

【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22年1月14日 (2010.1.14)

【公表番号】特表2009-517353(P2009-517353A)

【公表日】平成21年4月30日 (2009.4.30)

【年通号数】公開・登録公報2009-017

【出願番号】特願2008-541641(P2008-541641)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 K 47/42 (2006.01)

A 6 1 K 47/02 (2006.01)

A 6 1 K 47/04 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/04 C S P

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 9/48

A 6 1 K 47/42

A 6 1 K 47/02

A 6 1 K 47/04

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/12

A 6 1 K 47/36

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成21年11月20日 (2009.11.20)

【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

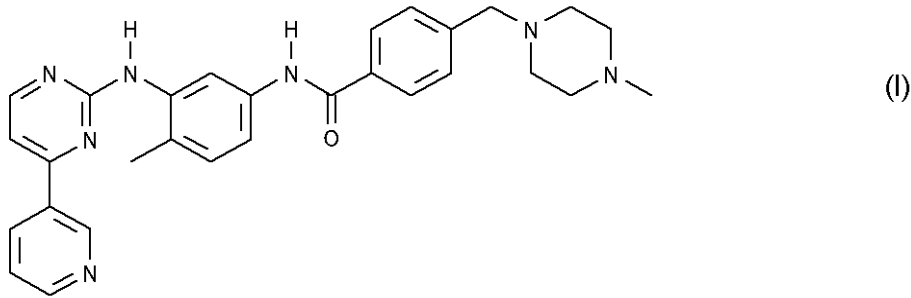
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

8.4°および8.6°の回折角2シートにX線回折ピークを示し、そしてX線回折ダイアグラムにおける最強の線が20.9°の回折角2シートで観察される、式I

## 【化 1】



の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形 F。

## 【請求項 2】

X 線回折ダイアグラムにおいて：8.4°、8.6°、13.3°、16.2°、16.8°、17.1°、19.5°、20.9°、23.6°および24.5°の回折角 2 シータで線を示す、請求項 1 に記載の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形。

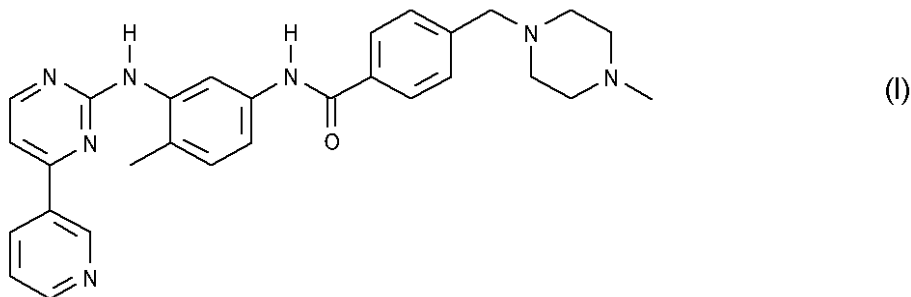
## 【請求項 3】

本質的に純粋な形で存在する請求項 1 または 2 に記載の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形。

## 【請求項 4】

図 1 に示すタイプの X 線回折ダイアグラムを示し、ここで、各ピークの相対強度が図 1 に示すダイアグラムの相対的ピーク強度から 10 % を超えて逸脱しない、式 I

## 【化 2】



の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形。

## 【請求項 5】

請求項 1 または 2 に記載の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形を、所望により薬学的に許容される担体と共に含む、医薬組成物。

## 【請求項 6】

非晶形、結晶形、結晶形および H 1 結晶形から選択される少なくとも 1 種の異なる形の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩をさらに含む、請求項 5 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 7】

50 mg から 800 mg の式 I の請求項 1 または 2 に記載の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形を含む、請求項 5 または 6 に記載の医薬組成物。

