

【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30年9月27日(2018.9.27)

【公表番号】特表2017-528446(P2017-528446A)

【公表日】平成29年9月28日(2017.9.28)

【年通号数】公開・登録公報2017-037

【出願番号】特願2017-508663(P2017-508663)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/5517	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 K	31/436	(2006.01)
A 6 1 K	31/519	(2006.01)
A 6 1 K	31/53	(2006.01)
A 6 1 K	31/454	(2006.01)
A 6 1 K	31/203	(2006.01)
A 6 1 K	31/549	(2006.01)
A 6 1 K	31/4184	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 K	9/00	(2006.01)
A 6 1 K	47/38	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/5517	
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 K	31/436	
A 6 1 K	31/519	
A 6 1 K	31/53	
A 6 1 K	31/454	
A 6 1 K	31/203	
A 6 1 K	31/549	
A 6 1 K	31/4184	
A 6 1 P	43/00	1 2 1
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	43/00	1 0 5
A 6 1 K	9/00	
A 6 1 K	47/38	

【手続補正書】

【提出日】平成30年8月17日(2018.8.17)

【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】

(S)-2-[4-(4-クロロフェニル)-2,3,9-トリメチル-6H-チエノ[3,2-f][1,2,4]トリアゾロ-[4,3-a][1,4]ジアゼピン-6-イル]-N-(4-ヒドロキシフェニル)アセトアミドニ水和物または(S)-2-[4-

- (4-クロロフェニル)-2,3,9-トリメチル-6H-チエノ[3,2-f][1,2,4]トリアゾロ-[4,3-a][1,4]ジアゼピン-6-イル]-N-(4-ヒドロキシフェニル)アセトアミドである化合物若しくはその医薬上許容される塩の医薬上許容される量を含有する、哺乳動物における活性化B細胞D L B C L (A B C - D L B C L) 及び胚B細胞D L B C L (G B C - D L B C L) からなる群から選ばれるびまん性大細胞型B細胞リンパ腫(D L B C L) の治療剤。

【請求項2】

D L B C L の細胞が、化合物への曝露時に、m i R - 9 2 a - 1 - 5 p、m i R - 2 1 - 3 p 又はそれらの組み合わせからなる群から選ばれるマイクロRNA量の減少を示す、請求項1に記載の治療剤。

【請求項3】

D L B C L の細胞が、化合物への曝露時に、マイクロRNA m i R - 9 6 - 5 p の量の増加を示す、請求項1又は2に記載の治療剤。

【請求項4】

他の治療剤と組み合わされる、請求項1～3の何れか1項に記載の治療剤。

【請求項5】

他の治療剤が、m - TOR阻害剤である、請求項4に記載の治療剤。

【請求項6】

他の治療剤が、BTK阻害剤である、請求項4に記載の治療剤。

【請求項7】

他の治療剤が、DNAメチルトランスフェラーゼ阻害剤である、請求項4に記載の治療剤。

【請求項8】

他の治療剤が、免疫調節剤である、請求項4に記載の治療剤。

【請求項9】

他の治療剤が、DNAアルキル化剤である、請求項4に記載の治療剤。

【請求項10】

他の治療剤が、ヒストンデアセチラーゼ阻害剤である、請求項4に記載の治療剤。

【請求項11】

化合物が、(S)-2-[4-(4-クロロフェニル)-2,3,9-トリメチル-6H-チエノ[3,2-f][1,2,4]トリアゾロ-[4,3-a][1,4]ジアゼピン-6-イル]-N-(4-ヒドロキシフェニル)アセトアミドニ水和物である、請求項1～10の何れか1項に記載の治療剤。

【請求項12】

化合物が、(S)-2-[4-(4-クロロフェニル)-2,3,9-トリメチル-6H-チエノ[3,2-f][1,2,4]トリアゾロ-[4,3-a][1,4]ジアゼピン-6-イル]-N-(4-ヒドロキシフェニル)アセトアミドである、請求項1～10の何れか1項に記載の治療剤。

【請求項13】

化合物が、固体分散体として形成する、請求項1～12の何れか1項に記載の治療剤。

【請求項14】

固体分散体が、非晶質化合物及び医薬上許容されるポリマーを含む、請求項13に記載の治療剤。

【請求項15】

医薬上許容されるポリマーが、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ットであり、化合物を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ット(H P M C A S) に対して1：3ないし1：1の重量比で有する、請求項14に記載の治療剤。

