

【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27年6月18日(2015.6.18)

【公表番号】特表2014-513097(P2014-513097A)

【公表日】平成26年5月29日(2014.5.29)

【年通号数】公開・登録公報2014-028

【出願番号】特願2014-508463(P2014-508463)

【国際特許分類】

A 61 K 31/4439 (2006.01)
A 61 K 31/506 (2006.01)
A 61 K 31/497 (2006.01)
A 61 K 31/4184 (2006.01)
A 61 P 43/00 (2006.01)
A 61 P 17/06 (2006.01)
A 61 P 13/08 (2006.01)
A 61 P 35/00 (2006.01)
A 61 P 35/02 (2006.01)
A 61 P 37/06 (2006.01)
A 61 P 9/10 (2006.01)
A 61 P 27/02 (2006.01)
A 61 P 9/12 (2006.01)
A 61 P 37/02 (2006.01)
A 61 P 25/00 (2006.01)
A 61 P 9/00 (2006.01)
A 61 P 21/00 (2006.01)
A 61 P 7/00 (2006.01)
A 61 P 31/04 (2006.01)
A 61 P 31/12 (2006.01)
A 61 K 31/436 (2006.01)
A 61 K 45/00 (2006.01)

【F I】

A 61 K 31/4439
A 61 K 31/506
A 61 K 31/497
A 61 K 31/4184
A 61 P 43/00 1 2 1
A 61 P 43/00 1 1 1
A 61 P 17/06
A 61 P 13/08
A 61 P 35/00
A 61 P 35/02
A 61 P 37/06
A 61 P 9/10
A 61 P 27/02
A 61 P 43/00 1 0 5
A 61 P 9/12
A 61 P 37/02
A 61 P 25/00
A 61 P 9/00

A 6 1 P 21/00
A 6 1 P 7/00
A 6 1 P 31/04
A 6 1 P 31/12
A 6 1 K 31/436
A 6 1 K 45/00

【手続補正書】

【提出日】平成27年4月21日(2015.4.21)

【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) 化合物(S)-ピロリジン-1,2-ジカルボン酸2-アミド1-(4-メチル-5-[2-(2,2,2-トリフルオロ-1,1-ジメチル-エチル)-ピリジン-4-イル]-チアゾール-2-イル)-アミド)またはその薬学的に許容される塩および

b) RADラパマイシン(シロリムス)およびその誘導体/類似体、エベロリムス(RAD001)、テムシロリムス(CC1-779)、ゾタロリムス(ABT578)、SAR543、アスコマイシン(FK506のエチルアナログ)、デフェロリムス(AP23573/MK-8669)、AP23841、KU-0063794、INK-128、EX2044、EX3855、EX7518、AZD08055、OSI-027、WYE-125132、XL765、NV-128、WYE-125132、ならびにEM101/LY303511またはその薬学的に許容される塩から選択される少なくとも1つのmTOR阻害剤

を含む薬学的組み合わせであって、

臓器または組織移植拒絶反応; 移植片対宿主病; 再狭窄; 過誤腫症候群; リンパ脈管筋腫症; 細膜色素変性; 自己免疫疾患; ステロイド抵抗性急性リンパ芽球性白血病; 線維性疾患; 肺高血圧症; 免疫修飾; 多発性硬化症; VHL症候群; カーニー複合; 家族性アデノナムトスボリポーシス; 若年性ポリポーシス症候群; バート・ホッグ・デューク症候群; 家族性肥大型心筋症; ウォルフ・パーキンソン・ホワイト症候群; 神經変性(Neurodegenerative)障害; 渗出型および乾燥型黄斑変性; 筋消耗およびミオパシー; 細菌性およびウイルス性感染症; 神經線維腫症; ポイツ・ジェガース症候群、ならびに増殖性疾患から選択される、哺乳類ラパマイシン標的タンパク質(mTOR)キナーゼ依存性疾患の治療または予防に使用するための、薬学的組み合わせ。

