

【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6年10月8日(2024.10.8)

【国際公開番号】WO2022/072820

【公表番号】特表2023-548745(P2023-548745A)

【公表日】令和5年11月21日(2023.11.21)

【年通号数】公開公報(特許)2023-219

【出願番号】特願2023-520066(P2023-520066)

【国際特許分類】

A 6 1 K 9/19(2006.01)

A 6 1 K 31/404(2006.01)

A 6 1 K 47/38(2006.01)

A 6 1 K 47/34(2017.01)

A 6 1 K 47/24(2006.01)

A 6 1 K 47/22(2006.01)

A 6 1 K 9/10(2006.01)

A 6 1 K 39/395(2006.01)

A 6 1 P 35/00(2006.01)

A 6 1 K 47/10(2017.01)

10

20

【F I】

A 6 1 K 9/19

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/24

A 6 1 K 47/22

A 6 1 K 9/10

A 6 1 K 39/395 N

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 47/10

30

【手続補正書】

【提出日】令和6年9月30日(2024.9.30)

【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】

40

【請求項1】

約20%wt/wt～約45%wt/wtの(S)-イソプロピル2-((S)-2-アセトアミド-3-(1H-インドール-3-イル)プロパンアミド)-6-ジアゾ-5-オキソヘキサノエートと、約35%wt/wt～約55%wt/wtの増量剤とを含む、凍結乾燥物。

【請求項2】

約1%wt/wt～約10%wt/wtのセルロース系懸濁調節剤をさらに含む、請求項1記載の凍結乾燥物。

【請求項3】

約1%wt/wt～約5%wt/wtのポロキサマー系懸濁調節剤をさらに含む、請求項1または2記載の凍結乾燥物。

50

## 【請求項 4】

約10% wt/wt～約20% wt/wtのレシチン系懸濁調節剤をさらに含む、請求項1～3のいずれか一項記載の凍結乾燥物。

## 【請求項 5】

約0.5% wt/wt～約2.5% wt/wtの緩衝剤をさらに含む、請求項1～4のいずれか一項記載の凍結乾燥物。

## 【請求項 6】

(i) 約20% wt/wt～約30% wt/wtの(S)-イソプロピル2-((S)-2-アセトアミド-3-(1H-インドール-3-イル)プロパンアミド)-6-ジアゾ-5-オキソヘキサノエート；

(ii) 約45% wt/wt～約55% wt/wtの増量剤；

(iii) 約1% wt/wt～約9% wt/wtのセルロース系懸濁調節剤；

(iv) 約1% wt/wt～約4% wt/wtのポロキサマー系懸濁調節剤；

(v) 約12% wt/wt～約20% wt/wtのレシチン系懸濁調節剤；および

(vi) 約1% wt/wt～約2% wt/wtの緩衝剤

を含む、請求項1～5のいずれか一項記載の凍結乾燥物。

10

## 【請求項 7】

(i) 約62.5mgの(S)-イソプロピル2-((S)-2-アセトアミド-3-(1H-インドール-3-イル)プロパンアミド)-6-ジアゾ-5-オキソヘキサノエート；

(ii) 約125mgのマンニトール；

(iii) 約8.3mgのカルボキシメチルセルロースナトリウム；

(iv) 約7.1mgのポロキサマー188(NF)；

(v) 約41.7mgの大豆レシチン；および

(vi) 約4.3mgのヒスチジン

を含む、請求項1記載の凍結乾燥物。

20

## 【請求項 8】

請求項1～7のいずれか一項記載の凍結乾燥物を含む薬学的組成物であって、凍結乾燥物が、薬学的に許容される担体に懸濁している、薬学的組成物。

## 【請求項 9】

(S)-イソプロピル2-((S)-2-アセトアミド-3-(1H-インドール-3-イル)プロパンアミド)-6-ジアゾ-5-オキソヘキサノエートの濃度が、約20mg/mL～約60mg/mLである、請求項8記載の薬学的組成物。

