

【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】令和 5 年 4 月 4 日(2023.4.4)

【国際公開番号】WO2020/198705

【公表番号】特表 2022-519930(P2022-519930A)

【公表日】令和 4 年 3 月 25 日(2022.3.25)

【年通号数】公開公報(特許)2022-053

【出願番号】特願 2021-557396(P2021-557396)

【国際特許分類】

10

A 6 1 K 31/506(2006.01)

A 6 1 P 35/00(2006.01)

A 6 1 K 45/00(2006.01)

A 6 1 K 31/4164(2006.01)

A 6 1 K 31/337(2006.01)

A 6 1 K 31/706(2006.01)

A 6 1 K 31/475(2006.01)

A 6 1 P 43/00(2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/506

20

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/4164

A 6 1 K 31/337

A 6 1 K 31/706

A 6 1 K 31/475

A 6 1 P 43/00 1 2 1

【手続補正書】

【提出日】令和 5 年 3 月 27 日(2023.3.27)

30

【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】

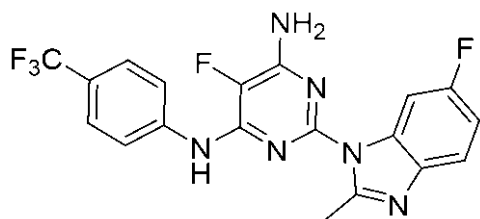
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

化合物 1 の構造を有する 5 - フルオロ - 2 - (6 - フルオロ - 2 - メチル - 1 H - ベンゾ [d] イミダゾール - 1 - イル) - N⁴ - [4 - (トリフルオロメチル) フェニル] ピリミジン - 4 , 6 - ジアミン、またはその薬学的に許容される塩を含む、それを必要とする対象における肉腫を治療するための医薬組成物。

40

【化 1】



化合物 1

50

【請求項 2】

少なくとも 1 種の化学療法剤と組み合わせて対象に投与するための、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

約 100 mg、約 125 mg、約 150 mg、約 175 mg、約 200 mg、約 225 mg、約 250 mg、約 275 mg および約 300 mg からなる群から選択される用量で週 2 回経口投与するための、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

約 125 mg、約 150 mg、約 175 mg、約 225 mg、約 250 mg、約 275 mg および約 300 mg からなる群から選択される用量で週 2 回経口投与するための、請求項 3 に記載の医薬組成物。

10

【請求項 5】

少なくとも 1 種の化学療法剤が、ダカルバジン、ドセタキセル、ドキソルビシン、リボソームドキソルビシン、ゲムシタピン、エピルビシン、エリブリン、イホスファミド、テモゾロミド、トラベクテジンおよびピンクリスチンからなる群から選択される、請求項 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

少なくとも 1 種の化学療法剤が、ダカルバジン、ドセタキセル、ドキソルビシン、リボソームドキソルビシンおよびピンクリスチンからなる群から選択される、請求項 5 に記載の医薬組成物。

20

【請求項 7】

少なくとも 1 種の化学療法剤がダカルバジンである、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

少なくとも 1 種の化学療法剤がドセタキセルである、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

少なくとも 1 種の化学療法剤がドキソルビシンである、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

少なくとも 1 種の化学療法剤がリボソームドキソルビシンである、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

少なくとも 1 種の化学療法剤がピンクリスチンである、請求項 6 に記載の医薬組成物。

30

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0113

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0113】

本明細書に示すように、化合物 1 は、少なくとも 1 種の標準治療化学療法剤と組み合わせて投与したとき、相乗的かつ相加的活性を示す、肉腫の治療のための標準治療化学療法剤との組み合わせ療法として、前臨床 *in vivo* 活性を示した。これらの結果は、肉腫の治療に対する化合物 1 と少なくとも 1 種の化学療法剤との組み合わせの潜在的な臨床治療的有用性を強く示す。

40

参照

本明細書において引用される文書が、参照により組み込まれるように具体的かつ個々に示されたかどうかにかかわらず、本明細書において参照されるすべての文書は、あたかも各々の個々の参照が、本明細書に十分に記載されていたかのように、あらゆる目的のために同じ程度で参照により本出願に組み込まれる。

次に、特許請求の範囲の主題が十分に記載され、前記が、本明細書に記載される主題の範囲または態様に影響を与えずに、広範囲の等価物内で実施され得ることが当業者により理解されるであろう。添付の特許請求の範囲は、すべてのこのような等価物を含むと解釈

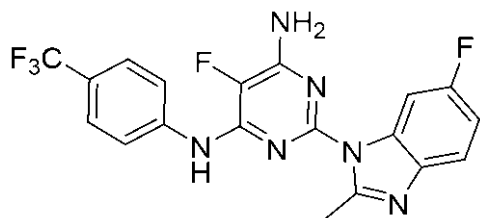
50

されることが意図される。

本発明のまた別の態様は、以下のとおりであってもよい。

〔１〕化合物１の構造を有する、有効量の５-フルオロ-２-(６-フルオロ-２-メチル-１H-ベンゾ[d]イミダゾール-１-イル)-N⁴-[４-(トリフルオロメチル)フェニル]ピリミジン-４,６-ジアミン、またはその薬学的に許容される塩もしくは医薬組成物を対象に投与することを含む、それを必要とする対象における肉腫を治療する方法。

【化１】



10

化合物１

〔２〕有効量の化合物１またはその薬学的に許容される塩もしくは医薬組成物を有効量の少なくとも１種の化学療法剤と組み合わせて対象に投与することを含む、前記〔１〕に記載の方法。

20

〔３〕有効量が、週２回経口投与される、約１００mg、約１２５mg、約１５０mg、約１７５mg、約２００mg、約２２５mg、約２５０mg、約２７５mgおよび約３００mgからなる群から選択される用量である、前記〔１〕に記載の方法。

〔４〕有効量が、週２回経口投与される、約１２５mg、約１５０mg、約１７５mg、約２２５mg、約２５０mg、約２７５mgおよび約３００mgからなる群から選択される用量である、前記〔３〕に記載の方法。

〔５〕少なくとも１種の化学療法剤が、ダカルバジン、ドセタキセル、ドキソルビシン、リポソームドキソルビシン、ゲムシタビン、エピルビシン、エリブリン、イホスファミド、テモゾロミド、トラベクテジンおよびビンクリスチンからなる群から選択される、前記〔２〕に記載の方法。

30

〔６〕少なくとも１種の化学療法剤が、ダカルバジン、ドセタキセル、ドキソルビシン、リポソームドキソルビシンおよびビンクリスチンからなる群から選択される、前記〔５〕に記載の方法。

〔７〕少なくとも１種の化学療法剤がダカルバジンである、前記〔６〕に記載の方法。

〔８〕少なくとも１種の化学療法剤がドセタキセルである、前記〔６〕に記載の方法。

〔９〕少なくとも１種の化学療法剤がドキソルビシンである、前記〔６〕に記載の方法。

〔１０〕少なくとも１種の化学療法剤がリポソームドキソルビシンである、前記〔６〕に記載の方法。

〔１１〕少なくとも１種の化学療法剤がビンクリスチンである、前記〔６〕に記載の方法。

40