

【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6年4月5日(2024.4.5)

【公開番号】特開2024-7504(P2024-7504A)

【公開日】令和6年1月18日(2024.1.18)

【年通号数】公開公報(特許)2024-010

【出願番号】特願2023-108177(P2023-108177)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/395(2006.01)

10

A 6 1 P 35/00(2006.01)

A 6 1 P 43/00(2006.01)

A 6 1 K 45/00(2006.01)

A 6 1 K 39/395(2006.01)

A 6 1 K 33/24(2019.01)

A 6 1 K 31/282(2006.01)

A 6 1 K 31/519(2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/395

A 6 1 P 35/00

20

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 39/395 N

A 6 1 K 33/24

A 6 1 K 31/282

A 6 1 K 31/519

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】令和6年3月28日(2024.3.28)

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】

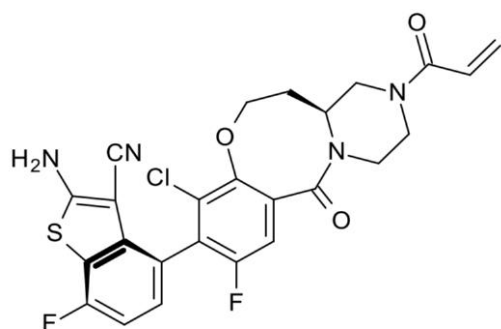
【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物、

【化1】

40



(式I)

又はその薬学的に許容される塩を含む、KRAS G12C変異がんの治療剤であって、

50

治療を必要とする患者に、約 50 mg ~ 約 200 mg の第 1 の用量の式 I の化合物又はその薬学的に許容される塩が投与されるように用いられることを特徴とする、治療剤。

【請求項 2】

前記化合物が投与される、請求項 1 に記載の治療剤。

【請求項 3】

投与された前記用量が、約 50 mg、約 100 mg、約 150 mg、約 200 mg、約 300 mg、約 400 mg、約 500 mg、約 600 mg、約 700 mg、及び約 800 mg からなる群から選択される最大 1 日用量である、請求項 1 に記載の治療剤。

【請求項 4】

前記最大 1 日用量が、約 50 mg である、請求項 3 に記載の治療剤。

10

【請求項 5】

前記最大 1 日用量が、約 100 mg である、請求項 3 に記載の治療剤。

【請求項 6】

前記最大 1 日用量が、約 200 mg である、請求項 3 に記載の治療剤。

【請求項 7】

前記最大 1 日用量が、約 300 mg である、請求項 3 に記載の治療剤。

【請求項 8】

前記最大 1 日用量が、約 400 mg である、請求項 3 に記載の治療剤。

【請求項 9】

前記 K R A S G 1 2 C 変異がんが、肺がん、結腸直腸がん、膵臓がん、膀胱がん、子宮頸がん、子宮内膜がん、卵巣がん、胆管がん、及び食道がんからなる群から選択される、請求項 1 に記載の治療剤。

