

【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29年11月16日 (2017.11.16)

【公表番号】特表2016-532657(P2016-532657A)

【公表日】平成28年10月20日 (2016.10.20)

【年通号数】公開・登録公報2016-060

【出願番号】特願2016-521344(P2016-521344)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/14 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 21/04 (2006.01)

A 6 1 P 17/14 (2006.01)

A 6 1 P 21/02 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 27/16 (2006.01)

A 6 1 P 19/08 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 5/14 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

A 6 1 K 47/36 (2006.01)

A 6 1 K 47/26 (2006.01)

A 6 1 K 47/12 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 37/00

A 6 1 P 9/14

A 6 1 P 3/00

A 6 1 P 21/04

A 6 1 P 17/14

A 6 1 P 21/02

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 27/16

A 6 1 P 19/08

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 5/14

A 6 1 P 19/02  
 A 6 1 P 29/00 1 0 1  
 A 6 1 P 29/00  
 A 6 1 K 9/48  
 A 6 1 K 47/36  
 A 6 1 K 47/26  
 A 6 1 K 47/12

【手続補正書】

【提出日】平成29年10月5日(2017.10.5)

【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

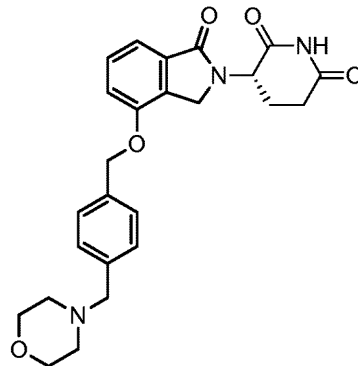
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

カプセル形態の経口剤形であって、1) 該剤形の総重量の約0.1乃至約3重量%の量の下記構造の化合物A：

【化 1】



又はその薬学的に許容され得るプロドラッグ、塩、溶媒和物、水和物、包接化合物、立体異性体、互変異性体、もしくはラセミ混合物と；2) 該経口剤形の総重量の約90乃至99.9重量%の量の担体又は賦形剤であって、澱粉と乳糖との混合物である前記担体又は賦形剤と；3) 滑沢剤であって、ステアリン酸である前記滑沢剤とを含む、前記経口剤形。

【請求項 2】

化合物Aが、前記剤形の総重量の約0.1乃至約1重量%の量で存在する、請求項 1 記載の経口剤形。

【請求項 3】

前記担体又は賦形剤が、前記剤形の総重量の約95乃至約99.9重量%の量で存在する、請求項 1 記載の経口剤形。

【請求項 4】

前記経口剤形中における乳糖：澱粉の比率が、約1:1乃至約5:1である、請求項 1 記載の経口剤形。

【請求項 5】

前記経口剤形中における乳糖：澱粉の比率が、約3:1である、請求項 4 記載の経口剤形。

【請求項 6】

前記澱粉が、アルファ化澱粉である、請求項 1 記載の経口剤形。

【請求項 7】

前記乳糖が、無水乳糖である、請求項 1 記載の経口剤形。

【請求項 8】

前記滑沢剤が、前記剤形の総重量の0.01乃至1重量%の量で存在する、請求項 1 記載の経口剤形。

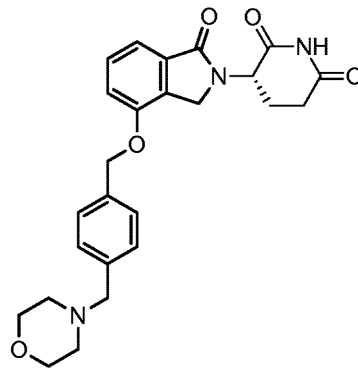
【請求項 9】

前記滑沢剤が、前記剤形の総重量の0.1乃至0.5重量%の量で存在する、請求項 8 記載の経口剤形。

【請求項 10】

約75mgの重さがあり、且つ、1)0.3mgの化合物Aの効能を提供する量の下記構造の化合物A：

【化 2】



又はその薬学的に許容され得るプロドラッグ、塩、溶媒和物、水和物、包接化合物、立体異性体、互変異性体、もしくはラセミ混合物と；2)薬学的に許容され得る担体又は賦形剤であって、澱粉と乳糖との混合物である前記担体又は賦形剤と；3)滑沢剤であって、ステアリン酸である前記滑沢剤とを含む、請求項 1 記載の経口剤形。

