

【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 28 年 4 月 21 日 (2016.4.21)

【公開番号】特開 2015-232006 (P2015-232006A)

【公開日】平成 27 年 12 月 24 日 (2015.12.24)

【年通号数】公開・登録公報 2015-081

【出願番号】特願 2015-142670 (P2015-142670)

【国際特許分類】

C 07 D 295/14 (2006.01)

A 61 K 31/5377 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 35/02 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 295/14 C S P A

A 61 K 31/5377

A 61 P 35/00

A 61 P 35/02

A 61 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成 28 年 3 月 4 日 (2016.3.4)

【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】

固体結晶形態の化合物 N - (4 - (4 - ((2 - (4 - クロロフェニル) - 5 , 5 - ジメチル - 1 - シクロヘキサ - 1 - エン - 1 - イル) メチル) ピペラジン - 1 - イル) ベンゾイル) - 4 - (((1 R) - 3 - (モルホリン - 4 - イル) - 1 - ((フェニルスルファニル) メチル) プロピル) アミノ) - 3 - ((トリフルオロメチル) スルホニル) ベンゼンスルホンアミド (A B T - 2 6 3) であって、

前記結晶形態が、有機溶媒で溶媒和された A B T - 2 6 3 遊離塩基を含む溶媒和物であり、前記溶媒和物が、エタノール / 酢酸エチル混合物、1 - プロパノール、2 - プロパノール、メタノール、ベンゼン、トルエン、ジオキサン / ヘキサン混合物、酢酸メチル / ヘキサン混合物、クロロホルム、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸メチル、ピリジン、アニソールおよびトリフルオロトルエンの溶媒和物からなる群から選択される、化合物。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の固体結晶形態の化合物と、1 種以上の医薬として許容される賦形剤と、を含む医薬組成物。

【請求項 3】

請求項 1 に記載の化合物を、医薬として許容される溶媒または溶媒の混合物に溶解させることを含む、A B T - 2 6 3 の医薬溶液組成物を調製する方法。

【請求項 4】

アポトーシス異常および / または抗アポトーシス B c l - 2 ファミリータンパク質の過剰発現を特徴とする疾患を治療するための医薬の製造における、治療的有効量の請求項 1 に記載の化合物および 1 種以上の医薬として許容される賦形剤の使用であって、

前記疾患が、癌、中皮腫、膀胱癌、膵臓癌、皮膚癌、頭頸部癌、皮膚または眼内黒色腫、卵巣癌、乳癌、子宮癌、ファロピウス管癌、子宮内膜癌、子宮頸癌、膣癌、外陰癌、骨癌、結腸癌、直腸癌、肛門部癌、胃癌、胃腸（胃、結腸直腸および／または十二指腸）癌、慢性リンパ性白血病、急性リンパ性白血病、食道癌、小腸癌、内分泌系癌、甲状腺癌、副甲状腺癌、副腎癌、軟組織肉腫、尿道癌、陰茎癌、睾丸癌、肝細胞（肝管および／または胆管）癌、原発性または続発性中枢神経系腫瘍、原発性または続発性脳腫瘍、ホジキン病、慢性または急性白血病、慢性骨髄性白血病、リンパ球性リンパ腫、リンパ芽球性白血病、濾胞性リンパ腫、T細胞またはB細胞由来のリンパ性悪性疾患、黒色腫、多発性黒色腫、口腔癌、非小細胞肺癌、前立腺癌、小細胞肺癌、腎臓および／または尿管癌、腎細胞癌、腎盂癌、中枢神経系腫瘍、原発性中枢神経系リンパ腫、非ホジキンリンパ腫、脊髄軸腫瘍、脳幹膠腫、下垂体腺腫、副腎皮質癌、胆嚢癌、膵臓癌、胆管癌、線維肉腫、神経芽細胞腫、網膜芽細胞腫およびこれらの組合せからなる群から選択される腫瘍性疾患である、使用。

【請求項 5】

前記溶媒和物が、エタノール／酢酸エチル混合物、1 - プロパノール、2 - プロパノール、メタノール、ベンゼン、トルエン、ジオキサン／ヘキサン混合物、酢酸メチル／ヘキサン混合物、クロロホルム、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸メチル、ピリジン、アニソールおよびトリフルオロトルエンの溶媒和物からなる群から選択される、請求項 4 に記載の使用。

