

【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27年4月9日(2015.4.9)

【公表番号】特表2014-505740(P2014-505740A)

【公表日】平成26年3月6日(2014.3.6)

【年通号数】公開・登録公報2014-012

【出願番号】特願2013-554678(P2013-554678)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z

C 0 7 D 471/04 C S P

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 31/437

A 6 1 K 9/14

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成27年2月20日(2015.2.20)

【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

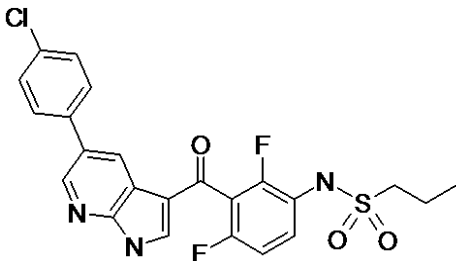
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式1、

【化1】



(1)

の化合物の固体形態であって、

- a) X V I I 型、X V I I I 型、X I X 型、X X 型、X X I 型、X X I I 型、X X I I I 型、X X I V 型、X X V 型、X X V I 型またはその組み合わせから選択される化合物1の実質的に非晶質の形態であって、化合物1が分子的に分散している形態；
- b) I I I 型、I V 型、V 型、V I 型、V I I 型、I X 型、X 型、X I 型、X I I 型、X I I I 型、X I V 型またはX V 型の溶媒和物；

- c) V I I I 型または X V I 型の多形；ならびに
d) 化合物 1 の硫酸塩、臭化水素酸塩または塩酸塩
からなる群から選択される固体形態。

【請求項 2】

X V I I 型、X V I I I 型、X I X 型、X X 型、X X I 型、X X I I 型、X X I I I 型、X X I V 型、X X V 型、X X V I 型またはその組み合わせから選択される化合物 1 の実質的に非晶質の形態であって、化合物 1 がポリマーマトリックス内に分子的に分散している形態から選択される、請求項 1 に記載の固体形態。

【請求項 3】

実質的に図 20 に示すような X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 2 に記載の固体形態 (X V I I)。

【請求項 4】

実質的に図 21 に示すような X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 2 に記載の固体形態 (X V I I I)。

【請求項 5】

実質的に図 22 に示すような X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 2 に記載の固体形態 (X I X)。

【請求項 6】

実質的に図 23 に示すような X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 2 に記載の固体形態 (X X)。

【請求項 7】

実質的に図 24 に示すような X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 2 に記載の固体形態 (X X I)。

【請求項 8】

実質的に図 25 に示すような X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 2 に記載の固体形態 (X X I I)。

【請求項 9】

実質的に図 26 に示すような X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 2 に記載の固体形態 (X X I I I)。

【請求項 10】

実質的に図 27 に示すような X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 2 に記載の固体形態 (X X I V)。

【請求項 11】

実質的に図 28 に示すような X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 2 に記載の固体形態 (X X V)。

【請求項 12】

実質的に図 29 に示すような X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 2 に記載の固体形態 (X X V I)。

【請求項 13】

固体形態が噴霧分散工程によって製造される、請求項 2 ~ 12 のいずれかに記載の固体形態。

【請求項 14】

ポリマーがヒドロキシプロピルメチルセルロースアセテートスクシネート (HPMCAS)、ヒドロキシプロピルメチルセルロース、メタクリル酸コポリマー、ポリビニルピロリドン (ポビドン)、4-ビニルピロリドン-ビニルアセテートコポリマー (コポビドン) またはメタクリル酸とエチルアクリレートのコポリマー (EUDRAGIT (登録商標) L100-55) から選択される、請求項 2 ~ 13 のいずれかに記載の固体形態。

【請求項 15】

請求項 2 ~ 14 のいずれかに記載の少なくとも 1 つの固体形態、またはその医薬的に許容される塩、および医薬的に許容される担体、添加剤または賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 16】

