

【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 4 年 1 月 6 日 (2022.1.6)

【公表番号】特表 2021-504384 (P2021-504384A)

【公表日】令和 3 年 2 月 15 日 (2021.2.15)

【年通号数】公開・登録公報 2021-007

【出願番号】特願 2020-529159 (P2020-529159)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/381 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 31/381

【手続補正書】

【提出日】令和 3 年 11 月 29 日 (2021.11.29)

【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】

(E) - 3 - (4 - ((2 - (2 - (1, 1 - ジフルオロエチル) - 4 - フルオロフェニル) - 6 - ヒドロキシベンゾ [b] チオフェン - 3 - イル) オキシ) フェニル) アクリル酸又は薬学的に許容されるその塩と、(S) - ピロリジン - 1, 2 - ジカルボン酸 2 - アミド 1 - ({ 4 - メチル - 5 - [2 - (2, 2, 2 - トリフルオロ - 1, 1 - ジメチル - エチル) - ピリジン - 4 - イル] - チアゾール - 2 - イル } - アミド又は薬学的に許容されるその塩と) の組合せを含む医薬組成物。

【請求項 2】

(E) - 3 - (4 - ((2 - (2 - (1, 1 - ジフルオロエチル) - 4 - フルオロフェニル) - 6 - ヒドロキシベンゾ [b] チオフェン - 3 - イル) オキシ) フェニル) アクリル酸又は薬学的に許容されるその塩と、(S) - ピロリジン - 1, 2 - ジカルボン酸 2 - アミド 1 - ({ 4 - メチル - 5 - [2 - (2, 2, 2 - トリフルオロ - 1, 1 - ジメチル - エチル) - ピリジン - 4 - イル] - チアゾール - 2 - イル } - アミド又は薬学的に許容されるその塩は、別々に、同時に又は逐次的に任意の順序で投与される、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

(E) - 3 - (4 - ((2 - (2 - (1, 1 - ジフルオロエチル) - 4 - フルオロフェニル) - 6 - ヒドロキシベンゾ [b] チオフェン - 3 - イル) オキシ) フェニル) アクリル酸又は薬学的に許容されるその塩と、(S) - ピロリジン - 1, 2 - ジカルボン酸 2 - アミド 1 - ({ 4 - メチル - 5 - [2 - (2, 2, 2 - トリフルオロ - 1, 1 - ジメチル - エチル) - ピリジン - 4 - イル] - チアゾール - 2 - イル } - アミド又は薬学的に許容されるその塩は、同じ製剤中に存在するか、又は、別々の製剤中に存在する、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

少なくとも 1 種の薬学的に許容される担体をさらに含む、請求項 1 ～ 3 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

E R + 乳癌の処置における使用のための、請求項 1 ～ 4 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

前記 E R + 乳癌は、野生型の E R + 乳癌である、請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

前記 E R + 乳癌は、E S R 1 変異を有する、請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

前記 E S R 1 変異は、M C F - 7 が発現する E S R 1 変異である、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

前記変異は、D 5 3 8 G、E 3 8 0 Q、Y 5 3 7 S、Y 5 3 7 N 及び Y 5 3 7 C からなる群から選択される、請求項 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

(E) - 3 - (4 - ((2 - (2 - (1, 1 - ジフルオロエチル) - 4 - フルオロフェニル) - 6 - ヒドロキシベンゾ [b] チオフェン - 3 - イル) オキシ) フェニル) アクリル酸は、1 日当たり約 1 0 0 m g、又は 1 日当たり 2 0 0 m g、又は 1 日当たり 3 0 0 m g、又は 1 日当たり 4 0 0 m g、又は 1 日当たり 4 5 0 m g、又は 1 日当たり 5 0 0 m g、又は 1 日当たり 6 0 0 m g、又は 1 日当たり 9 0 0 m g の用量で経口投与され、かつ、(S) - ピロリジン - 1, 2 - ジカルボン酸 2 - アミド 1 - ({4 - メチル - 5 - [2 - (2, 2, 2 - トリフルオロ - 1, 1 - ジメチル - エチル) - ピリジン - 4 - イル] - チアゾール - 2 - イル} - アミドは、1 日当たり約 5 0 m g、又は 1 日当たり 1 0 0 m g、又は 1 日当たり 1 5 0 m g、又は 1 日当たり 2 0 0 m g、又は 1 日当たり 2 5 0 m g、又は 1 日当たり 3 0 0 m g、又は 1 日当たり 3 5 0 m g、又は 1 日当たり 4 0 0 m g、又は 1 日当たり 4 5 0 m g の用量で経口投与される、請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

