

【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25年10月17日(2013.10.17)

【公表番号】特表2013-504630(P2013-504630A)

【公表日】平成25年2月7日(2013.2.7)

【年通号数】公開・登録公報2013-007

【出願番号】特願2012-529881(P2012-529881)

【国際特許分類】

A 6 1 K	47/48	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 K	31/4745	(2006.01)
A 6 1 K	47/40	(2006.01)
A 6 1 K	47/34	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/04	(2006.01)
A 6 1 P	35/02	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	47/48
A 6 1 P	35/00
A 6 1 K	31/4745
A 6 1 K	47/40
A 6 1 K	47/34
A 6 1 K	45/00
A 6 1 P	35/04
A 6 1 P	35/02

【手続補正書】

【提出日】平成25年9月2日(2013.9.2)

【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】

対象における癌の治療における使用のための組成物であって、該組成物は、C DP - トポイソメラーゼ阻害剤コンジュゲートまたは粒子を含み、

該組成物は、コンジュゲートのmg数ではなくトポイソメラーゼ阻害剤のmg数で表される、6mg/m²、7mg/m²、8mg/m²、9mg/m²、10mg/m²、11mg/m²、12mg/m²、13mg/m²、14mg/m²、15mg/m²、16mg/m²、17mg/m²、18mg/m²、19mg/m²、20mg/m²、21mg/m²、22mg/m²、23mg/m²、24mg/m²、25mg/m²、26mg/m²、27mg/m²、28mg/m²、29mg/m²または30mg/m²の用量での初回投与で前記対象に投与されることを特徴とし、

前記組成物は、6mg/m²、7mg/m²、8mg/m²、9mg/m²、10mg/m²、11mg/m²、12mg/m²、13mg/m²、14mg/m²、15mg/m²、16mg/m²、17mg/m²、18mg/m²、19mg/m²、20mg/m²、21mg/m²、22mg/m²、23mg/m²、24mg/m²、25mg/m²、26mg/m²、27mg/m²、28mg/m²、29mg/m²または30mg/m²

m g / m² の用量での前記組成物の 1 回以上の後続投与で前記対象に投与され、ここで前記後続投与は、前回投与後の 9、10、11、12、13、14、15 日または 16 日の間にそれぞれ独立して提供されることを特徴とする、
組成物。

【請求項 2】

前記組成物は、30 分、45 分、または 60 分以下にわたって静脈内投与により投与されることを特徴とする、請求項 1 に記載の使用のための組成物。

【請求項 3】

前記組成物は、癌の第一選択治療として投与されることを特徴とする、請求項 1 または 2 に記載の使用のための組成物。

【請求項 4】

前記組成物は、1 つ以上の追加の薬剤と組み合わせて投与されることを特徴とする、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の使用のための組成物。

【請求項 5】

前記組成物は、1 つ以上の追加の化学療法剤と組み合わせて投与されることを特徴とする、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の使用のための組成物。

【請求項 6】

前記癌が、肺癌、卵巣癌、胃癌、または腎臓癌である、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の使用のための組成物。

【請求項 7】

各後続投与が、前回投与の 12 ~ 16 日後に行われることを特徴とする、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の使用のための組成物。

【請求項 8】

前記組成物が、12 ~ 17 mg / (m² · 投与)、例えば、12 ~ 15 mg / (m² · 投与) で投与されることを特徴とする、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の使用のための組成物。

【請求項 9】

前記組成物が、カンプトテシン、イリノテカン、SN-38、トポテカン、ラメラリン D またはそれらの誘導体を含む、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の使用のための組成物。

【請求項 10】

前記組成物が、カンプトテシン、または SN-38 を含む、請求項 9 に記載の使用のための組成物。

【請求項 11】

前記 CDP - トポイソメラーゼ阻害剤が、CRLX101 である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の使用のための組成物。

