

【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4月18日 (2019.4.18)

【公表番号】特表2018-513123(P2018-513123A)

【公表日】平成30年5月24日 (2018.5.24)

【年通号数】公開・登録公報2018-019

【出願番号】特願2017-547968(P2017-547968)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/06 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 13/10 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 7/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 5/28 (2006.01)

A 6 1 P 5/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/58 (2006.01)

A 6 1 K 31/167 (2006.01)

A 6 1 K 31/473 (2006.01)

A 6 1 K 31/4166 (2006.01)

A 6 1 K 31/275 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/568 (2006.01)

A 6 1 K 31/138 (2006.01)

A 6 1 K 31/337 (2006.01)

C 1 2 N 15/113 (2010.01)

C 1 2 N 15/09 (2006.01)

C 1 2 Q 1/68 (2018.01)

C 1 2 Q 1/66 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/00 Z N A

A 6 1 K 45/06

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 P 13/08

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 13/10

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 7/00

A 6 1 P 25/00 1 0 1

A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	37/02	
A 6 1 P	5/28	
A 6 1 P	5/00	
A 6 1 K	31/58	
A 6 1 K	31/167	
A 6 1 K	31/473	
A 6 1 K	31/4166	
A 6 1 K	31/275	
A 6 1 K	31/4439	
A 6 1 K	31/568	
A 6 1 K	31/138	
A 6 1 K	31/337	
C 1 2 N	15/00	G
C 1 2 N	15/00	A
C 1 2 Q	1/68	A
C 1 2 Q	1/68	Z
C 1 2 Q	1/66	

【手続補正書】

【提出日】平成31年3月6日(2019.3.6)

【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】

有効量のレチノイン酸受容体関連オーファン受容体 γ (ROR γ) 阻害剤を含む、対象においてがんを治療するための薬学的組成物。

【請求項 2】

前記がんが、抗がん剤に抵抗性である、請求項1記載の薬学的組成物。

【請求項 3】

前記抗がん剤が、抗アンドロゲン薬、化学療法剤、放射線治療剤、抗原特異的免疫治療剤、内分泌療法、チロシンキナーゼ阻害剤、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、請求項2記載の薬学的組成物。

【請求項 4】

前記抗アンドロゲン薬が、エンザルタミド、ビカルタミド、アピラテロン (arbitratone)、ニルタミド、フルタミド、アパルタミド、フィナステリド、デュタステリド、アルファトラジオール、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、請求項3記載の薬学的組成物。

【請求項 5】

前記化学療法剤が、タモキシフェン、タキサン、またはこれらの組み合わせである、請求項3記載の薬学的組成物。

【請求項 6】

前記タキサンが、パクリタキセル、ドセタキセル、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、請求項5記載の薬学的組成物。

【請求項 7】

前記がんが、前立腺がん、肺がん、乳がん、肝臓がん、卵巣がん、子宮内膜がん、膀胱がん、結腸がん、リンパ腫、および神経膠腫からなる群より選択される、請求項1～6のい

ずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項 8】

前記前立腺がんが、去勢抵抗性前立腺がんである、請求項7記載の薬学的組成物。

【請求項 9】

前記肺がんが、非小細胞肺がん（NSCLC）、K-Ras変異肺がん、BRAF変異肺がん、EGFR変異肺がん、チロシンキナーゼ阻害剤抵抗性肺がん、または小細胞肺がん（SCLC）である、請求項7記載の薬学的組成物。

【請求項 10】

前記乳がんが、トリプルネガティブ乳がん（TNBC）、タモキシフェン抵抗性乳がん、放射線抵抗性乳がん、HER2陽性乳がん、またはER陽性乳がんである、請求項7記載の薬学的組成物。

【請求項 11】

前記ROR γ 阻害剤が、低分子化合物である、請求項1～10のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項 12】

前記低分子化合物が、ROR γ に選択的に結合し、ROR γ 活性を阻害する、請求項11記載の薬学的組成物。

【請求項 13】

前記対象が、がん治療を必要とするヒトである、請求項1～12のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項 14】

有効量のレチノイン酸受容体関連オーファン受容体 γ （ROR γ ）阻害剤を含む、対象においてがんを治療するための薬学的組成物であって、有効量の抗がん剤と組み合わせる対象に投与されるように用いられる、薬学的組成物。

