

【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 2 年 4 月 16 日 (2020.4.16)

【公表番号】特表 2017-536407 (P2017-536407A)

【公表日】平成 29 年 12 月 7 日 (2017.12.7)

【年通号数】公開・登録公報 2017-047

【出願番号】特願 2017-529774 (P2017-529774)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 9/20

A 6 1 P 35/00

【誤訳訂正書】

【提出日】令和 2 年 3 月 3 日 (2020.3.3)

【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

A R N - 5 0 9、ポリ（メタ）アクリレート共重合体、及び H P M C A S を含む固体分散体。

【請求項 2】

前記分散体が A R N - 5 0 9、ポリ（メタ）アクリレート共重合体、及び H P M C A S からなる、請求項 1 に記載の固体分散体。

【請求項 3】

前記固体分散体中の A R N - 5 0 9：（ポリ（メタ）アクリレート共重合体及び H P M C A S）の重量比が、1：1～1：5 の範囲内である、請求項 1 又は 2 に記載の固体分散体。

【請求項 4】

前記固体分散体中の A R N - 5 0 9：（ポリ（メタ）アクリレート共重合体及び H P M C A S）の重量比が 1：3 である、請求項 3 に記載の固体分散体。

【請求項 5】

前記固体分散体中の A R N - 5 0 9：（ポリ（メタ）アクリレート共重合体及び H P M C A S）の重量比が 1：2 である、請求項 3 に記載の固体分散体。

【請求項 6】

前記固体分散体中の A R N - 5 0 9：（ポリ（メタ）アクリレート共重合体及び H P M C A S）の重量比が 1：1 である、請求項 3 に記載の固体分散体。

【請求項 7】

前記固体分散体中のポリ（メタ）アクリレート共重合体と H P M C A S との重量比が、

5 : 9 5 ~ 9 5 : 5 の範囲である、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の固体分散体。

【請求項 8】

前記固体分散体中のポリ(メタ)アクリレート共重合体と H P M C A S との重量比が、2 5 : 7 5 ~ 7 5 : 2 5 の範囲である、請求項 7 に記載の固体分散体。

【請求項 9】

前記固体分散体中のポリ(メタ)アクリレート共重合体と H P M C A S との重量比が、5 0 : 5 0 である、請求項 8 に記載の固体分散体。

【請求項 10】

A R N - 5 0 9 が非晶質形態で存在する、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の固体分散体。

【請求項 11】

前記分散体が固溶体である、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の固体分散体。

【請求項 12】

前記ポリ(メタ)アクリレート共重合体が ポリ(メタクリレート-コ-エチルアクリレート) 1 : 1 である、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の固体分散体。

【請求項 13】

前記 H P M C A S が H P M C A S L G である、請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の固体分散体。

【請求項 14】

噴霧乾燥物である、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の固体分散体。

【請求項 15】

高温溶融押出物である、請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の固体分散体。

【請求項 16】

請求項 1 ~ 15 のいずれか一項で定義されている固体分散体からなる粒子。

【請求項 17】

請求項 1 ~ 15 のいずれか一項で定義されている固体分散体を含む粒子。

【請求項 18】

製薬的に許容される担体と、請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の固体分散体と、を含む、医薬製剤。

【請求項 19】

製薬的に許容される担体と、請求項 16 又は 17 に記載の粒子と、を含む、医薬製剤。

【請求項 20】

前記製剤が 6 0 m g の A R N - 5 0 9 を含む、請求項 18 又は 19 に記載の製剤。

【請求項 21】

前記製剤が 1 2 0 m g の A R N - 5 0 9 を含む、請求項 18 又は 19 に記載の製剤。

【請求項 22】

前記製剤が 2 4 0 m g の A R N - 5 0 9 を含む、請求項 18 又は 19 に記載の製剤。

【請求項 23】

前記固体分散体の重量が製剤の総重量の 2 0 ~ 4 0 % の範囲である、請求項 18 ~ 22 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 24】

前記製剤が錠剤である、請求項 18 ~ 23 のいずれか一項に記載の製剤。

【請求項 25】

経口投与に適している、請求項 24 に記載の製剤。

【請求項 26】

A R N - 5 0 9、ポリ(メタ)アクリレート共重合体、及び H P M C A S を好適な溶媒中で混合する工程と、前記混合物を噴霧乾燥させる工程と、を含む、請求項 14 に記載の固体分散体を調製するためのプロセス。

【請求項 27】

前記適切な溶媒が、ジクロロメタンとメタノールの混合物である、請求項 26 に記載の

プロセス。

【請求項 28】

前記混合物中のジクロロメタンとメタノールとの重量比が 50 : 50 である、請求項 27 に記載のプロセス。

【請求項 29】

前立腺癌の治療のための、請求項 18 ~ 25 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 30】

経口投与用である、請求項 29 に記載の医薬製剤。

【請求項 31】

請求項 18 ~ 25 のいずれか一項に記載の医薬製剤であって、別の抗癌剤との組み合わせで用いられる、医薬製剤。

【請求項 32】

前記医薬製剤が前記別の抗癌剤を含む、請求項 31 に記載の医薬製剤。

【請求項 33】

前記別の抗癌剤がアンドロゲン生合成阻害薬である、請求項 31 または 32 に記載の医薬製剤。

【請求項 34】

前記別の抗癌剤が酢酸アピラテロンである、請求項 31 または 32 に記載の医薬製剤。

【請求項 35】

プレドニゾンとのさらなる組み合わせで用いられる、請求項 31 ~ 34 のいずれか一項に記載の医薬製剤。

【請求項 36】

前記医薬製剤が前記プレドニゾンを含む、請求項 35 に記載の医薬製剤。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0013

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0013】

アクリル酸エステル及びメタクリル酸エステルに由来する共重合体（ポリ（メタ）アクリレート）は、Eudragit（登録商標）として産業界では知られている。Eudragit（登録商標）は、様々なポリ（メタ）アクリレート系共重合体の商標名である。異なるグレードが入手可能である。本発明の一態様では、ARN-509 との分散体中の Eudragit（登録商標）は、Eudragit（登録商標）L 100-55 であり、これは、メタクリル酸及びエチルアクリレートをベースとするアニオン性共重合体含有している（CAS 番号 25212-88-8；化学名/IUPAC 名：ポリ（メタクリル酸-コ-エチルアクリレート）1:1）（Evonik Industries）。本発明の一態様では、ARN-509 との分散体中の Eudragit（登録商標）は、Eudragit（登録商標）E 100 であり、これは、メタクリル酸ジメチルアミノエチル、メタクリル酸ブチル、及びメタクリル酸メチルをベースとするカチオン性共重合体である（CAS 番号 24938-16-7；化学名/IUPAC 名：ポリ（ブチルメタクリレート-コ-（2-ジメチルアミノエチル）メタクリレート-コ-メチルメタクリレート）1:2:1（Evonik Industries）。