E R + 乳癌の処置のための医薬の製造のための、請求項 1 ～ 4 のいずれか一項に記載の医薬組成物の使用。

【請求項 12】

前記 E R + 乳癌は、野生型の E R + 乳癌である、請求項 11 に記載の使用。

【請求項 13】

前記 E R + 乳癌は、E S R 1 変異を有する、請求項 11 に記載の使用。

【請求項 14】

前記 E S R 1 変異は、M C F - 7 が発現する E S R 1 変異である、請求項 13 に記載の使用。

【請求項 15】

前記変異は、D 5 3 8 G、E 3 8 0 Q、Y 5 3 7 S、Y 5 3 7 N 及び Y 5 3 7 C からなる群から選択される、請求項 14 に記載の使用。

【請求項 16】

(E) - 3 - (4 - ((2 - (2 - (1, 1 - ジフルオロエチル) - 4 - フルオロフェニル) - 6 - ヒドロキシベンゾ [b] チオフェン - 3 - イル) オキシ) フェニル) アクリル酸は、1 日当たり約 1 0 0 m g、又は 1 日当たり 2 0 0 m g、又は 1 日当たり 3 0 0 m g、又は 1 日当たり 4 0 0 m g、又は 1 日当たり 4 5 0 m g、又は 1 日当たり 5 0 0 m g、又は 1 日当たり 6 0 0 m g、又は 1 日当たり 9 0 0 m g の用量で経口投与され、かつ、(S) - ピロリジン - 1, 2 - ジカルボン酸 2 - アミド 1 - ({4 - メチル - 5 - [2 - (2, 2, 2 - トリフルオロ - 1, 1 - ジメチル - エチル) - ピリジン - 4 - イル] - チアゾール - 2 - イル} - アミドは、1 日当たり約 5 0 m g、又は 1 日当たり 1 0 0 m g、

又は1日当たり150mg、又は1日当たり200mg、又は1日当たり250mg、又は1日当たり300mg、又は1日当たり350mg、又は1日当たり400mg、又は1日当たり450mgの用量で経口投与される、請求項11に記載の使用。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0132

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0132】

本明細書に記載されている実施例及び実施形態は、例示のために過ぎず、それに照らした様々な改変形態又は変更形態が当業者に示唆され、本出願の趣旨及び趣旨並びに添付の特許請求の範囲内に含まれることが理解される。

また、本発明は以下を提供する。

[1]

(E) - 3 - (4 - ((2 - (2 - (1, 1 - ジフルオロエチル) - 4 - フルオロフェニル) - 6 - ヒドロキシベンゾ [b] チオフェン - 3 - イル) オキシ) フェニル) アクリル酸又は薬学的に許容されるその塩と、(S) - ピロリジン - 1, 2 - ジカルボン酸 2 - アミド 1 - ({4 - メチル - 5 - [2 - (2, 2, 2 - トリフルオロ - 1, 1 - ジメチル - エチル) - ピリジン - 4 - イル] - チアゾール - 2 - イル} - アミド又は薬学的に許容されるその塩とを含む医薬品の組合せ。

[2]

(E) - 3 - (4 - ((2 - (2 - (1, 1 - ジフルオロエチル) - 4 - フルオロフェニル) - 6 - ヒドロキシベンゾ [b] チオフェン - 3 - イル) オキシ) フェニル) アクリル酸又は薬学的に許容されるその塩と、(S) - ピロリジン - 1, 2 - ジカルボン酸 2 - アミド 1 - ({4 - メチル - 5 - [2 - (2, 2, 2 - トリフルオロ - 1, 1 - ジメチル - エチル) - ピリジン - 4 - イル] - チアゾール - 2 - イル} - アミド又は薬学的に許容されるその塩は、別々に、同時に又は逐次的に任意の順序で投与される、[1]に記載の組合せ。

