

【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 - 6 H - 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 - 6 H - 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む、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、mi R - 9 2 a - 1 - 5 p、mi 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 mi 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 - T O R 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、B T K 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 - 6 H - 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、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 - 6 H - 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ートであり、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ート (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 13 ~ 15 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 13 ~ 16 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 - 6 H - 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 13 ~ 17 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 - 6 H - 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 18 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 - 6 H - 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 - 6 H - 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 13 ~ 19 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ず治療剤。

【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 22 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 22 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 24 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 22 に記載の治療剤。

【請求項 27】

エベロリムス、イブルチニブ、デシタピン、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せられる、請求項 2 2 ~ 2 6 の何れか１項に記載の 治療剤。