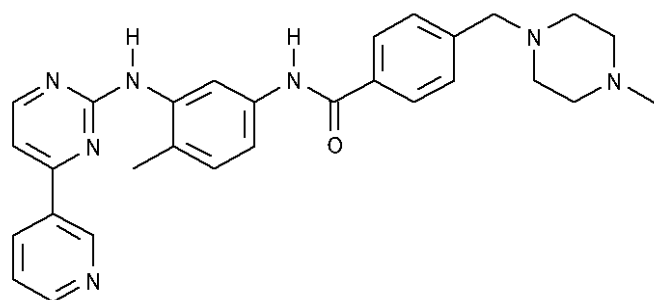
## 【請求項 8】

50 mg から 200 mg の請求項 1 または 2 に記載の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形を含む粉末混合を含むカプセル剤である、請求項 5 から 7 のいずれかに記載の医薬組成物。

## 【請求項 9】

95 で融解事象、その後発熱性再結晶および約 223 での 2 回目の融解を示す DSC 曲線により特徴付けられる、式 I

## 【化 3】



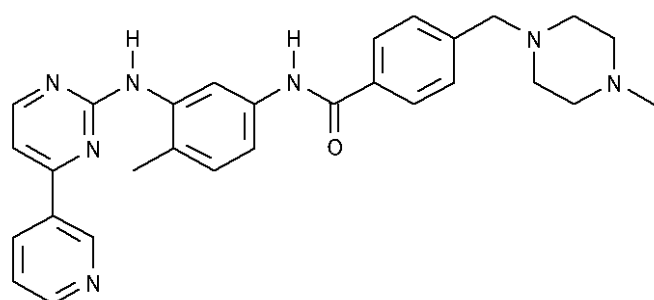
(I)

の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形。

## 【請求項 1 0】

式 I

## 【化 4】



(I)

の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形 G。

## 【請求項 1 1】

4 ° から 8 ° の回折角 2 シータの間に何の線も示さないとき、1 0 . 5 ° の回折角 2 シータに X 線回折ピークを示す、請求項 1 0 に記載の結晶形。

## 【請求項 1 2】

1 0 . 5 °、1 8 . 1 ° および 1 8 . 7 ° の回折角 2 シータでの X 線回折ピークにより特徴付けられる、請求項 1 0 に記載の結晶形。

## 【請求項 1 3】

X 線回折ダイアグラムにおいて：1 0 . 5 °、1 5 . 0 °、1 7 . 2 °、1 8 . 1 °、1 8 . 7 °、1 9 . 2 °、2 1 . 1 ° および 2 1 . 3 ° の回折角 2 シータで線を示す、請求項 1 0 または 1 1 に記載の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形。

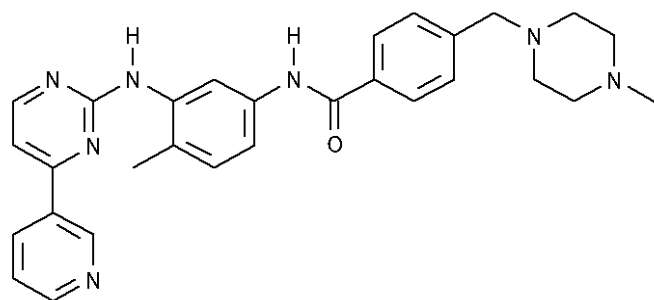
## 【請求項 1 4】

本質的に純粋な形で存在する、請求項 1 0 から 1 3 のいずれかに記載の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形。

## 【請求項 1 5】

図 2 に示すタイプの X 線回折ダイアグラムを示し、ここで、各ピークの相対強度が図 2 に示すダイアグラムの相対的ピーク強度から 1 0 % を超えて逸脱しない、式 I

## 【化 5】



(I)

の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形。

【請求項 16】

請求項 10 から 13 のいずれかに記載の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形を、所望により薬学的に許容される担体と共に含む、医薬組成物。

【請求項 17】

非晶形、結晶形、結晶形および H 1 結晶形から選択される少なくとも 1 種の異なる形の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩をさらに含む、請求項 16 に記載の医薬組成物。

