

【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4年6月8日(2022.6.8)

【公開番号】特開2021-185200(P2021-185200A)

【公開日】令和3年12月9日(2021.12.9)

【年通号数】公開・登録公報2021-059

【出願番号】特願2021-146090(P2021-146090)

【国際特許分類】

C 0 7 D 4 0 1 / 1 2 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 7 0 9 (2 0 0 6 . 0 1)

【 F I 】

C 0 7 D 4 0 1 / 1 2 C S P

A 6 1 P 3 5 / 0 0

A 6 1 K 3 1 / 4 7 0 9

10

【手続補正書】

【提出日】令和4年5月31日(2022.5.31)

【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】

乳癌または肺癌を処置するための医薬組成物であって、該組成物は、賦形剤および治療有効量の結晶性の(E)-N-{4-[3-クロロ-4-(2-ピリジニルメトキシ)アニリノ]-3-シアノ-7-エトキシ-6-キノリニル}-4-(ジメチルアミノ)-2-ブテンアミドマレイン酸塩一水和物の形態IIを含み、

30

1) 該結晶性の(E)-N-{4-[3-クロロ-4-(2-ピリジニルメトキシ)アニリノ]-3-シアノ-7-エトキシ-6-キノリニル}-4-(ジメチルアミノ)-2-ブテンアミドマレイン酸塩一水和物の形態IIが、遊離塩基製剤のネラチニブと比較して少なくとも2倍の曲線下面積をもたらし、そして該遊離塩基製剤のネラチニブと比較して増大した経口吸収を有し、

2) 該結晶性の(E)-N-{4-[3-クロロ-4-(2-ピリジニルメトキシ)アニリノ]-3-シアノ-7-エトキシ-6-キノリニル}-4-(ジメチルアミノ)-2-ブテンアミドマレイン酸塩一水和物の形態IIが、そのX線回折パターンにおいて以下の2角(±0.20°): 6.53、8.43、10.16、12.19、12.47、13.01、15.17、16.76、17.95、19.86、21.11、21.88、23.22、23.78、25.69、26.17、27.06、27.58、28.26、28.73、および29.77におけるX線回折ピークを特徴とし、109.63および203.81のピーク温度で2つの熱事象を有するDSCプロットをさらに特徴とする、

40

医薬組成物。

【請求項2】

前記結晶性の(E)-N-{4-[3-クロロ-4-(2-ピリジニルメトキシ)アニリノ]-3-シアノ-7-エトキシ-6-キノリニル}-4-(ジメチルアミノ)-2-ブテンアミドマレイン酸塩一水和物の形態IIが、一水和物化合物の重量に基づいて、熱重量分析またはカールフィッシャー滴定によって決定されるように、2.5重量%~2.

50

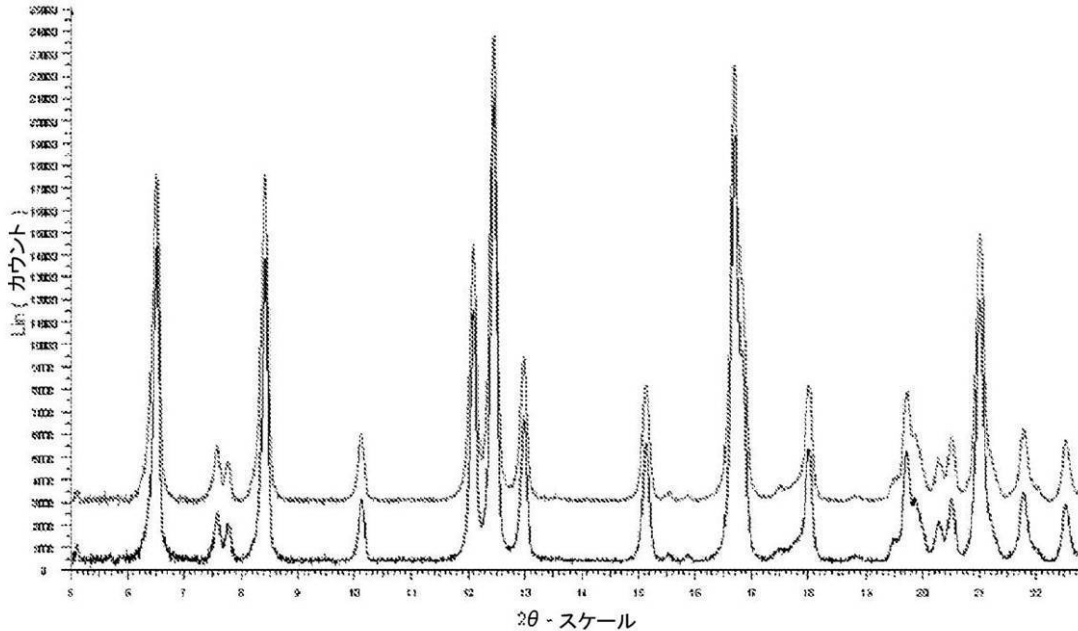
7重量%の水分含量を有する、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項3】

前記結晶性の(E)-N-{4-[3-クロロ-4-(2-ピリジニルメトキシ)アニリノ]-3-シアノ-7-エトキシ-6-キノリニル}-4-(ジメチルアミノ)-2-ブテンアミドマレイン酸塩一水和物の形態IIが、図7:

