

【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29年4月6日(2017.4.6)

【公開番号】特開2017-39702(P2017-39702A)

【公開日】平成29年2月23日(2017.2.23)

【年通号数】公開・登録公報2017-008

【出願番号】特願2016-146928(P2016-146928)

【国際特許分類】

C 07 D 498/18 (2006.01)

A 61 K 31/439 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 498/18 C S P

A 61 K 31/439

A 61 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成29年2月28日(2017.2.28)

【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】

9.6、10.1、14.3、16.2、および17.3°2±0.2°2からなる群から選択される2値の箇所に2つ以上のピークを含む粉末X線回折(PXRD)パターンを有する、(10R)-7-アミノ-12-フルオロ-2,10,16-トリメチル-15-オキソ-10,15,16,17-テトラヒドロ-2H-8,4-(メテノ)ピラゾロ[4,3-h][2,5,11]ベンゾオキサジアザシクロテトラデシン-3-カルボニトリル(ロルラチニブ)遊離塩基の結晶形態。

【請求項2】

9.6、10.1、および16.2°2±0.2°2の2値の箇所にピークを含むPXRDパターンを有する、請求項1に記載の結晶形態。

【請求項3】

17.3°2±0.2°2の2値の箇所にピークをさらに含むPXRDパターンを有する、請求項2に記載の結晶形態。

【請求項4】

14.3°2±0.2°2の2値の箇所にピークをさらに含むPXRDパターンを有する、請求項2または3に記載の結晶形態。

【請求項5】

2229および2240cm⁻¹±2cm⁻¹の波数(cm⁻¹)値を含むラマンスペクトルを有する、請求項1から4のいずれか一項に記載の結晶形態。

【請求項6】

39.1および142.1ppm±0.2ppmの共鳴(ppm)値を含む¹³C固体NMRスペクトルを有する、請求項1から5のいずれか一項に記載の結晶形態。

【請求項7】

-108.2および-115.2ppm±0.2ppmの共鳴(ppm)値を含む¹⁹F固体NMRスペクトルを有する、請求項1から6のいずれか一項に記載の結晶形態。

【請求項 8】

774、1553、1619、2229、および2240 $\text{cm}^{-1} \pm 2 \text{ cm}^{-1}$ からなる群から選択される2つ以上の波数(cm^{-1})値を含むラマンスペクトルを有する、ロルラチニブ遊離塩基の結晶形態。

【請求項 9】

2229および2240 $\text{cm}^{-1} \pm 2 \text{ cm}^{-1}$ の波数(cm^{-1})値を含むラマンスペクトルを有する、請求項8に記載の結晶形態。

【請求項 10】

1619 $\text{cm}^{-1} \pm 2 \text{ cm}^{-1}$ の波数(cm^{-1})値をさらに含むラマンスペクトルを有する、請求項9に記載の結晶形態。

【請求項 11】

1553 $\text{cm}^{-1} \pm 2 \text{ cm}^{-1}$ の波数(cm^{-1})値をさらに含むラマンスペクトルを有する、請求項9または10に記載の結晶形態。

【請求項 12】

774 $\text{cm}^{-1} \pm 2 \text{ cm}^{-1}$ の波数(cm^{-1})値をさらに含むラマンスペクトルを有する、請求項9、10、または11に記載の結晶形態。

【請求項 13】

39.1および142.1 ppm $\pm 0.2 \text{ ppm}$ の共鳴(ppm)値を含む ^{13}C 固体NMRスペクトルを有する、請求項8から12のいずれか一項に記載の結晶形態。

【請求項 14】

-108.2および-115.2 ppm $\pm 0.2 \text{ ppm}$ の共鳴(ppm)値を含む ^{19}F 固体NMRスペクトルを有する、請求項8から13のいずれか一項に記載の結晶形態。

【請求項 15】

25.8、39.1、112.3、117.7、および142.1 ppm $\pm 0.2 \text{ ppm}$ からなる群から選択される2つ以上の共鳴(ppm)値を含む ^{13}C 固体NMRスペクトルを有する、ロルラチニブ遊離塩基の結晶形態。

【請求項 16】

39.1および142.1 ppm $\pm 0.2 \text{ ppm}$ の共鳴(ppm)値を含む ^{13}C 固体NMRスペクトルを有する、請求項15に記載の結晶形態。

【請求項 17】

112.3 ppm $\pm 0.2 \text{ ppm}$ の共鳴(ppm)値をさらに含む ^{13}C 固体NMRスペクトルを有する、請求項16に記載の結晶形態。

【請求項 18】

25.8 ppm $\pm 0.2 \text{ ppm}$ の共鳴(ppm)値をさらに含む ^{13}C 固体NMRスペクトルを有する、請求項16または17に記載の結晶形態。

【請求項 19】

117.7 ppm $\pm 0.2 \text{ ppm}$ の共鳴(ppm)値をさらに含む ^{13}C 固体NMRスペクトルを有する、請求項16、17、または18に記載の結晶形態。

【請求項 20】

-108.2および-115.2 ppm $\pm 0.2 \text{ ppm}$ からなる群から選択される共鳴(ppm)値を含む ^{19}F 固体NMRスペクトルを有する、ロルラチニブ遊離塩基の結晶形態。

【請求項 21】

-115.2 ppm $\pm 0.2 \text{ ppm}$ の共鳴(ppm)値を含む ^{19}F 固体NMRスペクトルを有する、請求項20に記載の結晶形態。

【請求項 22】

-108.2 ppm $\pm 0.2 \text{ ppm}$ の共鳴(ppm)値を含む ^{19}F 固体NMRスペクトルを有する、請求項20または21に記載の結晶形態。

【請求項 23】

請求項1から22のいずれか一項に記載のロルラチニブ遊離塩基の結晶形態と、薬学的

に許容できる担体または添加剤とを含む医薬組成物。

【請求項 2 4】

異常な細胞成長を治療するための、請求項 1 から 2 2 のいずれか一項に記載のロルラチニブ遊離塩基の結晶形態を含む医薬組成物。

【請求項 2 5】

異常な細胞成長ががんである、請求項 2 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 6】

がんが、未分化リンパ腫キナーゼ (A L K) または c - r o s 癌遺伝子 1 受容体チロシンキナーゼ (R O S 1) によって媒介される、請求項 2 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 7】

がんが非小細胞肺がん (N S C L C) である、請求項 2 5 または 2 6 に記載の医薬組成物。