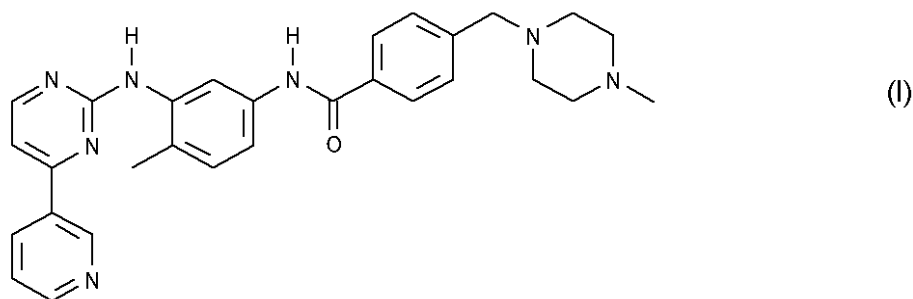
【請求項 18】

50 mg から 800 mg の請求項 10 から 13 のいずれかに記載の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形を含む、請求項 16 または 17 に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

式 I

【化 6】



の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形 H。

【請求項 20】

32.9° の回折角 2 シータで X 線回折のピークを示す、請求項 19 に記載の結晶形。

【請求項 21】

25.1° の回折角 2 シータでの X 線回折ピークにより特徴付けられる、請求項 19 に記載の結晶形。

【請求項 22】

X 線回折ダイアグラムにおいて：10.5°、22.8°、25.1° および 32.9° の回折角 2 シータで線を示す、請求項 19 から 21 のいずれかに記載の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形。

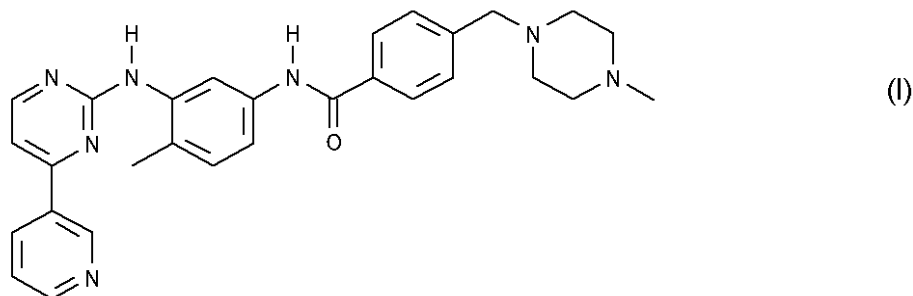
【請求項 23】

本質的に純粋な形で存在する、請求項 19 から 22 のいずれかに記載の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形。

【請求項 24】

図 3 に示すタイプの X 線回折ダイアグラムを示し、ここで、各ピークの相対強度が図 3 に示すダイアグラムの相対的ピーク強度から 10 % を超えて逸脱しない、式 I

【化 7】



の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形。

## 【請求項 25】

請求項 19 から 23 のいずれかに記載の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形を、所望により薬学的に許容される担体と共に含む、医薬組成物。

## 【請求項 26】

非晶形、結晶形、結晶形および H 1 結晶形から選択される少なくとも 1 種の異なる形の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩をさらに含む、請求項 25 に記載の医薬組成物。

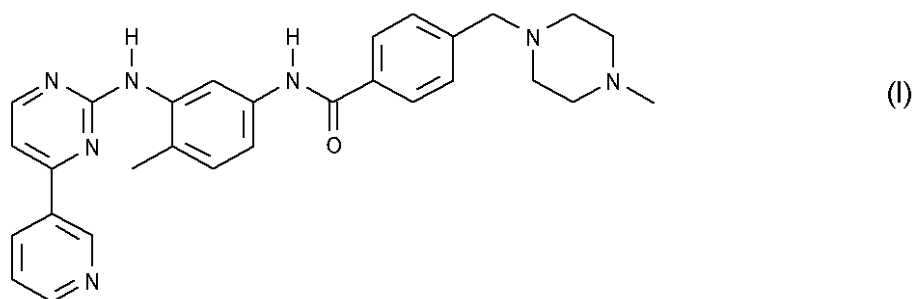
## 【請求項 27】

50 mg から 800 mg の請求項 19 から 23 のいずれかに記載の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形を含む、請求項 25 または 26 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 28】