【化1】

FIG. 7



に示されるX線回折パターンを有することを特徴とする、請求項1または2に記載の医薬組成物。

【請求項4】

患者において、乳癌または肺癌を処置するための医薬の製造における、結晶性の(E)-N-{4-[3-クロロ-4-(2-ピリジニルメトキシ)アニリノ]-3-シアノ-7-エトキシ-6-キノリニル}-4-(ジメチルアミノ)-2-ブテンアミドマレイン酸塩一水和物の形態IIの使用であって、

1) 該結晶性の(E)-N-{4-[3-クロロ-4-(2-ピリジニルメトキシ)アニリノ]-3-シアノ-7-エトキシ-6-キノリニル}-4-(ジメチルアミノ)-2-ブテンアミドマレイン酸塩一水和物の形態IIが、遊離塩基製剤のネラチニブと比較して少なくとも2倍の曲線下面積をもたらし、そして該遊離塩基製剤のネラチニブと比較して増大した経口吸収を有し、

2) 該結晶性の(E)-N-{4-[3-クロロ-4-(2-ピリジニルメトキシ)アニリノ]-3-シアノ-7-エトキシ-6-キノリニル}-4-(ジメチルアミノ)-2-ブテンアミドマレイン酸塩一水和物の形態IIが、そのX線回折パターンにおいて以下の2角(±0.20°): 6.53、8.43、10.16、12.19、12.47、13.01、15.17、16.76、17.95、19.86、21.11、21.88、23.22、23.78、25.69、26.17、27.06、27.58、28.26、28.73、および29.77におけるX線回折ピークを特徴とし、109.63および203.81のピーク温度で2つの熱事象を有するDSCプロットをさらに特徴とする、

使用。

【請求項5】

10

20

30

40

50

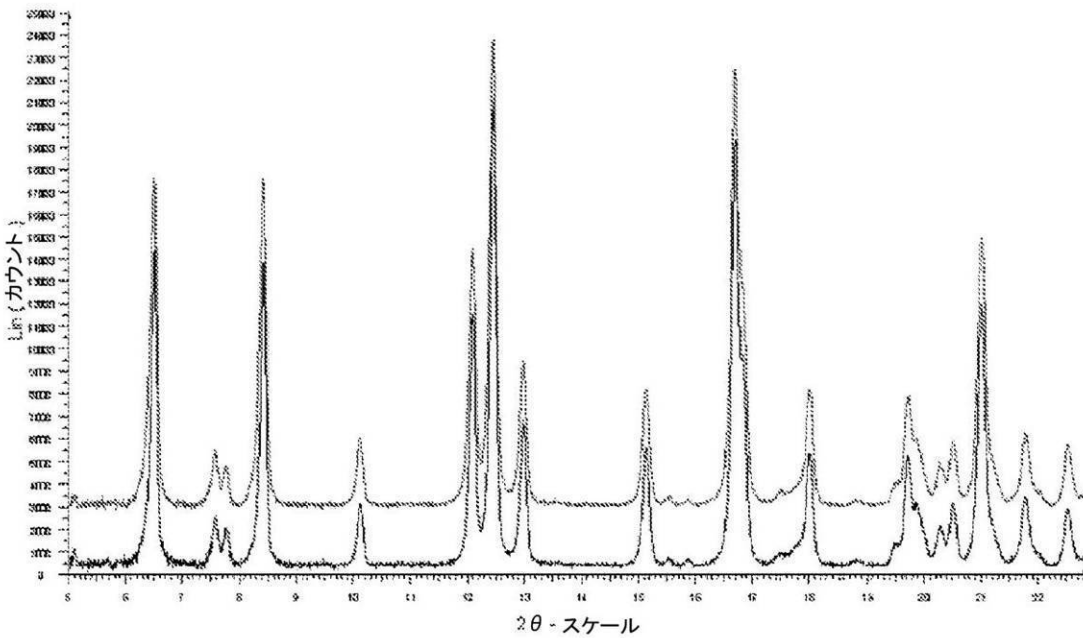
前記結晶性の (E) - N - { 4 - [3 - クロロ - 4 - (2 - ピリジニルメトキシ) アニリノ] - 3 - シアノ - 7 - エトキシ - 6 - キノリニル } - 4 - (ジメチルアミノ) - 2 - ブテンアミドマレイン酸塩一水和物の形態 I I が、一水和物化合物の重量に基づいて、熱重量分析またはカールフィッシャー滴定によって決定されるように、2.5重量% ~ 2.7重量%の水分含量を有する、請求項 4 に記載の使用。

【請求項 6】

前記結晶性の (E) - N - { 4 - [3 - クロロ - 4 - (2 - ピリジニルメトキシ) アニリノ] - 3 - シアノ - 7 - エトキシ - 6 - キノリニル } - 4 - (ジメチルアミノ) - 2 - ブテンアミドマレイン酸塩一水和物の形態 I I が、図 7 :

【化 2】

FIG. 7



に示される X 線回折パターンを有することを特徴とする、請求項 4 または 5 に記載の使用

—

10

20

30

40

50