【請求項2】

mTOR阻害剤がエベロリムス(RAD001)である、請求項1に記載の薬学的組み合わせ。

【請求項3】

増殖性疾患が、良性または悪性腫瘍; 脳、腎臓、肝臓、副腎、膀胱、乳房、腎細胞癌、神經内分泌腫瘍、前立腺、胃、胃腫瘍、卵巣、結腸、直腸、前立腺、脾臓、肺、腫もしくは甲状腺の癌、肉腫、膠芽腫、多発性骨髄腫または胃腸癌、上皮過剰増殖、乾癬、前立腺肥大症、新形成、上皮性新形成、リンパ腫、乳癌または白血病から選択される、請求項1または2に記載の薬学的組み合わせ。

【請求項4】

胃腸癌が、結腸癌、結腸直腸腺腫および頭頸部腫瘍から選択される、請求項3に記載の薬学的組み合わせ。

【請求項 5】

臓器または組織移植拒絶反応；移植片対宿主病；再狭窄；過誤腫症候群；リンパ脈管筋腫症；網膜色素変性；自己免疫疾患；ステロイド抵抗性急性リンパ芽球性白血病；線維性疾患；肺高血圧症；免疫修飾；多発性硬化症；VHL症候群；カーニー複合；家族性アデノナムトスボリポーシス；若年性ポリポーシス症候群；パート・ホッグ・デューク症候群；家族性肥大型心筋症；ウォルフ・パーキンソン・ホワイト症候群；神経変性(Neurodegenerative)障害；滲出型および乾燥型黄斑変性；筋消耗およびミオパチー；細菌性およびウイルス性感染症；神経線維腫症；ポイツ・ジェガース症候群、ならびに増殖性疾患から選択される、mTORキナーゼ依存性疾患の治療または予防に使用するための、請求項1または2に記載の薬学的組み合わせを含む、医薬組成物。

【請求項 6】

哺乳類ラバマイシン標的タンパク質(mTOR)キナーゼ依存性疾患の治療または予防のための薬剤を製造するための、化合物(S)-ピロリジン-1,2-ジカルボン酸2-アミド1-({4-メチル-5-[2-(2,2,2-トリフルオロ-1,1-ジメチル-エチル)-ピリジン-4-イル]-チアゾール-2-イル} -アミド)または薬学的に許容されるその塩、ならびに

RADラバマイシン(シロリムス)およびその誘導体/類似体、エベロリムス(RAD001)、テムシロリムス(CCI-779)、ゾタロリムス(ABT578)、SAR543、アスコマイシン(FK506のエチルアナログ)、デフェロリムス(AP23573/MK-8669)、AP23841、KU-0063794、INK-128、EX2044、EX3855、EX7518、AZD08055、OSI-027、WYE-125132、XL765、NV-128、WYE-125132ならびにEM101/LY303511から選択される少なくとも1つのmTOR阻害剤またはその薬学的に許容される塩の使用であって、

前記哺乳類ラバマイシン標的タンパク質(mTOR)キナーゼ依存性疾患が、臓器または組織移植拒絶反応；移植片対宿主病；再狭窄；過誤腫症候群；リンパ脈管筋腫症；網膜色素変性；自己免疫疾患；ステロイド抵抗性急性リンパ芽球性白血病；線維性疾患；肺高血圧症；免疫修飾；多発性硬化症；VHL症候群；カーニー複合；家族性アデノナムトスボリポーシス；若年性ポリポーシス症候群；パート・ホッグ・デューク症候群；家族性肥大型心筋症；ウォルフ・パーキンソン・ホワイト症候群；神経変性(Neurodegenerative)障害；滲出型および乾燥型黄斑変性；筋消耗およびミオパチー；細菌性およびウイルス性感染症；神経線維腫症；ポイツ・ジェガース症候群、ならびに増殖性疾患から選択されるものである、使用。

【請求項 7】

化合物(S)-ピロリジン-1,2-ジカルボン酸2-アミド1-({4-メチル-5-[2-(2,2,2-トリフルオロ-1,1-ジメチル-エチル)-ピリジン-4-イル]-チアゾール-2-イル} -アミド)または薬学的に許容されるその塩、ならびに

RADラバマイシン(シロリムス)およびその誘導体/類似体、エベロリムス(RAD001)、テムシロリムス(CCI-779)、ゾタロリムス(ABT578)、SAR543、アスコマイシン(FK506のエチルアナログ)、デフェロリムス(AP23573/MK-8669)、AP23841、KU-0063794、INK-128、EX2044、EX3855、EX7518、AZD08055、OSI-027、WYE-125132、XL765、NV-128、WYE-125132ならびにEM101/LY303511から選択される少なくとも1つのmTOR阻害剤または薬学的に許容されるその塩

