

【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1月12日 (2017.1.12)

【公表番号】特表2016-501222(P2016-501222A)

【公表日】平成28年1月18日 (2016.1.18)

【年通号数】公開・登録公報2016-004

【出願番号】特願2015-545170(P2015-545170)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/06 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

A 6 1 K 31/4184 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/06

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 31/517

A 6 1 K 31/4184

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成28年11月22日 (2016.11.22)

【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】

(a) プロテインキナーゼ C (PKC) インヒビター化合物、またはその医薬的に許容可能な塩、および

(b) マイトジェン活性化プロテインキナーゼ (MEK) インヒビター化合物、またはその医薬的に許容可能な塩

を含むかまたはそれらからなる、医薬的組合せ。

【請求項 2】

前記 PKC インヒビター化合物が、

3 - (1H - インドール - 3 - イル) - 4 - [2 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - キナゾリン - 4 - イル] - 1H - ピロール - 2, 5 - ジオン、

3 - (1H - インドール - 3 - イル) - 4 - [2 - (ピペラジン - 1 - イル) - キナゾリン - 4 - イル] - 1H - ピロール - 2, 5 - ジオン、

3 - [2 - クロロ - 7 - [(ジメチルアミノ)メチル] - 1 - ナフタレニル] - 4 - [7 - [2 - (2 - メトキシエトキシ)エトキシ] - 1H - インドール - 3 - イル] - 1H - ピロール - 2, 5 - ジオン、

3 - [3 - (4, 7 - ジアザ - スピロ [2, 5] オクト - 7 - イル) - イソキノリン - 1 - イル] - 4 - (7 - メチル - 1H - インドール - 3 - イル) - ピロール - 2, 5 - ジオン、

(9S) - 9 - [(ジメチルアミノ)メチル] - 6, 7, 10, 11 - テトラヒドロ -

9 H , 18 H - 5 , 21 : 12 , 17 - ジメテノジベンゾ - [e , k] ピロロ [3 , 4 - h] [1 , 4 , 13] オキサジアザシクロヘキサデシン - 18 , 20 (19 H) - ジオン、

ルボキシスタウリン、および

12 - (2 - シアノエチル) - 6 , 7 , 12 , 13 - テトラヒドロ - 13 - メチル - 5 - オキソ - 5 H - インドロ (2 , 3 - a) ピロロ (3 , 4 - c) - カルバゾール
 からなる群から選択される化合物であるかまたはその医薬的に許容可能な塩である、請求項 1 に記載の医薬的組合せ。

【請求項 3】

前記 M E K インヒビター化合物が、

6 - (4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニルアミノ) - 7 - フルオロ - 3 - メチル - 3 H - ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (2 - ヒドロキシエトキシ) - アミド、(S) - 5 - フルオロ - 2 - (2 - フルオロ - 4 - (メチルチオ) フェニルアミノ) - N - (2 - ヒドロキシプロポキシ) - 1 - メチル - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド、PD0325901、PD - 184352、RDEA119、GSK1120212、XL518、AS - 701255、AS - 701173、AS703026、RDEA436、E6201、RO4987655、JTP - 74057、RG7167 および RG7420

からなるグループから選択される化合物であるかまたはその医薬的に許容可能な塩である、請求項 1 または 2 に記載の医薬的組合せ。

【請求項 4】

前記 P K C インヒビター化合物が、3 - (1 H - インドール - 3 - イル) - 4 - [2 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - キナゾリン - 4 - イル] - 1 H - ピロール - 2 , 5 - ジオン、またはその医薬的に許容可能な塩である、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の医薬的組合せ。

【請求項 5】

前記 M E K インヒビター化合物が、6 - (4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニルアミノ) - 7 - フルオロ - 3 - メチル - 3 H - ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (2 - ヒドロキシエトキシ) - アミド、もしくは (S) - 5 - フルオロ - 2 - (2 - フルオロ - 4 - (メチルチオ) フェニルアミノ) - N - (2 - ヒドロキシプロポキシ) - 1 - メチル - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロピリジン - 3 - カルボキサミド、またはその医薬的に許容可能な塩である、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の医薬的組合せ。

【請求項 6】

前記 P K C インヒビター化合物が、3 - (1 H - インドール - 3 - イル) - 4 - [2 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - キナゾリン - 4 - イル] - 1 H - ピロール - 2 , 5 - ジオンまたはその医薬的に許容可能な塩であり、前記 M E K インヒビター化合物が、6 - (4 - ブロモ - 2 - フルオロフェニルアミノ) - 7 - フルオロ - 3 - メチル - 3 H - ベンゾイミダゾール - 5 - カルボン酸 (2 - ヒドロキシエトキシ) - アミドまたはその医薬的に許容可能な塩である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の医薬的組合せ。

【請求項 7】

少なくとも一つの医薬的に許容可能な担体を更に含む、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の医薬的組合せ。

【請求項 8】

同時に、別個に、または順次に投与するための、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の医薬的組合せ。

【請求項 9】

増殖性疾患の治療に用いるための、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の医薬的組合せ。

【請求項 10】

前記増殖性疾患が癌である、請求項 9 に記載の医薬的組合せ。

【請求項 1 1】

前記増殖性疾患が黒色腫である、請求項 9 に記載の医薬的組合せ。

【請求項 1 2】

前記黒色腫が、ブドウ膜黒色腫、転移性ブドウ膜黒色腫、GNAQ変異ブドウ膜黒色腫、GNAQ変異転移性ブドウ膜黒色腫、GNA11変異ブドウ膜黒色腫、またはGNA11変異転移性ブドウ膜黒色腫である、請求項 1 1 に記載の医薬的組合せ。

【請求項 1 3】

(a) 前記PKCインヒビター化合物および(b)MEKインヒビター化合物が、増殖性疾患の治療に相乗作用的に有効な量で提供される、請求項 1 ~ 1 2 のいずれか一項に記載の医薬的組合せ。

【請求項 1 4】

増殖性疾患の治療のための薬剤の調製における、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の医薬的組合せの使用。

【請求項 1 5】

前記増殖性疾患が癌である、請求項 1 4 に記載の使用。

【請求項 1 6】

前記増殖性疾患が黒色腫である、請求項 1 4 に記載の使用。

【請求項 1 7】

前記黒色腫が、ブドウ膜黒色腫、転移性ブドウ膜黒色腫、GNAQ変異ブドウ膜黒色腫、GNAQ変異転移性ブドウ膜黒色腫、GNA11変異ブドウ膜黒色腫、またはGNA11変異転移性ブドウ膜黒色腫である、請求項 1 6 に記載の使用。

【請求項 1 8】

(a) PKCインヒビター化合物 3 - (1H - インドール - 3 - イル) - 4 - [2 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - キナゾリン - 4 - イル] - 1H - ピロール - 2 , 5 - ジオンまたはその医薬的に許容可能な塩の一つ以上の単位剤形、および(b)MEKインヒビター化合物またはその医薬的に許容可能な塩の一つ以上の単位剤形を含む、併用製剤。

【請求項 1 9】

請求項 1 ~ 1 3 のいずれか一項にて定義された組合せと、少なくとも一つの医薬的に許容可能な担体を含む、医薬組成物。

【請求項 2 0】

前記PKCインヒビターおよびMEKインヒビターが、増殖性疾患の治療に相乗作用的に有効な量で提供される、請求項 1 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 1】

増殖性疾患の進行の遅延または治療に用いるための治療薬として請求項 1 ~ 1 3 のいずれか一項に定義された医薬的組合せを、その同時の、別個の、または順次の投与のための説明書と一緒に含む、コマーシャルパッケージ。