20

【請求項 10】

前記 K R A S G 1 2 C 変異がんが、非小細胞肺がん、膵臓がん、又は結腸直腸がんである、請求項 1 に記載の治療剤。

【請求項 11】

前記 K R A S G 1 2 C 変異がんが、非小細胞肺がん又は結腸直腸がんである、請求項 1 に記載の治療剤。

【請求項 12】

前記 K R A S G 1 2 C 変異がんが、非小細胞肺がんである、請求項 1 に記載の治療剤。

30

【請求項 13】

前記 K R A S G 1 2 C 変異がんが、膵臓がんである、請求項 1 に記載の治療剤。

【請求項 14】

前記 K R A S G 1 2 C 変異がんが、結腸直腸がんである、請求項 1 に記載の治療剤。

【請求項 15】

前記用量が、前記患者に、少なくとも 1 日 1 回投与される、請求項 1 に記載の治療剤。

【請求項 16】

前記用量が、約 50 mg、約 100 mg、約 150 mg、及び約 200 mg からなる群から選択される、請求項 15 に記載の治療剤。

【請求項 17】

前記用量が、カプセル中にある、請求項 1 に記載の治療剤。

40

【請求項 18】

前記カプセルが、約 25 mg 若しくは約 50 mg の式 I の化合物、又はその薬学的に許容される塩を含有する、請求項 17 に記載の治療剤。

【請求項 19】

前記用量が、前記患者に、少なくとも 1 日 2 回投与される、請求項 1 に記載の治療剤。

【請求項 20】

前記用量が、前記患者に、少なくとも 1 日 2 回、約 50 mg の用量として投与される、請求項 1 に記載の治療剤。

【請求項 21】

50

前記用量が、前記患者に、少なくとも1日2回、約100mgの用量として投与される、請求項1に記載の治療剤。

【請求項22】

前記用量が、前記患者に、少なくとも1日2回、約150mgの用量として投与される、請求項1に記載の治療剤。

【請求項23】

前記用量が、前記患者に、少なくとも1日2回、約200mgの用量として投与される、請求項1に記載の治療剤。

【請求項24】

前記患者が、用量制限毒性(DLT)を示す場合、第2の用量の前記式Iの化合物又はその薬学的に許容される塩がさらに投与されるように用いられることを特徴とする、請求項1～23のいずれか一項に記載の治療剤であって、前記第2の用量が、第1の用量と比較して減少する、治療剤。 10

【請求項25】

前記第1の用量が、約50mg、約100mg、約150mg、及び約200mgからなる群から選択される、請求項24に記載の治療剤。

【請求項26】

前記第2の用量が、5mg、10mg、15mg、20mg、25mg、30mg、35mg、40mg、45mg、50mg、55mg、60mg、65mg、70mg、75mg、80mg、85mg、90mg、95mg、100mg、110mg、120mg、130mg、140mg、及び約150mgからなる群から選択される、請求項24に記載の治療剤。 20

【請求項27】

前記第2の用量が、前記第1の用量と比較して50mg減少する、請求項24に記載の治療剤。

【請求項28】

前記第2の用量が、約50mg、約100mg、及び約150mgからなる群から選択される、請求項24に記載の治療剤。

【請求項29】

前記DLTが、治療中に発生した有害事象及び臨床的に重要な決定を含む、請求項24に記載の治療剤。 30

【請求項30】

前記DLTが、前記第1の用量を投与してから最初の21日間に生じる、請求項24に記載の治療剤。

【請求項31】

前記患者に、約50mg、約100mg、及び約150mgの前記式Iの化合物又はその薬学的に許容される塩からなる群から選択される前記第2の用量を投与した後に、前記患者が、DLTを示す場合、第3の用量の前記式Iの化合物又はその薬学的に許容される塩がさらに投与されるように用いられることを特徴とする、請求項24に記載の治療剤であって、前記第3の用量が、前記第2の用量と比較して減少する、治療剤。 40

【請求項32】

前記DLTが、治療中に発生した有害事象及び臨床的に重要な決定を含む、請求項31に記載の治療剤。

【請求項33】

前記DLTが、前記第2の用量を投与してから最初の21日間に生じる、請求項31に記載の治療剤。

【請求項34】

前記治療中に発生した有害事象が、グレード3以上である、請求項32に記載の治療剤。

【請求項35】

前記治療中に発生した有害事象が、グレード4である、請求項32に記載の治療剤。

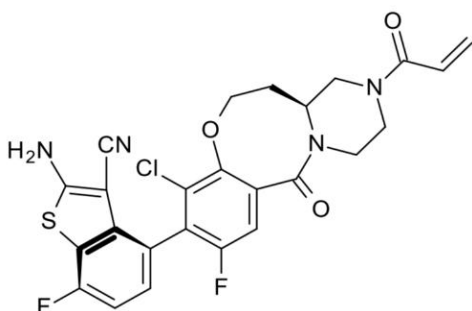
【請求項36】

前記第3の用量が、前記第2の用量と比較して50mg減少する、請求項31に記載の治療剤。

【請求項37】

式Iの化合物、

【化2】



(式 I)

10

又はその薬学的に許容される塩を含む、KRAS G12C変異がんの治療剤であって、前記化合物又はその薬学的に許容される塩が、治療を必要とする患者に約50mg～約200mgの用量で投与され、第2の治療薬と同時に、別個に、又は逐次組み合わせて投与されるように用いられることを特徴とする、治療剤。

20

【請求項38】

前記第2の治療薬が、PD-1阻害剤又はその薬学的に許容される塩、PD-L1阻害剤又はその薬学的に許容される塩、CDK4/CDK6阻害剤又はその薬学的に許容される塩、EGFR阻害剤又はその薬学的に許容される塩、ERK阻害剤又はその薬学的に許容される塩、白金剤又はその薬学的に許容される塩、抗葉酸剤又はその薬学的に許容される塩、オーロラA阻害剤又はその薬学的に許容される塩、及びSHP2阻害剤又はその薬学的に許容される塩からなる群のうちの一つ以上から選択される、請求項37に記載の治療剤。

