

【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1月18日(2018.1.18)

【公表番号】特表2016-540775(P2016-540775A)

【公表日】平成28年12月28日(2016.12.28)

【年通号数】公開・登録公報2016-070

【出願番号】特願2016-536733(P2016-536733)

【国際特許分類】

C 07 F 9/72 (2006.01)

A 61 K 31/285 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 35/02 (2006.01)

【F I】

C 07 F 9/72

A 61 K 31/285

A 61 P 35/00

A 61 P 35/02

【手続補正書】

【提出日】平成29年12月4日(2017.12.4)

【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】

約190～200 の範囲の融点を有する、ダリナバルシンの結晶形態。

【請求項2】

前記融点が約190～198 の範囲である、請求項1に記載の結晶形態。

【請求項3】

前記融点が約191～196 の範囲である、請求項1に記載の結晶形態。

【請求項4】

2 に対して、約16.6°、約17.4°、約21.4°および約25.2°で表される特徴的なピークを含むX線粉末回折パターンを有する、請求項1に記載の結晶形態。

【請求項5】

2 に対して、約14.4°、約16.6°、約17.4°、約19.3°、約21.4°、約22.0°、約23.3°、約25.0°および約25.2°で表される特徴的なピークを含むX線粉末回折パターンを有する、請求項1に記載の結晶形態。

【請求項6】

2 に対して、約16.6°、約17.4°、約21.4°および約25.2°で表される特徴的なピークを含むX線粉末回折パターンを有する、ダリナバルシンの結晶形態。

【請求項7】

2 に対して、約14.4°、約16.6°、約17.4°、約19.3°、約21.4°、約22.0°、約23.3°、約25.0°および約25.2°で表されるピークを含むX線粉末回折パターンを有する、請求項6に記載の結晶形態。

【請求項8】

治療的有効量の請求項1～7の何れかに記載の結晶形態を含む、癌を処置するための組成物。

【請求項 9】

前記組成物が経口投与されることを特徴とする、請求項 8 に記載の組成物。

【請求項 10】

前記組成物が、1つ以上の物質または治療と組み合わせて投与されることを特徴とする、請求項 8 に記載の組成物。

【請求項 11】

前記1つ以上の物質または治療が化学療法剤または治療である、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 12】

前記化学療法剤が、シスプラチニン(CDDP)、カルボプラチニン、プロカルバジン、メクロレタミン、シクロホスファミド、カンプトテシン、イホスファミド、メルファラン、クロランプシル、ブスルファン、ニトロソウレア、ダクチノマイシン、ダウノルビシン、ドキソルビシン、ブレオマイシン、ブリカマイシン、マイトマイシン、エトポシド(VP-16)、タモキシフェン、ラロキシフェン、エストロゲン受容体結合剤、ドセタキセル、パクリタキセル、ゲムシタビン、ナベルビン、ファルネシル-タンパク質トランスフェラーゼ阻害剤、トランス白金、5-フルオロウラシル、ビンクリスチン、ビンプラスチンおよびメトトレキサートまたは任意のそれらの類似体もしくは誘導変異体から選択される、請求項 11 に記載の組成物。

【請求項 13】

前記1つ以上の物質または治療が、線、X線および放射性同位体から選択される放射線療法である、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 14】

前記1つ以上の物質または治療が、免疫療法剤または治療である、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 15】

前記免疫療法剤または治療が抗体である、請求項 14 に記載の組成物。

【請求項 16】

前記抗体が薬物または毒素と複合化されている、請求項 15 に記載の組成物。

【請求項 17】

前記薬物または毒素が、全トランスレチノイン酸、9-シスレチノイン酸、Am-80およびアスコルビン酸から選択される、請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 18】

前記薬物または毒素が、化学療法剤、放射性ヌクレオチド、リシンA鎖、コレラ毒素および百日咳毒素から選択される、請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 19】