【請求項 12】

前記組成物は、コンジュゲートの mg 数ではなくカンプトテシンの mg 数で表される、12 mg / m²、13 mg / m²、14 mg / m²、または 15 mg / m² の用量での初回投与で前記対象に投与されることを特徴とし、

前記組成物は、12 mg / m²、13 mg / m²、14 mg / m²、または 15 mg / m² の用量での前記組成物の 1 回以上の後続投与を、前回投与後の 12 日、13 日、14 日、15 日または 16 日の間にそれぞれ独立して前記対象に投与されることを特徴とする、

請求項 11 に記載の使用のための組成物。

【請求項 13】

前記組成物は、30 分、45 分、または 60 分以下にわたって静脈内投与により投与されることを特徴とする、請求項 12 に記載の使用のための組成物。

【請求項 14】

前記組成物は、癌の第一選択治療として投与されることを特徴とする、請求項 12 また

は 13 に記載の使用のための組成物。

【請求項 15】

前記組成物は、1つ以上の追加の薬剤と組み合わせて投与されることを特徴とする、請求項 12～14 のいずれか 1 項に記載の使用のための組成物。

【請求項 16】

前記組成物は、1つ以上の追加の化学療法剤と組み合わせて投与されることを特徴とする、請求項 12～15 のいずれか 1 項に記載の使用のための組成物。

【請求項 17】

前記癌が、肺癌、卵巣癌、胃癌、または腎臓癌である、請求項 12～16 のいずれか 1 項に記載の使用のための組成物。

【請求項 18】

前記癌が、肺癌、例えば非小細胞肺癌（例えば、扁平上皮細胞非小細胞肺癌）である、請求項 17 に記載の使用のための組成物。

【請求項 19】

前記組成物は、請求項 13～16 のいずれか 1 項に記載の様式で投与されることを特徴とする、請求項 18 に記載の使用のための組成物。

【請求項 20】

前記癌が、卵巣癌である、請求項 17 に記載の使用のための組成物。

【請求項 21】

前記癌が、白金系薬剤（例えば、カルボプラチニン、シスプラチニン、オキサリプラチニン）に対して難治性、再発性または耐性である、請求項 20 に記載の使用のための組成物。

【請求項 22】

前記組成物は、請求項 13 または 14 に記載の様式で投与されることを特徴とする、請求項 18 に記載の使用のための組成物。

【請求項 23】

前記組成物は、第二の化学療法剤と組み合わせて投与されることを特徴とする、請求項 20～22 のいずれか 1 項に記載の使用のための組成物。

【請求項 24】

前記第二の化学療法剤が、ドキソルビシン（例えば、リポソームドキソルビシン）である、請求項 23 に記載の使用のための組成物。

【請求項 25】

前記癌が、腎臓癌である、請求項 17 に記載の使用のための組成物。

【請求項 26】

前記組成物は、請求項 13 または 14 に記載の様式で投与されることを特徴とする、請求項 25 に記載の使用のための組成物。

【請求項 27】

前記組成物は、血管新生阻害剤（例えば、VEGF 経路阻害剤（例えば、ベバシズマブ））と組み合わせて投与されることを特徴とする、請求項 25 または 26 に記載の使用のための組成物。

【請求項 28】

前記癌が、胃癌である、請求項 17 に記載の使用のための組成物。

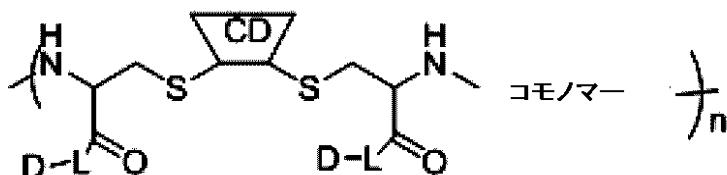
【請求項 29】

前記組成物は、請求項 13～16 のいずれか 1 項に記載の様式で投与されることを特徴とする、請求項 28 に記載の使用のための組成物。

【請求項 30】

以下の式：

【化1A】



を有する CDP - トポイソメラーゼ阻害剤であって、

Lはそれぞれ独立してリンカーであるか、または存在せず、かつDはそれぞれ独立してS
N - 3 8 または - OHであり、コモノマーはそれぞれポリエチレングリコール (PEG)
を含み、かつnは少なくとも4である、CDP - トポイソメラーゼ阻害剤。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0191