【請求項 15】

前記がんが、前記抗がん剤に抵抗性である、請求項14記載の薬学的組成物。

【請求項 16】

前記ROR γ 阻害剤が、前記抗がん剤の治療効果を増強する、請求項14または15記載の薬学的組成物。

【請求項 17】

前記ROR γ 阻害剤が、前記抗がん剤に対するがん細胞抵抗性を逆転するもしくは減少させ、かつ／またはがん細胞を前記抗がん剤に対して感受性にする、請求項16記載の薬学的組成物。

【請求項 18】

前記がんが、前立腺がん、肺がん、乳がん、肝臓がん、卵巣がん、子宮内膜がん、膀胱がん、結腸がん、リンパ腫、および神経膠腫からなる群より選択される、請求項14～17のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項 19】

前記前立腺がんが、去勢抵抗性前立腺がんである、請求項18記載の薬学的組成物。

【請求項 20】

前記肺がんが、非小細胞肺がん（NSCLC）、K-Ras変異肺がん、BRAF変異肺がん、EGFR変異肺がん、チロシンキナーゼ阻害剤抵抗性肺がん、または小細胞肺がん（SCLC）である、請求項18記載の薬学的組成物。

【請求項 21】

前記乳がんが、トリプルネガティブ乳がん（TNBC）、タモキシフェン抵抗性乳がん、放射線抵抗性乳がん、HER2陽性乳がん、またはER陽性乳がんである、請求項18記載の薬学的組成物。

【請求項 22】

前記ROR γ 阻害剤が、低分子化合物である、請求項14～21のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項 23】

前記低分子化合物が、ROR γ に選択的に結合し、ROR γ 活性を阻害する、請求項22記載の薬学的組成物。

【請求項 24】

前記抗がん剤が、抗アンドロゲン薬、化学療法剤、放射線治療剤、抗原特異的免疫治療剤、内分泌療法、チロシンキナーゼ阻害剤、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、請求項14～23のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項 25】

前記抗アンドロゲン薬が、エンザルタミド、ビカルタミド、アピラテロン、ニルタミド、フルタミド、アパルタミド、フィナステリド、デュタステリド、アルファトラジオール、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、請求項24記載の薬学的組成物。

【請求項 26】

前記化学療法剤が、タモキシフェン、タキサン、またはこれらの組み合わせである、請求項24記載の薬学的組成物。

【請求項 27】

前記タキサンが、パクリタキセル、ドセタキセル、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、請求項26記載の薬学的組成物。

【請求項 28】

前記対象が、がん治療を必要とするヒトである、請求項14～26のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項 29】

レチノイン酸受容体関連オーファン受容体 γ (ROR γ) 阻害剤と抗がん剤とを含む組成物。

【請求項 30】

前記ROR γ 阻害剤が、低分子化合物である、請求項29記載の組成物。

【請求項 31】

前記低分子化合物が、ROR γ に選択的に結合し、ROR γ 活性を阻害する、請求項30記載の組成物。

【請求項 32】

前記抗がん剤が、抗アンドロゲン薬、化学療法剤、放射線治療剤、抗原特異的免疫治療剤、内分泌療法、チロシンキナーゼ阻害剤、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、請求項29～31のいずれか一項記載の組成物。

【請求項 33】

前記抗アンドロゲン薬が、エンザルタミド、ビカルタミド、アピラテロン、ニルタミド、フルタミド、アパルタミド、フィナステリド、デュタステリド、アルファトラジオール、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、請求項32記載の組成物。

【請求項 34】

前記化学療法剤が、タモキシフェン、タキサン、またはこれらの組み合わせである、請求項32記載の組成物。

【請求項 35】

前記タキサンが、パクリタキセル、ドセタキセル、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、請求項34記載の組成物。

【請求項 36】

薬学的に許容可能な賦形剤または希釈剤をさらに含む、請求項29～35のいずれか一項記載の組成物。

【請求項 37】

レチノイン酸受容体関連オーファン受容体 γ (ROR γ) 阻害剤と抗がん剤とを含むキット。

【請求項 38】

前記ROR γ 阻害剤が、低分子化合物である、請求項37記載のキット。

【請求項 39】

前記低分子化合物が、ROR γ に選択的に結合し、ROR γ 活性を阻害する、請求項38記載のキット。

【請求項 40】

前記抗がん剤が、抗アンドロゲン薬、化学療法剤、放射線治療剤、抗原特異的免疫治療剤、内分泌療法、チロシンキナーゼ阻害剤、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、請求項37～39のいずれか一項記載のキット。

