

【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4年11月21日(2022.11.21)

【国際公開番号】WO2020/097625

【公表番号】特表2022-506829(P2022-506829A)

【公表日】令和4年1月17日(2022.1.17)

【年通号数】公開公報(特許)2022-007

【出願番号】特願2021-524438(P2021-524438)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/527(2006.01)

A 6 1 K 31/357(2006.01)

A 6 1 P 35/00(2006.01)

A 6 1 P 35/04(2006.01)

A 6 1 P 43/00(2006.01)

A 6 1 K 31/565(2006.01)

A 6 1 K 31/4196(2006.01)

A 6 1 K 31/568(2006.01)

A 6 1 K 31/573(2006.01)

A 6 1 K 31/138(2006.01)

A 6 1 K 38/08(2019.01)

A 6 1 K 31/5377(2006.01)

A 6 1 K 31/519(2006.01)

A 6 1 K 31/506(2006.01)

C 0 7 D 487/20(2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/527

A 6 1 K 31/357

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/04

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 31/565

A 6 1 K 31/4196

A 6 1 K 31/568

A 6 1 K 31/573

A 6 1 K 31/138

A 6 1 K 38/08

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 31/506

C 0 7 D 487/20

【手続補正書】

【提出日】令和4年11月11日(2022.11.11)

【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】

10

20

30

40

50

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

ヒトにおいて癌を処置するための組合せ医薬であって、

前記組合せ医薬は、有効量の選択的サイクリン依存性キナーゼ 4 / 6 (C D K 4 / 6) 阻害剤と、有効量のエリブリンまたはその薬学上許容可能な塩とを含んでなり、

前記エリブリンは、21日間の化学療法サイクルの1日目および8日目に投与され、

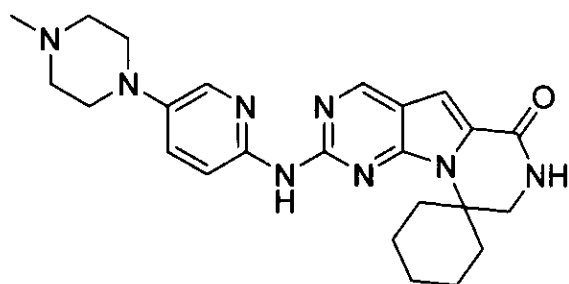
前記選択的 C D K 4 / 6 阻害剤は、21日間の化学療法サイクルの1日目および8日目に投与され、

前記選択的 C D K 4 / 6 阻害剤は、前記エリブリンの投与前4時間以内に投与され、

前記選択的 C D K 4 / 6 阻害剤は、

10

【化 1】



(化合物 1)

20

またはその薬学上許容可能な塩である、前記組合せ医薬。

【請求項 2】

前記エリブリンの薬学上許容可能な塩がメシル酸エリブリンである、請求項 1 に記載の組合せ医薬。

【請求項 3】

前記癌が、乳癌、切除不能 / 転移性脂肪肉腫、非小細胞性肺癌、前立腺癌、膵臓癌、結腸直腸癌、膀胱癌、骨肉腫、平滑肉腫、卵巣癌、子宮頸癌、結腸癌、頭頸部癌、肉腫、再発性 / 難治性横紋筋肉腫、非横紋筋肉腫性軟部組織肉腫、ユーイング肉腫、血管肉腫、類上皮型血管内皮腫および尿路上皮細胞癌からなる群から選択される、請求項 1 または 2 に記載の組合せ医薬。

30

【請求項 4】

前記乳癌が、転移性乳癌、トリプルネガティブ乳癌、トリプルポジティブ乳癌、HER2 陰性乳癌、HER2 陽性乳癌、エストロゲン受容体陽性乳癌、エストロゲン受容体陰性乳癌、プロゲステロン受容体陽性乳癌、プロゲステロン受容体陰性乳癌、非浸潤性乳管癌 (O C i S)、浸潤性乳管癌、浸潤性小葉癌、炎症性乳癌、乳頭のパジェット病、フィロデス腫瘍およびホルモン応答性癌からなる群から選択される、請求項 3 に記載の組合せ医薬。