【請求項39】

前記PD-1又はPD-L1阻害剤が、ペムプロリズマブである、請求項38に記載の治療剤。

30

【請求項40】

前記白金剤が、シスプラチンである、請求項38に記載の治療剤。

【請求項41】

前記白金剤が、カルボプラチンである、請求項38に記載の治療剤。

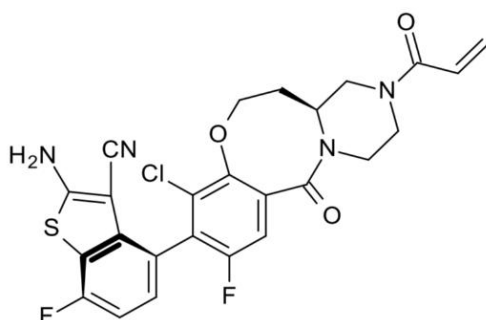
【請求項42】

前記抗葉酸剤が、ペメトレキセドである、請求項38に記載の治療剤。

【請求項43】

式Iの化合物、

【化3】



(式 I)

40

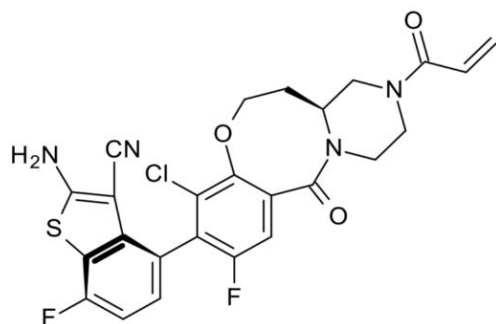
50

又はその薬学的に許容される塩を含む、KRAS G12C変異がんの治療剤であって、前記化合物又はその薬学的に許容される塩が、治療を必要とする患者に約50mg～約200mgの用量で投与され、KRAS G12C変異型進行性NSCLCの治療において、ペムプロリズマブと同時に、別個に、又は逐次組み合わせて投与されるように用いられることを特徴とする、治療剤。

【請求項44】

KRAS G12C変異がんの治療用の医薬の製造における式Iの化合物、

【化4】



(式I)

10

又はその薬学的に許容される塩の使用であって、前記医薬が約50mg～約200mgの用量の式Iの化合物又はその薬学的に許容される塩を含む、使用。

20

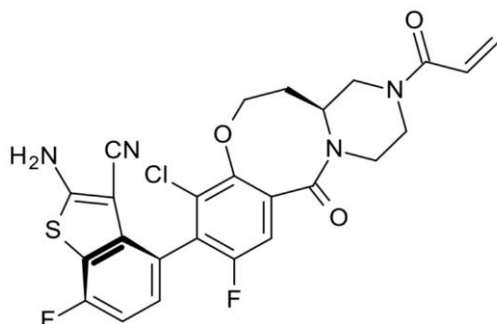
【請求項45】

前記用量が、約50mg、約100mg、約150mg、及び約200mgからなる群から選択される、請求項44に記載の使用。

【請求項46】

KRAS G12C変異がんの治療用の医薬の製造における式Iの化合物、

【化5】



(式I)

30

又はその薬学的に許容される塩の使用であって、前記医薬が、約50mg、約100mg、約150mg、及び約200mgからなる群から選択される第1の用量の式Iの化合物又はその薬学的に許容される塩が患者に投与されるように用いられ、

前記患者が、DLTを示す場合、第2の用量の前記式Iの化合物又はその薬学的に許容される塩が投与され、前記第2の用量が、前記第1の用量と比較して減少することを特徴とする、使用。

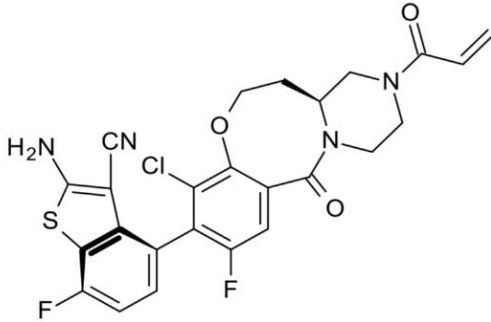
40

【請求項47】

KRAS G12C変異がんの治療用の医薬の製造における前記式Iの化合物、

50

## 【化6】



(式I)