式 I

## 【化 8】



の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形 I。

## 【請求項 29】

9°より低いおよび 29°より高い回折角 2 シータが存在しないのと同時に、12.9°の回折角 2 シータで X 線回折のピークを示す、請求項 28 に記載の結晶形。

## 【請求項 30】

12.9°、17.1°、20.9°、23.9°および 24.3°の回折角 2 シータでの X 線回折ピークにより特徴付けられる、請求項 28 に記載の結晶形。

## 【請求項 31】

X 線回折ダイアグラムにおいて：12.9°、14.1°、17.1°、18.0°、18.7°、19.1°、19.8°、20.9°、23.9°、24.3°および 25.2°の回折角 2 シータで線を示す、請求項 28 に記載の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形。

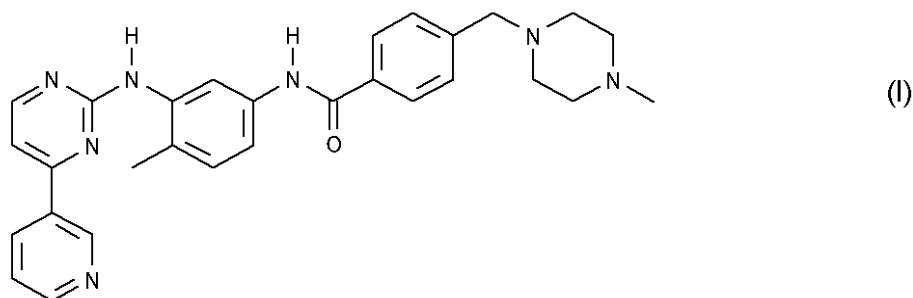
## 【請求項 32】

本質的に純粋な形で存在する、請求項 28 から 31 のいずれかに記載の結晶形。

## 【請求項 33】

図 4 に示すタイプの X 線回折ダイアグラムを示し、ここで、各ピークの相対強度が図 4 に示すダイアグラムの相対的ピーク強度から 10% を超えて逸脱しない、式 I

## 【化 9】



の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形。

## 【請求項 3 4】

請求項 2 8 から 3 3 のいずれかに記載の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形を、所望により薬学的に許容される担体と共に含む、医薬組成物。

## 【請求項 3 5】

非晶形、結晶形、結晶形および H 1 結晶形から選択される少なくとも 1 種の異なる形の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩をさらに含む、請求項 3 4 に記載の医薬組成物。

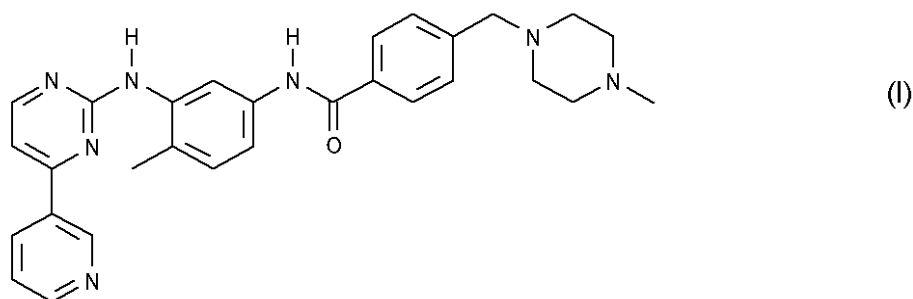
## 【請求項 3 6】

5 0 mg から 8 0 0 mg の請求項 2 8 から 3 3 のいずれかに記載の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形を含む、請求項 3 4 または 3 5 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 3 7】

