

【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】令和2年12月10日(2020.12.10)

【公表番号】特表2019-533684(P2019-533684A)

【公表日】令和1年11月21日(2019.11.21)

【年通号数】公開・登録公報2019-047

【出願番号】特願2019-522381(P2019-522381)

【国際特許分類】

| | | |
|---------|---------|-----------|
| A 6 1 K | 31/519 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/4745 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/282 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/513 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 9/127 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 35/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 1/04 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 43/00 | (2006.01) |

【F I】

| | | |
|---------|---------|-------|
| A 6 1 K | 31/519 | |
| A 6 1 K | 31/4745 | |
| A 6 1 K | 31/282 | |
| A 6 1 K | 31/513 | |
| A 6 1 K | 9/127 | |
| A 6 1 P | 35/00 | |
| A 6 1 P | 1/04 | |
| A 6 1 P | 43/00 | 1 2 1 |

【手続補正書】

【提出日】令和2年10月29日(2020.10.29)

【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】

これまで胃がんを処置するために抗腫瘍剤を受けたことがないヒト患者の該胃がんを処置するための組み合わせ物であって、前記組み合わせ物が、2週間に1回、該患者に抗腫瘍療法として投与されることを特徴とし、該組み合わせ物が、

a. 50または55mg/m²±5%のリポソームイリノテカン、
b. 60、70、または85mg/m²±5%のオキサリプラチン、
c. 200mg/m²の(1)型ロイコボリンまたは400mg/m²の(1+d)ラセミ体ロイコボリン、および
d. 2,400mg/m²の5-フルオロウラシル
からなる、組み合わせ物。

【請求項2】

50mg/m²±5%のリポソームイリノテカンが、2週間に1回、前記抗腫瘍療法中に前記患者に投与されることを特徴とする、請求項1に記載の組み合わせ物。

【請求項3】

55mg/m²±5%のリポソームイリノテカンが、2週間に1回、前記抗腫瘍療法中

に前記患者に投与されることを特徴とする、請求項 1 に記載の組み合わせ物。

【請求項 4】

6 0 m g / m² ± 5 % のオキサリプラチンが、2週間に1回、前記抗腫瘍療法中に前記患者に投与されることを特徴とする、請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載の組み合わせ物。

【請求項 5】

7 0 m g / m² ± 5 % のオキサリプラチンが、2週間に1回、前記抗腫瘍療法中に前記患者に投与されることを特徴とする、請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載の組み合わせ物。

【請求項 6】

8 5 m g / m² ± 5 % のオキサリプラチンが、2週間に1回、前記抗腫瘍療法中に前記患者に投与されることを特徴とする、請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載の組み合わせ物。

【請求項 7】

5 0 m g / m² ± 5 % のリポソームイリノテカン、および 6 0 m g / m² ± 5 % のオキサリプラチンが、2週間に1回、前記抗腫瘍療法中に前記患者に投与されることを特徴とする、請求項 1 に記載の組み合わせ物。

【請求項 8】

5 5 m g / m² ± 5 % のリポソームイリノテカン、および 7 0 m g / m² ± 5 % のオキサリプラチンが、2週間に1回、前記抗腫瘍療法中に前記患者に投与されることを特徴とする、請求項 1 に記載の組み合わせ物。

【請求項 9】

5 0 m g / m² ± 5 % のリポソームイリノテカン、および 8 5 m g / m² ± 5 % のオキサリプラチンが、2週間に1回、前記抗腫瘍療法中に前記患者に投与されることを特徴とする、請求項 1 に記載の組み合わせ物。

【請求項 10】

前記オキサリプラチンの各投与が、前記リポソームイリノテカンの各投与の終了から2時間後に開始されることを特徴とする、請求項 1 から 9 のいずれか一項に記載の組み合わせ物。

【請求項 11】

前記 5 - フルオロウラシルが、46時間にわたり注入物として投与されることを特徴とする、請求項 1 から 10 のいずれか一項に記載の組み合わせ物。

【請求項 12】

前記ロイコボリンが、前記 5 - フルオロウラシルの直前に投与されることを特徴とする、請求項 1 から 11 のいずれか一項に記載の組み合わせ物。

【請求項 13】

前記リポソームイリノテカン、オキサリプラチン、5 - フルオロウラシル、およびロイコボリンが、28日処置サイクルの1および15日目に投与されることを特徴とする、請求項 1 から 12 のいずれか一項に記載の組み合わせ物。