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0191】

本発明の1つ以上の実施形態の詳細を以下の説明において記載する。本発明のその他の特徴、目的および利点は、説明および図面、ならびに特許請求の範囲から明らかになるであろう。

例えば、本発明は以下の項目を提供する。

(項目1)

対象における増殖性疾患の治療法であって、

CRLX10を含む組成物による少なくとも1サイクルの治療を提供することを含み、
前記サイクルが以下の投与を含み、それにより前記増殖性疾患を治療する方法：

CRLX101を含む組成物の初回投与を、コンジュゲートのmg数ではなくカンプト
テシンのmg数で表される、12mg/m²を上回る用量、例えば、13mg/m²、1
4mg/m²、15mg/m²、16mg/m²または17mg/m²の用量で前記対象
に提供することと、

任意に前記CRLX101の1回以上の後続投与を、12mg/m²を上回る用量、例
えば、13mg/m²、14mg/m²、15mg/m²、16mg/m²または17m
g/m²の用量で、前回投与後の9、10、11、12、13、14日または15日の間
にそれぞれ独立して提供すること。

(項目2)

前記癌が、肺癌、例えば非小細胞肺癌、例えば扁平上皮細胞非小細胞肺癌である、項目
1に記載の方法。

(項目3)

前記対象が、KRAS遺伝子における変異を有するおよび/またはKRAS発現のレベ
ルが、例えば参照標準に比べて増加している、項目2に記載の方法。

(項目4)

前記対象が、EGFR遺伝子における変異を有する、項目2または3に記載の方法。

(項目5)

前記癌が卵巣癌である、項目1に記載の方法。

(項目6)

前記癌が、化学療法剤、例えば、白金系薬剤（例えば、カルボプラチン、シスプラチン
、オキサリプラチン）に対して難治性、再発性または耐性である、項目5に記載の方法。

(項目7)

前記対象に、CRLX101を第二の化学療法剤と組み合わせて投与する、項目5または
6に記載の方法。

(項目8)

前記CRLX101を、30分、45分、60分または90分以下にわたって静脈内投与により投与する、項目1に記載の方法。

(項目9)

前記CRLX101を、12時間、15時間、18時間、20時間、21時間、24時間または27時間にわたって静脈内投与により投与する、項目1に記載の方法。

(項目10)

対象における増殖性疾患、例えば癌の治療法であって、

CRLX10を含む組成物による少なくとも1サイクルの治療を提供することを含み、前記サイクルが以下の投与を含み、それにより前記増殖性疾患を治療する方法：

CRLX101を含む組成物の初回投与を、コンジュゲートのmg数ではなくカンプトテシンのmg数で表される、6mg/m²を上回る用量、例えば、7mg/m²、8mg/m²、9mg/m²、10mg/m²、11mg/m²または12mg/m²の用量で1日2回、前記対象に提供することと、

任意に前記CRLX101の1回以上の後続投与を、コンジュゲートのmg数ではなくカンプトテシンのmg数で表される、6mg/m²を上回る用量、例えば、7mg/m²、8mg/m²、9mg/m²、10mg/m²、11mg/m²または12mg/m²の用量で1日2回、前回投与後の9、10、11、12、13、14日または15日の間にそれぞれ独立して提供すること。

(項目11)