式 I

## 【化 1 0】



の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形 K。

## 【請求項 3 8】

3 7 . 9 ° の回折角 2 シータで X 線回折のピークを示す、請求項 3 7 に記載の結晶形。

## 【請求項 3 9】

1 . 0 ° の回折角 2 シータでの X 線回折ピークにより特徴付けられる、請求項 3 7 に記載の結晶形。

## 【請求項 4 0】

X 線回折ダイアグラムにおいて：1 2 . 1 °、1 4 . 1 °、1 8 . 2 °、1 8 . 4 °、2 1 . 0 °、2 3 . 4 ° および 2 8 . 4 ° の回折角 2 シータで線を示す、請求項 3 7 または 3 8 に記載の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形。

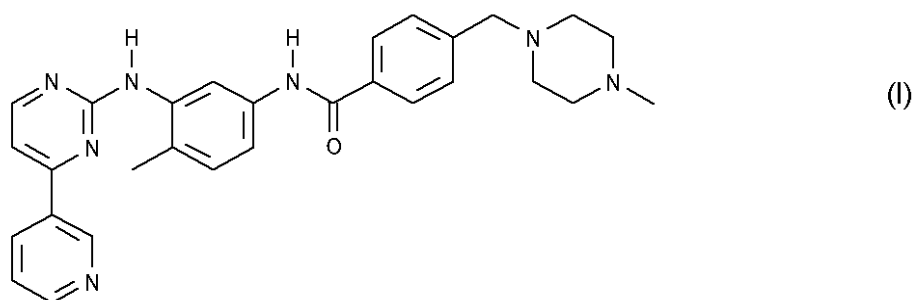
## 【請求項 4 1】

本質的に純粋な形で存在する、請求項 3 7 から 4 0 のいずれかに記載の結晶形。

## 【請求項 4 2】

図 5 に示すタイプの X 線回折ダイアグラムを示し、ここで、各ピークの相対強度が図 5 に示すダイアグラムの相対的ピーク強度から 1 0 % を超えて逸脱しない、式 I

## 【化 1 1】



の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形。

## 【請求項 4 3】

請求項 3 7 から 4 2 のいずれかに記載の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶

形を、所望により薬学的に許容される担体と共に含む、医薬組成物。

【請求項 4 4】

非晶形、結晶形、結晶形および H 1 結晶形から選択される少なくとも 1 種の異なる形の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩をさらに含む、請求項 4 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 5】

5 0 mg から 8 0 0 mg の請求項 3 7 から 4 2 のいずれかに記載の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形を含む、請求項 4 3 または 4 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 6】

5 0 mg から 2 0 0 mg の請求項 3 7 から 4 2 のいずれかに記載の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形を含む粉末混合を含むカプセル剤である、請求項 4 3 から 4 5 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 4 7】

1 0 0 mg、4 0 0 mg または 8 0 0 mg 医薬物質を不活性賦形剤と共に含む錠剤である、請求項 5 から 7、1 6 から 1 8、2 5 から 2 7、3 4 から 3 6 または 4 3 から 4 5 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 4 8】

不活性賦形剤がコロイド状無水シリカ、ポリビニルピロリドン、ステアリン酸マグネシウムおよび微晶性セルロースから選択される、請求項 4 7 に記載の錠剤。

【請求項 4 9】

転移、手術不能な G I S T、進行性慢性骨髄性白血病、新規に診断された慢性骨髄性白血病、小児科フィラデルフィア染色体陽性慢性骨髄性白血病、フィラデルフィア染色体陽性急性リンパ性白血病 (A L L)、多形神経膠芽腫、隆起性皮膚線維肉腫 (D F S P)、好酸球増加症候群 (H E S)、および慢性骨髄単球性白血病 (C M M L) から成る群から選択される疾患の処置用薬剤の製造のための、請求項 1 または 2、1 0 から 1 3、1 9 から 2 2、2 8 から 3 1 または 3 7 から 4 0 のいずれかに記載の式 I の化合物のメタンスルホン酸付加塩の結晶形の使用。