

【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 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/497 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 487/04 1 3 6

C 0 7 D 487/04 C S P

A 6 1 K 31/497

A 6 1 P 35/00

A 6 1 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

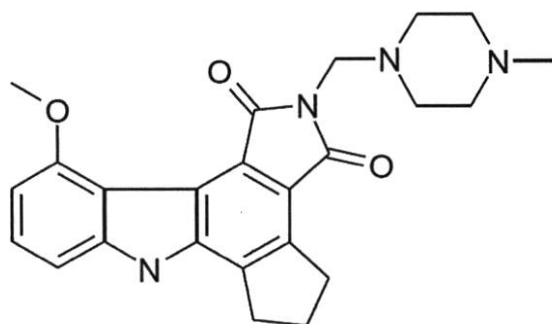
【補正の内容】

【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] - 1 H - シクロペンタ [a] ピロロ [3, 4 - c] カルバゾール - 1, 3 (2 H) - 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30.5°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A₁である、請求項1に記載の結晶形態。

【請求項8】

8.6、9.2、10.1、10.4、11.7、11.9、14.7、15.3、15.6、17.2、17.8、18.5、20.3、20.7、21.2、22.4、23.5、24.3、及び27.0 ± 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A₁である、請求項1に記載の結晶形態。

【請求項13】

6.0、9.6、10.3、10.5、11.0、12.0、13.2、15.0、16.7、17.5、17.8、18.0、19.0、20.8、21.0、21.1、22.0、22.1、23.1、23.4、23.5、24.8、及び26.6 ± 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-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 (2 H) - 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。