【請求項 41】

前記抗アンドロゲン薬が、エンザルタミド、ビカルタミド、アピラテロン、ニルタミド、フルタミド、アパルタミド、フィナステリド、デュタステリド、アルファトラジオール、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、請求項40記載のキット。

【請求項 42】

前記化学療法剤が、タモキシフェン、タキサン、またはこれらの組み合わせである、請求項40記載のキット。

【請求項 43】

前記タキサンが、パクリタキセル、ドセタキセル、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、請求項42記載のキット。

【請求項 44】

前記ROR γ 阻害剤および／または前記抗がん剤を対象に投与するための指示を有するラベルをさらに含む、請求項37～43のいずれか一項記載のキット。

【請求項 45】

前記対象が、がん治療を必要とするヒトである、請求項37～44のいずれか一項記載のキット。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0033

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0033】

[本発明1001]

対象においてがんを治療するための方法であって、有効量のレチノイン酸受容体関連オーファン受容体 γ (ROR γ) 阻害剤を対象に投与する段階を含む、方法。

[本発明1002]

前記がんが、抗がん剤に抵抗性である、本発明1001の方法。

[本発明1003]

前記抗がん剤が、抗アンドロゲン薬、化学療法剤、放射線治療剤、抗原特異的免疫治療剤、内分泌療法、チロシンキナーゼ阻害剤、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、本発明1002の方法。

[本発明1004]

前記抗アンドロゲン薬が、エンザルタミド、ビカルタミド、アピラテロン (arbitratone)、ニルタミド、フルタミド、アパルタミド、フィナステリド、デュタステリド、アルファトラジオール、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、本発明1003の方法。

[本発明1005]

前記化学療法剤が、タモキシフェン、タキサン、またはこれらの組み合わせである、本発明1003の方法。

[本発明1006]

前記タキサンが、パクリタキセル、ドセタキセル、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、本発明1005の方法。

[本発明1007]

前記がんが、前立腺がん、肺がん、乳がん、肝臓がん、卵巣がん、子宮内膜がん、膀胱がん、結腸がん、リンパ腫、および神経膠腫からなる群より選択される、本発明1001～1006のいずれかの方法。

[本発明1008]

前記前立腺がんが、去勢抵抗性前立腺がんである、本発明1007の方法。

[本発明1009]

前記肺がんが、非小細胞肺がん（NSCLC）、K-Ras変異肺がん、BRAF変異肺がん、EGFR変異肺がん、チロシンキナーゼ阻害剤抵抗性肺がん、または小細胞肺がん（SCLC）である、本発明1007の方法。

[本発明1010]

前記乳がんが、トリプルネガティブ乳がん（TNBC）、タモキシフェン抵抗性乳がん、放射線抵抗性乳がん、HER2陽性乳がん、またはER陽性乳がんである、本発明1007の方法。

[本発明1011]

前記ROR γ 阻害剤が、低分子化合物である、本発明1001～1010のいずれかの方法。

[本発明1012]

前記低分子化合物が、ROR γ に選択的に結合し、ROR γ 活性を阻害する、本発明1011の方法。

[本発明1013]

前記対象が、がん治療を必要とするヒトである、本発明1001～1012のいずれかの方法。

[本発明1014]

対象においてがんを治療するための方法であって、有効量のレチノイン酸受容体関連オーファン受容体 γ （ROR γ ）阻害剤を、有効量の抗がん剤と組み合わせて、対象に投与する段階を含む、方法。

[本発明1015]

前記がんが、前記抗がん剤に抵抗性である、本発明1014の方法。

[本発明1016]

前記ROR γ 阻害剤が、前記抗がん剤の治療効果を増強する、本発明1014または1015の方法。

[本発明1017]

前記ROR γ 阻害剤が、前記抗がん剤に対するがん細胞抵抗性を逆転するかもしくは減少させ、かつ／またはがん細胞を前記抗がん剤に対して感受性にする、本発明1016の方法。

[本発明1018]

前記がんが、前立腺がん、肺がん、乳がん、肝臓がん、卵巣がん、子宮内膜がん、膀胱がん、結腸がん、リンパ腫、および神経膠腫からなる群より選択される、本発明1014～1017のいずれかの方法。

[本発明1019]

前記前立腺がんが、去勢抵抗性前立腺がんである、本発明1018の方法。

[本発明1020]

