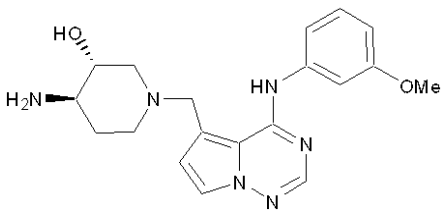
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成22年4月2日(2010.4.2)

【公表番号】特表2009-527491(P2009-527491A)
【公表日】平成21年7月30日(2009.7.30)
【年通号数】公開・登録公報2009-030
【出願番号】特願2008-555505(P2008-555505)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 487/04　　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　31/517　　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　35/00　　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 487/04　　１４０
Ｃ０７Ｄ 487/04　　ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ　31/517
Ａ６１Ｐ　35/00

【手続補正書】
【提出日】平成22年2月10日(2010.2.10)
【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】
無溶媒Ｎ－２型を含む、化合物Ｉ：
【化１】



(I)
の結晶形。
【請求項２】
本質的に前記Ｎ－２型からなる、請求項１の結晶形。
【請求項３】
前記Ｎ－２型が実質的に純粋な形態である、請求項１の結晶形。
【請求項４】
前記Ｎ－２型が、実質的に図１に示されるシミュレーションされた粉末Ｘ線回折パターンの特徴を有する、請求項１の結晶形。
【請求項５】
前記Ｎ－２型が、実質的に図１に示される実測された粉末Ｘ線回折パターンの特徴を有する、請求項１の結晶形。
【請求項６】
結晶形の測定が約２５℃の温度で行われ、前記Ｎ－２型が、１０．５±０．１、１３．０±０．１、１３．６±０．１、１５．８±０．１、１６．２±０．１、１６．９±０．

１、２０．６±０．１、２１．２±０．１、２１．５±０．１、２４．４±０．１、および２８．６±０．１から選択される４つ以上の２θ値（ＣｕＫα λ＝１．５４１８Å）を含む粉末Ｘ線回折パターンの特徴を有する、請求項１の結晶形。

【請求項７】

結晶形の測定が約２５℃の温度で行われ、前記Ｎ－２型が、１０．５±０．１、１３．０±０．１、１３．６±０．１、１５．８±０．１、１６．２±０．１、１６．９±０．１、２０．６±０．１、２１．２±０．１、２１．５±０．１、２４．４±０．１、および２８．６±０．１から選択される５つ以上の２θ値（ＣｕＫα λ＝１．５４１８Å）を含む粉末Ｘ線回折パターンの特徴を有する、請求項１の結晶形。

【請求項８】

結晶形の測定が約２５℃の温度で行われ、前記Ｎ－２型が、下表：

格子定数	ａ＝６．７２Å ｂ＝１０．９３Å ｃ＝２６．１２Å α＝９０．０° β＝１０８．５° γ＝９０．０°
空間群	$P2_12_12_1$
化合物Ｉの分子／非対称単位	１

に実質的に等しい単位格子パラメータの特徴を有する、請求項１の結晶形。

【請求項９】

ａ）　結晶形の測定が約２５℃の温度で行われる、下表：

格子定数	ａ＝６．７２Å ｂ＝１０．９３Å ｃ＝２６．１２Å α＝９０．０° β＝１０８．５° γ＝９０．０°
空間群	$P2_12_12_1$
化合物Ｉの分子／非対称単位	１

；

ｂ）　前記結晶形の測定が約２５℃の温度で行われる、１０．５±０．１、１３．０±０．１、１３．６±０．１、１５．８±０．１、１６．２±０．１、１６．９±０．１、２０．６±０．１、２１．２±０．１、２１．５±０．１、２４．４±０．１、および２８．６±０．１から選択される４つ以上の２θ値（ＣｕＫα λ＝１．５４１８Å）を含む粉末Ｘ線回折パターン；および／または

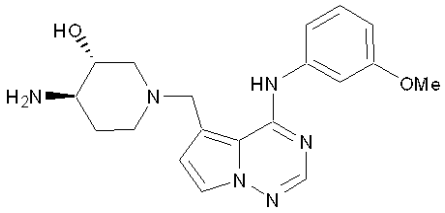
ｃ）　約１５０℃の温度に加熱すると、ごくわずかな重量減少を有する熱重量分析サーモグラム

のａ）～ｃ）のいずれか一つ以上の特徴を前記Ｎ－２型が有する、請求項１の結晶形。

【請求項１０】

Ｎ－１型を含む、化合物Ｉ：

【化２】



(I)