【請求項 6】

前記医薬が、経口、非経口、舌下、頬側、鼻腔内、肺、局所、経皮、皮内、眼、耳、直腸、膣、胃内、頭蓋内、滑液嚢内または関節内経路で投与される、請求項 4 に記載の使用。

【請求項 7】

前記腫瘍性疾患が、リンパ性悪性疾患である、請求項 4 に記載の使用。

【請求項 8】

前記リンパ性悪性疾患が、非ホジキンリンパ腫である、請求項 7 に記載の使用。

【請求項 9】

前記医薬が、1 日当たり 50 ～ 1000 mg の A B T - 263 の用量で、3 時間～7 日間の平均治療間隔で経口投与される、請求項 4 に記載の使用。

【請求項 10】

前記医薬が、1 日当たり 200 ～ 400 mg の A B T - 263 遊離塩基当量の用量で 1 日 1 回経口投与される、請求項 4 に記載の使用。

【請求項 11】

アポトーシス異常および／または抗アポトーシス Bcl-2 ファミリータンパク質の過剰発現を特徴とする疾患を治療するための医薬の製造における、治療的有効量の請求項 1 に記載の化合物 および 1 種以上の医薬として許容される賦形剤の使用であって、

前記医薬は、治療的有効量の請求項 1 に記載の化合物を、医薬として許容される溶媒または溶媒の混合物に溶解させることにより調製され、得られた溶液は疾患を有する対象に投与され、

前記疾患は、癌、中皮腫、膀胱癌、膵臓癌、皮膚癌、頭頸部癌、皮膚または眼内黒色腫、卵巣癌、乳癌、子宮癌、ファロピウス管癌、子宮内膜癌、子宮頸癌、膣癌、外陰癌、骨癌、結腸癌、直腸癌、肛門部癌、胃癌、胃腸（胃、結腸直腸および／または十二指腸）癌、慢性リンパ性白血病、急性リンパ性白血病、食道癌、小腸癌、内分泌系癌、甲状腺癌、副甲状腺癌、副腎癌、軟組織肉腫、尿道癌、陰茎癌、睾丸癌、肝細胞（肝管および／または胆管）癌、原発性または続発性中枢神経系腫瘍、原発性または続発性脳腫瘍、ホジキン病、慢性または急性白血病、慢性骨髄性白血病、リンパ球性リンパ腫、リンパ芽球性白血病、濾胞性リンパ腫、T細胞またはB細胞由来のリンパ性悪性疾患、黒色腫、多発性黒色腫、口腔癌、非小細胞肺癌、前立腺癌、小細胞肺癌、腎臓および／または尿管癌、腎細胞癌、腎盂癌、中枢神経系腫瘍、原発性中枢神経系リンパ腫、非ホジキンリンパ腫、脊髄軸

腫瘍、脳幹膠腫、下垂体腺腫、副腎皮質癌、胆嚢癌、脾臓癌、胆管癌、線維肉腫、神経芽細胞腫、網膜芽細胞腫およびこれらの組合せからなる群から選択される腫瘍性疾患である、使用。

【請求項 1 2】

前記溶媒和物が、エタノール/酢酸エチル混合物、1-プロパノール、2-プロパノール、メタノール、ベンゼン、トルエン、ジオキサン/ヘキサン混合物、酢酸メチル/ヘキサン混合物、クロロホルム、酢酸エチル、酢酸イソプロピル、酢酸メチル、ピリジン、アニソールおよびトリフルオロトルエンの溶媒和物からなる群から選択される、請求項 1 1 に記載の使用。

【請求項 1 3】

前記溶液が、経口、非経口、舌下、頬側、鼻腔内、肺、局所、経皮、皮内、眼、耳、直腸、膣、胃内、頭蓋内、滑液嚢内または関節内経路で投与される、請求項 1 1 に記載の使用。

【請求項 1 4】

前記腫瘍性疾患が、リンパ性悪性疾患である、請求項 1 1 に記載の使用。

【請求項 1 5】

前記リンパ性悪性疾患が、非ホジキンリンパ腫である、請求項 1 4 に記載の使用。

【請求項 1 6】

前記溶液が、1日当たり50～1000mgのABT-263の用量で、3時間～7日間の平均治療間隔で経口投与される、請求項 1 1 に記載の使用。

【請求項 1 7】

前記溶液が、1日当たり200～400mgのABT-263遊離塩基当量の用量で、1日1回経口投与される、請求項 1 1 に記載の使用。