

【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6月14日 (2018.6.14)

【公表番号】特表2017-514907(P2017-514907A)

【公表日】平成29年6月8日 (2017.6.8)

【年通号数】公開・登録公報2017-021

【出願番号】特願2017-510449(P2017-510449)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/5517 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/38 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/5517

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 K 9/14

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/38

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

【手続補正書】

【提出日】平成30年4月24日 (2018.4.24)

【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】

(S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェニル) - 2 , 3 , 9 - トリメチル - 6 H - チエノ [3 , 2 - f] [1 , 2 , - 4] トリアゾロ [4 , 3 - a] [1 , 4] ジアゼピン - 6 - イル] - N - (4 - ヒドロキシフェニル) アセトアミドニ水和物又は (S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェニル) - 2 , 3 , 9 - トリメチル - 6 H - チエノ [3 , 2 - f] [1 , 2 , - 4] トリアゾロ [4 , 3 - a] [1 , 4] ジアゼピン - 6 - イル] - N - (4 - ヒドロキシフェニル) アセトアミドである化合物若しくはその医薬上許容される塩の医薬上許容される量を含有する哺乳動物における耐性非ホジキンリンパ腫、髄芽腫、及び / 又は A L K + 非小細胞肺癌の治療剤。

【請求項 2】

化合物が、 (S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェニル) - 2 , 3 , 9 - トリメチル - 6 H - チエノ [3 , 2 - f] [1 , 2 , - 4] トリアゾロ [4 , 3 - a] [1 , 4] ジアゼピン - 6 - イル] - N - (4 - ヒドロキシフェニル) アセトアミドニ水和物である請求項 1 に記載の治療剤。

【請求項 3】

化合物が、(S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェニル) - 2 , 3 , 9 - トリメチル - 6 H - チエノ [3 , 2 - f] [1 , 2 , - 4] トリアゾロ [4 , 3 - a] [1 , 4] ジアゼピン - 6 - イル] - N - (4 - ヒドロキシフェニル) アセトアミドである請求項1に記載の治療剤。

【請求項 4】

化合物が、固体分散体として形成する請求項 1 ~ 3 の何れか 1 項に記載の治療剤。

【請求項 5】

固体分散体が、約 130 ないし約 140 の範囲内でガラス転移温度 (T g) の単一の変曲点を示す請求項4に記載の治療剤。

【請求項 6】

固体分散体が、約 175 ないし約 185 の範囲内でガラス転移温度 (T g) の単一の変曲点を示す請求項4に記載の治療剤。

【請求項 7】

固体分散体が、(S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェニル) - 2 , 3 , 9 - トリメチル - 6 H - チエノ [3 , 2 - f] [1 , 2 , - 4] トリアゾロ [4 , 3 - a] [1 , 4] ジアゼピン - 6 - イル] - N - (4 - ヒドロキシフェニル) アセトアミド二水和物の非晶質化合物又はその医薬上許容される塩又はその水和物；及び医薬上許容されるポリマーを含む請求項4に記載の治療剤。

【請求項 8】

固体分散体が、(S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェニル) - 2 , 3 , 9 - トリメチル - 6 H - チエノ [3 , 2 - f] [1 , 2 , - 4] トリアゾロ [4 , 3 - a] [1 , 4] ジアゼピン - 6 - イル] - N - (4 - ヒドロキシフェニル) アセトアミド二水和物の結晶質化合物に関連する回折線を実質的に含まない粉末 X 線回折パターンを示す請求項7に記載の治療剤。

【請求項 9】

固体分散体が、噴霧乾燥により得られる請求項8に記載の治療剤。

【請求項 10】

医薬上許容されるポリマーが、PVPである請求項7に記載の治療剤。

【請求項 11】

固体分散体が、(S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェニル) - 2 , 3 , 9 - トリメチル - 6 H - チエノ [3 , 2 - f] [1 , 2 , - 4] トリアゾロ [4 , 3 - a] [1 , 4] ジアゼピン - 6 - イル] - N - (4 - ヒドロキシフェニル) アセトアミド二水和物を PVP に対して 1 : 3 ないし 1 : 1 の重量比で有する請求項10に記載の治療剤。

【請求項 12】

医薬上許容されるポリマーが、ヒドロキシプロピルメチルセルロースアセテートスクシネート (HPMCAS) である請求項7に記載の治療剤。

【請求項 13】

固体分散体が、(S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェニル) - 2 , 3 , 9 - トリメチル - 6 H - チエノ [3 , 2 - f] [1 , 2 , - 4] トリアゾロ [4 , 3 - a] [1 , 4] ジアゼピン - 6 - イル] - N - (4 - ヒドロキシフェニル) アセトアミド二水和物を HPMCAS に対して 1 : 3 ないし 1 : 1 の重量比で有する請求項12に記載の治療剤。

【請求項 14】

髄芽腫が、古典的髄芽腫、線維形成性結節性髄芽腫、大細胞髄芽腫、神経芽分化又は神経分化を伴う髄芽腫、グリア分化を伴う髄芽腫、髄芽筋芽細胞腫、又はメラニン細胞性髄芽腫である請求項 1 ~ 13 の何れか 1 項に記載の治療剤。