前記肺がんが、非小細胞肺がん（NSCLC）、K-Ras変異肺がん、BRAF変異肺がん、EGFR変異肺がん、チロシンキナーゼ阻害剤抵抗性肺がん、または小細胞肺がん（SCLC）である、本発明1018の方法。

[本発明1021]

前記乳がんが、トリプルネガティブ乳がん（TNBC）、タモキシフェン抵抗性乳がん、放射線抵抗性乳がん、HER2陽性乳がん、またはER陽性乳がんである、本発明1018の方法。

[本発明1022]

前記ROR γ 阻害剤が、低分子化合物である、本発明1014～1021のいずれかの方法。

[本発明1023]

前記低分子化合物が、ROR γ に選択的に結合し、ROR γ 活性を阻害する、本発明1022の方法。

[本発明1024]

前記抗がん剤が、抗アンドロゲン薬、化学療法剤、放射線治療剤、抗原特異的免疫治療剤、内分泌療法、チロシンキナーゼ阻害剤、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、本発明1014～1023のいずれかの方法。

[本発明1025]

前記抗アンドロゲン薬が、エンザルタミド、ビカルタミド、アビラテロン、ニルタミド、フルタミド、アパルタミド、フィナステリド、デュタステリド、アルファトラジオール、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、本発明1024の方法。

[本発明1026]

前記化学療法剤が、タモキシフェン、タキサン、またはこれらの組み合わせである、本発明1024の方法。

[本発明1027]

前記タキサンが、パクリタキセル、ドセタキセル、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、本発明1026の方法。

[本発明1028]

前記対象が、がん治療を必要とするヒトである、本発明1014～1026のいずれかの方法。

[本発明1029]

レチノイン酸受容体関連オーファン受容体 γ (ROR γ) 阻害剤と抗がん剤とを含む組成物。

[本発明1030]

前記ROR γ 阻害剤が、低分子化合物である、本発明1029の組成物。

[本発明1031]

前記低分子化合物が、ROR γ に選択的に結合し、ROR γ 活性を阻害する、本発明1030の組成物。

[本発明1032]

前記抗がん剤が、抗アンドロゲン薬、化学療法剤、放射線治療剤、抗原特異的免疫治療剤、内分泌療法、チロシンキナーゼ阻害剤、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、本発明1029～1031のいずれかの組成物。

[本発明1033]

前記抗アンドロゲン薬が、エンザルタミド、ビカルタミド、アビラテロン、ニルタミド、フルタミド、アパルタミド、フィナステリド、デュタステリド、アルファトラジオール、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、本発明1032の組成物。

[本発明1034]

前記化学療法剤が、タモキシフェン、タキサン、またはこれらの組み合わせである、本発明1032の組成物。

[本発明1035]

前記タキサンが、パクリタキセル、ドセタキセル、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、本発明1034の組成物。

[本発明1036]

薬学的に許容可能な賦形剤または希釈剤をさらに含む、本発明1029～1035のいずれかの組成物。

[本発明1037]

レチノイン酸受容体関連オーファン受容体 γ (ROR γ) 阻害剤と抗がん剤とを含むキット。

[本発明1038]

前記ROR γ 阻害剤が、低分子化合物である、本発明1037のキット。

[本発明1039]

前記低分子化合物が、ROR γ に選択的に結合し、ROR γ 活性を阻害する、本発明1038のキット。

[本発明1040]

前記抗がん剤が、抗アンドロゲン薬、化学療法剤、放射線治療剤、抗原特異的免疫治療

剤、内分泌療法、チロシンキナーゼ阻害剤、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、本発明1037～1039のいずれかのキット。

[本発明1041]

前記抗アンドロゲン薬が、エンザルタミド、ビカルタミド、アピラテロン、ニルタミド、フルタミド、アパルタミド、フィナステリド、デュタステリド、アルファトラジオール、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、本発明1040のキット。

[本発明1042]

前記化学療法剤が、タモキシフェン、タキサン、またはこれらの組み合わせである、本発明1040のキット。

[本発明1043]

前記タキサンが、パクリタキセル、ドセタキセル、およびこれらの組み合わせからなる群より選択される、本発明1042のキット。

[本発明1044]

前記ROR γ 阻害剤および／または前記抗がん剤を対象に投与するための指示を有するラベルをさらに含む、本発明1037～1043のいずれかのキット。

[本発明1045]

前記対象が、がん治療を必要とするヒトである、本発明1037～1044のいずれかのキット

。

本発明の他の目的、特徴、および利点は、下記の詳細な記述および図面から当業者に明らかになる。