

【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5年10月31日(2023.10.31)

【公開番号】特開2022-177119(P2022-177119A)

【公開日】令和4年11月30日(2022.11.30)

【年通号数】公開公報(特許)2022-220

【出願番号】特願2022-144243(P2022-144243)

【国際特許分類】

A 61K 31/415(2006.01)

10

A 61P 35/00(2006.01)

A 61P 37/06(2006.01)

A 61P 35/02(2006.01)

C 07D 231/38(2006.01)

A 61P 43/00(2006.01)

A 61K 31/635(2006.01)

A 61K 39/395(2006.01)

A 61K 31/675(2006.01)

A 61K 31/704(2006.01)

A 61K 31/475(2006.01)

20

A 61K 31/573(2006.01)

【F I】

A 61K 31/415

A 61P 35/00

A 61P 37/06

A 61P 35/02

C 07D 231/38 B C S P

A 61P 43/00 121

A 61K 31/635

A 61K 39/395 T

30

A 61K 31/675

A 61K 31/704

A 61K 31/475

A 61K 31/573

【手続補正書】

【提出日】令和5年10月23日(2023.10.23)

【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

40

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

BTK媒介性癌を患う患者における活性化されたB細胞の増殖および/または生存の阻害に使用するための医薬品であって、

前記医薬品が、(S)-5-アミノ-3-(4-((5-フルオロ-2-メトキシベンズアミド)メチル)フェニル)-1-(1,1,1-トリフルオロプロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミドである化合物またはその薬学的に許容される塩を含み、

50

前記使用が、BTK媒介性癌を患う患者に、治療有効量の前記化合物またはその薬学的に許容される塩を、BTK媒介性癌の進行または許容できない毒性が生じるまで連続的な日用量レジメンで経口投与することを含み、

治療有効量の該投与により、AUC<sub>(0~24)</sub>が52400ng\*h/mL以上になります。

治療有効量の該投与により、該投与の24時間後に曝露が806ng/mL以上になる医薬品。

**【請求項2】**

前記AUC<sub>(0~24)</sub>が、91000ng\*h/mL以上になる、請求項1に記載の医薬品。

10

**【請求項3】**

前記曝露が、3910ng/mL以上になる、請求項1または2に記載の医薬品。

**【請求項4】**

前記曝露が、5770ng/mL以上になる、請求項3に記載の医薬品。

**【請求項5】**

治療有効量の該投与により、平均トラフ血漿レベルが2200ng/mLを超える、請求項1~4のいずれか1項に記載の医薬品。

**【請求項6】**

癌の治療に使用するための医薬品であって、

前記医薬品が、(S)-5-アミノ-3-(4-((5-フルオロ-2-メトキシベンズアミド)メチル)フェニル)-1-(1,1,1-トリフルオロプロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミドである化合物またはその薬学的に許容される塩を含み、

20

前記化合物またはその薬学的に許容される塩が、120mg~300mgの日用量で投与され、

該投与により、AUC<sub>(0~24)</sub>が91000ng\*h/mL以上になる、医薬品。

**【請求項7】**

癌の治療に使用するための医薬品であって、

前記医薬品が、(S)-5-アミノ-3-(4-((5-フルオロ-2-メトキシベンズアミド)メチル)フェニル)-1-(1,1,1-トリフルオロプロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミドである化合物またはその薬学的に許容される塩を含み、

30

前記化合物またはその薬学的に許容される塩が、120mg~300mgの日用量で投与され、

該投与により、該投与の24時間後に曝露が5770ng/mL以上になる、医薬品。

**【請求項8】**

癌の治療に使用するための医薬品であって、

前記医薬品が、(S)-5-アミノ-3-(4-((5-フルオロ-2-メトキシベンズアミド)メチル)フェニル)-1-(1,1,1-トリフルオロプロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミドである化合物またはその薬学的に許容される塩を含み、

40

前記化合物またはその薬学的に許容される塩が、120mg~300mgの日用量で投与され、

該投与により、平均トラフ血漿レベルが2200ng/mLを超える、医薬品。

**【請求項9】**

癌の治療に使用するための医薬品であって、

前記医薬品が、(S)-5-アミノ-3-(4-((5-フルオロ-2-メトキシベンズアミド)メチル)フェニル)-1-(1,1,1-トリフルオロプロパン-2-イル)-1H-ピラゾール-4-カルボキサミドである化合物またはその薬学的に許容される塩を含み、

50

前記化合物またはその薬学的に許容される塩の投与により、該投与の24時間後に曝露が3910ng/mL以上になる、医薬品。

10

20

30

40

50