【請求項 14】

前記リポソームイリノテカンが、合計で約90分間にわたり注入物として投与されることを特徴とする、請求項 1 から 13 のいずれか一項に記載の組み合わせ物。

【請求項 15】

前記リポソームイリノテカンが投与され、その後、前記オキサリプラチンが投与され、その後、前記ロイコボリンが投与され、その後、前記 5 - フルオロウラシルが投与されることを特徴とする、請求項 1 から 14 のいずれか一項に記載の組み合わせ物。

【請求項 16】

前記リポソームイリノテカンが、リポソームに封入されたイリノテカンクロースオクタスルフェートを含む、請求項 1 から 15 のいずれか一項に記載の組み合わせ物。

【請求項 17】

前記リポソームイリノテカンが、200のリン脂質分子ごとに約1つのポリエチレンリコール（PEG）分子の量において、イリノテカンスクロースオクタスルフェート、ホスファチジルコリン、コレステロール、およびポリエチレンリコール誘導体化ホスファチジル-エタノールアミンを含む、請求項1から16のいずれか一項に記載の組み合わせ物。

【請求項18】

前記リポソームイリノテカン、オキサリプラチン、5-フルオロウラシル、およびロイコボリンが、28日処置サイクルの1および15日目に投与され、該リポソームイリノテカンの各投与が、該ロイコボリンの前に投与され、該ロイコボリンが、該5-フルオロウラシルの各投与の直前に投与され、5-フルオロウラシルの各投与が、46時間にわたり注入物として投与されることを特徴とする、請求項17に記載の組み合わせ物。

【請求項19】

前記リポソームイリノテカンが、イリノテカンスクロースオクタスルフェート、1,2-ジステアロイル-sn-グリセロ-3-ホスホコリン（DSPC）、コレステロール、およびN-（カルボニルメトキシポリエチレンリコール-2000）-1,2-ジステアロイル-sn-グリセロ-3-ホスホエタノールアミン（MPEG-2000-DSP-E）を含む、請求項17に記載の組み合わせ物。

【請求項20】

前記リポソームイリノテカン、オキサリプラチン、5-フルオロウラシル、およびロイコボリンが、28日処置サイクルの1および15日目に投与され、該リポソームイリノテカンの各投与が、該ロイコボリンの前に投与され、該ロイコボリンが、該5-フルオロウラシルの各投与の直前に投与され、5-フルオロウラシルの各投与が、46時間にわたり注入物として投与されることを特徴とする、請求項19に記載の組み合わせ物。

【請求項21】

これまで胃がんを処置するためにゲムシタビンを受けたことがないヒト患者の該胃がんを処置するための組み合わせ物であって、該組み合わせ物が、2週間に1回、該患者に抗腫瘍療法として投与されることを特徴とし、該組み合わせ物が、

- a. 50mg/m² ± 5%のリポソームイリノテカン、
 - b. 85mg/m² ± 5%のオキサリプラチン、
 - c. 200mg/m²の(1)型ロイコボリンまたは400mg/m²の(1+d)ラセミ体ロイコボリン、および
 - d. 2,400mg/m²の5-フルオロウラシル
- を含む、組み合わせ物。

【請求項22】

これまで胃がんを処置するためにゲムシタビンを受けたことがないヒト患者の該胃がんを処置するための組み合わせ物であって、該組み合わせ物が、2週間に1回、該患者に抗腫瘍療法として投与されることを特徴とし、該組み合わせ物が、

- a. 55mg/m² ± 5%のリポソームイリノテカン、
 - b. 70mg/m² ± 5%のオキサリプラチン、
 - c. 200mg/m² ± 5%の(1)型ロイコボリンまたは400mg/m²の(1+d)ラセミ体ロイコボリン、および
 - d. 2,400mg/m²の5-フルオロウラシル
- を含む、組み合わせ物。

【請求項23】

これまで胃がんを処置するためにゲムシタビンを受けたことがないヒト患者の該胃がんを処置するための組み合わせ物であって、該組み合わせ物が、2週間に1回、該患者に抗腫瘍療法として投与されることを特徴とし、該組み合わせ物が、

