

【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30年12月27日(2018.12.27)

【公表番号】特表2017-535564(P2017-535564A)

【公表日】平成29年11月30日(2017.11.30)

【年通号数】公開・登録公報2017-046

【出願番号】特願2017-527299(P2017-527299)

【国際特許分類】

C 07 D 487/04 (2006.01)

A 61 K 31/497 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 15/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 487/04 136

C 07 D 487/04 C S P

A 61 K 31/497

A 61 P 35/00

A 61 P 15/00

【手続補正書】

【提出日】平成30年11月14日(2018.11.14)

【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

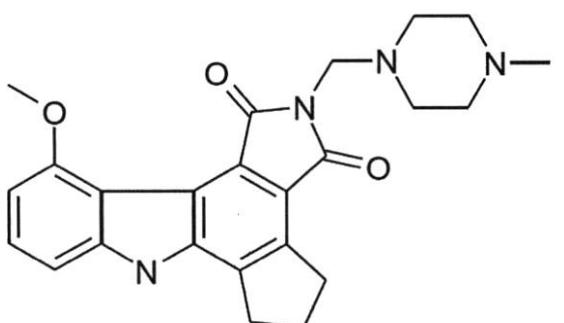
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

4,5,6,7-テトラヒドロ-11-メトキシ-2-[(4-メチル-1-ピペラジニル)メチル]-1H-シクロペンタ[a]ピロロ[3,4-c]カルバゾール-1,3(2H)-ジオン(化合物A)の結晶形態であって、

【化1】



化合物A

化合物A、グリコール酸塩水和物形態A₁、

化合物A、L-リンゴ酸塩形態A₁、又は

化合物A、L-ピログルタミン酸塩形態A₁である結晶形態。

【請求項2】

化合物A、グリコール酸塩水和物形態A₁である、請求項1に記載の結晶形態。

【請求項3】

8.2、8.7、13.8、14.9、16.4、17.5、18.2、18.5、20.2、20.6、21.2、21.4、23.0、24.6、27.8、29.9、3

0 . 1 、 及び 3 0 . 5 ° 2 ± 0 . 2 ° 2 から成る群から選択される少なくとも 3 つのピークを持つ X 線粉末回折パターンを特徴とする、請求項 2 に記載の結晶形態。

【請求項 4】

実質的に図 9 又は図 10 に示すような X 線粉末回折パターンをさらに特徴とする、請求項 2 又は請求項 3 に記載の結晶形態。

【請求項 5】

実質的に図 11 に示すような DSC をさらに特徴とする、請求項 2 ~ 4 のいずれか一項に記載の結晶形態。

【請求項 6】

実質的に図 12 に示すような DVS をさらに特徴とする、請求項 2 ~ 5 のいずれか一項に記載の結晶形態。

【請求項 7】

化合物 A 、 L - リンゴ酸塩形態 A ₁ である、請求項 1 に記載の結晶形態。

【請求項 8】

8 . 6 、 9 . 2 、 1 0 . 1 、 1 0 . 4 、 1 1 . 7 、 1 1 . 9 、 1 4 . 7 、 1 5 . 3 、 1 5 . 6 、 1 7 . 2 、 1 7 . 8 、 1 8 . 5 、 2 0 . 3 、 2 0 . 7 、 2 1 . 2 、 2 2 . 4 、 2 3 . 5 、 2 4 . 3 、 及び 2 7 . 0 ± 0 . 2 ° 2 から成る群から選択される少なくとも 3 つのピークを持つ X 線粉末回折パターンを特徴とする、請求項 7 に記載の結晶形態。

【請求項 9】

実質的に図 14 又は図 15 に示すような X 線粉末回折パターンをさらに特徴とする、請求項 7 又は請求項 8 に記載の結晶形態。

【請求項 10】

実質的に図 16 に示すような DSC をさらに特徴とする、請求項 7 ~ 9 のいずれか一項に記載の結晶形態。

【請求項 11】

実質的に図 17 に示すような DVS をさらに特徴とする、請求項 7 ~ 10 のいずれか一項に記載の結晶形態。

【請求項 12】

化合物 A 、 L - ピログルタミン酸塩形態 A ₁ である、請求項 1 に記載の結晶形態。

【請求項 13】

6 . 0 、 9 . 6 、 1 0 . 3 、 1 0 . 5 、 1 1 . 0 、 1 2 . 0 、 1 3 . 2 、 1 5 . 0 、 1 6 . 7 、 1 7 . 5 、 1 7 . 8 、 1 8 . 0 、 1 9 . 0 、 2 0 . 8 、 2 1 . 0 、 2 1 . 1 、 2 2 . 0 、 2 2 . 1 、 2 3 . 1 、 2 3 . 4 、 2 3 . 5 、 2 4 . 8 、 及び 2 6 . 6 ± 0 . 2 ° 2 から成る群から選択される少なくとも 3 つのピークを持つ X 線粉末回折パターンを特徴とする、請求項 12 に記載の結晶形態。

【請求項 14】

実質的に図 21 又は図 22 に示すような X 線粉末回折パターンをさらに特徴とする、請求項 12 又は請求項 13 に記載の結晶形態。

【請求項 15】

実質的に図 23 に示すような DSC をさらに特徴とする、請求項 12 ~ 14 のいずれか一項に記載の結晶形態。

【請求項 16】

実質的に図 24 に示すような DVS をさらに特徴とする、請求項 12 ~ 15 のいずれか一項に記載の結晶形態。

【請求項 17】

請求項 1 ~ 16 のいずれか一項に記載の結晶形態 及び 少なくとも一つの医薬的に許容可能な賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 18】

請求項 1 ~ 17 のいずれか一項に記載の、 4 , 5 , 6 , 7 - テトラヒドロ - 1 1 - メトキシ - 2 - [(4 - メチル - 1 - ピペラジニル) メチル] - 1 H - シクロペンタ [a] ピ

□□[3,4-c]カルバゾール-1,3(2H)-ジオン(化合物A)の結晶形態を患者に投与することを含む、患者の癌を治療する方法。

【請求項19】

前記癌が乳癌又は卵巣癌である、請求項18に記載の方法。