前記薬物または毒素が、シスプラチニン(CDDP)、カルボプラチニン、プロカルバジン、メクロレタミン、シクロホスファミド、カンプトテシン、イホスファミド、メルファラン、クロランプシル、ブスルファン、ニトロソウレア、ダクチノマイシン、ダウノルビシン、ドキソルビシン、ブレオマイシン、ブリカマイシン、マイトマイシン、エトポシド(VP-16)、タモキシフェン、ラロキシフェン、エストロゲン受容体結合剤、ドセタキセル、パクリタキセル、ゲムシタビン、ナベルビン、ファルネシル-タンパク質トランスフェラーゼ阻害剤、トランス白金、5-フルオロウラシル、ビンクリスチン、ビンプラスチンおよびメトトレキサートまたは何れかのそれらの類似体もしくは誘導変異体から選択される化学療法剤である、請求項 18 に記載の組成物。

【請求項 20】

前記抗体が、癌胎児性抗原、前立腺特異的抗原、泌尿器腫瘍関連抗原、胎児性抗原、チロシナーゼ(p97)、gp68、TAG-72、HMG、シアリルルイス抗原、MucA、MucB、PLAP、エストロゲン受容体、ラミニン受容体、erbBおよびp155から選択される腫瘍マーカーを標的とする、請求項 15 に記載の組成物。

【請求項 21】

前記 1 つ以上の物質または治療が遺伝子治療である、請求項 1 0 に記載の組成物。

【請求項 2 2】

前記 1 つ以上の物質または治療が外科的手術である、請求項 1 0 に記載の組成物。

【請求項 2 3】

前記癌が 固形腫瘍を含む、請求項 8 に記載の組成物。

【請求項 2 4】

前記癌が、脳、肺、肝臓、脾臓、腎臓、リンパ節、小腸、胰臓、血液細胞、骨、結腸、胃、乳房、子宮内膜、前立腺、睾丸、卵巣、中枢神経系、皮膚、頭頸部、食道または骨髄癌である、請求項 8 に記載の組成物。

【請求項 2 5】

前記癌が 血液癌である、請求項 8 に記載の組成物。

【請求項 2 6】

前記癌が、白血病、リンパ腫、多発性骨髄腫、骨髄異形成、骨髄増殖性疾患または不応性白血病である、請求項 8 に記載の組成物。

【請求項 2 7】

前記癌が 急性前骨髄球性白血病である、請求項 8 に記載の組成物。

【請求項 2 8】

前記癌が 非ホジキンリンパ腫である、請求項 8 に記載の組成物。

【請求項 2 9】

前記癌が ホジキンリンパ腫である、請求項 8 に記載の組成物。

【請求項 3 0】

前記治療的有効量が 0 . 1 ~ 1 0 0 0 m g / k g である、請求項 8 に記載の組成物。

【請求項 3 1】

前記治療的有効量が 1 ~ 5 0 0 m g / k g である、請求項 3 0 に記載の組成物。

【請求項 3 2】

前記治療的有効量が 1 0 ~ 1 0 0 m g / k g である、請求項 3 0 に記載の組成物。

【請求項 3 3】

前記化合物が 每日投与される、請求項 3 0 に記載の組成物。

【請求項 3 4】

前記化合物が 注射により投与される、請求項 3 0 に記載の組成物。

【請求項 3 5】

前記 1 つ以上の物質または治療が、ボルテゾミブ、デキサメタゾン、イリノテカン、オキサリプラチニン、5 - フルオロウラシル、ソラフェニブ、全トランスレチノイン酸、9 - シスレチノイン酸、A m - 8 0 およびアスコルビン酸から選択される、請求項 1 0 に記載の組成物。

【請求項 3 6】

請求項 1 ~ 7 の何れか 1 項に記載の結晶形態と、薬学的に許容可能な担体または希釈剤と、を含む医薬組成物。

【請求項 3 7】

4 ~ 7 の範囲の p H を有する水溶液である医薬組成物の調製のための方法であって、請求項 1 ~ 7 の何れか 1 項に記載の結晶形態を注射用の水中で溶解させ；任意選択により前記 p H を調整することを含む、方法。

