

【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11月29日 (2018.11.29)

【公表番号】特表2017-533223(P2017-533223A)

【公表日】平成29年11月9日 (2017.11.9)

【年通号数】公開・登録公報2017-043

【出願番号】特願2017-523507(P2017-523507)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 K 33/24 (2006.01)

A 6 1 K 31/337 (2006.01)

A 6 1 K 31/282 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/519

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 K 33/24

A 6 1 K 31/337

A 6 1 K 31/282

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 1/00

【手続補正書】

【提出日】平成30年10月16日 (2018.10.16)

【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】

((1 R , 2 R , 3 S , 4 R) - 2 , 3 - ジヒドロキシ - 4 - (2 - (3 - (トリフル
オロメチルチオ)フェニル)ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 7 - イルアミノ) シク
ロペンチル) メチルスルファメート (化合物 1) またはその薬学的に許容される塩を含む
、癌を治療するための組成物であって、前記組成物は、そのような治療を必要とする患者
に対して、

i) プラチンまたは

i i) タキサンの中の 1 つ以上と組み合わせ投与されることを特徴とする、組成物

。

【請求項 2】

前記癌が、乳癌、結腸直腸癌、卵巣癌、肺癌、前立腺癌、または頭頸部癌である、請求
項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

前記癌が、急性骨髄性白血病、骨髄異形成症候群、多発性骨髄腫、または非ホジキンリンパ腫である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 4】

前記プラチンが、シスプラチン、カルボプラチン、オキサリプラチン、サトラプラチン、ピコプラチン、ネダプラチン、またはトリプラチンである、請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 5】

前記タキサンが、パクリタキセル、ドセタキセル、または n a b - パクリタキセルである、請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 6】

((1 R , 2 R , 3 S , 4 R) - 2 , 3 - ジヒドロキシ - 4 - (2 - (3 - (トリフルオロメチルチオ)フェニル)ピラゾロ [1 , 5 - a]ピリミジン - 7 - イルアミノ)シクロペンチル)メチルスルファメート (化合物 1) またはその薬学的に許容される塩が、21 日間のスケジュールの 1 日目、4 日目、8 日目、及び 11 日目の各日に投与されることを特徴とする、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 7】

((1 R , 2 R , 3 S , 4 R) - 2 , 3 - ジヒドロキシ - 4 - (2 - (3 - (トリフルオロメチルチオ)フェニル)ピラゾロ [1 , 5 - a]ピリミジン - 7 - イルアミノ)シクロペンチル)メチルスルファメート (化合物 1) またはその薬学的に許容される塩が、21 日間のスケジュールの 1 日目、8 日目、及び 15 日目の各日に投与されることを特徴とする、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 8】

((1 R , 2 R , 3 S , 4 R) - 2 , 3 - ジヒドロキシ - 4 - (2 - (3 - (トリフルオロメチルチオ)フェニル)ピラゾロ [1 , 5 - a]ピリミジン - 7 - イルアミノ)シクロペンチル)メチルスルファメート (化合物 1) またはその薬学的に許容される塩が、28 日間のスケジュールの 1 日目、8 日目、及び 15 日目の各日に投与されることを特徴とする、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 9】

((1 R , 2 R , 3 S , 4 R) - 2 , 3 - ジヒドロキシ - 4 - (2 - (3 - (トリフルオロメチルチオ)フェニル)ピラゾロ [1 , 5 - a]ピリミジン - 7 - イルアミノ)シクロペンチル)メチルスルファメート (化合物 1) またはその薬学的に許容される塩を含む、請求項 1 ~ 3 及び 5 ~ 8 のいずれかに記載の組成物であって、前記組成物は、そのような治療を必要とする患者に対して、タキサンと組み合わせて投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項 10】

前記タキサンが、ドセタキセルまたはパクリタキセルである、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 11】

前記タキサンが、パクリタキセルである、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 12】

前記タキサンが、ドセタキセルである、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 13】

前記タキサンが、21 日間のスケジュールの 1 日目に投与される、請求項 9 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 14】

前記タキサンが、21 日間のスケジュールの 1 日目、8 日目、及び 15 日目の各日に投与される、請求項 9 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 15】

前記タキサンが、28 日間のスケジュールの 1 日目、8 日目、及び 15 日目の各日に投与される、請求項 9 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 16】