【請求項 5】

前記癌が C D K 4 / 6 複製依存性癌である、請求項 1 または 2 に記載の組合せ医薬。

40

【請求項 6】

前記癌が R b 陽性癌である、請求項 1 または 2 に記載の組合せ医薬。

【請求項 7】

前記癌が C D K 4 / 6 複製非依存性癌である、請求項 1 または 2 に記載の組合せ医薬。

【請求項 8】

前記選択的 C D K 4 / 6 阻害剤またはその薬学上許容可能な塩が、前記エリブリンまたはその薬学上許容可能な塩の投与前約 30 分以内に、前記ヒトに投与される、請求項 1 または 2 に記載の組合せ医薬。

【請求項 9】

前記選択的 C D K 4 / 6 阻害剤またはその薬学上許容可能な塩が 2 回投与され、そのう

50

ち、第 1 回目の投与が前記エリブリンまたはその薬学上許容可能な塩の投与前約 2 4 時間以内である、請求項 1 または 2 に記載の組合せ医薬。

【請求項 1 0】

癌の処置が行われているヒトにおいて造血幹および前駆細胞 (HSPC) を保護するための組合せ医薬であって、

前記組合せ医薬は、有効量の選択的 CDK 4 / 6 阻害剤と、有効量のエリブリンまたはその薬学上許容可能な塩とを含んでなり、

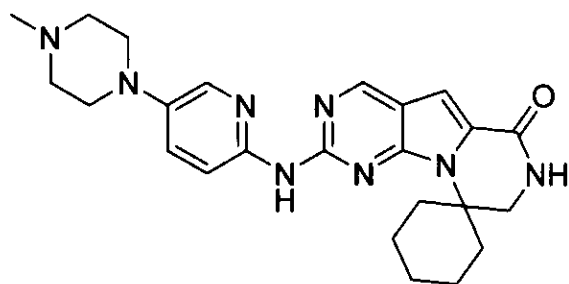
前記エリブリンは、2 1 日間の化学療法サイクルの 1 日目および 8 日目に投与され、

前記選択的 CDK 4 / 6 阻害剤は、2 1 日間の化学療法サイクルの 1 日目および 8 日目に投与され、

前記選択的 CDK 4 / 6 阻害剤は、前記エリブリンの投与前 4 時間以内に投与され、

前記選択的 CDK 4 / 6 阻害剤は、

【化 2】



(化合物 1)

またはその薬学上許容可能な塩である、前記組合せ医薬。

【請求項 1 1】

前記エリブリンの薬学上許容可能な塩がメシル酸エリブリンである、請求項 1 0 に記載の組合せ医薬。

【請求項 1 2】

前記癌が、乳癌、切除不能 / 転移性脂肪肉腫、非小細胞性肺癌、前立腺癌、膵臓癌、結腸直腸癌、膀胱癌、骨肉腫、平滑肉腫、卵巣癌、子宮頸癌、結腸癌、頭頸部癌、肉腫、再発性 / 難治性横紋筋肉腫、非横紋筋肉腫性軟部組織肉腫、ユーイング肉腫、血管肉腫、類上皮型血管内皮腫および尿路上皮細胞癌からなる群から選択される、請求項 1 0 または 1 1 に記載の組合せ医薬。

【請求項 1 3】

前記乳癌が、転移性乳癌、トリプルネガティブ乳癌、トリプルポジティブ乳癌、HER 2 陰性乳癌、HER 2 陽性乳癌、エストロゲン受容体陽性乳癌、エストロゲン受容体陰性乳癌、プロゲステロン受容体陽性乳癌、プロゲステロン受容体陰性乳癌、非浸潤性乳管癌 (OCIS)、浸潤性乳管癌、浸潤性小葉癌、炎症性乳癌、乳頭のパジェット病、フィロデス腫瘍およびホルモン応答性癌からなる群から選択される、請求項 1 2 に記載の組合せ医薬。