をそれを必要とする温血動物に投与することによって、哺乳類ラバマイシン標的タンパク質(mTOR)キナーゼ依存性疾患を治療または予防する方法であって、

前記哺乳類ラバマイシン標的タンパク質(mTOR)キナーゼ依存性疾患が、臓器または組織移植拒絶反応；移植片対宿主病；再狭窄；過誤腫症候群；リンパ脈管筋腫症；網膜色素変性；自己免疫疾患；ステロイド抵抗性急性リンパ芽球性白血病；線維性疾患；肺高

血圧症；免疫修飾；多発性硬化症；VHL症候群；カーニー複合；家族性アデノナムトス
ポリポーシス；若年性ポリポーシス症候群；バート・ホッグ・デューク症候群；家族性肥
大型心筋症；ウォルフ・パーキンソン・ホワイト症候群；神経変性（Neurodegenerative
）障害；滲出型および乾燥型黄斑変性；筋消耗およびミオパチー；細菌性およびウイルス
性感染症；神経線維腫症；ポイツ・ジエガース症候群、ならびに増殖性疾患から選択され
るものである、方法。

【請求項 8】

mTOR阻害剤がエベロリムス（RAD001）である、請求項6に記載の使用または
請求項7に記載の方法。

【請求項 9】

増殖性疾患が、良性または悪性腫瘍；脳、腎臓、肝臓、副腎、膀胱、乳房、腎細胞癌、
神経内分泌腫瘍、前立腺、胃、胃腫瘍、卵巣、結腸、直腸、前立腺、胰臓、肺、腫もしくは
甲状腺の癌、肉腫、膠芽腫、多発性骨髄腫または胃腸癌、上皮過剰増殖、乾癬、前立腺
肥大症、新形成、上皮性新形成、リンパ腫、乳癌または白血病から選択されるものである、
請求項6に記載の使用または請求項7に記載の方法。

【請求項 10】

胃腸癌が、結腸癌、結腸直腸腺腫および頭頸部腫瘍から選択される、請求項9に記載の
使用または方法。

【請求項 11】

治療有効量の化合物（S）-ピロリジン-1,2-ジカルボン酸2-アミド1-（{4
-メチル-5-[2-(2,2,2-トリフルオロ-1,1-ジメチル-エチル)-ピリ
ジン-4-イル]-チアゾール-2-イル}-アミド）、または薬学的に許容されるその
塩をそれを必要とする温血動物に投与するステップを含む、RADラパマイシン（シロリ
ムス）およびその誘導体／類似体、エベロリムス（RAD001）、テムシロリムス（C
CI-779）、ゾタロリムス（ABT578）、SAR543、アスコマイシン（FK
506のエチルアナログ）、デフェロリムス（AP23573/MK-8669）、AP
23841、KU-0063794、INK-128、EX2044、EX3855、EX
7518、AZD08055、OSI-027、WYE-125132、XL765、
NV-128、WYE-125132ならびにEM101/LY303511から選択さ
れる少なくとも1つのmTOR阻害剤または薬学的に許容されるその塩による治療に耐性
を持つようになったか、またはそれに対する感受性が低下した増殖性疾患を治療する方法
。

【請求項 12】

a) 化合物（S）-ピロリジン-1,2-ジカルボン酸2-アミド1-（{4-メチル
-5-[2-(2,2,2-トリフルオロ-1,1-ジメチル-エチル)-ピリジン-4
-イル]-チアゾール-2-イル}-アミド）またはその薬学的に許容される塩
および

b) エベロリムス（RAD001）、テムシロリムス（CI-779）、ゾタロリムス（ABT578）、SAR543、デフェロリムス（AP23573/MK-8669）、AP23841、KU-0063794、INK-128、EX2044、EX3855、EX7518、AZD08055、OSI-027、WYE-125132、XL765、NV-128、WYE-125132、ならびにEM101/LY303511
またはその薬学的に許容される塩から選択される少なくとも1つのmTOR阻害剤
を含む薬学的組み合わせ。

【請求項 13】

mTOR阻害剤がエベロリムス（RAD001）またはその薬学的に許容される塩であ
る、請求項12に記載の薬学的組み合わせ。