疾患または状態を治療するための、請求項 15 に記載の組成物。

【請求項 17】

疾患または状態がメラノーマ、甲状腺癌または結腸癌である、請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 18】

III 型、IV 型、V 型、VI 型、VII 型、IX 型、X 型、XI 型、XII 型、XIII 型、XIV 型または XV 型の溶媒和物から選択される、請求項 1 に記載の固体形態。

【請求項 19】

VII 型または XVI 型の多形から選択される、請求項 1 に記載の固体形態。

【請求項 20】

化合物 1 の硫酸塩、臭化水素酸塩または塩酸塩から選択される、請求項 1 に記載の固体形態。

【請求項 21】

およそ 9.5 、 10.0 、 13.0 、 16.7 、 18.7 、 20.1 、 21.0 および $25.6^\circ 2$ ($\pm 0.2^\circ 2$) で特徴的なピークを含む X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 18 に記載の固体形態 (III 型)。

【請求項 22】

およそ 5.5 、 7.4 、 11.0 、 13.4 、 14.8 、 16.0 、 16.7 、 17.1 、 17.9 、 19.1 、 19.5 、 20.1 、 20.5 、 20.9 、 21.2 、 22.2 、 23.0 、 23.6 、 24.2 、 24.5 および $25.1^\circ 2$ ($\pm 0.2^\circ 2$) で特徴的なピークを含む X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 18 に記載の固体形態 (IV 型)。

【請求項 23】

およそ 12.7 、 13.1 、 14.3 、 16.3 、 19.0 、 20.1 、 22.4 、 25.1 、 27.1 および $28.9^\circ 2$ ($\pm 0.2^\circ 2$) で特徴的なピークを含む X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 18 に記載の固体形態 (V 型)。

【請求項 24】

およそ 7.8 、 10.3 、 11.4 、 11.8 、 15.1 、 15.6 、 16.1 、 16.6 、 18.6 、 18.9 、 19.2 、 20.4 、 21.0 、 21.6 、 22.8 、 24.6 、 25.1 、 25.8 、 26.1 、 27.4 および $28.8^\circ 2$ ($\pm 0.2^\circ 2$) で特徴的なピークを含む X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 18 に記載の固体形態 (VI 型)。

【請求項 25】

およそ 7.6 、 9.4 、 9.9 、 13.1 、 15.9 、 16.2 、 17.0 、 18.1 、 18.8 、 19.9 、 20.5 、 20.7 、 21.4 、 21.8 、 24.3 、 24.9 および $25.3^\circ 2$ ($\pm 0.2^\circ 2$) で特徴的なピークを含む X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 18 に記載の固体形態 (VII 型)。

【請求項 26】

およそ 9.5 、 9.9 、 13.0 、 15.9 、 16.4 、 17.0 、 17.9 、 18.7 、 19.9 、 20.7 、 21.7 、 24.8 および $25.1^\circ 2$ ($\pm 0.2^\circ 2$) で特徴的なピークを含む X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 18 に記載の固体形態 (IX 型)。

【請求項 27】

およそ 7.4 、 9.2 、 10.8 、 13.6 、 14.9 、 19.0 、 20.2 、 21.4 、 22.4 、 23.7 、 25.5 、 27.0 および $29.8^\circ 2$ ($\pm 0.2^\circ 2$) で特徴的なピークを含む X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 18 に記載の固体形態 (X 型)。

【請求項 28】

およそ 8.0 、 12.1 、 12.6 、 13.4 、 13.9 、 14.8 、 16.2 、 17

． 6、 18． 5、 19． 2、 20． 1、 21． 0、 21． 4、 21． 7、 23． 5、 25． 3、 25． 5、 26． 6、 27． 0 および 30． 8 ° 2 (± 0． 2 ° 2) で特徴的なピークを含む X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 18 に記載の固体形態 (X I 型)。