- a. 50mg/m² ± 5%のリポソームイリノテカン、
- b. 60mg/m² ± 5%のオキサリプラチン、
- c. 200mg/m²の(1)型ロイコボリンまたは400mg/m²の(1+d)ラ

セミ体ロイコボリン、および

d . 2 , 4 0 0 m g / m ² の 5 - フルオロウラシル

からなる、組み合わせ物。

【請求項 2 4】

これまで胃がんを処置するためにゲムシタビンを受けたことがないヒト患者の該胃がんを処置するための組み合わせ物であって、該組み合わせ物が、2週間に1回、前記患者に抗腫瘍療法として投与されることを特徴とし、該組み合わせ物が、

a . 5 5 m g / m ² ± 5 % のリポソームイリノテカン、

b . 8 5 m g / m ² ± 5 % のオキサリプラチニン、

c . 2 0 0 m g / m ² の (1) 型ロイコボリンまたは 4 0 0 m g / m ² の (1 + d) ラセミ体ロイコボリン、および

d . 2 , 4 0 0 m g / m ² の 5 - フルオロウラシル

を含む、組み合わせ物。

【請求項 2 5】

前記リポソームイリノテカンが、200のリン脂質分子ごとに約1つのポリエチレングリコール (PEG) 分子の量において、イリノテカンスクロースオクタスルフェート、ホスファチジルコリン、コレステロール、およびポリエチレングリコール誘導体化ホスファチジル - エタノールアミンを含み、

該リポソームイリノテカン、オキサリプラチニン、5 - フルオロウラシル、およびロイコボリンが、28日処置サイクルの1および15日目に投与され、

該ロイコボリンが、該5 - フルオロウラシルの各投与の直前に投与され、

5 - フルオロウラシルの各投与が、46時間にわたり注入物として投与されることを特徴とする、請求項 2_1 から 2_4 のいずれか一項に記載の組み合わせ物。

【請求項 2 6】

前記オキサリプラチニンの各投与が、前記リポソームイリノテカンの各投与の終了後に開始され、コルチコステロイドおよび抗嘔吐薬が前記抗腫瘍療法の施行の前に前記患者に投与されることを特徴とする、請求項 2_5 に記載の組み合わせ物。

【請求項 2 7】

これまで胃がんを処置するために抗腫瘍剤を受けたことがないヒト患者の該胃がんを処置するための組成物であって、前記組成物が、50または55 m g / m ² ± 5 % のリポソームイリノテカンを含み、該組成物が、

a . 6 0 、 7 0 、 または 8 5 m g / m ² ± 5 % のオキサリプラチニン、

b . 2 0 0 m g / m ² の (1) 型ロイコボリンまたは 4 0 0 m g / m ² の (1 + d) ラセミ体ロイコボリン、および

c . 2 , 4 0 0 m g / m ² の 5 - フルオロウラシル

と組み合わせて、

2週間に1回、該患者に抗腫瘍療法として投与されることを特徴とする、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 0 6

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 0 6】

MM - 398は、リポソームイリノテカンであり、ゲムシタビンをベースにした療法の後の疾患の進行後に、ある特定の形態の膵がんを有する患者の処置のために、5 - フルオロウラシルおよびロイコボリンと組み合わせたFDAに承認された製品ONIVYDE(登録商標)として米国で販売されている。

特定の実施形態では、例えば、以下が提供される:

(項目 1)

胃がんを処置するためにこれまで抗腫瘍剤を受けたことがないヒト患者の該胃がんを処置する方法であって、合計で2週間に1回、該患者に抗腫瘍療法を施行することを含み、該抗腫瘍療法が、合計で、

a . 50または55mg/m²のリポソームイリノテカン、

b . 60、70、または85mg/m²のオキサリプラチン、

c . 200mg/m²の(1)型ロイコボリンをまたは400mg/m²の(1+d)

ラセミ体ロイコボリン、および

d . 2,400mg/m²の5-フルオロウラシル

を該患者に投与して該ヒト患者の該胃がんを処置することからなる、方法。

(項目2)

合計で50mg/m²のリポソームイリノテカンが、2週間に1回、前記抗腫瘍療法中に前記患者に投与される、項目1に記載の方法。

(項目3)

合計で55mg/m²のオキサリプラチンが、2週間に1回、前記抗腫瘍療法中に前記患者に投与される、項目1に記載の方法。

(項目4)