((1 R , 2 R , 3 S , 4 R) - 2 , 3 - ジヒドロキシ - 4 - (2 - (3 - (トリフルオロメチルチオ)フェニル)ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 7 - イルアミノ) シクロペンチル) メチルスルファメート (化合物 1) またはその薬学的に許容される塩を含む、請求項 1 ~ 4 及び 6 ~ 8 に記載の組成物であって、前記組成物は、そのような治療を必要とする患者に対して、プラチンと組み合わせて投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項 17】

前記プラチンが、シスプラチンまたはカルボプラチンである、請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 18】

前記プラチンが、カルボプラチンである、請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 19】

前記プラチンが、21日間のスケジュールの1日目に投与される、請求項 16 ~ 18 のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項 20】

前記プラチンが、21日間のスケジュールの1日目、8日目、及び15日目の各日に投与される、請求項 16 ~ 18 のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項 21】

前記プラチンが、28日間のスケジュールの1日目、8日目、及び15日目の各日に投与される、請求項 16 ~ 18 のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項 22】

パクリタキセルをさらに含む、請求項 18 ~ 21 のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項 23】

ドセタキセルをさらに含む、請求項 18 ~ 21 のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項 24】

プラチンを含む、癌を治療するための組成物であって、前記組成物は、そのような治療を必要とする患者に対して、((1 R , 2 R , 3 S , 4 R) - 2 , 3 - ジヒドロキシ - 4 - (2 - (3 - (トリフルオロメチルチオ)フェニル)ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 7 - イルアミノ) シクロペンチル) メチルスルファメート (化合物 1) またはその薬学的に許容される塩と組み合わせて投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項 25】

タキサンを含む、癌を治療するための組成物であって、前記組成物は、そのような治療を必要とする患者に対して、((1 R , 2 R , 3 S , 4 R) - 2 , 3 - ジヒドロキシ - 4 - (2 - (3 - (トリフルオロメチルチオ)フェニル)ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 7 - イルアミノ) シクロペンチル) メチルスルファメート (化合物 1) またはその薬学的に許容される塩と組み合わせて投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項 26】

((1 R , 2 R , 3 S , 4 R) - 2 , 3 - ジヒドロキシ - 4 - (2 - (3 - (トリフルオロメチルチオ)フェニル)ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 7 - イルアミノ) シクロペンチル) メチルスルファメート (化合物 1) またはその薬学的に許容される塩と、

i) プラチンまたは

i i) タキサンのうちの1つ以上とを含む、癌を治療するための組み合わせ物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0034

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0034】

一態様において、本開示は、そのような治療を必要とする対象における癌の治療での使

用のための薬に関する。薬は、U A E 阻害物質及び 1 つ以上の化学療法剤を含む。

特定の実施形態では、例えば以下の項目が提供される。

(項目 1)

癌の治療方法であって、そのような治療を必要とする患者に対して、((1 R , 2 R , 3 S , 4 R) - 2 , 3 - ジヒドロキシ - 4 - (2 - (3 - (トリフルオロメチルチオ)フェニル)ピラゾロ [1 , 5 - a]ピリミジン - 7 - イルアミノ)シクロペンチル)メチルスルファメート (化合物 1) またはその薬学的に許容される塩と、

i) プラチンまたは

i i) タキサンの中の 1 つ以上との組み合わせを投与することを含む、前記方法。

(項目 2)

前記癌が、乳癌、結腸直腸癌、卵巣癌、肺癌、前立腺癌、または頭頸部癌である、項目 1 に記載の方法。

(項目 3)

前記癌が、急性骨髄性白血病、骨髄異形成症候群、多発性骨髄腫、または非ホジキンリンパ腫である、項目 1 に記載の方法。

(項目 4)

前記プラチンが、シスプラチン、カルボプラチン、オキサリプラチン、サトラプラチン、ピコプラチン、ネダプラチン、またはトリプラチンである、項目 1 ~ 3 のいずれかに記載の方法。

(項目 5)

前記タキサンが、パクリタキセル、ドセタキセル、または n a b - パクリタキセルである、項目 1 ~ 3 のいずれかに記載の方法。

(項目 6)

