩の結晶形態であって、

【化19】



5 . 0、7 . 3、13 . 4、17 . 3、21 . 3、22 . 5、22 . 9、及び24 . 7の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

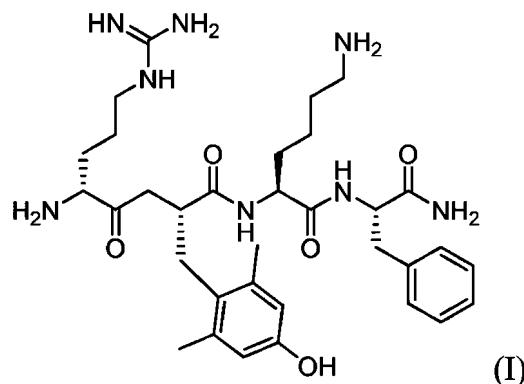
[実施態様35]

5 . 0、7 . 3、12 . 2、13 . 2、13 . 4、15 . 0、16 . 2、17 . 3、18 . 6、20 . 1、21 . 3、22 . 5、22 . 9、23 . 3、24 . 4、及び24 . 7の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、実施態様34に記載の結晶形態。

[実施態様36]

化合物Iのシュウ酸塩の結晶形態であって、

【化20】



3 . 8、4 . 3、8 . 1、19 . 8、20 . 7、22 . 3、24 . 9、及び25 . 6の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

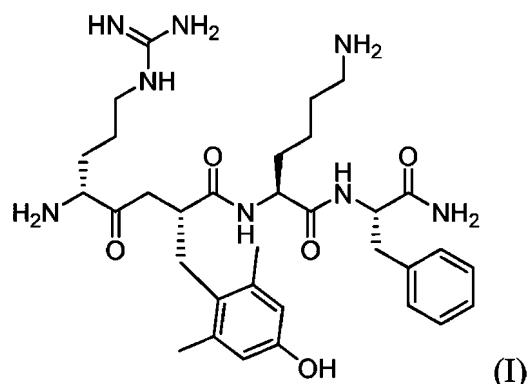
[実施態様37]

3 . 8、4 . 3、7 . 0、8 . 1、18 . 2、18 . 3、19 . 1、19 . 8、20 . 3、20 . 7、21 . 1、22 . 3、22 . 8、23 . 2、23 . 5、24 . 0、24 . 6、24 . 9、及び25 . 6の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、実施態様36に記載の結晶形態。

[実施態様38]

化合物Iのエシル酸塩の結晶形態であって、

【化21】



5 . 4、9 . 8、10 . 8、18 . 8、19 . 7、21 . 1、21 . 8、及び22 . 3の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

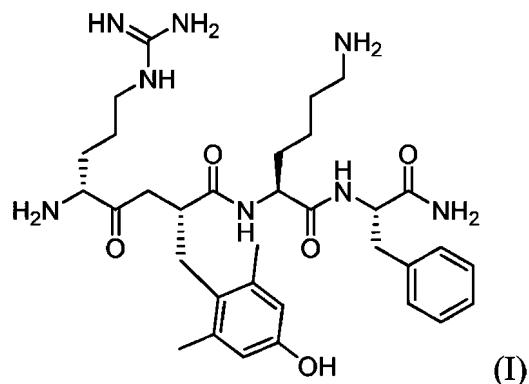
[実施態様39]

5 . 4、9 . 8、10 . 8、11 . 8、14 . 4、15 . 1、15 . 6、17 . 2、17 . 7、18 . 8、19 . 0、19 . 7、21 . 1、21 . 5、21 . 8、及び22 . 3の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、実施態様38に記載の結晶形態。

[実施態様40]

化合物Iのエシル酸塩の結晶形態であって、

【化22】



5 . 4、10 . 8、11 . 0、14 . 5、17 . 3、18 . 7、19 . 6、21 . 0、21 . 4、及び22 . 1の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

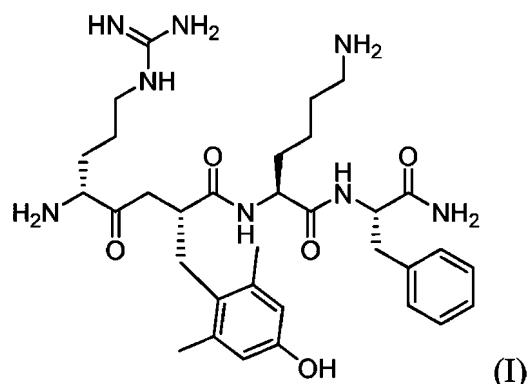
[実施態様41]

5 . 4、9 . 7、10 . 8、11 . 0、14 . 5、15 . 0、16 . 0、17 . 3、17 . 7、18 . 7、19 . 6、21 . 0、21 . 4、22 . 1、及び24 . 0の2シータ(°2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、実施態様40に記載の結晶形態。

[実施態様42]

化合物Iの安息香酸塩の結晶形態であって、

【化23】



5.1、10.2、13.2、14.0、20.4、21.9、及び25.3の2シータ($^{\circ}$ 2)値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

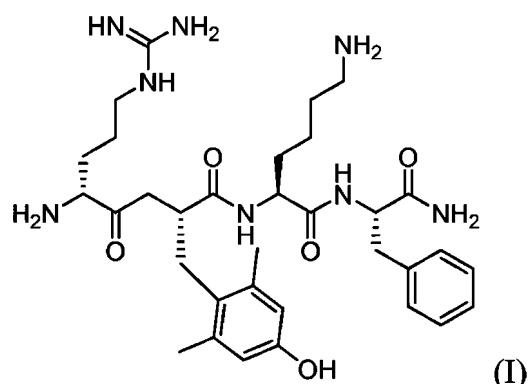
[実施態様43]

5.1、10.2、11.9、13.2、13.8、14.0、16.0、16.7、
20.4、21.9、23.1、23.5、24.5、及び25.3の2シータ($^{\circ}$ 2)
値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、実施態様42に記載の結晶形態。

[実施態様44]

化合物Iのコハク酸塩の結晶形態であって、

【化24】



4.2、5.1、6.6、9.9、14.1、18.0、及び24.1の2シータ($^{\circ}$ 2)
値に、XRPDパターンにおける特徴的ピークを有する、結晶形態。

[実施態様45]

4.2、5.1、6.6、8.0、9.9、10.3、13.1、14.1、14.6、
17.6、18.0、18.5、19.0、19.9、20.8、22.2、22.4、
23.4、及び24.1の2シータ($^{\circ}$ 2)値に、XRPDパターンにおける特徴的
ピークを有する、実施態様44に記載の結晶形態。

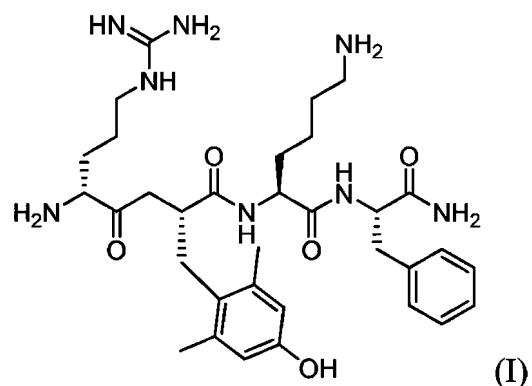
[実施態様46]

実施態様1～45のいずれかに記載の結晶形態を含む、組成物。

[実施態様47]

化合物Iを含む医薬組成物を作製するプロセスであって、

【化25】



(I)

実施態様 1 ~ 4 5 のいずれかに記載の結晶形態を溶解させる工程を含む、プロセス。