

【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 8 月 30 日(2024.8.30)

【公開番号】特開 2024-59647(P2024-59647A)
【公開日】令和 6 年 5 月 1 日(2024.5.1)
【年通号数】公開公報(特許)2024-080
【出願番号】特願 2024-14546(P2024-14546)
【国際特許分類】

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)
A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
A 6 1 P 3 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)
A 6 1 P 3 5 / 0 2 (2 0 0 6 . 0 1)
A 6 1 K 3 1 / 5 3 (2 0 0 6 . 0 1)

10

【F I】

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 1 4 0
C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 C S P
A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1
A 6 1 P 3 5 / 0 0
A 6 1 P 3 5 / 0 2
A 6 1 K 3 1 / 5 3

20

【手続補正書】
【提出日】令和 6 年 8 月 21 日(2024.8.21)
【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】

30

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

N - (4 - (4 - アミノ - 7 - (1 - イソブチリルピペリジン - 4 - イル) ピロロ [1 , 2 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 5 - イル) フェニル) - 1 - イソプロピル - 2 , 4 - ジオキソ - 3 - (ピリジン - 2 - イル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 5 - カルボキサミドマレイン酸塩である塩及び更なる治療薬を含む、がんの治療のための組合せ医薬であって、前記塩及び前記更なる治療薬が、単一の剤形として、または別々の剤形として同時もしくは逐次的に、前記がんの治療を必要とする患者に投与される、前記組合せ医薬であり、

前記更なる治療薬が、

i) 抗ウイルス剤、化学療法剤もしくは他の抗がん剤、免疫増強剤、免疫抑制剤、放射線、抗腫瘍、抗ウイルスワクチン、サイトカイン療法剤、及びチロシンキナーゼ阻害剤、ならびに

40

i i) 抗 P D 1 抗体、抗 P D - L 1 抗体、及び抗 C T L A - 4 抗体から選択される免疫チェックポイント分子の阻害剤

から選択される、

前記組合せ医薬。

【請求項 2】

前記がんが、肝細胞癌、膀胱癌、乳癌、子宮頸癌、結腸直腸癌、子宮内膜癌、胃癌、頭頸部癌、腎臓癌、肝臓癌、肺癌、卵巣癌、前立腺癌、食道癌、胆嚢癌、膵臓癌、甲状腺癌、皮膚癌、白血病、多発性骨髄腫、慢性リンパ球性リンパ腫、成人 T 細胞白血病、B 細胞

50

リンパ腫、急性骨髄性白血病、ホジキンリンパ腫または非ホジキンリンパ腫、ワルデンストレーマクログロブリン血症、有毛細胞リンパ腫、バーキットリンパ腫、神経膠芽腫、黒色腫、及び横紋筋肉腫から選択される、請求項 1 に記載の組合せ医薬。

【請求項 3】

前記がんが、肺癌、前立腺癌、結腸癌、乳癌、黒色腫、腎細胞癌、多発性骨髄腫、胃癌、または横紋筋肉腫である、請求項 1 に記載の組合せ医薬。

【請求項 4】

前記がんが、頭頸部癌である、請求項 1 に記載の組合せ医薬。

【請求項 5】

前記更なる治療薬が、抗ウイルス剤、化学療法剤もしくは他の抗がん剤、免疫増強剤、免疫抑制剤、放射線、抗腫瘍、抗ウイルスワクチン、サイトカイン療法剤、及びチロシンキナーゼ阻害剤から選択される、請求項 1 ～ 4 のいずれか 1 項に記載の組合せ医薬。

10

【請求項 6】

前記更なる治療薬が、抗 PD 1 抗体、抗 PD - L 1 抗体、及び抗 CTLA - 4 抗体から選択される免疫チェックポイント分子の阻害剤である、請求項 1 ～ 4 のいずれか 1 項に記載の組合せ医薬。

【請求項 7】

前記塩が、マレイン酸に対する N - (4 - (4 - アミノ - 7 - (1 - イソブチリルピペリジン - 4 - イル) ピロロ [1 , 2 - f] [1 , 2 , 4] トリアジン - 5 - イル) フェニル) - 1 - イソプロピル - 2 , 4 - ジオキソ - 3 - (ピリジン - 2 - イル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロピリミジン - 5 - カルボキサミドの化学量論比が 1 : 1 であるものである、請求項 1 ～ 6 のいずれか 1 項に記載の組合せ医薬。

