

【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23年8月4日 (2011.8.4)

【公表番号】特表2010-532364(P2010-532364A)

【公表日】平成22年10月7日 (2010.10.7)

【年通号数】公開・登録公報2010-040

【出願番号】特願2010-514996(P2010-514996)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/5513 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/4745 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 31/7068 (2006.01)

A 6 1 K 31/7048 (2006.01)

A 6 1 K 31/704 (2006.01)

A 6 1 K 33/24 (2006.01)

A 6 1 K 31/282 (2006.01)

A 6 1 K 31/513 (2006.01)

A 6 1 K 9/19 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/5513

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 31/4745

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 31/7068

A 6 1 K 31/7048

A 6 1 K 31/704

A 6 1 K 33/24

A 6 1 K 31/282

A 6 1 K 31/513

A 6 1 K 9/19

A 6 1 K 47/12

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 9/08

【手続補正書】

【提出日】平成23年6月20日 (2011.6.20)

【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】

卵巣癌、非小細胞肺癌又は大腸癌の治療のための、C P T - 1 1、ペメトレキセド、ゲ

ムシタピン、エトポシド、ドキソルビシン及びプラチナ化学療法剤からなる群から選ばれる化学療法剤と併用して使用する薬剤の調製のための、7 - (2, 5 - ジヒドロ - 4 - イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - イル - 2, 5 - ジオキソ - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 9 - フルオロ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 2 - (1 - ピペリジニルカルボニル) - ピロロ [3, 2, 1 - j k] [1, 4] - ベンゾジアゼピン又はその薬理的に許容できる塩もしくは溶媒和物の使用。

【請求項 2】

前記化学療法剤がプラチナ化学療法剤である、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 3】

前記プラチナ化学療法剤がシスプラチン又はカルボプラチンである、請求項 1 又は 2 のいずれかに記載の使用。

【請求項 4】

胃癌の治療のための 5 - フルオロウラシル及びプラチナ化学療法剤からなる群から選ばれる化学療法剤と併用して使用する薬剤の調製のための、7 - (2, 5 - ジヒドロ - 4 - イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - イル - 2, 5 - ジオキソ - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 9 - フルオロ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 2 - (1 - ピペリジニルカルボニル) - ピロロ [3, 2, 1 - j k] [1, 4] - ベンゾジアゼピン又はその薬理的に許容できる塩もしくは溶媒和物の使用。

【請求項 5】

卵巣癌、非小細胞肺癌又は大腸癌の治療における使用のための、CPT - 11、ペメトレキセド、ゲムシタピン、エトポシド、ドキソルビシン及びプラチナ化学療法剤からなる群から選ばれる化学療法剤と併用される、7 - (2, 5 - ジヒドロ - 4 - イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - イル - 2, 5 - ジオキソ - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 9 - フルオロ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 2 - (1 - ピペリジニルカルボニル) - ピロロ [3, 2, 1 - j k] [1, 4] - ベンゾジアゼピン又はその薬理的に許容できる塩もしくは溶媒和物。

【請求項 6】

胃癌の治療における使用のための、5 - フルオロウラシル及びプラチナ化学療法剤からなる群から選ばれる化学療法剤と併用される、7 - (2, 5 - ジヒドロ - 4 - イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - イル - 2, 5 - ジオキソ - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 9 - フルオロ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 2 - (1 - ピペリジニルカルボニル) - ピロロ [3, 2, 1 - j k] [1, 4] - ベンゾジアゼピン又はその薬理的に許容できる塩もしくは溶媒和物。

【請求項 7】

前記化学療法剤がプラチナ化学療法剤である、請求項 5 又は 6 のいずれかに記載の 7 - (2, 5 - ジヒドロ - 4 - イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - イル - 2, 5 - ジオキソ - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 9 - フルオロ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 2 - (1 - ピペリジニルカルボニル) - ピロロ [3, 2, 1 - j k] [1, 4] - ベンゾジアゼピン又はその薬理的に許容できる塩もしくは溶媒和物。

【請求項 8】

前記プラチナ化学療法剤がシスプラチン又はカルボプラチンである、請求項 5、6 又は 7 のいずれかに記載の 7 - (2, 5 - ジヒドロ - 4 - イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - イル - 2, 5 - ジオキソ - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 9 - フルオロ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 2 - (1 - ピペリジニルカルボニル) - ピロロ [3, 2, 1 - j k] [1, 4] - ベンゾジアゼピン又はその薬理的に許容できる塩もしくは溶媒和物。

【請求項 9】

a) 7 - (2, 5 - ジヒドロ - 4 - イミダゾ [1, 2 - a] ピリジン - 3 - イル - 2, 5 - ジオキソ - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 9 - フルオロ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロ - 2 - (1 - ピペリジニル - カルボニル) ピロロ [3, 2, 1 - j k] [1, 4] ベンゾジアゼピン又はその薬理的に許容できる塩もしくは溶媒和物を、少なくとも 1 モル

