

【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31年1月24日 (2019.1.24)

【公表番号】特表2017-537124(P2017-537124A)

【公表日】平成29年12月14日 (2017.12.14)

【年通号数】公開・登録公報2017-048

【出願番号】特願2017-530656(P2017-530656)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4745 (2006.01)

A 6 1 K 9/127 (2006.01)

A 6 1 K 49/18 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/04 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/4745

A 6 1 K 9/127

A 6 1 K 49/18

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/04

【手続補正書】

【提出日】平成30年12月7日 (2018.12.7)

【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】

少なくとも 1 の脳の病変を伴うヒトの患者の乳がんの治療のための医薬の製造のためのリポソーマルイリノテカンの使用であって、前記医薬は、 60 mg/m^2 の用量のリポソーマルイリノテカンが 2 週間毎に 1 度投与されるように製剤化されることを特徴とする使用。

【請求項 2】

前記乳がんが、ホルモン受容体陽性乳がん、ER 陽性乳がん、PR 陽性乳がん、ER 陽性 / PR 陽性乳がん、またはトリプルネガティブ乳がんである、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 3】

前記乳がんが、HER 2 陰性乳がんである、請求項 1 または請求項 2 に記載の使用。

【請求項 4】

前記乳がんが、HER 2 陽性乳がんである、請求項 1 または請求項 2 に記載の使用。

【請求項 5】

前記ヒトの患者が UGT 1A1 * 28 対立遺伝子についてホモ接合ではない、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 6】

前記リポソーマルイリノテカンの投与に先立って、前記患者が、デキサメタゾン及び / または制吐剤の投薬を受けている、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 7】

前記制吐剤が、5-HT₃ アンタゴニストである、請求項 6 に記載の使用。

【請求項 8】

前記医薬が、前記リボソーマルイリノテカンが90分間にわたって静脈内投与されるように製剤化されることを特徴とする、請求項1～7のいずれか1項に記載の使用。

【請求項9】

前記患者は以前に、少なくとも1つの白金をベースとする化学療法レジメンが不成功であった、請求項1～8のいずれか1項に記載の使用。

【請求項10】

前記患者は以前に、ゲムシタビンによる治療が不成功であったか、またはゲムシタビンに対して耐性になった、請求項1～9のいずれか1項に記載の使用。

【請求項11】

前記医薬が、リボソーム中に封入されたイリノテカンスクロースオクタスルファートを含む、請求項1～10のいずれか1項に記載の使用。

【請求項12】

前記医薬が、スクロースオクタスルファート塩として、ゲル化したまたは沈殿した状態でイリノテカンを含む水性空間を封入した、直径が約80～140nmの一枚膜脂質二重層ベシクルを含む、請求項1～11のいずれか1項に記載の使用。

【請求項13】

前記医薬が、ホスファチジルコリン、コレステロール、及び200のリン脂質分子に対して約1のポリエチレングリコール(PEG)分子の量のポリエチレングリコールで誘導体化されたホスファチジル-エタノールアミンを含む、請求項1～12のいずれか1項に記載の使用。

【請求項14】

少なくとも1の脳の病変を伴うヒトの患者の乳がんの治療のための組成物であって、前記組成物は、リボソーマルイリノテカンを含み、前記組成物は、 $60\text{mg}/\text{m}^2$ のリボソーマルイリノテカンの用量で2週間毎に1度投与されることを特徴とする組成物。

【請求項15】

前記乳がんが、ホルモン受容体陽性乳がん、ER陽性乳がん、PR陽性乳がん、ER陽性/PR陽性乳がん、またはトリプルネガティブ乳がんである、請求項14に記載の組成物。

【請求項16】

前記乳がんが、HER2陰性乳がんである、請求項14または請求項15に記載の組成物。

【請求項17】

前記乳がんが、HER2陽性乳がんである、請求項14または請求項15に記載の組成物。

【請求項18】

前記ヒトの患者がUGT1A1*28対立遺伝子についてホモ接合ではない、請求項14～17のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項19】