20

【請求項 8】

前記塩が、結晶性の塩である、請求項 1 ～ 7 のいずれか 1 項に記載の組合せ医薬。

【請求項 9】

前記結晶性の塩が、 $2 \cdot 1 \cdot 1 \pm 3$ に吸熱ピークを有する DSC 曲線の特徴とする、請求項 8 に記載の組合せ医薬。

【請求項 10】

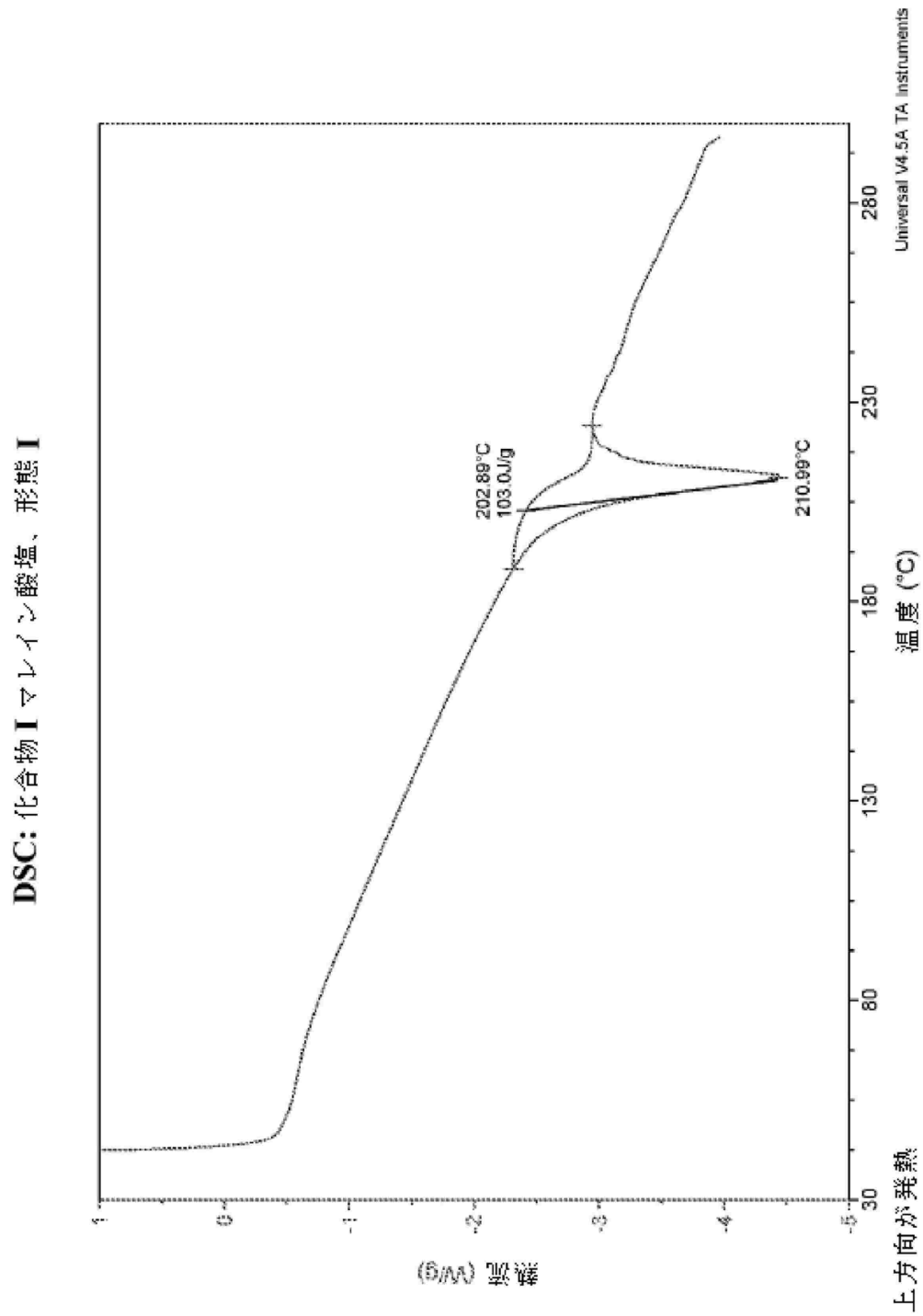
前記結晶性の塩が、DSC 曲線が図 2 :

