

【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28年9月29日(2016.9.29)

【公表番号】特表2015-535282(P2015-535282A)

【公表日】平成27年12月10日(2015.12.10)

【年通号数】公開・登録公報2015-077

【出願番号】特願2015-540700(P2015-540700)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/57 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/57

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成28年8月10日(2016.8.10)

【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】

子宮内膜症およびそれに関連する疼痛、腺筋症、卵巣の子宮内膜腫、月経困難症、子宮筋腫、子宮内膜過剰増殖、卵巣癌、および子宮頸癌からなる群から選択されるプロゲステロン依存性病態の処置を必要とする女性で、当該病態を処置する組み合わせ物であって、

(a) 第1の月経周期の16～28日目から次の第2の月経周期の11～25日目までの期間にわたって前記女性に経口投与するために処方された選択的プロゲステロン受容体モデュレータ(SPRM)を含む組成物；および

(b) 第2の月経周期の1～10日目から引き続き所望の治療効果が達成されるまでの期間にわたって前記女性に経腔投与するために処方されたSPRMを含む組成物、を含む組み合わせ物。

【請求項2】

前記経口投与および経腔投与されるSPRMが同一のものである、請求項1に記載の組み合わせ物。

【請求項3】

前記SPRMがCDB-4124である、請求項2に記載の組み合わせ物。

【請求項4】

前記SPRMが3mg～30mgの投与量で経口投与されることを特徴とする、請求項1～3のうちいずれか1つに記載の組み合わせ物。

【請求項5】

前記SPRMが3mg～30mgの投与量で経腔投与されることを特徴とする、請求項1～4のうちいずれか1つに記載の組み合わせ物。

【請求項6】

前記経口投与組成物が毎日または1日おきに投与されることを特徴とする、請求項1～5のうちいずれか1つに記載の組み合わせ物。

【請求項7】

前記経腔投与組成物が毎日または1日おきに投与されることを特徴とする、請求項1～6のうちいずれか1つに記載の組み合わせ物。

【請求項8】

前記経口投与組成物が錠剤またはカプセルである、請求項1～7のうちいずれか1つに記載の組み合わせ物。

【請求項9】

前記経腔投与組成物が生体接着性担体を含む、請求項1～8のうちいずれか1つに記載の組み合わせ物。

【請求項10】

前記SPRMが3、6、12または24mgの投与量で経腔投与されることを特徴とする、請求項1～9のうちいずれか1つに記載の組み合わせ物。

【請求項11】

前記SPRMが12mgの投与量で経腔投与されることを特徴とする、請求項10に記載の組み合わせ物。

【請求項12】

前記SPRMが3、6、12、または24mgの投与量で経口投与されることを特徴とする、請求項1～11のうちいずれか1つに記載の組み合わせ物。

【請求項13】

前記プロゲステロン依存性病態が子宮筋腫または子宮内膜症である、請求項1～12のうちいずれか1つに記載の組み合わせ物。

【請求項14】

前記経腔投与が間欠的である、請求項1～13のうちいずれか1つに記載の組み合わせ物。

【請求項15】

前記組成物が約4ヶ月間にわたり毎日連続して経腔投与され、次いで、継続的な無処置により女性の月経を可能にするのに十分な長さの中断期間後、組成物が約4ヶ月間毎日投与され、次いで、女性の月経を可能にするのに十分な長さの中断期間後、組成物が毎日投与され、この投与と投与の中止のパターンをプロゲステロン関連病態の処置を達成するのに必要な期間で繰り返すことを特徴とする、

請求項14に記載の組み合わせ物。

【請求項16】

(a) 乳癌を予防または処置する必要のある女性に経口投与するため処方された選択的プロゲステロン受容体モデュレータ(SPRM)を含む組成物；および

(b) 所望の治療効果が達成されるまで前記女性に経皮投与するため処方されたSPRMを含む組成物、

を含む、前記女性で乳癌を予防または処置するための組み合わせ物。

【請求項17】

前記経口投与および経皮投与されるSPRMが同一のものである、請求項16に記載の組み合わせ物。

【請求項18】

前記SPRMがCDB-4124である、請求項17に記載の組み合わせ物。

【請求項19】

前記SPRMが3、6、12または24mg等の3mg～30mgの投与量で経口投与されることを特徴とする、請求項16～18のうちいずれか1つに記載の組み合わせ物。

【請求項20】

前記SPRMが3mg～30mgの投与量で経皮投与されることを特徴とする、請求項16～19のうちいずれか1つに記載の組み合わせ物。

**【請求項 2 1】**

前記経皮投与される組成物が経皮パッチである、請求項 1 6 ~ 2 0 のうちいずれか 1 つに記載の組み合わせ物。

**【請求項 2 2】**

経口投与が経皮投与と同一の広がりを有する、請求項 1 6 ~ 2 1 のうちいずれか 1 つに記載の組み合わせ物。

**【請求項 2 3】**

経口投与が連日投与を含むことを特徴とする、請求項 1 6 ~ 2 2 のうちいずれか 1 つに記載の組み合わせ物。

**【請求項 2 4】**

経皮投与が連日投与を含むことを特徴とする、請求項 1 6 ~ 2 3 のうちいずれか 1 つに記載の組み合わせ物。

**【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 1

【補正方法】変更

【補正の内容】

**【0 0 1 1】**

本発明の組成物により処置されてもよいホルモン依存性病態としては、これに限定されないが、子宮内膜症およびそれに関連する疼痛、腺筋症、卵巣の子宮内膜腫、月経困難症、内分泌ホルモン依存性腫瘍、子宮筋腫、子宮内膜過剰増殖、卵巣癌、子宮頸癌および乳癌が挙げられる。本発明の組成物はまた、月経を誘発するため、分娩を誘発するため、および避妊用に使用されてもよい。