【請求項 3 8】

前記 p H を調整することが、水酸化ナトリウムまたは塩酸を使用することを含む、請求項 3 7 に記載の方法。

【請求項 3 9】

含水量が 約 5 % 未満である、請求項 3 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 0】

含水量が 約 2 % 未満である、請求項 3 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 1】

請求項 1 ~ 7 の何れか 1 項に記載の結晶形態の水溶液を調製し、前記水溶液を凍結乾燥することを含む、凍結乾燥物を調製するための方法。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0012

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0012】

いくつかの実施形態において、本発明は、式 (I) の構造を有する化合物の水溶液を調製し、この水溶液を凍結乾燥することを含む、凍結乾燥物の調製のための方法を提供する。

本発明は、例えば、以下の項目を提供する。

(項目 1)

約 190 ~ 200 の範囲の融点を有する、ダリナパルシンの結晶形態。

(項目 2)

前記融点が約 190 ~ 198 の範囲である、項目 1 に記載の結晶形態。

(項目 3)

前記融点が約 191 ~ 196 の範囲である、項目 1 に記載の結晶形態。

(項目 4)

2 に対して、約 16.6°、約 17.4°、約 21.4° および約 25.2° で表される特徴的なピークを含む X 線粉末回折パターンを有する、項目 1 に記載の結晶形態。

(項目 5)

2 に対して、約 14.4°、約 16.6°、約 17.4°、約 19.3°、約 21.4°、約 22.0°、約 23.3°、約 25.0° および約 25.2° で表される特徴的なピークを含む X 線粉末回折パターンを有する、項目 1 に記載の結晶形態。

(項目 6)

2 に対して、約 16.6°、約 17.4°、約 21.4° および約 25.2° で表される特徴的なピークを含む X 線粉末回折パターンを有する、ダリナパルシンの結晶形態。

(項目 7)

2 に対して、約 14.4°、約 16.6°、約 17.4°、約 19.3°、約 21.4°、約 22.0°、約 23.3°、約 25.0° および約 25.2° で表されるピークを含む X 線粉末回折パターンを有する、項目 6 に記載の結晶形態。

(項目 8)

治療的有効量の項目 1 ~ 7 の何れかに記載の結晶形態を投与することを含む、癌を処置するための方法。

(項目 9)

前記治療的有効量の前記結晶形態を経口投与することを含む、項目 8 に記載の方法。

(項目 10)

1 つ以上の物質または治療を投与することをさらに含む、項目 8 に記載の方法。

(項目 11)

前記 1 つ以上の物質または治療が化学療法剤または治療である、項目 10 に記載の方法。

(項目 12)

前記化学療法剤が、シスプラチニ (CDDP)、カルボプラチニ、プロカルバジニ、メクロレタミニ、シクロホスファミド、カンプトテシン、イホスファミド、メルファラン、クロランプシル、ブスルファン、ニトロソウレア、ダクチノマイシン、ダウノルビシン、ドキソルビシン、プレオマイシン、プリカマイシン、マイトマイシン、エトポシド (VP-16)、タモキシフェン、ラロキシフェン、エストロゲン受容体結合剤、ドセタキセル、

パクリタキセル、ゲムシタビン、ナベルビン、ファルネシル - タンパク質トランスフェラーゼ阻害剤、トランス白金、5 - フルオロウラシル、ビンクリスチン、ビンプラスチンおよびメトトレキサートまたは任意のそれらの類似体もしくは誘導変異体から選択される、項目11に記載の方法。

(項目13)

前記1つ以上の物質または治療が、線、X線および放射性同位体から選択される放射線療法である、項目10に記載の方法。

(項目14)

前記1つ以上の物質または治療が、免疫療法剤または治療である、項目10に記載の方法。

(項目15)

前記免疫療法剤または治療が抗体である、項目14に記載の方法。

(項目16)

前記抗体が薬物または毒素と複合化されている、項目15に記載の方法。

(項目17)

前記薬物または毒素が、全トランスレチノイン酸、9 - シスレチノイン酸、Am - 80およびアスコルビン酸から選択される、項目16に記載の方法。

(項目18)

前記薬物または毒素が、化学療法剤、放射性ヌクレオチド、リシンA鎖、コレラ毒素および百日咳毒素から選択される、項目16に記載の方法。

(項目19)