【請求項 11】

前記澱粉が、アルファ化澱粉である、請求項 10 記載の経口剤形。

【請求項 12】

前記アルファ化澱粉が、約18.075mgの量で存在する、請求項 11 記載の経口剤形。

【請求項 13】

前記ステアリン酸が、約0.225mgの量で存在する、請求項 10 記載の経口剤形。

【請求項 14】

前記乳糖が、無水乳糖である、請求項 10 記載の経口剤形。

【請求項 15】

前記無水乳糖が、組成物の総重量を約75mgとする量で存在する、請求項 14 記載の経口剤形。

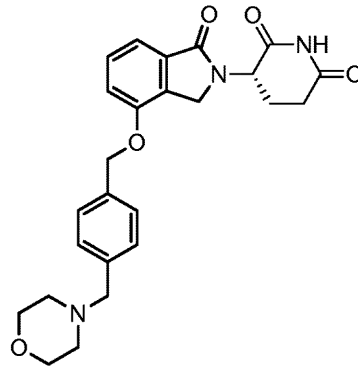
【請求項 16】

サイズ4以上のカプセルの形態で投与されるものである、請求項 10 記載の経口剤形。

【請求項 17】

約75mgの重さがあり、且つ、1)0.1mgの化合物Aの効能を提供する量の下記構造の化合物A：

## 【化 3】



又はその薬学的に許容され得るプロドラッグ、塩、溶媒和物、水和物、包接化合物、立体異性体、互変異性体、もしくはラセミ混合物と；2) 薬学的に許容され得る担体又は賦形剤であって、澱粉と乳糖との混合物である前記担体又は賦形剤と；3) 滑沢剤であって、ステアリン酸である前記滑沢剤とを含む、請求項 1 記載の経口剤形。

## 【請求項 18】

前記澱粉が、アルファ化澱粉である、請求項 17 記載の経口剤形。

## 【請求項 19】

前記アルファ化澱粉が、約18.75mgの量で存在する、請求項 18 記載の経口剤形。

## 【請求項 20】

前記ステアリン酸が、約0.225mgの量で存在する、請求項 17 記載の経口剤形。

## 【請求項 21】

前記乳糖が、無水乳糖である、請求項 17 記載の経口剤形。

## 【請求項 22】

前記無水乳糖が、組成物の総重量を約75mgとする量で存在する、請求項 21 記載の経口剤形。

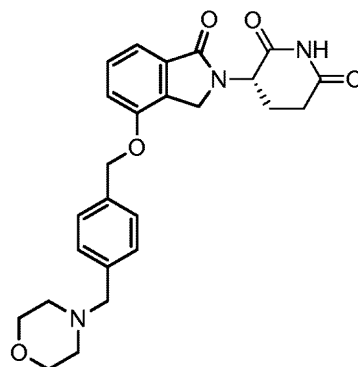
## 【請求項 23】

サイズ4以上のカプセルの形態で投与されるものである、請求項 17 記載の経口剤形。

## 【請求項 24】

約150mgの重さがあり、且つ、1)0.2mgの化合物Aの効能を提供する量の下記構造の化合物A：

## 【化 4】



又はその薬学的に許容され得るプロドラッグ、塩、溶媒和物、水和物、包接化合物、立体異性体、互変異性体、もしくはラセミ混合物と；2) 薬学的に許容され得る担体又は賦形剤であって、澱粉と乳糖との混合物である前記担体又は賦形剤と；3) 滑沢剤であって、ステアリン酸である前記滑沢剤とを含む、請求項 1 記載の経口剤形。