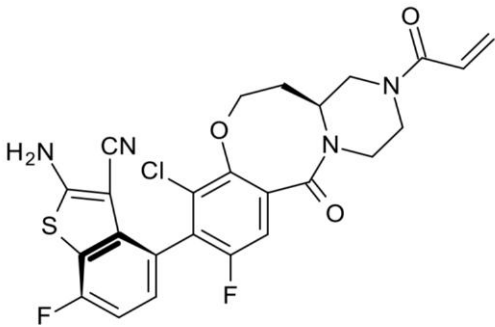
10

又はその薬学的に許容される塩の使用であって、前記医薬が約50mg～約200mgの用量の式Iの化合物又はその薬学的に許容される塩を含み、前記KRAS G12C変異がんが、KRAS G12C変異型進行性NSCLCである、使用。

## 【請求項48】

KRAS G12C変異がんの治療用の医薬の製造における、式Iの化合物、

## 【化7】



(式I)

20

又はその薬学的に許容される塩の使用であって、前記医薬が、約50mg～約200mgの用量の前記式Iの化合物又はその薬学的に許容される塩を含み、第2の治療薬と同時に、別個に、又は逐次組み合わせて投与されるように用いられることを特徴とする、使用。

30

## 【請求項49】

前記第2の治療薬が、PD-1阻害剤又はその薬学的に許容される塩、PD-L1阻害剤又はその薬学的に許容される塩、CDK4/CDK6阻害剤又はその薬学的に許容される塩、EGFR阻害剤又はその薬学的に許容される塩、ERK阻害剤又はその薬学的に許容される塩、白金剤又はその薬学的に許容される塩、抗葉酸剤又はその薬学的に許容される塩、オーロラA阻害剤又はその薬学的に許容される塩、及びSHP2阻害剤又はその薬学的に許容される塩のうちの一つ以上からなる群から選択される、請求項48に記載の使用。

## 【請求項50】

前記式Iの化合物又はその薬学的に許容される塩の用量が、約50mg、約100mg、及び約150mgからなる群から選択される減少用量である、請求項49に記載の使用。

40

## 【請求項51】

前記減少用量が、約50mgである、請求項50に記載の使用。

## 【請求項52】

前記減少用量が、約100mgである、請求項50に記載の使用。

## 【請求項53】

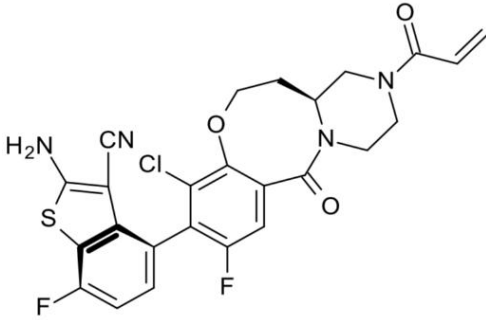
前記減少用量が、約150mgである、請求項50に記載の使用。

## 【請求項54】

式Iの化合物、

50

## 【化 8】



(式 I)

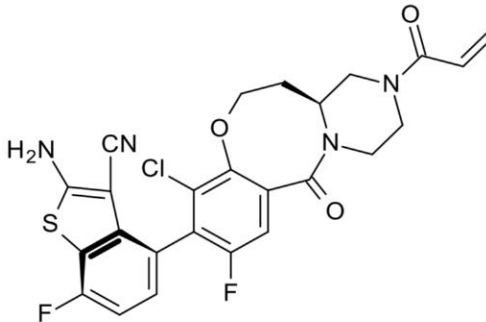
10

又はその薬学的に許容される塩を含む、K R A S G 1 2 C 変異がんの治療剤であって、前記化合物又はその薬学的に許容される塩が約 5 0 m g ~ 約 2 0 0 m g の用量にて治療を必要とする患者に投与されるように用いられることを特徴とし、前記 K R A S G 1 2 C 変異がんが、K R A S G 1 2 C 変異型膵臓がんである、治療剤。

## 【請求項 5 5】

K R A S G 1 2 C 変異がんの治療用の医薬の製造における前記式 I の化合物、

## 【化 9】



(式 I)

20

又はその薬学的に許容される塩の使用であって、前記医薬が、約 5 0 m g ~ 約 2 0 0 m g の用量の式 I の化合物又はその薬学的に許容される塩を含み、前記 K R A S G 1 2 C 変異がんが、K R A S G 1 2 C 変異型膵臓がんである、使用。

30

40

50