【請求項16】

固体分散体が、結晶質化合物に関連する回折線を実質的に含まない粉末X線回折パターン

ンを示す、請求項1\_3～1\_5の何れか1項に記載の治療剤。

【請求項17】

固体分散体が、約130ないし約140の範囲内のガラス転移温度( $T_g$ )の単一の変曲点を示す、請求項1\_3～1\_6の何れか1項に記載の治療剤。

【請求項18】

固体分散体が、(S)-2-[4-(4-クロロフェニル)-2,3,9-トリメチル-6H-チエノ[3,2-f][1,2,4]トリアゾロ-[4,3-a][1,4]ジアゼピン-6-イル]-N-(4-ヒドロキシフェニル)アセトアミド二水和物である非晶質化合物又はその医薬上許容される塩及び医薬上許容されるポリマーを含む、請求項1\_3～1\_7の何れか1項に記載の治療剤。

【請求項19】

固体分散体が、(S)-2-[4-(4-クロロフェニル)-2,3,9-トリメチル-6H-チエノ[3,2-f][1,2,4]トリアゾロ-[4,3-a][1,4]ジアゼピン-6-イル]-N-(4-ヒドロキシフェニル)アセトアミド二水和物である結晶質化合物に関連する回折線を実質的に含まない粉末X線回折パターンを示す、請求項1\_8に記載の治療剤。

【請求項20】

活性化B細胞D L B C L (A B C - D L B C L )及び胚B細胞D L B C L (G B C - D L B C L )からなる群から選ばれるびまん性大細胞型B細胞リンパ腫(D L B C L )の治療剤を製造するための、(S)-2-[4-(4-クロロフェニル)-2,3,9-トリメチル-6H-チエノ[3,2-f][1,2,4]トリアゾロ-[4,3-a][1,4]ジアゼピン-6-イル]-N-(4-ヒドロキシフェニル)アセトアミド二水和物または(S)-2-[4-(4-クロロフェニル)-2,3,9-トリメチル-6H-チエノ[3,2-f][1,2,4]トリアゾロ-[4,3-a][1,4]ジアゼピン-6-イル]-N-(4-ヒドロキシフェニル)アセトアミドである化合物若しくはその医薬上許容される塩の使用。

【請求項21】

活性化B細胞D L B C L (A B C - D L B C L )及び胚B細胞D L B C L (G B C - D L B C L )からなる群から選ばれるびまん性大細胞型B細胞リンパ腫(D L B C L )の治療剤を製造するための、請求項20に記載の化合物及び医薬上許容されるポリマーの固体分散体の使用。

【請求項22】

請求項1\_3～1\_9の何れか1項に記載の固体分散体を含む医薬上許容される量の組成物を含有する、哺乳動物におけるリンパ腫の治療剤であって、該化合物が、リンパ腫細胞におけるヒストンのアップレギュレーションをもたらす治療剤。

【請求項23】

化合物が、さらにリンパ腫細胞におけるM Y C 遺伝子をダウンレギュレートする、請求項2\_2に記載の治療剤。

【請求項24】

化合物が、N F K B 、T L R 及びJ A K / S T A T 経路の1以上のメンバーをダウンレギュレートする、請求項2\_2に記載の治療剤。

【請求項25】

N K F B 、T L R 及びJ A K / S T A T 経路の1以上のメンバーが、M Y D 8 8 、I R A K 1 、T L R 6 、I L 6 、S T A T 3 、及びT N F R S F 1 7 からなる群から選ばれる、請求項2\_4に記載の治療剤。

【請求項26】

化合物が、I R F 4 、T N F A I P 3 及びB I R C 3 から選ばれる少なくとも1つのN F K B 標的遺伝子をダウンレギュレートする、請求項2\_2に記載の治療剤。

【請求項27】

エベロリムス、イブルチニブ、デシタビン、レナリドマイド、a l l - t r a n s レチ

ノイン酸、ロミデプシン、及びベンダムスチンからなる群から選ばれる少なくとも1種の他の治療剤と組み合わされる、請求項2\_2～2\_6の何れか1項に記載の治療剤。