## 【請求項 25】

前記澱粉が、アルファ化澱粉である、請求項 24 記載の経口剤形。

## 【請求項 26】

前記アルファ化澱粉が、約37.5mgの量で存在する、請求項 25 記載の経口剤形。

## 【請求項 27】

前記ステアリン酸が、約0.45mgの量で存在する、請求項 24 記載の経口剤形。

## 【請求項 28】

前記乳糖が、無水乳糖である、請求項 24 記載の経口剤形。

## 【請求項 29】

前記無水乳糖が、組成物の総重量を約150mgとする量で存在する、請求項 28 記載の経口剤形。

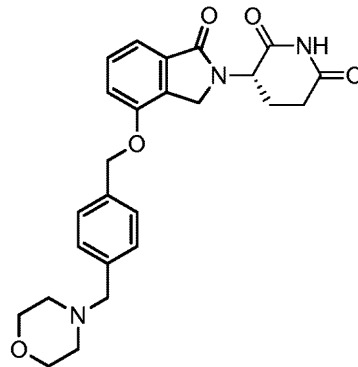
## 【請求項 30】

サイズ3以上のカプセルの形態で投与されるものである、請求項 24 記載の経口剤形。

## 【請求項 31】

約125mgの重さがあり、且つ、1)0.5mgの化合物Aの効能を提供する量の下記構造の化合物A：

## 【化 5】



又はその薬学的に許容され得るプロドラッグ、塩、溶媒和物、水和物、包接化合物、立体異性体、互変異性体、もしくはラセミ混合物と；2)薬学的に許容され得る担体又は賦形剤であって、澱粉と乳糖との混合物である前記担体又は賦形剤と；3)滑沢剤であって、ステアリン酸である前記滑沢剤とを含む、請求項 1 記載の経口剤形。

## 【請求項 32】

前記澱粉が、アルファ化澱粉である、請求項 31 記載の経口剤形。

## 【請求項 33】

前記アルファ化澱粉が、約31.25mgの量で存在する、請求項 32 記載の経口剤形。

## 【請求項 34】

前記ステアリン酸が、約0.375mgの量で存在する、請求項 31 記載の経口剤形。

## 【請求項 35】

前記乳糖が、無水乳糖である、請求項 31 記載の経口剤形。

## 【請求項 36】

前記無水乳糖が、組成物の総重量を約125mgとする量で存在する、請求項 35 記載の経口剤形。

## 【請求項 37】

サイズ3以上のカプセルの形態で投与されるものである、請求項 31 記載の経口剤形。

## 【請求項 38】

疾患又は障害を治療、予防、又は管理するための方法における使用のための請求項 1 乃至 37 のいずれか一項記載の経口剤形であって、当該方法は、患者に当該経口剤形を投与することを含み、当該疾患又は障害は、癌、ループス、強皮症、凍傷状狼瘡、サルコイドーシス、シェーグレン症候群、ANCA-誘導脈管炎、抗リン脂質症候群、重症筋無力症、アジソン病、円形脱毛症、強直性脊椎炎、抗リン脂質抗体症候群、抗リン脂質症候群、特に原発性又は続発性の抗リン脂質症候群、喘息、自己免疫性胃炎、自己免疫性溶血性貧血、

自己免疫性肝炎、自己免疫性内耳疾患、自己免疫性リンパ増殖性疾患、自己免疫性血小板減少性紫斑病、パロー病、ベーチェット病、水疱性類天疱瘡、心筋ミオパチー、セリアック病、シャーガス病、慢性炎症性脱髄性多発神経炎、良性粘膜類天疱瘡、特に粘膜類天疱瘡、寒冷凝集素症、デゴス病、ヘルペス状皮膚炎、本態性混合型クリオグロブリン血症、グッドパスチャー症候群、グレーブス病、ギラン・バレー症候群、橋本甲状腺炎（橋本病；自己免疫性甲状腺炎）、特発性肺線維症、特発性血小板減少性紫斑病、IgA腎症、若年性関節炎、扁平苔癬、メニエール病、混合性結合組織病、限局性強皮症、ナルコレプシー、神経性筋緊張病、小児自己免疫性神経精神疾患（PANDA）、尋常性天疱瘡、悪性貧血、結節性多発動脈炎、多発性軟骨炎、リウマチ性多発筋痛、原発性無ガンマグロブリン血症、原発性胆汁性肝硬変、レイノー病（レイノー現象）、ライター症候群、再発性多発性軟骨炎、リウマチ熱、シェーグレン症候群、全身硬直症候群（メルシュ・ヴォルトマン症候群）、高安動脈炎、側頭動脈炎（巨細胞性動脈炎）、ブドウ膜炎、脈管炎、特にエリテマトーデスに関連していない脈管炎、白斑、又はウェゲナー肉芽腫症である、経口剤形。

