

【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】令和 3 年 2 月 12 日 (2021.2.12)

【公表番号】特表 2020-514291 (P2020-514291A)

【公表日】令和 2 年 5 月 21 日 (2020.5.21)

【年通号数】公開・登録公報 2020-020

【出願番号】特願 2019-536266 (P2019-536266)

【国際特許分類】

C 07 C 211/53 (2006.01)

A 61 K 31/137 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 15/00 (2006.01)

A 61 K 9/20 (2006.01)

【F I】

C 07 C 211/53 C S P

A 61 K 31/137

A 61 P 35/00

A 61 P 15/00

A 61 K 9/20

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 12 月 29 日 (2020.12.29)

【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】

相対湿度約 0% で、2 に関して  $7.1^{\circ}2 \pm 0.2^{\circ}2$  でピークを含む X 線粉末回析パターンを有する、RAD1901-2HCl の固形形態。

【請求項 2】

相対湿度約 0% で、2 に関して  $7.1^{\circ}2 \pm 0.2^{\circ}2$  および  $14.3^{\circ}2 \pm 0.2^{\circ}2$  でピークを含む X 線粉末回析パターンを有する、請求項 1 記載の固形形態。

【請求項 3】

相対湿度約 0% で、2 に関して  $14.3^{\circ}2 \pm 0.2^{\circ}2$  および  $18.3^{\circ}2 \pm 0.2^{\circ}2$  からなる群より選択される少なくとも 1 個のピークをさらに含む X 線粉末回析パターンを有する、請求項 1 記載の固形形態。

【請求項 4】

相対湿度約 0% で、2 に関して  $14.3^{\circ}2 \pm 0.2^{\circ}2$ 、 $18.3^{\circ}2 \pm 0.2^{\circ}2$ 、 $13.8^{\circ}2 \pm 0.2^{\circ}2$  および  $12.0^{\circ}2 \pm 0.2^{\circ}2$  からなる群より選択される少なくとも 2 個のピークをさらに含む X 線粉末回析パターンを有する、請求項 1 記載の固形形態。

【請求項 5】

相対湿度約 0% で、2 に関して  $14.3^{\circ}2 \pm 0.2^{\circ}2$ 、 $18.3^{\circ}2 \pm 0.2^{\circ}2$ 、 $13.8^{\circ}2 \pm 0.2^{\circ}2$ 、 $12.0^{\circ}2 \pm 0.2^{\circ}2$ 、 $25.1^{\circ}2 \pm 0.2^{\circ}2$  および  $18.9^{\circ}2 \pm 0.2^{\circ}2$  からなる群より選択される少なくとも 3 個のピークをさらに含む X 線粉末回析パターンを有する、請求項 1 記載の固形形態。

【請求項 6】

相対湿度約 0% で、2 に関して  $14.3^{\circ}2 \pm 0.2^{\circ}2$ 、 $18.3^{\circ}2 \pm 0.2^{\circ}2$ 、 $13.8^{\circ}2$

$\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $12.0^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $25.1^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $18.9^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $27.2^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$  および  $11.0^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$  からなる群より選択される少なくとも4個のピークをさらに含むX線粉末回析パターンを有する、請求項1記載の固形形態。

【請求項7】

相対湿度約0%で、2 に関して  $14.3^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $18.3^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $13.8^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $12.0^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $25.1^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $18.9^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $27.2^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $11.0^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$  および  $16.2^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$  からなる群より選択される少なくとも4個のピークをさらに含むX線粉末回析パターンを有する、請求項1記載の固形形態。

【請求項8】

相対湿度約0%で、2 に関して  $14.3^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $18.3^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $13.8^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $12.0^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $25.1^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $18.9^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $27.2^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $11.0^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$  および  $16.2^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$  からなる群より選択される少なくとも6個のピークをさらに含むX線粉末回析パターンを有する、請求項1記載の固形形態。

【請求項9】

相対湿度約0%で、2 に関して  $14.3^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $18.3^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $13.8^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $12.0^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $25.1^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $18.9^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $27.2^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $11.0^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$  および  $16.2^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$  からなる群より選択される少なくとも7個のピークをさらに含むX線粉末回析パターンを有する、請求項1記載の固形形態。

【請求項10】

相対湿度約0%で、2 に関して  $14.3^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $18.3^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $13.8^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $12.0^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $25.1^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $18.9^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $27.2^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $11.0^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$  および  $16.2^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$  からなる群より選択される少なくとも8個のピークをさらに含むX線粉末回析パターンを有する、請求項1記載の固形形態。

【請求項11】

相対湿度約0%で、2 に関して  $7.1^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $14.3^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $18.3^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $13.8^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $12.0^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $25.1^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $18.9^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $27.2^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$ 、 $11.0^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$  および  $16.2^{\circ}2$   $\pm 0.2^{\circ}2$  のピークを含むX線粉末回析パターンを有する、請求項1記載の固形形態。

【請求項12】

相対湿度約0%で実質的に図3Gに示されるX線粉末回析パターンを有する、請求項1記載の固形形態。

【請求項13】

218.2 で溶融開始および232.1 で吸熱ピークを含む示差走査熱量測定(DSC)サーモグラムを有する、RAD1901-2HClの固形形態。

【請求項14】

実質的に図7の下図に示される示差走査熱量測定(DSC)サーモグラムを有する、請求項13記載の固形形態。

【請求項15】

実質的に図7の上グラフに示される熱重量分析(TGA)を有する、RAD1901-2HClの固形形態。

【請求項16】

請求項1～15いずれか一項記載の固形形態および1つ以上の薬学的に許容され得る賦形剤を含む、医薬組成物。

【請求項17】

RAD1901-2HClおよび溶媒を含む溶液から沈殿させる工程、または溶媒中でRAD1901-2HClをスラリー化する工程を含む、請求項1～15いずれか一項記載の固形形態を調製するた

めのプロセスであって、該溶媒が、メタノールを除く有機溶媒を含み、水分含量が5%v/v以下である、プロセス。

【請求項 18】

該有機溶媒が、n-ヘプタン、酢酸プロピル、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、メチルイソブチルケトン(MIBK)、メチルエチルケトン(MEK)、1-プロパノール、エタノール、t-ブチルメチルエーテル(TBME)、1,4-ジオキサン、トルエン、1,2-ジメトキシエタン、テトラヒドロフラン、ジクロロメタン、アセトニトリル、ニトロメタンおよびそれらの混合物からなる群より選択される、請求項 17 記載のプロセス。

【請求項 19】

乳癌を治療するための請求項 16 記載の医薬組成物。

【請求項 20】

該乳癌がER+である、請求項 19 記載の医薬組成物。

【請求項 21】

卵巣癌を治療するための請求項 16 記載の医薬組成物。