((1 R , 2 R , 3 S , 4 R) - 2 , 3 - ジヒドロキシ - 4 - (2 - (3 - (トリフルオロメチルチオ)フェニル)ピラゾロ [1 , 5 - a]ピリミジン - 7 - イルアミノ)シクロペンチル)メチルスルファメート (化合物 1) またはその薬学的に許容される塩が、2 1 日間のスケジュールの 1 日目、4 日目、8 日目、及び 1 1 日目の各日に投与される、項目 1 ~ 5 のいずれかに記載の方法。

(項目 7)

((1 R , 2 R , 3 S , 4 R) - 2 , 3 - ジヒドロキシ - 4 - (2 - (3 - (トリフルオロメチルチオ)フェニル)ピラゾロ [1 , 5 - a]ピリミジン - 7 - イルアミノ)シクロペンチル)メチルスルファメート (化合物 1) またはその薬学的に許容される塩が、2 1 日間のスケジュールの 1 日目、8 日目、及び 1 5 日目の各日に投与される、項目 1 ~ 5 のいずれかに記載の方法。

(項目 8)

((1 R , 2 R , 3 S , 4 R) - 2 , 3 - ジヒドロキシ - 4 - (2 - (3 - (トリフルオロメチルチオ)フェニル)ピラゾロ [1 , 5 - a]ピリミジン - 7 - イルアミノ)シクロペンチル)メチルスルファメート (化合物 1) またはその薬学的に許容される塩が、2 8 日間のスケジュールの 1 日目、8 日目、及び 1 5 日目の各日に投与される、項目 1 ~ 5 のいずれかに記載の方法。

(項目 9)

そのような治療を必要とする患者に対して、((1 R , 2 R , 3 S , 4 R) - 2 , 3 - ジヒドロキシ - 4 - (2 - (3 - (トリフルオロメチルチオ)フェニル)ピラゾロ [1 , 5 - a]ピリミジン - 7 - イルアミノ)シクロペンチル)メチルスルファメート (化合物 1) またはその薬学的に許容される塩とタキサンとの組み合わせを投与することを含む、項目 1 ~ 3 及び 5 ~ 8 のいずれかに記載の方法。

(項目 10)

前記タキサンが、ドセタキセルまたはパクリタキセルである、項目 9 に記載の方法。

(項目 11)

前記タキサンが、パクリタキセルである、項目 9 に記載の方法。

(項目 1 2)

前記タキサンが、ドセタキセルである、項目 9 に記載の方法。

(項目 1 3)

前記タキサンが、21 日間のスケジュールの 1 日目に投与される、項目 9 ~ 1 2 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 4)

前記タキサンが、21 日間のスケジュールの 1 日目、8 日目、及び 1 5 日目の各日に投与される、項目 9 ~ 1 2 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 5)

前記タキサンが、28 日間のスケジュールの 1 日目、8 日目、及び 1 5 日目の各日に投与される、項目 9 ~ 1 2 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 6)

そのような治療を必要とする患者に対して、((1 R , 2 R , 3 S , 4 R) - 2 , 3 - ジヒドロキシ - 4 - (2 - (3 - (トリフルオロメチルチオ) フェニル) ピラゾロ [1 , 5 - a] ピリミジン - 7 - イルアミノ) シクロペンチル) メチルスルファメート (化合物 1) またはその薬学的に許容される塩とプラチンとの組み合わせを投与することを含む、項目 1 ~ 4 及び 6 ~ 8 に記載の方法。

(項目 1 7)

前記プラチンが、シスプラチンまたはカルボプラチンである、項目 1 6 に記載の方法。

(項目 1 8)

前記プラチンが、カルボプラチンである、項目 1 6 に記載の方法。

(項目 1 9)

前記プラチンが、21 日間のスケジュールの 1 日目に投与される、項目 1 6 ~ 1 8 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 2 0)

前記プラチンが、21 日間のスケジュールの 1 日目、8 日目、及び 1 5 日目の各日に投与される、項目 1 6 ~ 1 8 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 2 1)

前記プラチンが、28 日間のスケジュールの 1 日目、8 日目、及び 1 5 日目の各日に投与される、項目 1 6 ~ 1 8 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 2 2)

パクリタキセルをさらに含む、項目 1 8 ~ 2 1 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 2 3)

ドセタキセルをさらに含む、項目 1 8 ~ 2 1 のいずれか 1 項に記載の方法。