対象における癌の治療法であって、

以下を含み、それにより前記癌を治療する方法：

CDP-トポイソメラーゼ阻害剤コンジュゲート、粒子または組成物の初回投与を、コンジュゲートのmg数ではなくトポイソメラーゼ阻害剤のmg数で表される、6mg/m²、7mg/m²、8mg/m²、9mg/m²、10mg/m²、11mg/m²、12mg/m²、13mg/m²、14mg/m²、15mg/m²、16mg/m²、17mg/m²、18mg/m²、19mg/m²、20mg/m²、21mg/m²、22mg/m²、23mg/m²、24mg/m²、25mg/m²、26mg/m²、27mg/m²、28mg/m²、29mg/m²または30mg/m²の用量で前記対象に提供することと、

任意に前記CDP-トポイソメラーゼ阻害剤コンジュゲート、粒子または組成物の1回以上の後続投与を、6mg/m²、7mg/m²、8mg/m²、9mg/m²、10mg/m²、11mg/m²、12mg/m²、13mg/m²、14mg/m²、15mg/m²、16mg/m²、17mg/m²、18mg/m²、19mg/m²、20mg/m²、21mg/m²、22mg/m²、23mg/m²、24mg/m²、25mg/m²、26mg/m²、27mg/m²、28mg/m²、29mg/m²または30mg/m²の用量で、前回投与後の9、10、11、12、13、14、15日または16日の間にそれぞれ独立して提供すること。

(項目12)

少なくとも2、3、4、5、6、7、8、9、10、12、15回または20回の前記投与が同じである、項目11に記載の方法。

(項目13)

少なくとも2、3、4、5、6、7、8、9、10、12、15回または20回の投与間の時間が同じである、項目11または12に記載の方法。

(項目14)

各後続投与が、前回投与の12～16日後に行われる、項目11～13のいずれか1項に記載の方法。

(項目15)

前記薬物を12～17mg/(m²・投与)で投与する、項目11～14のいずれか1項に記載の方法。

(項目16)

前記コンジュゲートが、トポイソメラーゼI阻害剤および／またはトポイソメラーゼII阻害剤を含む、項目11～15のいずれか1項に記載の方法。

(項目17)

前記コンジュゲートが、カンプトテシン、イリノテカン、SN-38、トポテカン、ラメラリンDまたはそれらの誘導体を含む、項目16に記載の方法。

(項目18)

前記コンジュゲートを、約30分、45分、60分、90分、120分、150分または180分以下にわたって静脈内投与により投与する、項目11～17のいずれか1項に記載の方法。

(項目19)

前記癌が、肺癌、卵巣癌、乳癌、胃癌、膵臓癌、結腸直腸癌または腎臓癌である、項目11～18のいずれか1項に記載の方法。

(項目20)

前記コンジュゲートを、1つ以上の追加の化学療法剤と組み合わせて投与する、項目11～19のいずれか1項に記載の方法。

(項目21)

対象における癌の治療法であって、

以下を含み、それにより前記癌を治療する方法：

C DP - トポイソメラーゼ阻害剤コンジュゲート、粒子または組成物の初回投与を、コンジュゲートのmg数ではなくトポイソメラーゼ阻害剤のmg数で表される、9mg/m²、10mg/m²、11mg/m²、12mg/m²、13mg/m²、14mg/m²、15mg/m²、16mg/m²、17mg/m²、18mg/m²、19mg/m²、20mg/m²、21mg/m²、22mg/m²、23mg/m²、24mg/m²、25mg/m²、26mg/m²、27mg/m²、28mg/m²、29mg/m²、30mg/m²、31mg/m²、32mg/m²、33mg/m²、34mg/m²、35mg/m²または36mg/m²の用量で前記対象に提供することと、

任意に前記C DP - トポイソメラーゼ阻害剤コンジュゲート、粒子または組成物の1回以上の後続投与を、6mg/m²、7mg/m²、8mg/m²、9mg/m²、10mg/m²、11mg/m²、12mg/m²、13mg/m²、14mg/m²、15mg/m²、16mg/m²、17mg/m²、18mg/m²、19mg/m²、20mg/m²、21mg/m²、22mg/m²、23mg/m²、24mg/m²、25mg/m²、26mg/m²、27mg/m²、28mg/m²、29mg/m²、30mg/m²、31mg/m²、32mg/m²、33mg/m²、34mg/m²、35mg/m²または36mg/m²の用量で、前回投与後の17、18、19、20、21、22、23、24、25、26、27、28、29、30日または31日の間にそれぞれ独立して提供すること。