合計で60mg/m²のオキサリプラチンが、2週間に1回、前記抗腫瘍療法中に前記患者に投与される、項目1から3のいずれか一項に記載の方法。

(項目5)

合計で70mg/m²のオキサリプラチンが、2週間に1回、前記抗腫瘍療法中に前記患者に投与される、項目1から3のいずれか一項に記載の方法。

(項目6)

合計で85mg/m²のオキサリプラチンが、2週間に1回、前記抗腫瘍療法中に前記患者に投与される、項目1から3のいずれか一項に記載の方法。

(項目7)

合計で50mg/m²のリポソームイリノテカン、および合計で60mg/m²のオキサリプラチンが、2週間に1回、前記抗腫瘍療法中に前記患者に投与される、項目1に記載の方法。

(項目8)

合計で55mg/m²のリポソームイリノテカン、および合計で70mg/m²のオキサリプラチンが、2週間に1回、前記抗腫瘍療法中に前記患者に投与される、項目1に記載の方法。

(項目9)

合計で50mg/m²のリポソームイリノテカン、および合計で85mg/m²のオキサリプラチンが、2週間に1回、前記抗腫瘍療法中に前記患者に投与される、項目1に記載の方法。

(項目10)

前記オキサリプラチンの各投与が、前記リポソームイリノテカンの各投与の終了から2時間後に開始される、項目1から9のいずれか一項に記載の方法。

(項目11)

前記5-フルオロウラシルが、46時間にわたり注入物として投与される、項目1から10のいずれか一項に記載の方法。

(項目12)

前記ロイコボリンが、前記5-フルオロウラシルの直前に投与される、項目1から11のいずれか一項に記載の方法。

(項目13)

前記リポソームイリノテカン、オキサリプラチン、5-フルオロウラシル、およびロイコボリンが、28日処置サイクルの1および15日目に投与される、項目1から12のいずれか一項に記載の方法。

(項目14)

前記リポソームイリノテカンが、合計で約90分間にわたり注入物として投与される、項目1から13のいずれか一項に記載の方法。

(項目15)

前記リポソームイリノテカンが投与され、その後、前記オキサリプラチンが投与され、その後、前記ロイコボリンが投与され、その後、前記5-フルオロウラシルが投与される、項目1から14のいずれか一項に記載の方法。

(項目16)

前記リポソームイリノテカンが、リポソームに封入されたイリノテカンスクロースオクタスルフェートを含む、項目1から15のいずれか一項に記載の方法。

(項目17)

前記リポソームイリノテカンが、1,2-ジステアロイル-sn-グリセロ-3-ホスホコリン(DSPC)、コレステロール、およびN-(カルボニルメトキシポリエチレングリコール-2000)-1,2-ジステアロイル-sn-グリセロ-3-ホスホエタノールアミン(MPEG-2000-DSPE)からなるリポソーム小胞に封入されたイリノテカンを含む、項目1から16のいずれか一項に記載の方法。

(項目18)

前記リポソームイリノテカンが、リポソームに封入されたイリノテカンスクロースオクタスルフェートを含み、該リポソームイリノテカンが、1,2-ジステアロイル-sn-グリセロ-3-ホスホコリン(DSPC)、コレステロール、およびN-(カルボニルメトキシポリエチレングリコール-2000)-1,2-ジステアロイル-sn-グリセロ-3-ホスホエタノールアミン(MPEG-2000-DSPE)からなるリポソーム小胞に封入されたイリノテカンを含む、項目2に記載の方法。

(項目19)

前記リポソームイリノテカン、オキサリプラチン、5-フルオロウラシル、およびロイコボリンが、28日処置サイクルの1および15日目に投与され、該リポソームイリノテカンの各投与が、該ロイコボリンの前に投与され、該ロイコボリンが、該5-フルオロウラシルの各投与の直前に投与され、5-フルオロウラシルの各投与が、46時間にわたり注入物として投与される、項目18に記載の方法。

(項目20)

前記リポソームイリノテカンが、リポソームに封入されたイリノテカンスクロースオクタスルフェートを含み、該リポソームイリノテカンが、1,2-ジステアロイル-sn-グリセロ-3-ホスホコリン(DSPC)、コレステロール、およびN-(カルボニルメトキシポリエチレングリコール-2000)-1,2-ジステアロイル-sn-グリセロ-3-ホスホエタノールアミン(MPEG-2000-DSPE)からなるリポソーム小胞に封入されたイリノテカンを含む、項目10に記載の方法。

