

【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 61 K 31/5377 (2006.01)  
A 61 P 35/00 (2006.01)  
A 61 P 13/12 (2006.01)  
A 61 P 17/00 (2006.01)  
A 61 P 37/00 (2006.01)  
A 61 P 9/14 (2006.01)  
A 61 P 3/00 (2006.01)  
A 61 P 21/04 (2006.01)  
A 61 P 17/14 (2006.01)  
A 61 P 21/02 (2006.01)  
A 61 P 11/06 (2006.01)  
A 61 P 1/04 (2006.01)  
A 61 P 1/16 (2006.01)  
A 61 P 27/16 (2006.01)  
A 61 P 19/08 (2006.01)  
A 61 P 25/00 (2006.01)  
A 61 P 5/14 (2006.01)  
A 61 P 19/02 (2006.01)  
A 61 P 29/00 (2006.01)  
A 61 K 9/48 (2006.01)  
A 61 K 47/36 (2006.01)  
A 61 K 47/26 (2006.01)  
A 61 K 47/12 (2006.01)

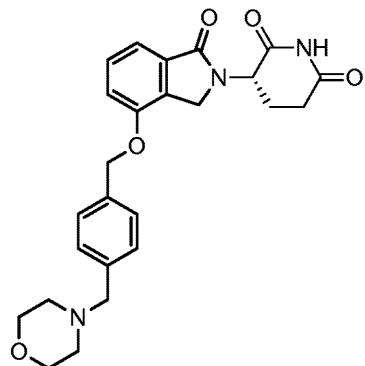
【F I】

A 61 K 31/5377  
A 61 P 35/00  
A 61 P 13/12  
A 61 P 17/00  
A 61 P 37/00  
A 61 P 9/14  
A 61 P 3/00  
A 61 P 21/04  
A 61 P 17/14  
A 61 P 21/02  
A 61 P 11/06  
A 61 P 1/04  
A 61 P 1/16  
A 61 P 27/16  
A 61 P 19/08  
A 61 P 25/00  
A 61 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。

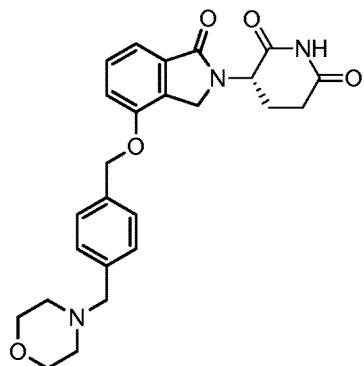
**【請求項9】**

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。

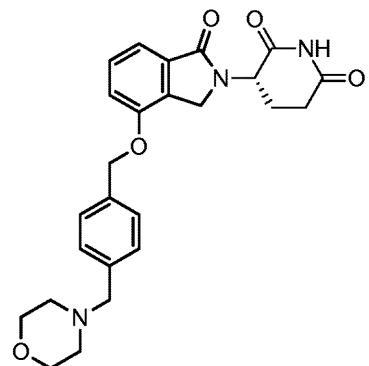
**【請求項16】**

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。

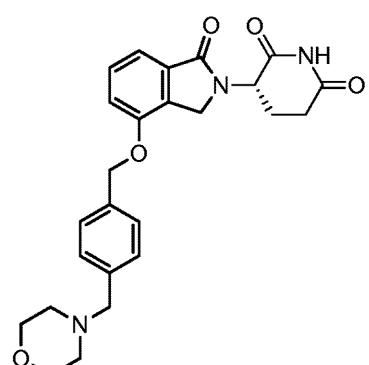
## 【請求項23】

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 2 6】**

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 2 7】**

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 2 8】**

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 2 9】**

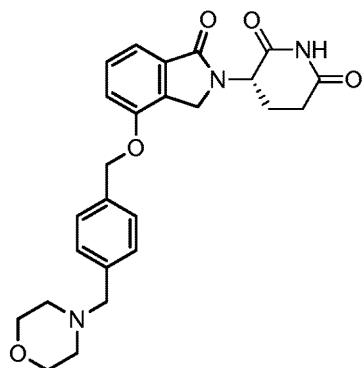
前記無水乳糖が、組成物の総重量を約150mgとする量で存在する、請求項28記載の経口剤形。

**【請求項 3 0】**

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 3 1】**

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 3 2】**

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 3 3】**

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 3 4】**

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 3 5】**

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 3 6】**

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 3 7】**

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 3 8】**

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、バロー病、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、慢性炎症性脱髓性多発神経炎、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、グッドパスチャーリー症候群、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 3 9】

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、デューケスC&D大腸癌、切除不能大腸癌、転移性肝細胞癌、カボジ肉腫、核型急性骨髓芽球性白血病、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、くすぶり型骨髓腫、無痛性骨髓腫、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、甲状腺髓様癌、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 4 0】

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 4 1】

前記疾患又は障害が、癌であり、該癌が、骨髓腫、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 4 2】

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 4 3】

前記疾患又は障害が、癌であり、該癌が、乳癌、結腸直腸癌、卵巣癌、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 4 4】

前記疾患又は障害が、癌であり、該癌が、肝細胞癌、前立腺癌、卵巣癌、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 4 5】

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 4 6】

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 4 7】

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。