

【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8月12日(2016.8.12)

【公表番号】特表2015-525754(P2015-525754A)

【公表日】平成27年9月7日(2015.9.7)

【年通号数】公開・登録公報2015-056

【出願番号】特願2015-521001(P2015-521001)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 K 47/40 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 9/08

C 0 7 D 487/04 1 4 5

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 47/40

【手続補正書】

【提出日】平成28年6月21日(2016.6.21)

【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】

化合物 1 - (6 - { [6 - (4 - フルオロフェニル) [1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3 - b] ピリダジン - 3 - イル] スルファニル} - 1, 3 - ベンゾチアゾール - 2 - イル) - 3 - (2 - モルホリン - 4 - イルエチル) 尿素、または薬学的に許容されるその塩と、シクロデキストリンとを含む、濃縮された液体水性医薬組成物。

【請求項 2】

シクロデキストリンは、スルホブチルエーテル β - シクロデキストリンナトリウムである、請求項 1 に記載の濃縮された液体水性医薬組成物。

【請求項 3】

シクロデキストリンの濃度は、10 ~ 50 % w / v である、請求項 1 または 2 に記載の濃縮された液体水性医薬組成物。

【請求項 4】

シクロデキストリンの濃度は、約 40 % w / v である、請求項 3 に記載の濃縮された液体水性医薬組成物。

【請求項 5】

pH は、2.5 ~ 4.0 である、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の濃縮された液体水性医薬組成物。

【請求項 6】

pH は、2.5 ~ 3.5 である、請求項 5 に記載の濃縮された液体水性医薬組成物。

【請求項 7】

化合物 1 - (6 - { [6 - (4 - フルオロフェニル) [1, 2, 4] トリアゾロ [4,

3-b] ピリダジン-3-イル] スルファニル} - 1, 3-ベンゾチアゾール-2-イル) - 3 - (2-モルホリン-4-イルエチル) 尿素、または薬学的に許容されるその塩の濃度は、5 ~ 20 mg/mL である、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の濃縮された液体水性医薬組成物。

【請求項 8】

化合物 1 - (6 - { [6 - (4-フルオロフェニル) [1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-b] ピリダジン-3-イル] スルファニル} - 1, 3-ベンゾチアゾール-2-イル) - 3 - (2-モルホリン-4-イルエチル) 尿素、または薬学的に許容されるその塩の濃度は、10 mg/mL または 15 mg/mL である、請求項 7 に記載の濃縮された液体水性医薬組成物。

【請求項 9】

— 10 mg/mL の化合物 1 - (6 - { [6 - (4-フルオロフェニル) [1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-b] ピリダジン-3-イル] スルファニル} - 1, 3-ベンゾチアゾール-2-イル) - 3 - (2-モルホリン-4-イルエチル) 尿素、または薬学的に許容されるその塩と、

— 40 % w/v のスルホブチルエーテル β -シクロデキストリンナトリウム
とを含み、
pH 3.0 を有する、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の濃縮された液体水性医薬組成物。

【請求項 10】

— 15 mg/mL の化合物 1 - (6 - { [6 - (4-フルオロフェニル) [1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-b] ピリダジン-3-イル] スルファニル} - 1, 3-ベンゾチアゾール-2-イル) - 3 - (2-モルホリン-4-イルエチル) 尿素、または薬学的に許容されるその塩と、

— 40 % w/v のスルホブチルエーテル β -シクロデキストリンナトリウム
とを含み、
pH 3.0 を有する、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の濃縮された液体水性医薬組成物。

【請求項 11】

化合物 1 - (6 - { [6 - (4-フルオロフェニル) [1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-b] ピリダジン-3-イル] スルファニル} - 1, 3-ベンゾチアゾール-2-イル) - 3 - (2-モルホリン-4-イルエチル) 尿素、または薬学的に許容されるその塩と、シクロデキストリンと、注入媒体とを含む、希釈された液体水性医薬組成物。

【請求項 12】

注入媒体は、塩化ナトリウム水溶液またはデキストロース溶液である、請求項 11 に記載の希釈された液体水性医薬組成物。

【請求項 13】

化合物 1 - (6 - { [6 - (4-フルオロフェニル) [1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-b] ピリダジン-3-イル] スルファニル} - 1, 3-ベンゾチアゾール-2-イル) - 3 - (2-モルホリン-4-イルエチル) 尿素/シクロデキストリンの重量比は、1/40 である、請求項 11 または 12 に記載の希釈された液体水性医薬組成物。