30

40

50

図 2



で示されるものである、請求項 8 または 9 に記載の組合せ医薬。

【請求項 11】

前記結晶性の塩が、TGA 曲線が図 3：

10

20

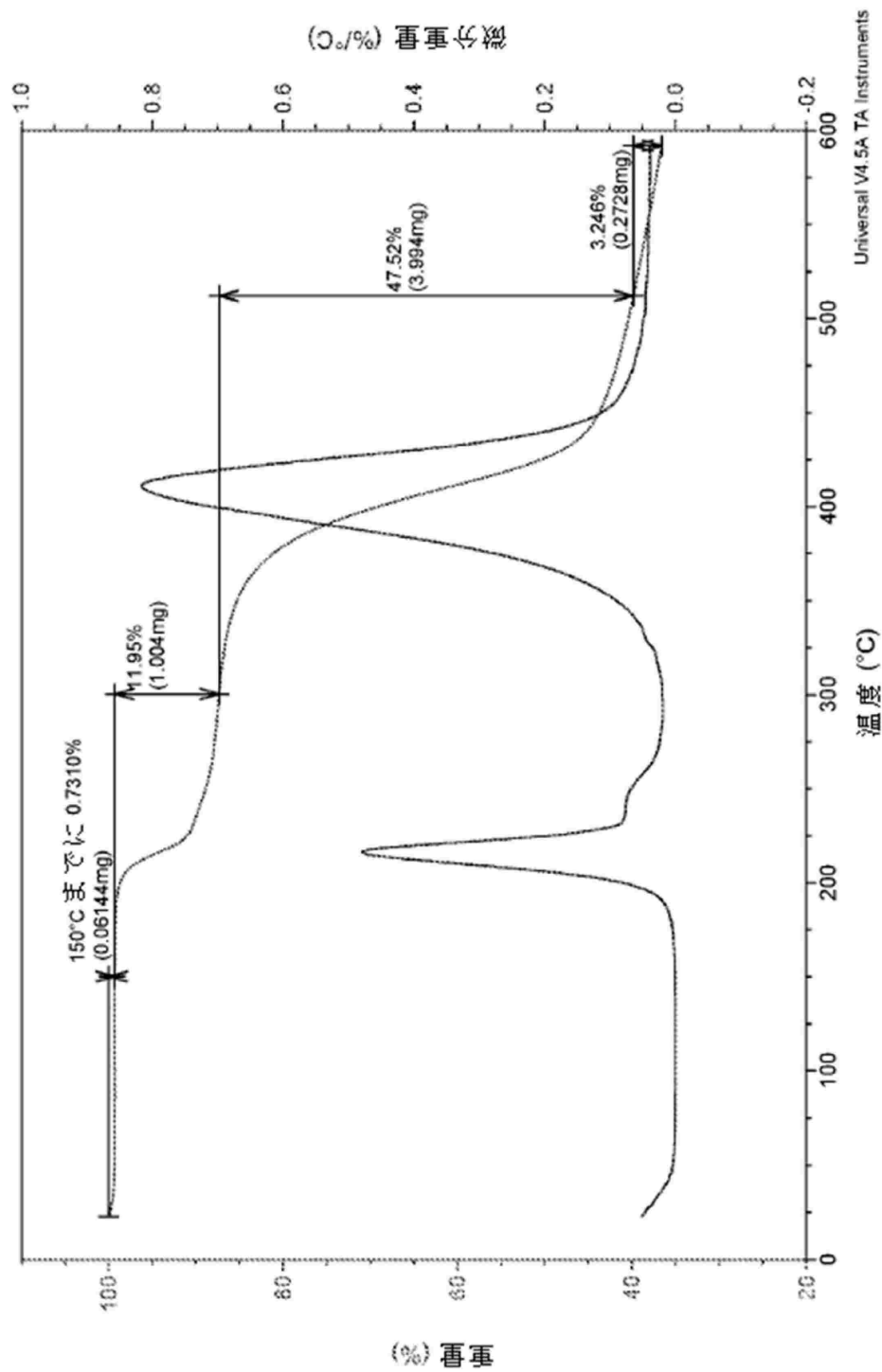
30

40

50

図 3

TGA: 化合物 I マレイン酸塩、形態 I



で示されるものである、請求項 8 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の組合せ医薬。

