

【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 7 年 6 月 5 日(2025.6.5)

【公開番号】特開 2025-630(P2025-630A)
【公開日】令和 7 年 1 月 7 日(2025.1.7)
【年通号数】公開公報(特許)2025-002
【出願番号】特願 2024-152009(P2024-152009)
【国際特許分類】

A 6 1 K 45/06(2006.01)
A 6 1 K 31/519(2006.01)
A 6 1 P 35/00(2006.01)
A 6 1 P 43/00(2006.01)
A 6 1 P 35/02(2006.01)
A 6 1 K 31/4709(2006.01)
A 6 1 K 31/436(2006.01)
A 6 1 K 31/4738(2006.01)
A 6 1 K 31/5377(2006.01)

10

【F I】

A 6 1 K 45/06
A 6 1 K 31/519
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 43/00 1 2 1
A 6 1 P 35/02
A 6 1 K 31/4709
A 6 1 K 31/436
A 6 1 K 31/4738
A 6 1 K 31/5377

20

【手続補正書】

30

【提出日】令和 7 年 5 月 28 日(2025.5.28)

【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】

がんの治療を必要とする対象においてがんを治療する方法において使用するための薬学的組成物であって、

40

前記方法が、前記対象に、治療有効量の、エベロリムス、ラパマイシン、ゾタロリムス、リダフォロリムス、サパニセルチブ、トリン - 1、ダクトリシブ、B E Z 2 3 5、ブパルリシブ、G D C - 0 9 4 1、G D C - 0 3 4 9、V S - 5 5 8 4、またはビスツセルチブから成る群から選ばれる m T O R 阻害剤と、下記式の K R A S G 1 2 C 阻害剤

50

CN1CCCC1OC2=NC3=C(N2)C(=NC=C3C4=CC=CC=C4C5=CC=CC=C5Cl)N6CCN(C6)C(=O)C(F)=C

30

20

40

50

CN1CCCC1OC2=NC3=C(N2)C(=NC=C3C4=CC=CC=C4C5=CC=CC=C5Cl)N6CCN(C6)C(=O)C(F)=CCN1CCCC1OC2=NC3=C(N2)C(=NC=C3C4=CC=CC=C4C5=CC=CC=C5Cl)N6CCN(C6)C(=O)C(F)=C

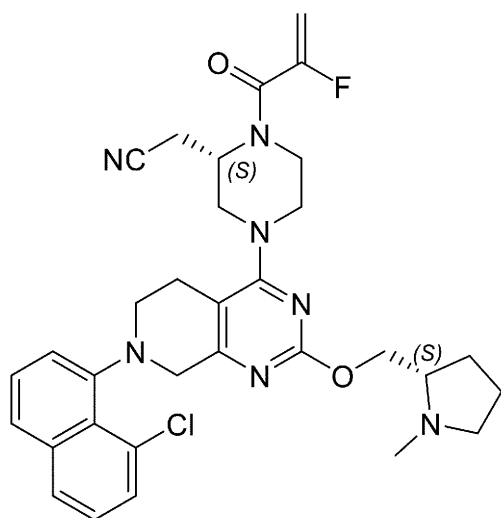
【請求項 15】

前記 m T O R 阻害剤が、前記 K R a s G 1 2 C 阻害剤に対するがん細胞の感受性を相乗的に増加させる、請求項 1 ~ 1 4 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 1 6】

下記式の K R a s G 1 2 C 阻害剤化合物

【化 4】



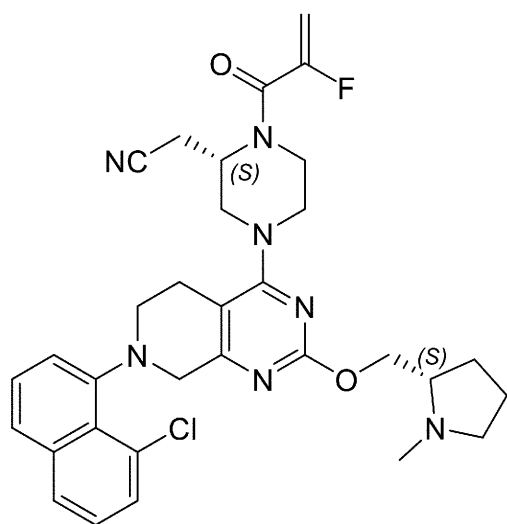
10

またはその薬学的に許容される塩に対するがん細胞の感受性を増加させるための方法において使用するための薬学的組成物であって、

20

前記方法が、単独でまたは薬学的に許容される担体、賦形剤、もしくは希釈剤と組み合わせて、下記式の化合物

【化 5】



30

またはその薬学的に許容される塩を用いた K R a s G 1 2 C 治療を受けている対象に、治療有効量の、エベロリムス、ラパマイシン、ゾタロリムス、リダフォロリムス、サパニセルチブ、トリン - 1、ダクトリシブ、B E Z 2 3 5、プパルリシブ、G D C - 0 9 4 1、G D C - 0 3 4 9、V S - 5 5 8 4、またはビスツセルチブから成る群から選ばれる m T O R 阻害剤を投与することを含み、

