

請求の範囲

- [請求項1] 1 - [[(3S) - 3 - メチル - 6 - (4, 4, 4 - トリフルオロブトキシ) - 3, 4 - ジヒドロナフタレン - 2 - イル] メチル] アゼチジン - 3 - カルボン酸の塩。
- [請求項2] 塩がー (4 - ヒドロキシ安息香酸塩) である請求項1記載の化合物。
- [請求項3] 結晶形態である請求項2記載の化合物。
- [請求項4] 粉末X線回折スペクトルにおいて、少なくとも約6.9、約12.8、約13.9、および約24.7度の回折角(2θ)に回折ピークを有する、請求項3記載の結晶。
- [請求項5] 粉末X線回折スペクトルにおいて、少なくとも約5.4、約6.9、約13.9、約18.1、約19.4、約19.8、約20.9、および約24.7度の回折角(2θ)に回折ピークを有する、請求項3記載の結晶。
- [請求項6] 粉末X線回折スペクトルにおいて、約11.3、および約14.4度の回折角(2θ)に回折ピークを有さない、請求項4または請求項5記載の結晶。
- [請求項7] 粉末X線回折スペクトルにおいて、約5.4、約6.9、約10.3、約12.8、約13.9、約15.0、約15.3、約15.9、約16.6、約16.8、約18.1、約19.4、約19.8、約20.9、約21.8、約22.7、約23.6、約24.7、約25.4、約25.8、約26.3、約26.7、約27.6、約27.8、約30.3、約33.4、および約34.2度の回折角(2θ)に回折ピークを有する、請求項3～6のいずれか一項に記載の結晶。
- [請求項8] 図7に示される粉末X線回折スペクトルチャートの特徴とする、請求項3～7のいずれか一項に記載の結晶。
- [請求項9] 示差走査熱量測定において、オンセット温度が約150℃またはピ

ーク温度が約153℃である吸熱ピークを有する、請求項3～8のいずれか一項に記載の結晶。

[請求項10] 図8に示される示差走査熱量測定チャートの特徴とする、請求項3～9のいずれか一項に記載の結晶。

[請求項11] 粉末X線回折スペクトルにおいて、少なくとも約11.3度の回折角(2θ)に回折ピークを有する、請求項3記載の結晶。

[請求項12] 粉末X線回折スペクトルにおいて、少なくとも約5.6、約11.3、約13.2、約15.9、約16.9、約18.8、約22.7、および約24.2度の回折角(2θ)に回折ピークを有する、請求項3または請求項11記載の結晶。

[請求項13] 粉末X線回折スペクトルにおいて、約5.6、約7.0、約7.9、約11.3、約12.3、約13.2、約13.9、約15.9、約16.9、約17.4、約17.9、約18.4、約18.8、約19.4、約19.9、約20.4、約21.0、約21.2、約21.9、約22.7、約23.2、約23.4、約24.2、約25.2、約26.5、約27.5、約29.1、約29.8、約30.5、および約34.1度の回折角(2θ)に回折ピークを有する、請求項3、請求項11または請求項12記載の結晶。

[請求項14] 図9に示される粉末X線回折スペクトルチャートの特徴とする、請求項3、または請求項11～13のいずれか一項に記載の結晶。

[請求項15] 示差走査熱量測定において、オンセット温度が約154℃またはピーク温度が約158℃である吸熱ピークを有する、請求項3、または請求項11～14のいずれか一項に記載の結晶。

[請求項16] 図10に示される示差走査熱量測定チャートの特徴とする、請求項3または請求項11～15のいずれか一項に記載の結晶。

[請求項17] 塩がトリプトファン塩である請求項1記載の化合物。

[請求項18] 結晶形態である請求項17記載の化合物。

[請求項19] 粉末X線回折スペクトルにおいて、少なくとも約8.0、約9.7

、約16.0、約17.0、約18.9、約19.1、約22.2、
および約24.6度の回折角（ 2θ ）に回折ピークを有する、請求項
18記載の結晶。

[請求項20] 粉末X線回折スペクトルにおいて、約8.0、約9.7、約12.
8、約15.6、約16.0、約16.6、約17.0、約17.3
、約17.6、約18.2、約18.6、約18.9、約19.1、
約19.6、約20.9、約21.3、約21.7、約21.9、約
22.2、約22.6、約23.4、約23.8、約24.6、約2
5.3、約25.7、約26.2、約26.6、約27.1、約27
.4、約27.9、約28.2、約28.7、約29.1、約29.
9、約30.2、約30.9、約32.0、約32.2、約32.5
、約33.1、約34.1、約34.5、および約34.8度の回折
角（ 2θ ）に回折ピークを有する、請求項18または請求項19記載
の結晶。