(項目21)

前記リポソームイリノテカン、オキサリプラチン、5-フルオロウラシル、およびロイコボリンが、28日処置サイクルの1および15日目に投与され、該リポソームイリノテカンの各投与が、該ロイコボリンの前に投与され、該ロイコボリンが、該5-フルオロウラシルの各投与の直前に投与され、5-フルオロウラシルの各投与が、46時間にわたり注入物として投与される、項目20に記載の方法。

(項目22)

胃がんを処置するためにこれまでゲムシタビンを受けたことがないヒト患者の該胃がんを処置する方法であって、合計で2週間に1回、該患者に抗腫瘍療法を施行することを含み、該抗腫瘍療法が、合計で、

a. 50mg/m²のリポソームイリノテカン、

b. 85mg/m²のオキサリプラチン、

c. 200mg/m²の(1)型ロイコボリンまたは400mg/m²の(1+d)ラセミ体ロイコボリン、および

d. 2,400mg/m²の5-フルオロウラシル

を該患者に投与して該ヒト患者の該胃がんを処置することからなる、方法。

(項目23)

胃がんを処置するためにこれまでゲムシタビンを受けたことがないヒト患者の該胃がんを処置する方法であって、合計で2週間に1回、該患者に抗腫瘍療法を施行することを含み、該抗腫瘍療法が、合計で、

a. 55mg/m²のリポソームイリノテカン、

b. 70mg/m²のオキサリプラチン、

c. 200mg/m²の(1)型ロイコボリンまたは400mg/m²の(1+d)ラセミ体ロイコボリン、および

d. 2,400mg/m²の5-フルオロウラシル

を該患者に投与して該ヒト患者の該胃がんを処置することからなる、方法。

(項目24)

胃がんを処置するためにこれまでゲムシタビンを受けたことがないヒト患者の該胃がんを処置する方法であって、合計で2週間に1回、該患者に抗腫瘍療法を施行することを含み、該抗腫瘍療法が、合計で、

a. 50mg/m²のリポソームイリノテカン、

b. 60mg/m²のオキサリプラチン、

c. 200mg/m²の(1)型ロイコボリンまたは400mg/m²の(1+d)ラセミ体ロイコボリン、および

d. 2,400mg/m²の5-フルオロウラシル

を該患者に投与して該ヒト患者の該胃がんを処置することからなる、方法。

(項目25)

胃がんを処置するためにこれまでゲムシタビンを受けたことがないヒト患者の該胃がんを処置する方法であって、合計で2週間に1回、前記患者に抗腫瘍療法を施行することを含み、該抗腫瘍療法が、合計で、

a. 55mg/m²のリポソームイリノテカン、

b. 85mg/m²のオキサリプラチン、

c. 200mg/m²の(1)型ロイコボリンまたは400mg/m²の(1+d)ラセミ体ロイコボリン、および

d. 2,400mg/m²の5-フルオロウラシル

を該患者に投与して該ヒト患者の該胃がんを処置することからなる、方法。

(項目26)

a. 前記リポソームイリノテカンが、1,2-ジステアロイル-sn-グリセロ-3-ホスホコリン(DSPC)、コレステロール、およびN-(カルボニルメトキシポリエトリエンギリコール-2000)-1,2-ジステアロイル(distearoyl)-sn-グリセロ-3-ホスホエタノールアミン(MPEG-2000-DSP-E)を含む、イリノテカンスクロースオクタスルフェート封入りリポソーム小胞を含み、

b. 該リポソームイリノテカン、オキサリプラチン、5-フルオロウラシル、およびロイコボリンが、28日処置サイクルの1および15日目に投与され、

c. 該リポソームイリノテカンの各投与が、該ロイコボリンの前に投与され、

d. 該ロイコボリンが、該5-フルオロウラシルの各投与の直前に投与され、

e. 5-フルオロウラシルの各投与が、46時間にわたり注入物として投与される、項目22から25のいずれか一項に記載の方法。

(項目27)

前記オキサリプラチンの各投与が、前記リポソームイリノテカンの各投与の終了後に開始され、コルチコステロイドおよび抗嘔吐薬を前記抗腫瘍療法の前に前記患者に投与することをさらに含む、項目26に記載の方法。