当量の S B E 7 - - C D 及び適宜薬理的に許容できるバッファを含有する水溶液に p H 5 . 5 未満にて添加すること、

b) 薬理的に許容できる酸又は塩基を用いて生成溶液の p H を 2 . 5 から 3 . 5 の間に調節すること、および

c) 前記生成溶液を適宜凍結乾燥すること
を含むステップによって得られる医薬組成物。

【請求項 1 0】

1 モル当量の 7 - (2 , 5 - ジヒドロ - 4 - イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - イル - 2 , 5 - ジオキソ - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 9 - フルオロ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 2 - (1 - ピペリジニルカルボニル) - ピロロ [3 , 2 , 1 - j k] [1 , 4] ベンゾジアゼピン又はその薬理的に許容できる塩もしくは溶媒和物、少なくとも 1 モル当量の S B E 7 - - C D 、 及び適宜薬理的に許容できるバッファを含む、注射又は点滴によって患者へ投与するのに適した溶液に水を用いて再構成可能な医薬組成物。

【請求項 1 1】

前記薬理的に許容できるバッファが存在する、請求項 1 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 2】

前記薬理的に許容できるバッファが酒石酸である、請求項 1 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 3】

1 モル当量の 7 - (2 , 5 - ジヒドロ - 4 - イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - イル - 2 , 5 - ジオキソ - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 9 - フルオロ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 2 - (1 - ピペリジニルカルボニル) - ピロロ [3 , 2 , 1 - j k] [1 , 4] ベンゾ - ジアゼピン及び少なくとも 1 モル当量の S B E 7 - - C D を含む、医薬組成物。

【請求項 1 4】

注射又は点滴によって患者へ投与するのに適した溶液に水を用いて再構成可能な 7 - 2 , 5 - ジヒドロ - 4 - イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - イル - 2 , 5 - ジオキソ - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 9 - フルオロ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 2 - (1 - ピペリジニル - カルボニル) ピロロ - [3 , 2 , 1 - j k] [1 , 4] ベンゾジアゼピンを含む医薬組成物の製造方法であって、

a) 7 - (2 , 5 - ジヒドロ - 4 - イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - イル - 2 , 5 - ジオキソ - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 9 - フルオロ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 2 - (1 - ピペリジニル - カルボニル) ピロロ [3 , 2 , 1 - j k] [1 , 4] ベンゾジアゼピン又はその薬理的に許容できる塩もしくは溶媒和物を、少なくとも 1 モル当量の S B E 7 - - C D 及び適宜薬理的に許容できるバッファを含有する水溶液に p H 5 . 5 未満にて添加すること、

b) 薬理的に許容できる酸又は塩基を用いて生成溶液の p H を 2 . 5 から 3 . 5 の間に調節すること、および

c) 前記生成溶液を凍結乾燥すること
を含む方法。

【請求項 1 5】

卵巣癌、非小細胞肺癌又は大腸癌の治療のための、ペメトレキセド及びプラチナ化学療法剤と併用して使用する薬剤の調製のための、7 - (2 , 5 - ジヒドロ - 4 - イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - イル - 2 , 5 - ジオキソ - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 9 - フルオロ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 2 - (1 - ピペリジニルカルボニル) - ピロロ [3 , 2 , 1 - j k] [1 , 4] - ベンゾジアゼピン又はその薬理的に許容できる塩もしくは溶媒和物の使用。

【請求項 1 6】

胃癌の治療のための 5 - フルオロウラシル及びプラチナ化学療法剤と併用して使用する薬剤の調製のための、7 - (2 , 5 - ジヒドロ - 4 - イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - イル - 2 , 5 - ジオキソ - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 9 - フルオロ - 1 , 2 , 3

、4 - テトラヒドロ - 2 - (1 - ピペリジニルカルボニル) - ピロロ [3 , 2 , 1 - j k] [1 , 4] - ベンゾジアゼピン又はその薬理的に許容できる塩もしくは溶媒和物の使用。

【請求項 17】

前記プラチナ化学療法剤がシスプラチン又はカルボプラチンである、請求項 15 又は 16 のいずれかに記載の使用。

【請求項 18】

卵巣癌、非小細胞肺癌又は大腸癌の治療における使用のための、ペメトレキセド及びプラチナ化学療法剤と併用される、7 - (2 , 5 - ジヒドロ - 4 - イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - イル - 2 , 5 - ジオキソ - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 9 - フルオロ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 2 - (1 - ピペリジニルカルボニル) - ピロロ [3 , 2 , 1 - j k] [1 , 4] - ベンゾジアゼピン又はその薬理的に許容できる塩もしくは溶媒和物。

【請求項 19】

胃癌の治療における使用のための、5 - フルオロウラシル及びプラチナ化学療法剤と併用される、7 - (2 , 5 - ジヒドロ - 4 - イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - イル - 2 , 5 - ジオキソ - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 9 - フルオロ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 2 - (1 - ピペリジニルカルボニル) - ピロロ [3 , 2 , 1 - j k] [1 , 4] - ベンゾジアゼピン又はその薬理的に許容できる塩もしくは溶媒和物。

【請求項 20】

前記プラチナ化学療法剤がシスプラチン又はカルボプラチンである、請求項 18 又は 19 のいずれかに記載の 7 - (2 , 5 - ジヒドロ - 4 - イミダゾ [1 , 2 - a] ピリジン - 3 - イル - 2 , 5 - ジオキソ - 1 H - ピロール - 3 - イル) - 9 - フルオロ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - 2 - (1 - ピペリジニルカルボニル) - ピロロ [3 , 2 , 1 - j k] [1 , 4] - ベンゾジアゼピン又はその薬理的に許容できる塩もしくは溶媒和物。