[請求項21] 図15に示される粉末X線回折スペクトルチャートの特徴とする、
請求項18～20のいずれか一項に記載の結晶。

[請求項22] 示差走査熱量測定において、オンセット温度が約178℃またはピーク温度が約183℃である吸熱ピークを有する、請求項18～21のいずれか一項に記載の結晶。

[請求項23] 示差走査熱量測定において、オンセット温度が約185℃またはピーク温度が約187℃である発熱ピークを有する、請求項18～22のいずれか一項に記載の結晶。

[請求項24] 図16に示される示差走査熱量測定チャートの特徴とする、請求項18～23のいずれか一項に記載の結晶。

[請求項25] 塩がヘミコハク酸塩である請求項1記載の化合物。

[請求項26] 結晶形態である請求項25記載の化合物。

[請求項27] 粉末X線回折スペクトルにおいて、少なくとも約6.4、約6.9
、約12.9、約13.8、約17.2、約18.1、約19.3、

約23.9、および約24.3度の回折角(2θ)に回折ピークを有する、請求項26記載の結晶。

[請求項28] 粉末X線回折スペクトルにおいて、約6.1、約6.4、約6.9、約12.9、約13.8、約16.6、約17.2、約18.1、約18.3、約18.7、約19.3、約19.9、約20.5、約20.7、約21.0、約21.4、約21.9、約22.1、約22.7、約23.0、約23.6、約23.9、約24.3、約24.6、約25.2、約25.8、約26.0、約27.4、約27.5、約27.8、約28.7、約29.5、約30.2、約30.5、約30.8、約31.3、約31.7、約32.3、約32.5、約33.8、約34.1、約34.5、および約34.9度の回折角(2θ)に回折ピークを有する、請求項26または請求項27記載の結晶。

[請求項29] 図17に示される粉末X線回折スペクトルチャートの特徴とする、請求項26～28のいずれか一項に記載の結晶。

[請求項30] 示差走査熱量測定において、オンセット温度が約111℃またはピーク温度が約114℃である吸熱ピークを有する、請求項26～29のいずれか一項に記載の結晶。

[請求項31] 示差走査熱量測定において、オンセット温度が約137℃またはピーク温度が約140℃である吸熱ピークを有する、請求項26～30のいずれか一項に記載の結晶。

[請求項32] 図18に示される示差走査熱量測定チャートの特徴とする、請求項26～31のいずれか一項に記載の結晶。

[請求項33] 1-[[(3S)-3-メチル-6-(4,4,4-トリフルオロブトキシ)-3,4-ジヒドロナフタレン-2-イル]メチル]アゼチジン-3-カルボン酸の結晶。

[請求項34] 粉末X線回折スペクトルにおいて、少なくとも約6.5、約7.8、約8.6、および約11.6度の回折角(2θ)に回折ピークを有

する、請求項33記載の結晶。

- [請求項35] 粉末X線回折スペクトルにおいて、約6.5、約7.8、約8.6、約11.6、約13.0、約13.1、約15.2、約15.8、約17.0、約17.3、約18.8、約18.9、約19.3、約20.9、約21.1、約21.3、約22.8、約23.3、約23.6、約23.8、約24.0、約24.9、約25.8、約26.4、約27.1、約27.9、約29.8、約30.4、約30.7、約31.6、約32.0、および約34.0度の回折角(2 θ)に回折ピークを有する、請求項33または請求項34記載の結晶。
- [請求項36] 図1に示される粉末X線回折スペクトルチャートの特徴とする、請求項33～35のいずれか一項に記載の結晶。
- [請求項37] 示差走査熱量測定において、オンセット温度が約128℃またはピーク温度が約133℃である吸熱ピークを有する、請求項33～36のいずれか一項に記載の結晶。
- [請求項38] 図2に示される示差走査熱量測定チャートの特徴とする、請求項33～37のいずれか一項に記載の結晶。
- [請求項39] 請求項1～38のいずれか一項に記載の化合物と薬学的に許容される担体とを含有する医薬組成物。
- [請求項40] S1P₅介在性疾患の予防および／または治療剤である、請求項39記載の医薬組成物。
- [請求項41] S1P₅介在性疾患が、神経変性疾患である請求項40記載の医薬組成物。
- [請求項42] 神経変性疾患が、多系統萎縮症またはパーキンソン病である請求項41記載の医薬組成物。
- [請求項43] 請求項1～38のいずれか一項に記載の化合物を含有するS1P₅介在性疾患の予防および／または治療剤。
- [請求項44] 請求項1～38のいずれか一項に記載の化合物の有効量を哺乳動物に投与することを特徴とする、S1P₅介在性疾患の予防および／ま

たは治療方法。

- [請求項45] S 1 P₅ 介在性疾患の予防および／または治療に使用される請求項 1 ～ 3 8 のいずれか一項に記載の化合物。
- [請求項46] S 1 P₅ 介在性疾患の予防および／または治療剤を製造するための請求項 1 ～ 3 8 のいずれか一項に記載の化合物の使用。