【請求項 29】

およそ 7． 5、 9． 9、 12． 1、 13． 6、 16． 2、 16． 7、 17． 1、 17． 5、 18． 3、 18． 5、 20． 1、 21． 7、 22． 4、 23． 4、 24． 3、 25． 6、 26． 9 および 31． 6 ° 2 (± 0． 2 ° 2) で特徴的なピークを含む X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 18 に記載の固体形態 (X I I 型)。

【請求項 30】

およそ 5． 1、 5． 8、 6． 9、 15． 3、 16． 2、 17． 4、 18． 4、 18． 9、 19． 5、 20． 4、 21． 1、 21． 5、 22． 2、 22． 6、 25． 2 および 25． 7 ° 2 (± 0． 2 ° 2) で特徴的なピークを含む X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 18 に記載の固体形態 (X I I I 型)。

【請求項 31】

およそ 5． 2、 10． 2、 12． 9、 13． 9、 17． 1、 17． 6、 18． 7、 19． 8、 20． 1、 20． 5、 21． 0、 21． 7、 22． 8、 24． 1、 25． 1、 25． 5、 27． 1 および 27． 4 ° 2 (± 0． 2 ° 2) で特徴的なピークを含む X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 18 に記載の固体形態 (X I V 型)。

【請求項 32】

およそ 12． 6、 13． 8、 14． 6、 16． 2、 16． 6、 17． 8、 18． 3、 20． 4、 20． 7、 21． 4、 22． 4、 23． 2、 24． 2、 24． 5、 25． 5、 26． 9、 27． 8 および 28． 7 ° 2 (± 0． 2 ° 2) で特徴的なピークを含む X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 18 に記載の固体形態 (X V 型)。

【請求項 33】

その X 線粉末回折曲線において、 7． 0、 8． 4、 8． 9、 13． 0、 13． 8、 17． 7、 18． 8、 20． 7、 25． 8 および 29． 7 ° 2 (± 0． 2 ° 2) の位置でシグナルを含むことを特徴とする、請求項 18 に記載の「パターン 6」と命名された固体形態。

【請求項 34】

その X 線粉末回折曲線において、 5． 0、 11． 3、 11． 6、 12． 0、 13． 8、 16． 2、 16． 7、 19． 0、 20． 1、 20． 8、 22． 5 および 27． 1 ° 2 (± 0． 2 ° 2) の位置でシグナルを含むことを特徴とする、請求項 19 に記載の固体形態 (V I I I 型)。

【請求項 35】

図 15 に示されているそのラマンスペクトルによって特徴付けられる、請求項 19 に記載の固体形態 (X V I 型)。

【請求項 36】

およそ 4． 7、 6． 7、 10． 6、 13． 3、 14． 5、 15． 7、 16． 4、 18． 3、 18． 6、 18． 9、 19． 5、 20． 1、 20． 9、 21． 2、 23． 2、 23． 7、 24． 0、 26． 9 および 30． 0 ° 2 (± 0． 2 ° 2) で特徴的なピークを含む X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 20 に記載の硫酸塩。

【請求項 37】

およそ 5． 7、 6． 8、 11． 4、 13． 6、 18． 1、 19． 8、 20． 2、 21． 4、 21． 8、 24． 6、 26． 1、 27． 3 および 29． 2 ° 2 (± 0． 2 ° 2) で特徴的なピークを含む X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 20 に記載の臭化水素酸塩。

【請求項 38】

およそ 6． 6、 7． 8、 11． 2、 12． 6、 14． 1、 14． 7、 16． 3、 17． 8、 19． 3、 19． 6、 20． 7、 21． 5、 22． 7、 24． 1、 25． 4 および 2

5.8°2 (±0.2°2) で特徴的なピークを含む X 線粉末回折パターンによって特徴付けられる、請求項 20 に記載の塩酸塩。

【請求項 39】

医薬的に許容される添加剤、担体または賦形剤と共に、請求項 18 ~ 38 のいずれか 1 項に記載の固体形態の少なくとも 1 つを含む、医薬組成物。