

【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30年5月10日 (2018.5.10)

【公表番号】特表2017-512791(P2017-512791A)

【公表日】平成29年5月25日 (2017.5.25)

【年通号数】公開・登録公報2017-019

【出願番号】特願2016-558662(P2016-558662)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/498 (2006.01)

A 6 1 K 31/4985 (2006.01)

A 6 1 K 31/5025 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/498

A 6 1 K 31/4985

A 6 1 K 31/5025

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 45/00

【手続補正書】

【提出日】平成30年3月23日 (2018.3.23)

【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

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

N - (3 , 5 - ジメトキシフェニル) - N ' - (1 - メチルエチル) - N - [3 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) キノキサリン - 6 - イル] エタン - 1 , 2 - ジアミンまたはその薬学的に許容可能な塩もしくはその溶媒和物、および N - (2 - フルオロ - 3 , 5 - ジメトキシフェニル) - N - (1 H - イミダゾール - 2 - イルメチル) - 3 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリド [2 , 3 - b] ピラジン - 6 - アミンまたはその薬学的に許容可能な塩もしくはその溶媒和物から選択される第 1 の化合物と、 c M e t 阻害剤である第 2 の化合物との、組合せ。

【請求項 2】

第 1 の化合物が N - (3 , 5 - ジメトキシフェニル) - N ' - (1 - メチルエチル) - N - [3 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) キノキサリン - 6 - イル] エタン - 1 , 2 - ジアミンまたはその薬学的に許容可能な塩もしくはその溶媒和物である、請求項 1 に記載の組合せ。

【請求項 3】

第 1 の化合物が N - (3 , 5 - ジメトキシフェニル) - N ' - (1 - メチルエチル) - N - [3 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) キノキサリン - 6 - イル] エタン - 1 , 2 - ジアミン塩基である、請求項 2 に記載の組合せ。

【請求項 4】

第 1 の化合物が N - (2 - フルオロ - 3 , 5 - ジメトキシフェニル) - N - (1 H - イミダゾール - 2 - イルメチル) - 3 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリド [2 , 3 - b] ピラジン - 6 - アミンまたはその薬学的に許容可能な塩もしくはその溶媒和物である、請求項 1 に記載の組合せ。

【請求項 5】

第 1 の化合物が N - (2 - フルオロ - 3 , 5 - ジメトキシフェニル) - N - (1 H - イミダゾール - 2 - イルメチル) - 3 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリド [2 , 3 - b] ピラジン - 6 - アミン塩基である、請求項 4 に記載の組合せ。

【請求項 6】

c M e t 阻害剤が、6 - { ジフルオロ [6 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) [1 , 2 , 4] トリアゾロ [4 , 3 - b] ピリダジン - 3 - イル] メチル } キノリンまたはその薬学的に許容可能な塩もしくはその溶媒和物、および 6 - [ジフルオロ (6 - ピリジン - 4 - イル [1 , 2 , 4] トリアゾロ [4 , 3 - b] ピリダジン - 3 - イル) メチル] キノリンまたはその薬学的に許容可能な塩もしくはその溶媒和物から選択される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の組合せ。

【請求項 7】

c M e t 阻害剤が 6 - { ジフルオロ [6 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) [1 , 2 , 4] トリアゾロ [4 , 3 - b] ピリダジン - 3 - イル] メチル } キノリンまたはその薬学的に許容可能な塩もしくはその溶媒和物である、請求項 6 に記載の組合せ。

【請求項 8】

c M e t 阻害剤が 6 - { ジフルオロ [6 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) [1 , 2 , 4] トリアゾロ [4 , 3 - b] ピリダジン - 3 - イル] メチル } キノリン塩基である、請求項 7 に記載の組合せ。

【請求項 9】

c M e t 阻害剤が 6 - [ジフルオロ (6 - ピリジン - 4 - イル [1 , 2 , 4] トリアゾロ [4 , 3 - b] ピリダジン - 3 - イル) メチル] キノリンまたはその薬学的に許容可能な塩もしくはその溶媒和物である、請求項 6 に記載の組合せ。

【請求項 10】

c M e t 阻害剤が 6 - [ジフルオロ (6 - ピリジン - 4 - イル [1 , 2 , 4] トリアゾロ [4 , 3 - b] ピリダジン - 3 - イル) メチル] キノリン塩基である、請求項 9 に記載の組合せ。

【請求項 11】

薬学的に許容可能な担体と請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の組合せとを含んでなる、医薬組成物。

【請求項 12】

薬剤として使用するための、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の組合せまたは請求項 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

癌の予防または治療、特に、癌の治療を目的とする薬剤の製造のための、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の組合せまたは請求項 11 に記載の医薬組成物の使用。

【請求項 14】

癌の予防または治療、特に、癌の治療に使用するための、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の組合せまたは請求項 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

癌の予防または治療のための方法であって、それを必要とする被験体に請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の組合せまたは請求項 11 に記載の医薬組成物を投与することを含んでなる、方法。

【請求項 16】

肺癌、膀胱癌、乳癌、胃癌または肝細胞癌の治療のための、請求項 13 に記載の使用、または請求項 14 に記載の組合せ若しくは医薬組成物、または請求項 15 に記載の方法。

【請求項 17】

(i) 前記癌が膀胱癌である、

(ii) 前記癌が F G F R 3 の染色体転座を伴う膀胱癌である、または

(iii) 前記癌が F G F R 3 の点突然変異を伴う膀胱癌である、

請求項 14 に記載の組合せ若しくは医薬組成物。

【請求項 18】

(i) 前記癌が、F G F R 1、F G F R 2、F G F R 3 若しくは F G F R 4 の突然変異体を有する腫瘍である、

(ii) 前記癌が、F G F R 2 若しくは F G F R 3 の機能獲得型突然変異体を有する腫瘍である、または

(iii) 前記癌が、F G F R 1 の過剰発現を伴う腫瘍である、

癌の治療に使用するための、請求項 14 に記載の組合せ若しくは医薬組成物。

【請求項 19】

前記癌が、膀胱癌、尿路上皮癌、転移性尿路上皮癌、外科摘出不能尿路上皮癌、乳癌、膠芽腫、肺癌、非小細胞肺癌、扁平上皮細胞肺癌、肺の腺癌、肺腺癌、小細胞肺癌、卵巣癌、子宮内膜癌、子宮頸癌、軟組織肉腫、頭頸部扁平上皮癌、胃癌、食道癌、食道の扁平上皮癌、食道の腺癌、胆管癌または肝細胞癌である、癌の治療に使用するための、請求項 14 に記載の組合せ若しくは医薬組成物。

【請求項 20】

前記癌が、尿路上皮癌、転移性尿路上皮癌または外科摘出不能尿路上皮癌である、請求項 19 に記載の組合せ若しくは医薬組成物。

【請求項 21】

請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の組合せを、癌の治療における同時、個別または逐次使用のための組合せ製剤として含んでなる、医薬製剤。