

【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10月25日(2018.10.25)

【公表番号】特表2017-527567(P2017-527567A)

【公表日】平成29年9月21日(2017.9.21)

【年通号数】公開・登録公報2017-036

【出願番号】特願2017-512976(P2017-512976)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/7076 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

A 6 1 K 47/40 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/7076

A 6 1 K 9/08

A 6 1 K 47/40

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 35/02

【手続補正書】

【提出日】平成30年9月14日(2018.9.14)

【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

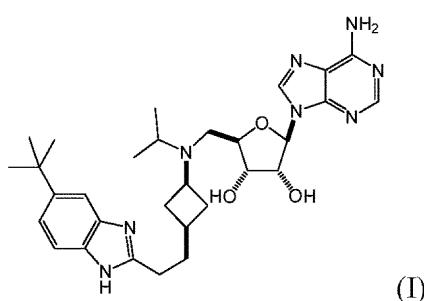
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：



の化合物またはそのN-オキシド、水和物、もしくは塩と、可溶化剤と、pH調整試薬とを含む製剤において、約1～10%(w/v)の式(I)の化合物および約4～40%(w/v)の可溶化剤を含むことを特徴とする製剤。

【請求項2】

請求項1に記載の製剤において、

a) 約10%(w/v)の式(I)の化合物、および/または

b) 約40%(w/v)の可溶化剤

を含み、

任意選択により、前記可溶化剤がシクロデキストリンであり、

任意選択により、前記シクロデキストリンがヒドロキシプロピルベータデクスであるこ

とを特徴とする製剤。

【請求項 3】

請求項 1 または 2 に記載の製剤において、約 0.1 ~ 5% (w/v)、約 1 ~ 2% (w/v)、約 1 ~ 1.8% (w/v)、または約 1.54 ~ 1.7% (w/v) の pH 調整試薬を含むことを特徴とする製剤。

【請求項 4】

請求項 1 乃至 3 の何れか 1 項に記載の製剤において、
a) 前記 pH 調整試薬がクエン酸であり、任意選択により、前記クエン酸が無水クエン酸またはクエン酸一水和物であり、および / または
b) 前記製剤は等張試薬をさらに含み、任意選択により、前記等張試薬が塩化ナトリウムおよびデキストロースから選択されることを特徴とする製剤。

【請求項 5】

請求項 1 乃至 4 の何れか 1 項に記載の製剤において、前記製剤の pH が約 4.0 ~ 8.0、約 4.5 ~ 7.0、または約 5.0 ~ 6.5 に調整されることを特徴とする製剤。

【請求項 6】

請求項 1 乃至 5 の何れか 1 項に記載の製剤において、前記製剤の pH が水酸化ナトリウムもしくは塩酸またはこれらの組み合わせを用いてさらに調製されることを特徴とする製剤。

【請求項 7】

請求項 1 に記載の製剤において、水をさらに含むことを特徴とする製剤。

【請求項 8】

請求項 1 に記載の製剤において、
a) 約 1.5 ~ 10% (w/v) の式 (I) の化合物、約 6 ~ 40% (w/v) の可溶化剤、および約 0.2 ~ 5% (w/v) の pH 調整試薬、または
b) 約 10% (w/v) の式 (I) の化合物、約 40% (w/v) のヒドロキシプロピルベータデクス、および約 1 ~ 2% (w/v) のクエン酸、または
c) 約 1.00% (w/v) の式 (I) の化合物、約 4.00% (w/v) のヒドロキシプロピルベータデクス、約 0.168% (w/v) のクエン酸一水和物、および水を含むことを特徴とする製剤。

【請求項 9】

製剤を、それを必要としている被験者に投与することにより白血病を治療することにおける使用のための、請求項 1 乃至 8 の何れか 1 項に記載の製剤において、前記製剤が、少なくとも 20 時間、少なくとも 1 日間、または少なくとも 2、3、4、5、6、7、8、9、10、11、12、13、14、21、28、35、42、47、56、もしくは 64 日間にわたり連続的に投与されることを特徴とする製剤。

【請求項 10】

請求項 9 に記載の製剤において、
a) 連続的な投与が休薬期間なしの投与を含む、および / または
b) 前記製剤が投与前に希釈されることを特徴とする製剤。

【請求項 11】

請求項 9 または 10 に記載の製剤において、
a) 前記製剤が 28 日間以上にわたり連続的に投与される、または
b) 前記製剤が単位剤形であり、かつ少なくとも 20 時間 ~ 最長約 14 日間にわたり連続的に投与されることを特徴とする製剤。

【請求項 12】

請求項 9 乃至 11 の何れか 1 項に記載の製剤において、前記製剤が少なくとも 36、45、54、70、80、または 90 mg/m² / 日の式 (I) の化合物の用量で投与されることを特徴とする製剤。

【請求項 13】

請求項 9 乃至 12 の何れか 1 項に記載の製剤において、

a) 前記被験者が成人であり、および前記製剤が少なくとも $90 \text{ mg} / \text{m}^2 / \text{日}$ の式 (I) の化合物の用量で投与される、または

b) 前記被験者が生後 12 か月以下の小児患者であり、および前記製剤が少なくとも $45 \text{ mg} / \text{m}^2 / \text{日}$ の式 (I) の化合物の用量で投与されることを特徴とする製剤。

【請求項 14】

請求項 9 乃至 13 の何れか 1 項に記載の製剤において、前記白血病が慢性骨髄単球性白血病 (CMMI)、急性骨髄性白血病 (AML)、または MLL 遺伝子の再構成を特徴とする白血病であり、任意選択により、

a) 前記 MLL 遺伝子の再構成が MLL 遺伝子 11q23 の転座である、または

b) 前記 MLL 遺伝子の再構成が MLL 遺伝子の部分的な縦列重複である、または

c) 前記 MLL 遺伝子の再構成が増大または逸脱した DOT1L メチル化活性をもたらすことを特徴とする製剤。

【請求項 15】

請求項 9 乃至 14 の何れか 1 項に記載の製剤において、

a) 治療が、解熱、悪液質の解消、または皮膚白血病の解消を含む、および / または

b) 治療が、正常造血の回復をもたらすことを特徴とする製剤。