

【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2017-533221(P2017-533221A)

【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2017-523500(P2017-523500)

【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 41/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (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 41/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

【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、放射線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 2】

前記癌が固形腫瘍である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

前記癌が、乳癌、結腸直腸癌、卵巣癌、肺癌、前立腺癌、頭頸部癌、胃癌、食道癌、ま
たは胃食道接合部癌である、請求項 1 または 2 に記載の組成物。

【請求項 4】

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 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 5】

前記癌が、胃癌、食道癌、または胃食道接合部癌である、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項
に記載の組成物。

【請求項 6】

前記癌が血液癌である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 7】

前記癌が、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 または 6 に記載の

組成物。

【請求項 8】

前記放射線が粒子放射線である、請求項 1～7 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 9】

前記放射線が対外照射によって投与される、請求項 1～8 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 10】

((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 週間繰り返される各週の 1 日目及び 4 日目の各日に投与されることを特徴とする、請求項 1～9 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 11】

((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 週間繰り返される各週の 1 日目に投与されることを特徴とする、請求項 1～9 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 12】

((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 週間繰り返される各週の 1～5 日目の各日に投与されることを特徴とする、請求項 1～9 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 13】

前記放射線が、2～8 週間繰り返される各週の 1～5 日目の各日に投与される、請求項 1～12 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 14】

前記放射線が、5～8 週間繰り返される各週の 1～5 日目のいずれか 2 日に投与される、請求項 1～12 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 15】

((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、約 4 m g ～約 6 5 m g の用量で投与されることを特徴とする、請求項 1～14 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が、約 1 5 m g ～約 5 5 m g の用量で投与されることを特徴とする、請求項 1～15 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 17】

((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、約 1 8 m g ～約 4 3 m g の用量で投与されることを特徴とする、請求項 1～16 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 18】

投与される放射線の総線量が、約 2 0 G y ～約 8 0 G y である、請求項 1～17 のい

れか 1 項に記載の組成物。

【請求項 19】

((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、6 ~ 8 週間繰り返される各週の 1 日目及び 4 日目の各日に投与され、かつ前記放射線が、6 ~ 8 週間繰り返される各週の 1 ~ 5 日目の各日に投与されることを特徴とする、請求項 1 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 20】

((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、6 ~ 8 週間繰り返される各週の 1 日目に投与され、かつ前記放射線が、6 ~ 8 週間繰り返される各週の 1 ~ 5 日目の各日に投与されることを特徴とする、請求項 1 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 21】

((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、6 ~ 8 週間繰り返される各週の 1 ~ 5 日目の各日に投与され、かつ前記放射線が、6 ~ 8 週間繰り返される各週の 1 ~ 5 日目の各日に投与されることを特徴とする、請求項 1 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 22】

((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、6 ~ 8 週の期間のうちのいずれか 1 または 2 週間は投与されないことを特徴とする、請求項 19 ~ 21 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 23】

前記放射線が、6 ~ 8 週の期間のうちのいずれか 1 または 2 週間は投与されない、請求項 19 ~ 22 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 24】

癌を治療するための放射線装置を備えるシステムであって、前記システムは、((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使用されることを特徴とする、システム。

【請求項 25】

((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放射線装置とを備える、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】0033

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0033】

一態様において、本開示は、癌の治療を必要とする対象における癌の治療での使用のた

めの薬に関し、本薬は、U A E 阻害物質及び放射線を含む。

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放射線との組み合わせを投与することを含む、前記方法。

(項目 2)

前記癌が固形腫瘍である、項目 1 に記載の方法。

(項目 3)

前記癌が、乳癌、結腸直腸癌、卵巣癌、肺癌、前立腺癌、頭頸部癌、胃癌、食道癌、または胃食道接合部癌である、項目 1 または 2 に記載の方法。

(項目 4)

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 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 5)

前記癌が、胃癌、食道癌、または胃食道接合部癌である、項目 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 6)

前記癌が血液癌である、項目 1 に記載の方法。

(項目 7)

前記癌が、多発性骨髄腫または非ホジキンリンパ腫である、項目 1 または 6 に記載の方法。

(項目 8)

前記放射線が粒子放射線である、項目 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 9)

前記放射線が対外照射によって投与される、項目 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 0)

((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 週間繰り返し返される各週の 1 日目及び 4 日目の各日に投与される、項目 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 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が、2 ~ 8 週間繰り返し返される各週の 1 日目に投与される、項目 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 2)

((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 週間繰り返し返される各週の 1 ~ 5 日目の各日に投与される、項目 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 3)

前記放射線が、2 ~ 8 週間繰り返し返される各週の 1 ~ 5 日目の各日に投与される、項目 1 ~ 1 2 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 1 4)

前記放射線が、5～8週間繰り返される各週の1～5日目のいずれか2日に投与される、項目1～12のいずれか1項に記載の方法。

(項目15)

((1R, 2R, 3S, 4R) - 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、約4mg～約65mgの用量で投与される、項目1～14のいずれか1項に記載の方法。

(項目16)

((1R, 2R, 3S, 4R) - 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、約15mg～約55mgの用量で投与される、項目1～15のいずれか1項に記載の方法。

(項目17)

((1R, 2R, 3S, 4R) - 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、約18mg～約43mgの用量で投与される、項目1～16のいずれか1項に記載の方法。

(項目18)

投与される放射線の総線量が、約20Gy～約80Gyである、項目1～17のいずれか1項に記載の方法。

(項目19)

((1R, 2R, 3S, 4R) - 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、6～8週間繰り返される各週の1日目及び4日目の各日に投与され、かつ前記放射線が、6～8週間繰り返される各週の1～5日目の各日に投与される、項目1～18のいずれか1項に記載の方法。

(項目20)

((1R, 2R, 3S, 4R) - 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、6～8週間繰り返される各週の1日目に投与され、かつ前記放射線が、6～8週間繰り返される各週の1～5日目の各日に投与される、項目1～18のいずれか1項に記載の方法。

(項目21)

((1R, 2R, 3S, 4R) - 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、6～8週間繰り返される各週の1～5日目の各日に投与され、かつ前記放射線が、6～8週間繰り返される各週の1～5日目の各日に投与される、項目1～18のいずれか1項に記載の方法。

(項目22)

((1R, 2R, 3S, 4R) - 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、6～8週の期間のうちのいずれか1または2週間は投与されない、項目19～21のいずれか1項に記載の方法。

(項目23)

前記放射線が、6～8週の期間のうちのいずれか1または2週間は投与されない、項目19～22のいずれか1項に記載の方法。