前記薬物または毒素が、シスプラチン(CDDP)、カルボプラチン、プロカルバジン、メクロレタミン、シクロホスファミド、カンプトテシン、イホスファミド、メルファラン、クロランプシル、ブスルファン、ニトロソウレア、ダクチノマイシン、ダウノルビシン、ドキソルビシン、ブレオマイシン、プリカマイシン、マイトイマイシン、エトポシド(VP16)、タモキシフェン、ラロキシフェン、エストロゲン受容体結合剤、ドセタキセル、パクリタキセル、ゲムシタビン、ナベルビン、ファルネシル - タンパク質トランスフェラーゼ阻害剤、トランス白金、5 - フルオロウラシル、ビンクリスチン、ビンプラスチンおよびメトトレキサートまたは何れかのそれらの類似体もしくは誘導変異体から選択される化学療法剤である、項目18に記載の方法。

(項目20)

前記抗体が、癌胎児性抗原、前立腺特異的抗原、泌尿器腫瘍関連抗原、胎児性抗原、チロシナーゼ(p97)、gp68、TAG-72、HMG、シアリルルイス抗原、MucA、MucB、PLAP、エストロゲン受容体、ラミニン受容体、erbBおよびp155から選択される腫瘍マーカーを標的とする、項目15に記載の方法。

(項目21)

前記1つ以上の物質または治療が遺伝子治療である、項目10に記載の方法。

(項目22)

前記1つ以上の物質または治療が外科的手術である、項目10に記載の方法。

(項目23)

前記癌が 固形腫瘍を含む、項目8に記載の方法。

(項目24)

前記癌が、脳、肺、肝臓、脾臓、腎臓、リンパ節、小腸、脾臓、血液細胞、骨、結腸、胃、乳房、子宮内膜、前立腺、睾丸、卵巣、中枢神経系、皮膚、頭頸部、食道または骨髄癌である、項目8に記載の方法。

(項目25)

前記癌が血液癌である、項目8に記載の方法。

(項目26)

前記癌が、白血病、リンパ腫、多発性骨髄腫、骨髄異形成、骨髄増殖性疾患または不応性白血病である、項目8に記載の方法。

(項目27)

前記癌が急性前骨髄球性白血病である、項目8に記載の方法。

(項目28)

前記癌が非ホジキンリンパ腫である、項目8に記載の方法。

(項目29)

前記癌がホジキンリンパ腫である、項目8に記載の方法。

(項目30)

前記治療的有効量が0.1～1000mg/kgである、項目8に記載の方法。

(項目31)

前記治療的有効量が1～500mg/kgである、項目30に記載の方法。

(項目32)

前記治療的有効量が10～100mg/kgである、項目30に記載の方法。

(項目33)

前記化合物が毎日投与される、項目30に記載の方法。

(項目34)

前記化合物が注射により投与される、項目30に記載の方法。

(項目35)

前記1つ以上の物質または治療が、ボルテゾミブ、デキサメタゾン、イリノテカン、オキサリプラチン、5-フルオロウラシル、ソラフェニブ、全トランスレチノイン酸、9-シスレチノイン酸、Am-80およびアスコルビン酸から選択される、項目10に記載の方法。

(項目36)

項目1～7の何れか1項に記載の結晶形態と、薬学的に許容可能な担体または希釈剤と、を含む医薬組成物。

(項目37)

4～7の範囲のpHを有する水溶液である医薬組成物の調製のための方法であって、請求項1～7の何れか1項に記載の結晶形態を注射用の水中で溶解させ；任意選択により前記pHを調整することを含む、方法。

(項目38)

前記pHを調整することが、水酸化ナトリウムまたは塩酸を使用することを含む、請求項37に記載の方法。

(項目39)

含水量が約5%未満である、項目36に記載の医薬組成物。

(項目40)

含水量が約2%未満である、項目36に記載の医薬組成物。

(項目41)

請求項1～7の何れか1項に記載の結晶形態の水溶液を調製し、前記水溶液を凍結乾燥することを含む、凍結乾燥物を調製するための方法。