本発明は、例えば、以下の項目も提供する。

**(項目 1)**

子宮内膜症およびそれに関連する疼痛、腺筋症、卵巣の子宮内膜腫、月経困難症、子宮筋腫、子宮内膜過剰増殖、卵巣癌、および子宮頸癌からなる群から選択されるプロゲステロン依存性病態の処置を必要とする女性で、当該病態を処置する方法であって、

(a) 選択的プロゲステロン受容体モデュレータ (S P R M) を含む組成物を、前記女性に第 1 の月経周期の 1 6 ~ 2 8 日目から次の第 2 の月経周期の 1 1 ~ 2 5 日目までの期間、経口投与すること；および

(b) 同時に、S P R M を含む組成物を、前記女性に、第 2 の月経周期の 1 ~ 1 0 日目から引き続き治療効果が達成されるまでの期間、経腔投与すること、

を含む方法。

**(項目 2)**

前記経口投与および経腔投与される S P R M が同一のものである、項目 1 に記載の方法。

**(項目 3)**

前記 S P R M が C D B - 4 1 2 4 である、項目 2 に記載の方法。

**(項目 4)**

前記 S P R M が 3 m g ~ 3 0 m g の投与量で経口投与される、項目 1 ~ 3 のうちいずれか 1 つに記載の方法。

**(項目 5)**

前記 S P R M が 3 m g ~ 3 0 m g の投与量で経腔投与される、項目 1 ~ 4 のうちいずれか 1 つに記載の方法。

**(項目 6)**

前記経口投与組成物が毎日または 1 日おきに投与される、項目 1 ~ 5 のうちいずれか 1 つに記載の方法。

**(項目 7)**

前記経腔投与組成物が毎日または1日おきに投与される、項目1～6のうちいずれか1つに記載の方法。

(項目8)

前記経口投与組成物が錠剤またはカプセルである、項目1～7のうちいずれか1つに記載の方法。

(項目9)

前記経腔投与組成物が生体接着性担体を含む、項目1～8のうちいずれか1つに記載の方法。

(項目10)

前記SPRMが3、6、12または24mgの投与量で経腔投与される、項目1～9のうちいずれか1つに記載の方法。

(項目11)

前記SPRMが12mgの投与量で経腔投与される、項目10に記載の方法。

(項目12)

前記SPRMが3、6、12、または24mgの投与量で経口投与される、項目1～11のうちいずれか1つに記載の方法。

(項目13)

前記プロゲステロン依存性病態が子宮筋腫または子宮内膜症である、項目1～12のうちいずれか1つに記載の方法。

(項目14)

前記経腔投与が間欠的である、項目1～13のうちいずれか1つに記載の方法。

(項目15)

前記組成物が約4ヶ月間にわたり毎日連続して経腔投与され、次いで、継続的な無処置により女性の月経を可能にするのに十分な長さの中断期間後、組成物が約4ヶ月間毎日投与され、次いで、女性の月経を可能にするのに十分な長さの中断期間後、組成物が毎日投与され、この投与と投与の中止のパターンをプロゲステロン関連病態の処置を達成するのに必要な期間で繰り返す。

項目14に記載の方法。

(項目16)

(a) 選択的プロゲステロン受容体モデュレータ(SPRM)を含む組成物を乳癌を予防または処置する必要のある女性に経口投与すること; および

(b) 同時に、所望の治療効果が達成されるまでSPRMを含む組成物を、前記女性に経皮投与すること、

を含む、前記女性で乳癌を予防または処置する方法。

(項目17)

前記経口投与および経皮投与されるSPRMが同一のものである、項目16に記載の方法。

(項目18)

前記SPRMがCDB-4124である、項目17に記載の方法。

(項目19)

前記SPRMが3、6、12または24mg等の3mg～30mgの投与量で経口投与される、項目16～18のうちいずれか1つに記載の方法。

(項目20)

前記SPRMが3mg～30mgの投与量で経皮投与される、項目16～19のうちいずれか1つに記載の方法。

(項目21)

前記経皮投与される組成物が経皮パッチである、項目16～20のうちいずれか1つに記載の方法。

(項目22)

経口投与が経皮投与と同一の広がりを有する、項目16～21のうちいずれか1つに記

載の方法。

( 項目 2 3 )

経口投与が連日投与を含む、項目 1 6 ~ 2 2 のうちいずれか 1 つに記載の方法。

( 項目 2 4 )

経皮投与が連日投与を含む、項目 1 6 ~ 2 3 のうちいずれか 1 つに記載の方法。