(項目22)

対象における癌の治療法であって、

以下を含み、それにより前記癌を治療する方法：

C DP - トポイソメラーゼ阻害剤コンジュゲート、粒子または組成物の初回投与を、コンジュゲートのmg数ではなくトポイソメラーゼ阻害剤のmg数で表される、3mg/m²、4mg/m²、5mg/m²、6mg/m²、7mg/m²、8mg/m²、9mg/m²、10mg/m²または11mg/m²の用量で前記対象に提供することと、

任意に前記C DP - トポイソメラーゼ阻害剤コンジュゲート、粒子または組成物の1回以上の後続投与を、3mg/m²、4mg/m²、5mg/m²、6mg/m²、7mg/m²、8mg/m²、9mg/m²、10mg/m²または11mg/m²の用量で、前回投与後の5、6、7、8、9日の間にそれぞれ独立して提供すること。

(項目23)

対象における卵巣癌の治療法であって、C DP - トポイソメラーゼ阻害剤コンジュゲー

ト、粒子または組成物を、第二の化学療法剤と組み合わせて対象に投与することを含む方法。

(項目24)

対象における結腸直腸癌の治療法であって、C D P - トポイソメラーゼ阻害剤コンジュゲート、粒子または組成物を、第二の化学療法剤と組み合わせて対象に投与することを含む方法。

(項目25)

対象における肺癌の治療法であって、C D P - トポイソメラーゼ阻害剤コンジュゲート、粒子または組成物を対象に投与することを含む方法。

(項目26)

対象における肺癌の治療法であって、C D P - トポイソメラーゼ阻害剤コンジュゲート、粒子または組成物を、第二の化学療法剤と組み合わせて対象に投与することを含む方法。

(項目27)

対象における乳癌の治療法であって、C D P - トポイソメラーゼ阻害剤コンジュゲート、粒子または組成物を、第二の化学療法剤と組み合わせて対象に投与することを含む方法。

(項目28)

対象における胃癌の治療法であって、C D P - トポイソメラーゼ阻害剤コンジュゲート、粒子または組成物を、第二の化学療法剤と組み合わせて対象に投与することを含む方法。

(項目29)

対象における癌の治療法であって、C D P - トポイソメラーゼ阻害剤コンジュゲート、粒子または組成物を、血管新生阻害剤と組み合わせて対象に投与することを含む方法。

(項目30)

前記癌が腎臓癌である、項目29に記載の方法。

(項目31)

前記血管新生阻害剤がV E G F 経路阻害剤である、項目29または30に記載の方法。

(項目32)

対象における癌の治療法であって、

前記対象に多糖を投与することと、

前記対象にC D P - トポイソメラーゼ阻害剤コンジュゲート、粒子または組成物を投与することと

を含む方法。

(項目33)

対象における癌の治療法であって、

前記対象に、治療に伴う膀胱毒性を改善する薬剤を投与することと、

前記対象に、カンプトテシンまたはカンプトテシン誘導体を含む組成物を投与することと

を含む方法。

(項目34)

対象における癌の治療法であって、

癌を有し、かつ1つ以上の過敏症の症状を低減または抑制する薬剤を投与されている対象を提供することと、

前記対象に、C D P - トポイソメラーゼ阻害剤コンジュゲート、粒子または組成物を含む組成物を投与することと

を含む方法。

(項目35)

対象における癌の治療法であって、

K R A S および / またはS T 発現レベルが増加している癌を有する対象を選択すること

と、

C D P - トポイソメラーゼ阻害剤コンジュゲート、粒子または組成物を、癌を治療する
のに十分な量で対象に投与することにより癌を治療することと
を含む方法。