[3]

経口投与のためのものである、[1]又は[2]に記載の医薬品の組合せ。

[4]

(E) - 3 - (4 - ((2 - (2 - (1, 1 - ジフルオロエチル) - 4 - フルオロフェニル) - 6 - ヒドロキシベンゾ [b] チオフェン - 3 - イル) オキシ) フェニル) アクリル酸は、経口用量形態である、[1]又は[2]に記載の医薬品の組合せ。

[5]

(S) - ピロリジン - 1, 2 - ジカルボン酸 2 - アミド 1 - ({4 - メチル - 5 - [2 - (2, 2, 2 - トリフルオロ - 1, 1 - ジメチル - エチル) - ピリジン - 4 - イル] - チアゾール - 2 - イル} - アミドは、経口用量形態である、[1]又は[2]に記載の医薬品の組合せ。

[6]

[1] ~ [5] のいずれか一項に記載の医薬品の組合せと、少なくとも1種の薬学的に許容される担体とを含む医薬組成物。

[7]

癌の処置における使用のための、[1] ~ [5] のいずれか一項に記載の医薬品の組合せ又は[6]に記載の医薬組成物。

[8]

前記癌は、ER + 乳癌である、[7]に記載の医薬品の組合せ。

[9]

癌の処置のための医薬の製造のための、[1] ~ [5] のいずれか一項に記載の医薬品の組合せ又は[6]に記載の医薬組成物の使用。

[1 0]

前記癌は、E R + 乳癌である、[9]に記載の医薬品の組合せの使用。

[1 1]

野生型 E R + 乳癌を処置する方法であって、それを必要とする患者に、[1] ~ [5] のいずれか一項に記載の医薬品の組合せ又は[6]に記載の医薬組成物を投与することを含む方法。

[1 2]

E R + 乳癌を処置する方法であって、前記 E R + 乳癌は、E S R 1 変異を含有し、前記方法は、それを必要とする患者に、[1] ~ [5] のいずれか一項に記載の医薬品の組合せ又は[6]に記載の医薬組成物を投与することを含む、方法。

[1 3]

前記 E S R 1 変異は、M C R 7 が発現する E S R 1 変異である、[1 2]に記載の方法。

[1 4]

前記変異は、D 5 3 8 G、E 3 8 0 Q、Y 5 3 7 S、Y 5 3 7 N 及び Y 5 3 7 C からなる群から選択される、[1 3]に記載の方法。

[1 5]

前記変異は、D 5 3 8 G 及び Y 5 3 7 S から選択される、[1 4]に記載の方法。

[1 6]

(E) - 3 - (4 - ((2 - (2 - (1 , 1 - ジフルオロエチル) - 4 - フルオロフェニル) - 6 - ヒドロキシベンゾ [b] チオフェン - 3 - イル) オキシ) フェニル) アクリル酸は、1日当たり約 1 0 0 m g、又は1日当たり 2 0 0 m g、又は1日当たり 3 0 0 m g、又は1日当たり 4 0 0 m g、又は1日当たり 4 5 0 m g、又は1日当たり 5 0 0 m g、又は1日当たり 6 0 0 m g、又は1日当たり 9 0 0 m g の用量で経口投与される、[1 1] 又は [1 2] に記載の方法。

[1 7]

(S) - ピロリジン - 1 , 2 - ジカルボン酸 2 - アミド 1 - ({ 4 - メチル - 5 - [2 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - 1 , 1 - ジメチル - エチル) - ピリジン - 4 - イル] - チアゾール - 2 - イル } - アミドは、1日当たり約 5 0 m g、又は1日当たり 1 0 0 m g、又は1日当たり 1 5 0 m g、又は1日当たり 2 0 0 m g、又は1日当たり 2 5 0 m g、又は1日当たり 3 0 0 m g、又は1日当たり 3 5 0 m g、又は1日当たり 4 0 0 m g、又は1日当たり 4 5 0 m g の用量で経口投与される、[1 4] に記載の方法。