30

## 【請求項 10】

懸濁液中の(S)-イソプロピル2-((S)-2-アセトアミド-3-(1H-インドール-3-イル)プロパンアミド)-6-ジアゾ-5-オキソヘキサノエートの平均粒度分布が、約1μm～約30μmである、請求項8または9記載の薬学的組成物。

## 【請求項 11】

治療有効量の、請求項8～10のいずれか一項記載の薬学的組成物を含む、その必要のある対象においてがんを処置するための薬学的組成物。

## 【請求項 12】

がんが、下記：

副腎がん、腺房細胞癌、聴神経腫瘍、末端黒子型黒色腫、先端汗腺腫、急性好酸球性白血病、急性赤白血病、急性リンパ芽球性白血病、急性巨核芽球性白血病、急性単球性白血病、急性前骨髄球性白血病、腺癌、腺様嚢胞癌、腺腫、腺様嚢原性腫瘍、腺扁平上皮癌、脂肪組織腫瘍、副腎皮質癌、成人T細胞白血病/リンパ腫、アグレッシブNK細胞白血病、エイズ関連リンパ腫、胞巣状横紋筋肉腫、胞状軟部肉腫、エナメル上皮線維腫、未分化大細胞リンパ腫、組織非形成性甲状腺がん、血管免疫芽球性T細胞リンパ腫、血管筋脂肪腫、血管肉腫、星状細胞腫、非定型奇形腫様ラブドイド腫瘍、B細胞性慢性リンパ性白血病、B細胞性前リンパ球性白血病、B細胞リンパ腫、基底細胞癌、胆道がん、膀胱がん、芽細胞腫、骨がん、ブレンナー腫瘍、ブラウン腫瘍、パーキットリンパ腫、乳がん、脳がん、癌腫、上皮内癌、癌肉腫、軟骨腫瘍、セメント質腫、骨髄肉腫、軟骨腫、脊索腫、絨毛癌