前記組成物の投与に先立って、前記患者が、デキサメタゾン及び/または制吐剤の投薬を受けている、請求項14～18のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項20】

前記制吐剤が、5-HT3アンタゴニストである、請求項19に記載の組成物。

【請求項21】

前記組成物が、90分間にわたって静脈内投与されることを特徴とする、請求項14～20のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項22】

前記患者は以前に、少なくとも1つの白金をベースとする化学療法レジメンが不成功であった、請求項14～21のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項23】

前記患者は以前に、ゲムシタビンによる治療が不成功であったか、またはゲムシタビン

に対して耐性になった、請求項 1 4 ~ 2 2 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 2 4】

前記組成物が、リボソーム中に封入されたイリノテカンスクロースオクタスルファートを含む、請求項 1 4 ~ 2 3 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 2 5】

前記組成物が、スクロースオクタスルファート塩として、ゲル化したまたは沈殿した状態でイリノテカンを含む水性空間を封入した、直径が約 8 0 ~ 1 4 0 n m の一枚膜脂質二重層ベシクルを含む、請求項 1 4 ~ 2 4 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 2 6】

前記組成物が、ホスファチジルコリン、コレステロール、及び 2 0 0 のリン脂質分子に対して約 1 のポリエチレングリコール (P E G) 分子の量のポリエチレングリコールで誘導体化されたホスファチジル - エタノールアミンを含む、請求項 1 4 ~ 2 5 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 1 0

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 1 0】

別の態様において、容器であって、1) 少なくとも 1 回分の M M - 3 9 8 が入った第 2 の容器と、2) 本明細書に開示される方法及び使用に従った、上記イリノテカンの使用説明書とが入った上記容器を備える、ヒトの患者の乳がんの治療用キットが提供される。

特定の実施形態において、例えば、以下が提供される：

(項目 1)

ヒトの患者の乳がんの治療のための、前記ヒトの患者へのフェルモキシトールの投与に続いて、2 週間毎に 1 度投与される $80 \text{ mg} / \text{m}^2$ の単回投与のリボソーマルイリノテカンの使用。

(項目 2)

前記フェルモキシトールの投与に続き、前記リボソーマルイリノテカンの投与に先立って、M R I スキャンによって得られる前記患者内のフェルモキシトールの画像を得る、項目 1 に記載の方法。

(項目 3)

前記スキャンされる体部が前記患者の病変の位置によって決定される、項目 3 に記載の方法。

(項目 4)

前記フェルモキシトールが乳がん病変中で検出され、該乳がん病変が、ホルモン受容体陽性乳がん病変、E R 陽性病変、P R 陽性病変、E R 陽性 / P R 陽性病変、トリプルネガティブ乳がん病変、転移性乳がん病変及び活動性脳転移病変からなる群より選択される、項目 3 に記載の使用。

(項目 5)

前記乳がん病変が転移性乳がん病変である、項目 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 6)

前記乳がん病変が活動性脳転移病変である、項目 5 に記載の使用。

(項目 7)

前記ヒトの患者が U G T 1 A 1 * 2 8 対立遺伝子についてホモ接合ではない、項目 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 8)

前記用量が、 $5 \text{ mg} / \text{kg}$ の単回用量で、最大で 510 mg を越えない総単回用量である、項目 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 9)

前記画像が前記フェルモキシトールの前記投与後 1 ～ 4 時間で得られる、項目 2 ～ 8 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 1 0)

前記画像が前記フェルモキシトールの前記投与後 2 4 時間で得られる、項目 2 ～ 8 のいずれか 1 項に記載の使用。

(項目 1 1)

前記リボソーマルイリノテカンが、リボソーム中に封入されたイリノテカンスクロースオクタスルファートを含む、項目 1 ～ 1 0 のいずれか 1 項に記載の使用。