【請求項 15】

髄芽腫が、Wnt 髄芽腫、Shh 髄芽腫、第 3 群髄芽腫又は第 4 群髄芽腫である請求項 1 ~ 13 の何れか 1 項に記載の治療剤。

【請求項 16】

Wnt 髄芽腫が、Wnt 髄芽腫又は Wnt 髄芽腫である請求項15に記載の治

療剤。

【請求項 17】

S h h 髄芽腫が、S h h 髄芽腫、S h h 髄芽腫、又は S h h 髄芽腫である請求項 15 に記載の治療剤。

【請求項 18】

A L K + 非小細胞肺癌が、約 10 % を上回る A L K 遺伝子活性を有する腫瘍細胞により特徴付けられる請求項 1 ~ 13 の何れか 1 項に記載の治療剤。

【請求項 19】

A L K + 非小細胞肺癌が、約 15 % を上回る A L K 遺伝子活性を有する腫瘍細胞により特徴付けられる請求項 1 ~ 13 の何れか 1 項に記載の治療剤。

【請求項 20】

A L K + 非小細胞肺癌が、A L K 遺伝子に融合した E M L 4 遺伝子を有する腫瘍細胞を含む請求項 18 及び 19 の何れか 1 項に記載の治療剤。

【請求項 21】

A L K + 非小細胞肺癌が、A L K 遺伝子に融合した K I F 5 B 遺伝子、T F G 遺伝子、又は K L C 1 遺伝子を有する腫瘍細胞を含む請求項 18 及び 19 の何れか 1 項に記載の治療剤。

【請求項 22】

耐性非ホジキンリンパ腫が、B 細胞非ホジキンリンパ腫又は T 細胞非ホジキンリンパ腫である請求項 1 ~ 13 の何れか 1 項に記載の治療剤。

【請求項 23】

耐性非ホジキンリンパ腫が、パーキットリンパ腫、慢性リンパ性白血病 / 小リンパ球性リンパ腫、びまん性大細胞型 B 細胞リンパ腫、濾胞性リンパ腫、免疫芽球性大細胞型リンパ腫、前駆 B リンパ芽球性リンパ腫、及びマントル細胞リンパ腫からなる群から選ばれる請求項 22 に記載の治療剤。

【請求項 24】

耐性非ホジキンリンパ腫が、菌状息肉腫、未分化大細胞型リンパ腫、及び前駆 T リンパ芽球性リンパ腫からなる群から選ばれる請求項 22 に記載の治療剤。

【請求項 25】

耐性非ホジキンリンパ腫が、びまん性大細胞型 B 細胞リンパ腫又はマントル細胞リンパ腫である請求項 22 に記載の治療剤。

【請求項 26】

m T O R 阻害剤、B T K 阻害剤、H D A C 阻害剤、抗 C D 20 モノクローナル抗体、D N A メチルトランスフェラーゼ阻害剤、免疫調節薬、又はそれらの組み合わせからなる群から選ばれる第二の薬剤と組み合わせられる請求項 23 ~ 25 の何れか 1 項に記載の治療剤。

【請求項 27】

耐性非ホジキンリンパ腫、髄芽腫、及び / 又は A L K + 非小細胞肺癌の治療剤を製造するための、(S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェニル) - 2 , 3 , 9 - トリメチル - 6 H - チエノ [3 , 2 - f] [1 , 2 , - 4] トリアゾロ [4 , 3 - a] [1 , 4] ジアゼピン - 6 - イル] - N - (4 - ヒドロキシフェニル) アセトアミド二水和物又は (S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェニル) - 2 , 3 , 9 - トリメチル - 6 H - チエノ [3 , 2 - f] [1 , 2 , - 4] トリアゾロ [4 , 3 - a] [1 , 4] ジアゼピン - 6 - イル] - N - (4 - ヒドロキシフェニル) アセトアミド若しくはその医薬上許容される塩の使用。

【請求項 28】

耐性非ホジキンリンパ腫、髄芽腫、及び / 又は A L K + 非小細胞肺癌の治療剤を製造するための、(S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェニル) - 2 , 3 , 9 - トリメチル - 6 H - チエノ [3 , 2 - f] [1 , 2 , - 4] トリアゾロ [4 , 3 - a] [1 , 4] ジアゼピン - 6 - イル] - N - (4 - ヒドロキシフェニル) アセトアミド二水和物の使用。

【請求項 29】

耐性非ホジキンリンパ腫、髄芽腫、及び／又は A L K + 非小細胞肺癌の治療剤を製造するための、(S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェニル) - 2 , 3 , 9 - トリメチル - 6 H - チエノ [3 , 2 - f] [1 , 2 , - 4] トリアゾロ [4 , 3 - a] [1 , 4] ジアゼピン - 6 - イル] - N - (4 - ヒドロキシフェニル) アセトアミド二水和物又は (S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェニル) - 2 , 3 , 9 - トリメチル - 6 H - チエノ [3 , 2 - f] [1 , 2 , - 4] トリアゾロ [4 , 3 - a] [1 , 4] ジアゼピン - 6 - イル] - N - (4 - ヒドロキシフェニル) アセトアミド若しくはその医薬上許容される塩及び医薬上許容されるポリマーの固体分散体の使用。

【請求項 30】

耐性非ホジキンリンパ腫、髄芽腫、及び／又は A L K + 非小細胞肺癌の治療剤を製造するための、(S) - 2 - [4 - (4 - クロロフェニル) - 2 , 3 , 9 - トリメチル - 6 H - チエノ [3 , 2 - f] [1 , 2 , - 4] トリアゾロ [4 , 3 - a] [1 , 4] ジアゼピン - 6 - イル] - N - (4 - ヒドロキシフェニル) アセトアミド二水和物及び医薬上許容されるポリマーの固体分散体の使用。