

【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 0 7 D 498/18 (2006.01)

A 6 1 K 31/439 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 498/18 C S P

A 6 1 K 31/439

A 6 1 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 値の箇所には 2 つ以上のピークを含む粉末 X 線回折 (P X R D) 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 - 2 H - 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 値の箇所にはピークを含む P X R D 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 値の箇所にはピークをさらに含む P X R D 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 値の箇所にはピークをさらに含む P X R D 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 2240 cm⁻¹ ± 2 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 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 142.1 ppm ± 0.2 ppm 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 - 115.2 ppm ± 0.2 ppm 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 $142.1\text{ ppm} \pm 0.2\text{ ppm}$ 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 $-115.2\text{ ppm} \pm 0.2\text{ ppm}$ 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 $142.1\text{ ppm} \pm 0.2\text{ ppm}$ 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 $142.1\text{ ppm} \pm 0.2\text{ ppm}$ 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】

$112.3\text{ ppm} \pm 0.2\text{ ppm}$ 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】

$25.8\text{ ppm} \pm 0.2\text{ ppm}$ 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】

$117.7\text{ ppm} \pm 0.2\text{ ppm}$ 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 $-115.2\text{ ppm} \pm 0.2\text{ ppm}$ 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】

$-115.2\text{ ppm} \pm 0.2\text{ ppm}$ 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 $\text{ppm} \pm 0.2\text{ ppm}$ 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】

がんが非小細胞肺癌 (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。