40

50

脈絡叢乳頭腫、腎明細胞肉腫、頭蓋咽頭腫、皮膚T細胞リンパ腫、子宮頸がん、結腸直腸がん、デゴス病、線維形成性小円形細胞腫瘍、びまん性大細胞型B細胞リンパ腫、胚芽異形成性神経上皮腫瘍、未分化胚細胞腫、胎児性癌、内分泌腺腫瘍、卵黄嚢腫瘍、腸症関連T細胞リンパ腫、食道がん、胎児内胎児、線維腫、線維肉腫、濾胞性リンパ腫、濾胞性甲状腺がん、神経節腫、胃腸がん、胚細胞性腫瘍、妊娠性絨毛癌、巨細胞性線維芽細胞腫、骨巨細胞腫、膠細胞腫瘍、多形神経膠芽腫、神経膠腫、大脳神経膠腫症、グルカゴン産生腫瘍、性腺芽腫、顆粒膜細胞腫、ギナンドロプラストーマ、胆嚢がん、胃がん、ヘアリーセル白血病、血管芽腫、頭頸部がん、血管外皮腫、血液がん、肝芽腫、肝脾T細胞リンパ腫、ホジキンリンパ腫、非ホジキンリンパ腫、浸潤性小葉癌、腸がん、腎臓がん、喉頭がん、悪性黒子、致死性正中癌、白血病、ライディッチ細胞腫、脂肪肉腫、肺がん、リンパ管腫、リンパ管肉腫、リンパ上皮腫、リンパ腫、急性リンパ性白血病、急性骨髄性白血病、慢性リンパ性白血病、肝臓がん、小細胞肺がん、非小細胞肺がん、MALTリンパ腫、悪性線維性組織球腫、悪性末梢神経鞘腫、悪性トリトン腫瘍、マントル細胞リンパ腫、辺縁帯B細胞リンパ腫、マスト細胞白血病、縦隔胚細胞腫瘍、乳腺髄様癌、甲状腺髄様がん、髄芽腫、黒色腫、髄膜腫、メルケル細胞がん、中皮腫、転移性尿路上皮癌、ミューラー管混合腫瘍、粘液性腫瘍、多発性骨髄腫、筋組織腫瘍、菌状息肉症、粘液性脂肪肉腫、粘液腫、粘液肉腫、上咽頭癌、神経鞘腫、神経芽細胞腫、神経線維腫、神経腫、結節型黒色腫、眼がん、乏突起星細胞腫、乏突起神経膠腫、オンコサイトーマ、視神経鞘髄膜腫、視神経腫瘍、口腔がん、骨肉腫、卵巣がん、パネコースト腫瘍、乳頭様甲状腺がん、傍神経節腫、松果体芽腫、松果体細胞腫、下垂体細胞腫、下垂体腺腫、下垂体腫瘍、形質細胞腫、多胎芽腫、前駆Tリンパ芽球性リンパ腫、原発性中枢神経系リンパ腫、原発性体液性リンパ腫、原発性腹膜がん、前立腺がん、膵臓がん、咽頭がん、腹膜偽粘液腫、腎細胞癌、腎髄質癌、網膜芽細胞腫、横紋筋腫、横紋筋肉腫、リヒタートランスフォーメーション、直腸がん、肉腫、神経鞘腫症、セミノーマ、セルトリ細胞腫、性索性腺間質腫瘍、印環細胞癌、皮膚がん、小青色円形細胞腫瘍、小細胞癌、軟部肉腫、ソマトスタチン産生腫瘍、ばい煙性いぼ、脊椎腫瘍、脾辺縁帯リンパ腫、扁平上皮細胞癌、滑膜肉腫、セザリー病、小腸がん、扁平上皮癌、胃がん、T細胞リンパ腫、精巣がん、莖膜細胞腫、甲状腺がん、移行上皮癌、咽頭がん、尿膜管がん、泌尿生殖器がん、尿路上皮癌、ぶどう膜黒色腫、子宮がん、疣状癌、視覚路神経膠腫、外陰がん、膣がん、ワルデンストレームマクログロブリン血症、ウォーシク腫瘍、またはウィルムス腫瘍

10

20

30

のうちの1つまたは複数である、請求項11の薬学的組成物。

【請求項13】

がんが、肝細胞癌、神経膠芽腫、肺がん、乳がん、頭頸部がん、前立腺がん、メラノーマ、または結腸直腸がんである、請求項11記載の薬学的組成物。

【請求項14】

薬学的組成物が、対象へ皮下投与される、請求項11～13のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項15】

薬学的組成物が、間欠投薬スケジュールに従って対象へ投与される、請求項14記載の薬学的組成物。

40

【請求項16】

1つまたは複数の任意選択の治療剤と組み合わせて対象へ投与される、請求項11～15のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項17】

1つまたは複数の任意選択の治療剤が、1つまたは複数の免疫チェックポイント阻害剤を含む、請求項16記載の薬学的組成物。

【請求項18】

容器内に1単位用量としてパッケージングされた、請求項1～7のいずれか一項記載の凍結乾燥物を含む、キット。

50

## 【請求項 19】

薬学的組成物を与えるための凍結乾燥物の溶媒への懸濁についての説明書をさらに含む、請求項18記載のキット。

## 【請求項 20】

(i) (S)-イソプロピル2-((S)-2-アセトアミド-3-(1H-インドール-3-イル)プロパンアミド)-6-ジアゾ-5-オキソヘキサノエートと増量剤と水とを含む凍結乾燥前溶液を調製する工程；

(ii) 凍結するか、または部分的に凍結するまで、凍結乾燥前溶液を冷却する工程；および

(iii) 凍結乾燥物を与えるため、凍結した、または部分的に凍結した凍結乾燥前溶液に真空を適用する工程  
を含む、請求項1記載の凍結乾燥物を作製する方法。 10

20

30

40

50