【請求項 12】

前記結晶性の塩が、XRPDプロファイルが図 1：

10

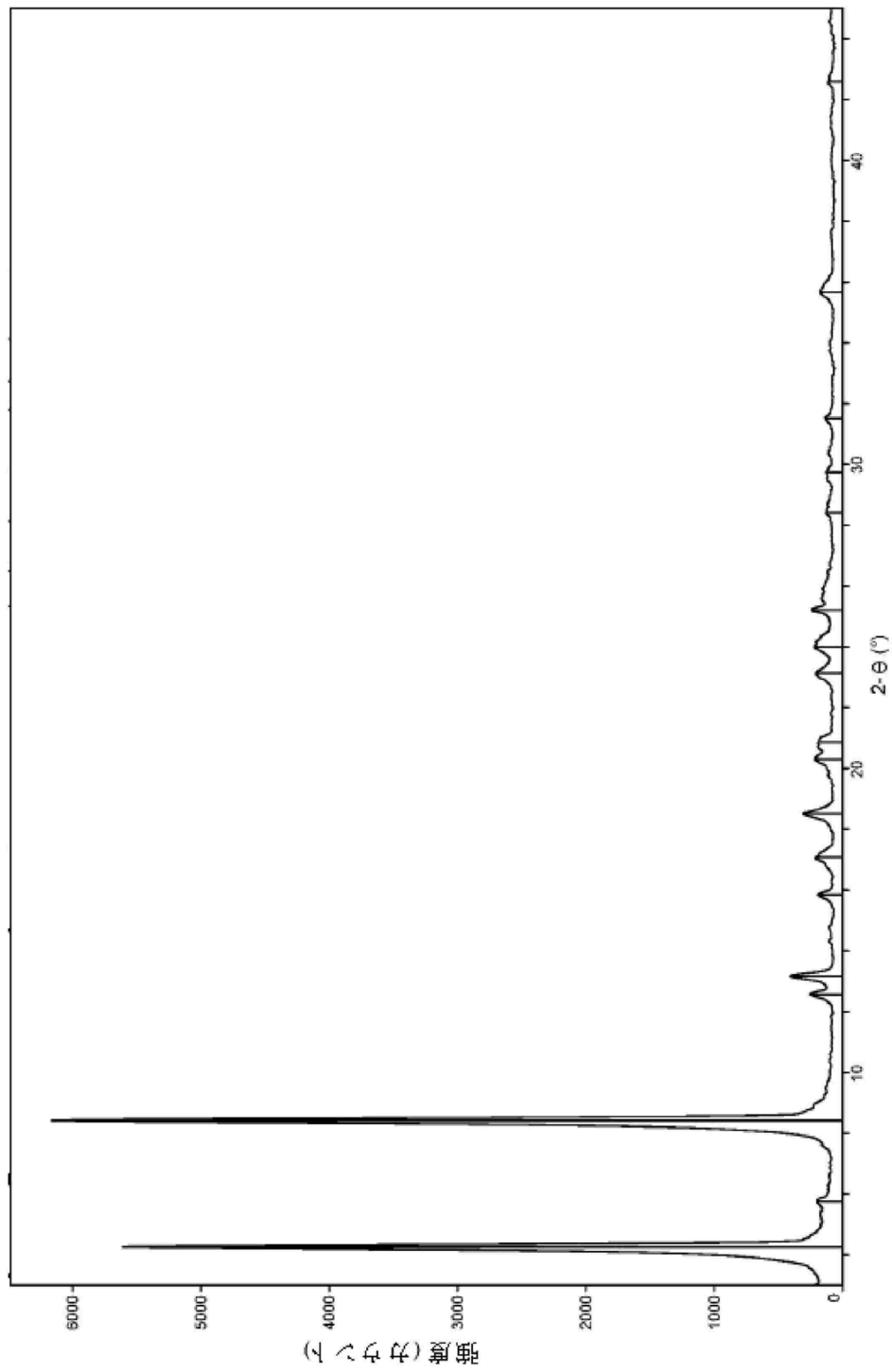
20

30

40

50

図 1

XRPD: 化合物 I マレイン酸塩、形態 I

で示されるものである、請求項 8 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の組合せ医薬。