の結晶形。

【請求項１１】

結晶形の測定が約２５℃の温度で行われ、前記Ｎ－１型が、７．７±０．１、１３．４±０．１、１４．６±０．１、１９．５±０．１、１９．８±０．１、２０．３±０．１、２０．９±０．１、２２．７±０．１、および２６．９±０．１から選択される４つ以上の２θ値（ＣｕＫα　λ＝１．５４１８Å）を含む粉末Ｘ線回折パターンの特徴を有する、請求項１０の結晶形。

【請求項１２】

結晶形の測定が約２５℃の温度で行われ、前記Ｎ－１型が、下表：

格子定数	ａ＝６．７２Å ｂ＝１４．０６Å ｃ＝１９．９３Å α＝９０．０° β＝９０．０° γ＝９０．０°
空間群	$P2_12_12_1$
化合物Ｉの分子／非対称単位	１

に実質的に等しい単位格子パラメータの特徴を有する、請求項１０の結晶形。

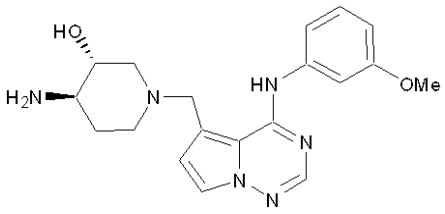
【請求項１３】

前記Ｎ－１型が、約１３４℃～約１４０℃の範囲にある融点の特徴を有する、請求項１０の結晶形。

【請求項１４】

Ｎ－１型のＨＣｌ塩を含む、化合物Ｉ：

【化３】



(I)

の結晶形。

【請求項１５】

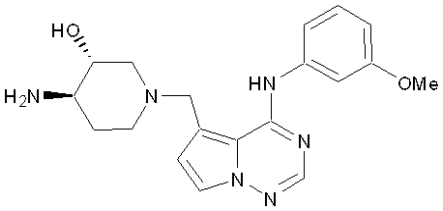
結晶形の測定が約２５℃の温度で行われ、前記Ｎ－１型のＨＣｌ塩が、５．２±０．１、１１．２±０．１、１６．３±０．１、１６．７±０．１、１９．１±０．１、２２．１±０．１、２３．５±０．１、および２７．５±０．１から選択される４つ以上の２θ値（ＣｕＫα　λ＝１．５４１８Å）を含む粉末Ｘ線回折パターンの特徴を有する、請求項１４の結晶形。

【請求項１６】

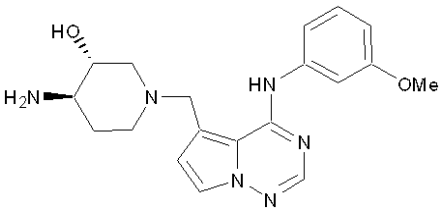
結晶形の測定が約２５℃の温度で行われ、前記Ｎ－１型のＨＣｌ塩が、下表：

格子定数	ａ＝３３．６７Å ｂ＝７．１８Å ｃ＝２３．５１Å α＝９０．０° β＝１３２．４° γ＝９０．０°
空間群	Ｃ２
化合物Ｉの分子／非対称単位	２

に実質的に等しい単位格子パラメータの特徴を有する、請求項１４の結晶形。
【請求項１７】
前記Ｎ－１型のＨＣｌ塩が、約２３０℃～約２４５℃の範囲にある融点の特徴を有する、請求項１４の結晶形。
【請求項１８】
請求項１の結晶形、および医薬的に許容される担体もしくは希釈剤を含む医薬組成物。
【請求項１９】
前記結晶形が実質的に純粋な形態である、請求項１８の医薬組成物。
【請求項２０】
化合物Ｉ：
【化４】

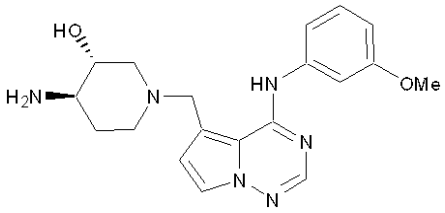


(I)
が請求項１の結晶形で提供され、前記化合物Ｉを含む、増殖性疾患の治療剤。
【請求項２１】
前記増殖性疾患が非小細胞肺癌または膵癌である、請求項２０の治療剤。
【請求項２２】
化合物Ｉ：
【化５】



(I)
が請求項１０の結晶形で提供され、前記化合物Ｉを含む、増殖性疾患の治療剤。
【請求項２３】
化合物Ｉ：

【化６】



(I)

が請求項１４の結晶形で提供され、前記化合物Ｉを含む、増殖性疾患の治療剤。