40

前記薬学的組成物が、前記 m T O R 阻害剤を含み、

前記 m T O R 阻害剤が、前記 K R a s G 1 2 C 阻害剤に対するがん細胞の感受性を相乗的に増加させる、薬学的組成物。

【請求項 1 7】

前記化合物の前記治療有効量が、約 0 . 0 1 ~ 1 0 0 m g / k g / 日である、請求項 1 ~ 1 6 のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

50

【請求項 18】

前記化合物の前記治療有効量が、1日当たり約0.1～50mg/kgである、請求項17に記載の薬学的組成物。

【請求項 19】

前記がんが、心臓：肉腫（血管肉腫、線維肉腫、横紋筋肉腫、脂肪肉腫）、粘液腫、横紋筋腫、線維腫、脂肪腫、および奇形腫；肺：気管支原性癌（扁平上皮細胞、未分化小細胞、未分化大細胞、腺癌）、肺胞（細気管支）癌、気管支腺腫、肉腫、リンパ腫、軟骨性過誤腫、中皮腫；消化管：食道（扁平上皮細胞癌、腺癌、平滑筋肉腫、リンパ腫）、胃（癌腫、リンパ腫、平滑筋肉腫）、膵臓（導管腺癌、インスリノーマ、グルカゴノーマ、ガストリノーマ、カルチノイド腫瘍、ビポーマ）、小腸（腺癌、リンパ腫、カルチノイド腫瘍、カボジ肉腫、平滑筋腫、血管腫、脂肪腫、神経線維腫、線維腫）、大腸（腺癌、管状腺腫、絨毛腺腫、過誤腫、平滑筋腫）；尿生殖路：腎臓（腺癌、ウィルムス腫瘍（腎芽細胞腫）、リンパ腫、白血病）、膀胱および尿道（扁平上皮細胞癌、移行上皮癌、腺癌）、前立腺（腺癌、肉腫）、精巣（精上皮腫、奇形腫、胎児性癌、奇形癌、絨毛癌、肉腫、間質細胞癌、線維腫、線維腺腫、類腺腫瘍、脂肪腫）；肝臓：肝臓癌（肝細胞癌）、胆管癌、肝芽腫、血管肉腫、肝細胞腺腫、血管腫；胆管：胆嚢癌、乳頭部癌、胆管癌；骨：骨原性肉腫（骨肉腫）、線維肉腫、悪性線維性組織球腫、軟骨肉腫、ユーイング肉腫、悪性リンパ腫（細網肉腫）、多発性骨髄腫、悪性巨大細胞腫瘍脊索腫、骨軟骨腫（骨軟骨性外骨症）、良性軟骨腫、軟骨芽細胞腫、軟骨粘液線維腫、類骨腫、および巨細胞腫；神経系：頭蓋（骨腫、血管腫、肉芽腫、黄色腫、変形性骨炎）、髄膜（髄膜腫、髄膜肉腫、神経膠腫症）、脳（星状細胞腫、髄芽腫、神経膠腫、上衣腫、胚細胞腫（松果体腫）、多形膠芽腫、乏突起細胞腫、シュワン腫、網膜芽細胞腫、先天性腫瘍）、脊髄神経線維腫、髄膜腫、神経膠腫、肉腫）；婦人科：子宮（子宮内膜癌（漿液性嚢胞腺癌、粘液性嚢胞腺癌、未分類癌腫）、顆粒膜卵胞膜細胞腫、セルトリ-ライディッヒ細胞腫、未分化胚細胞腫、悪性奇形腫）、外陰（扁平上皮細胞癌、上皮内癌、腺癌、線維肉腫、黒色腫）、膣（明細胞癌、扁平上皮細胞癌、ブドウ状肉腫（胎児性横紋筋肉腫）、卵管（癌腫）；血液学的：血液（骨髄性白血病（急性および慢性）、急性リンパ性白血病、慢性リンパ性白血病、骨髄増殖性疾患、多発性骨髄腫、骨髄異形成症候群）、ホジキン病、非ホジキンリンパ腫（悪性リンパ腫）；皮膚：悪性黒色腫、基底細胞癌、扁平上皮細胞癌、カボジ肉腫、異形成母斑、脂肪腫、血管腫、皮膚線維腫、ケロイド、乾癬；ならびに副腎：神経芽腫からなる群から選択される、請求項1～18のいずれか一項に記載の薬学的組成物。

【請求項 20】

前記KRAS G12Cに関連するがんが、非小細胞肺癌である、請求項19に記載の薬学的組成物。