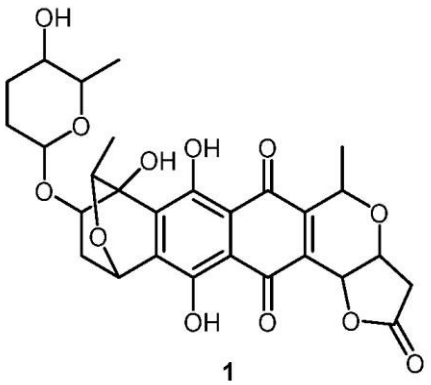
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成31年3月14日(2019.3.14)

【公表番号】特表2018-500355(P2018-500355A)
【公表日】平成30年1月11日(2018.1.11)
【年通号数】公開・登録公報2018-001
【出願番号】特願2017-534202(P2017-534202)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 493/18 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/352 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 31/04 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 45/00 (2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 493/18
Ａ６１Ｋ 31/352
Ａ６１Ｐ 31/04
Ａ６１Ｐ 35/00
Ａ６１Ｐ 35/02
Ａ６１Ｐ 43/00 １０５
Ａ６１Ｋ 45/00

【手続補正書】
【提出日】平成31年2月4日(2019.2.4)
【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１：
【化１】



1

の結晶性形態Ａ。
【請求項２】

図１または図２に示すものと実質的に同様のＸＲＰＤパターンを特徴とする、請求項１に記載の結晶性形態Ａ。
【請求項３】
以下の表：
【表１】

角度（2シータ°）
9.1 ± 0.2
10.0 ± 0.2
11.6 ± 0.2
16.1 ± 0.2

から選択される４つ以上のピークをそのＸＲＰＤパターンに有することを特徴とする、請求項１または２に記載の結晶性形態Ａ。
【請求項４】
以下の表：
【表２】

角度（2シータ°）
9.1 ± 0.2
10.0 ± 0.2
11.6 ± 0.2
16.1 ± 0.2
18.3 ± 0.2

から選択される５つ以上のピークをそのＸＲＰＤパターンに有することを特徴とする、請求項１～３のいずれか一項に記載の結晶性形態Ａ。
【請求項５】
以下の表：
【表３】

角度（2シータ°）
9.1 ± 0.2
10.0 ± 0.2
11.6 ± 0.2
16.1 ± 0.2
18.3 ± 0.2
4.5 ± 0.2
15.4 ± 0.2

から選択される７つ以上のピークをそのＸＲＰＤパターンに有することを特徴とする、請求項１～４のいずれか一項に記載の結晶性形態Ａ。
【請求項６】
以下の表：

【表４】

角度（2シータ°）
9.1 ± 0.2
10.0 ± 0.2
11.6 ± 0.2
16.1 ± 0.2
18.3 ± 0.2
4.5 ± 0.2
15.4 ± 0.2
12.6 ± 0.2
17.0 ± 0.2

から選択される９つ以上のピークをそのＸＲＰＤパターンに有することを特徴とする、請求項１～５のいずれか一項に記載の結晶性形態Ａ。

【請求項７】

以下の表：

【表５】

角度（2シータ°）
9.1 ± 0.2
10.0 ± 0.2
11.6 ± 0.2
16.1 ± 0.2
18.3 ± 0.2
4.5 ± 0.2
15.4 ± 0.2
12.6 ± 0.2
17.0 ± 0.2
13.3 ± 0.2
17.5 ± 0.2
21.6 ± 0.2
23.3 ± 0.2

から選択される１３のピークをそのＸＲＰＤパターンに有することを特徴とする、請求項１～６のいずれか一項に記載の結晶性形態Ａ。

【請求項８】

以下の表：

【表６】

角度（2シータ°）
9.1 ± 0.2
10.0 ± 0.2
11.6 ± 0.2
16.1 ± 0.2
18.3 ± 0.2
4.5 ± 0.2
15.4 ± 0.2
12.6 ± 0.2
17.0 ± 0.2
13.3 ± 0.2
17.5 ± 0.2
22.1 ± 0.2
23.3 ± 0.2
8.7 ± 0.2
19.7 ± 0.2
20.3 ± 0.2
21.6 ± 0.2