【請求項 14】

化合物 1 - (6 - { [6 - (4-フルオロフェニル) [1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-b] ピリダジン-3-イル] スルファニル} - 1, 3-ベンゾチアゾール-2-イル) - 3 - (2-モルホリン-4-イルエチル) 尿素/シクロデキストリンの重量比は、1/26.7 である、請求項 11 または 12 に記載の希釈された液体水性医薬組成物。

【請求項 15】

がん治療に使用される、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の濃縮された液体水性医薬組成物。

【請求項 16】

がん治療に使用される、請求項 11～14 のいずれか 1 項に記載の希釈された液体水性医薬組成物。

【請求項 17】

化合物の用量が $25 \sim 960 \text{ mg/m}^2$ でがん治療に使用される、化合物 1- (6- { [6- (4-フルオロフェニル) [1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-b] ピリダジン-3-イル] スルファニル} -1, 3-ベンゾチアゾール-2-イル) -3- (2-モルホリン-4-イルエチル) 尿素、または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 18】

化合物の用量が、以下の：25、50、75、100、150、200、250、260、300、340、350、400、440、450、570、500、550、600、650、700、740、750、800、850、900、950 および 960 mg/m^2 から選択される、請求項 17 に記載の化合物 1- (6- { [6- (4-フルオロフェニル) [1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-b] ピリダジン-3-イル] スルファニル} -1, 3-ベンゾチアゾール-2-イル) -3- (2-モルホリン-4-イルエチル) 尿素、または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 19】

化合物の用量が、以下の：260、340、440、570、740 および 960 mg/m^2 から選択される、請求項 18 に記載の化合物 1- (6- { [6- (4-フルオロフェニル) [1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-b] ピリダジン-3-イル] スルファニル} -1, 3-ベンゾチアゾール-2-イル) -3- (2-モルホリン-4-イルエチル) 尿素、または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 20】

化合物の用量が、 570 mg/m^2 である、請求項 19 に記載の化合物 1- (6- { [6- (4-フルオロフェニル) [1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-b] ピリダジン-3-イル] スルファニル} -1, 3-ベンゾチアゾール-2-イル) -3- (2-モルホリン-4-イルエチル) 尿素、または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 21】

化合物の用量が、 440 mg/m^2 である、請求項 19 に記載の化合物 1- (6- { [6- (4-フルオロフェニル) [1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-b] ピリダジン-3-イル] スルファニル} -1, 3-ベンゾチアゾール-2-イル) -3- (2-モルホリン-4-イルエチル) 尿素、または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 22】

がんは、進行性固形腫瘍である、請求項 17～21 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 23】

がんは、MET 遺伝子増幅腫瘍である、請求項 22 に記載の化合物。

【請求項 24】

進行性固形腫瘍の治療に使用される、化合物 1- (6- { [6- (4-フルオロフェニル) [1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-b] ピリダジン-3-イル] スルファニル} -1, 3-ベンゾチアゾール-2-イル) -3- (2-モルホリン-4-イルエチル) 尿素、または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 25】

MET 遺伝子増幅腫瘍の治療に使用される、請求項 24 に記載の化合物 1- (6- { [6- (4-フルオロフェニル) [1, 2, 4] トリアゾロ [4, 3-b] ピリダジン-3-イル] スルファニル} -1, 3-ベンゾチアゾール-2-イル) -3- (2-モルホリン-4-イルエチル) 尿素、または薬学的に許容されるその塩。

【請求項 26】

化合物は、非経口投与される、請求項 17～25 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 27】

化合物は、静脈内注入によって投与される、請求項 26 に記載の化合物。

【請求項 28】

化合物は、請求項 1 ～ 1 0 に記載の濃縮された液体水性医薬組成物として製剤化される、請求項 1 7 ～ 2 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 2 9】

治療は、

a) 請求項 1 ～ 1 0 のいずれか 1 項に規定した濃縮された液体水性医薬組成物を注入媒体で希釈し、請求項 1 1 ～ 1 4 のいずれか 1 項に規定した希釈された液体水性医薬組成物を得ること、および

b) 請求項 1 1 ～ 1 4 のいずれか 1 項に規定した、得られた希釈された液体水性医薬組成物を、患者に投与すること

からなる工程を含む、

請求項 2 8 に記載の化合物。

【請求項 3 0】

注入媒体は、塩化ナトリウム水溶液またはデキストロース溶液である、請求項 2 9 に記載の化合物。

【請求項 3 1】

化合物は、週 1 回投与される、請求項 1 7 ～ 3 0 のいずれか 1 項に記載の化合物。