【請求項 39】

前記疾患又は障害が、癌であり、該癌が、進行性悪性腫瘍、アミロイド症、神経芽細胞腫、髄膜腫、血管周囲細胞腫、多発性脳転移、膠芽細胞腫多形型、膠芽細胞腫、脳幹神経膠腫、予後不良の悪性脳腫瘍、悪性神経膠腫、未分化星状細胞腫、退形成性乏突起膠腫、神経内分泌腫瘍、直腸腺癌、デュークスC&D大腸癌、切除不能大腸癌、転移性肝細胞癌、カボジ肉腫、核型急性骨髄芽球性白血病、ホジキンリンパ腫、非ホジキンリンパ腫、皮膚T細胞リンパ腫、皮膚B細胞リンパ腫、びまん性大細胞型B細胞リンパ腫、低悪性度濾胞性リンパ腫、悪性黒色腫、悪性中皮腫、悪性胸水中皮腫症候群、腹膜癌、乳頭漿液性癌、婦人科肉腫、軟部組織肉腫、強皮症、皮膚血管炎、ランゲルハンス細胞組織球症、平滑筋肉腫、進行性骨化性線維形成異常症、ホルモン抵抗性前立腺癌、切除された高リスク軟部組織肉腫、切除不能肝細胞癌、ヴァンデンストレームのマクログロブリン血症、くすぶり型骨髄腫、無痛性骨髄腫、卵管癌、アンドロゲン非依存性前立腺癌、アンドロゲン依存性ステージIV非転移性前立腺癌、ホルモン非感受性前立腺癌、化学療法非感受性前立腺癌、甲状腺乳頭癌、濾胞性甲状腺癌、甲状腺髄様癌、又は平滑筋腫である、請求項 38 記載の使用のための経口剤形。

【請求項 40】

前記疾患又は障害が、癌であり、該癌が、血液感染性腫瘍である、請求項 38 記載の使用のための経口剤形。

【請求項 41】

前記疾患又は障害が、癌であり、該癌が、骨髄腫、白血病、又はリンパ腫である、請求項 38 記載の使用のための経口剤形。

【請求項 42】

前記疾患又は障害が、癌であり、該癌が、固体腫瘍である、請求項 38 記載の使用のための経口剤形。

【請求項 43】

前記疾患又は障害が、癌であり、該癌が、乳癌、結腸直腸癌、卵巢癌、前立腺癌、膵臓癌、又は腎臓癌である、請求項 38 記載の使用のための経口剤形。

【請求項 44】

前記疾患又は障害が、癌であり、該癌が、肝細胞癌、前立腺癌、卵巢癌、又は膠芽細胞腫である、請求項 38 記載の使用のための経口剤形。

【請求項 45】

前記疾患又は障害が、癌であり、該癌が、非ホジキンリンパ腫である、請求項 38 記載の使用のための経口剤形。

【請求項 46】

前記非ホジキンリンパ腫が、びまん性大細胞型B細胞リンパ腫である、請求項 45 記載の使用のための経口剤形。

【請求項 47】

前記びまん性大細胞型B細胞リンパ腫が、活性化されたB細胞フェノタイプのリンパ腫である、請求項46記載の使用のための経口剤形。

【請求項48】

前記びまん性大細胞型B細胞リンパ腫が、RIVA、U2932、TMD8又はOCI-Ly10細胞株中で過剰発現された1種以上のバイオマーカーの発現によって特徴付けられている、請求項47記載の使用のための経口剤形。

【請求項49】

前記癌が、再発したか又は難治性である、請求項38乃至48のいずれか一項記載の使用のための経口剤形。

【請求項50】

前記癌が、薬物抵抗性である、請求項38乃至49のいずれか一項記載の使用のための経口剤形。