から選択される１７のピークをそのＸＲＰＤパターンに有することを特徴とする、請求項１～７のいずれか一項に記載の結晶性形態Ａ。

【請求項９】

図３または図４に示すものと実質的に同様のＤＳＣエンドサーモグラムを特徴とする、請求項１～８のいずれか一項に記載の結晶性形態Ａ。

【請求項１０】

約１９０℃のピーク温度（T_{max}）を有するＤＳＣエンドサーモグラムを特徴とする、請求項１～９のいずれか一項に記載の結晶性形態Ａ。

【請求項１１】

約１４０℃～約２５０℃の範囲に相転移を有するＤＳＣエンドサーモグラムを特徴とする、請求項１～１０のいずれか一項に記載の結晶性形態Ａ。

【請求項１２】

図５または図６に示すものと実質的に同様の熱重量スペクトルを特徴とする、請求項１～１１のいずれか一項に記載の結晶性形態Ａ。

【請求項１３】

図７または図８に示すものと実質的に同様のＮＭＲスペクトルを特徴とする、請求項１～１２のいずれか一項に記載の結晶性形態Ａ。

【請求項１４】

結晶性形態Ａが、クロロホルムおよびメタノールから得られるか、またはメタノールおよびアセトンから得られる；および任意に、クロロホルムが、水を含まない、請求項１～１３のいずれか一項に記載の結晶性形態Ａ。

【請求項１５】

結晶性形態Ａが、水和物ではない；任意に、約０．０１ｗｔ％～約５．０ｗｔ％の水が存在する、請求項１～１４のいずれか一項に記載の結晶性形態Ａ。

【請求項１６】

結晶性形態Ａが、非晶質の化合物１を実質的に含まない；任意に、約０．０１ｗｔ％～約１０ｗｔ％の非晶質の化合物１が存在する、請求項１～１５のいずれか一項に記載の結

晶性形態Ａ。
【請求項１７】
結晶性形態Ａが、不純物を実質的に含まない、請求項１～１６のいずれか一項に記載の結晶性形態Ａ。
【請求項１８】
化合物１を、クロロホルムおよびメタノールから結晶化することを含む；任意に、クロロホルムが、水を含まない、請求項１～１７のいずれか一項に記載の結晶性形態Ａを調製する方法。
【請求項１９】
化合物１をメタノールおよびアセトンと混合して、混合物を生成することを含む；任意に、塩酸塩水溶液を加えて混合物を酸性化することをさらに含む、請求項１～１７のいずれか一項に記載の結晶性形態Ａを調製する方法。
【請求項２０】
請求項１～１７のいずれか一項に記載の結晶性形態Ａおよび任意に薬学的に許容し得る賦形剤を含む、医薬組成物。
【請求項２１】
増殖性疾患を処置するための方法であって、それを必要とする対象へ、治療有効量の請求項１～１７のいずれか一項に記載の結晶性形態Ａまたは請求項２０に記載の医薬組成物を投与することを含む、前記方法。
【請求項２２】
増殖性疾患が、がんである、請求項２１に記載の方法。
【請求項２３】
がんが、白血病、リンパ腫、骨髄異形成症候群、甲状腺がん、卵巣がん、肺がん、前立腺がん、精巣がん、腎細胞癌、肝臓がん、結腸直腸がん、胃がん、膵臓がん、膀胱がん、尿道がん、胆管がん、胆嚢がん、子宮頸がん、子宮内膜がん、乳がん、頭頚部がん、口腔がん、食道がん、皮膚がん、骨のがん、筋肉のがん、脳がん、または眼のがんである；任意に、白血病が、急性骨髄性白血病、慢性リンパ球性白血病、急性リンパ芽球性白血病、または急性混合型白血病である、請求項２２に記載の方法。
【請求項２４】
対象または生体試料における細胞成長を阻害する方法であって、方法が、対象または生体試料へ、治療有効量の請求項１～１７のいずれか一項に記載の結晶性形態Ａまたは請求項２０の医薬組成物を投与することを含む、前記方法。
【請求項２５】
対象または生体試料における細胞のアポトーシスを誘導する方法であって、方法が、対象または生体試料へ、治療有効量の請求項１～１７のいずれか一項に記載の結晶性形態Ａまたは請求項２０の医薬組成物を投与することを含む、前記方法。
【請求項２６】
対象が、ヒトである、請求項２１～２５のいずれか一項に記載の方法。