【請求項 1 4】

前記癌が CDK 4 / 6 複製依存性癌である、請求項 1 0 または 1 1 に記載の組合せ医薬。

【請求項 1 5】

前記癌が Rb 陽性癌である、請求項 1 0 または 1 1 に記載の組合せ医薬。

【請求項 1 6】

前記癌が CDK 4 / 6 複製非依存性癌である、請求項 1 0 または 1 1 に記載の組合せ医薬。

【請求項 1 7】

前記選択的 CDK 4 / 6 阻害剤またはその薬学上許容可能な塩が、前記エリブリンまた

はその薬学上許容可能な塩の投与前約30分以内に、前記ヒトに投与される、請求項10または11に記載の組合せ医薬。

【請求項18】

ヒトにおいて癌を処置するための組合せ医薬であって、

前記組合せ医薬は、有効量の選択的CDK4/6阻害剤と、有効量のエリブリンまたはその薬学上許容可能な塩とを含んでなり、

前記エリブリンは、28日間の化学療法サイクルの1日目、8日目および15日目に投与され、

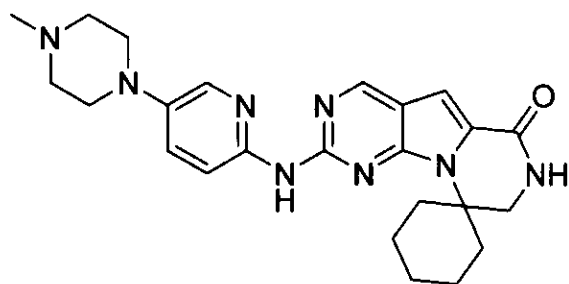
前記選択的CDK4/6阻害剤は、28日間の化学療法サイクルの1日目、8日目および15日目に投与され、

前記選択的CDK4/6阻害剤は、前記エリブリンの投与前4時間以内に投与され、

前記選択的CDK4/6阻害剤は、

10

【化3】



(化合物1)

20

またはその薬学上許容可能な塩である、前記組合せ医薬。

【請求項19】

前記エリブリンの薬学上許容可能な塩がメシル酸エリブリンである、請求項18に記載の組合せ医薬。

【請求項20】

前記癌が、乳癌、切除不能/転移性脂肪肉腫、非小細胞性肺癌、前立腺癌、膵臓癌、結腸直腸癌、膀胱癌、骨肉腫、平滑肉腫、卵巣癌、子宮頸癌、結腸癌、頭頸部癌、肉腫、再発性/難治性横紋筋肉腫、非横紋筋肉腫性軟部組織肉腫、ユーイング肉腫、血管肉腫、類上皮型血管内皮腫および尿路上皮細胞癌からなる群から選択される、請求項18または19に記載の組合せ医薬。

30

【請求項21】

前記乳癌が、転移性乳癌、トリプルネガティブ乳癌、トリプルポジティブ乳癌、HER2陰性乳癌、HER2陽性乳癌、エストロゲン受容体陽性乳癌、エストロゲン受容体陰性乳癌、プロゲステロン受容体陽性乳癌、プロゲステロン受容体陰性乳癌、非浸潤性乳管癌(OCIS)、浸潤性乳管癌、浸潤性小葉癌、炎症性乳癌、乳頭のパジェット病、フィロデス腫瘍およびホルモン応答性癌からなる群から選択される、請求項20に記載の組合せ医薬。

40

【請求項22】

前記癌がCDK4/6複製依存性癌である、請求項18または19に記載の組合せ医薬。

【請求項23】

前記癌がRb陽性癌である、請求項18または19に記載の組合せ医薬。

【請求項24】

前記癌がCDK4/6複製非依存性癌である、請求項18または19に記載の組合せ医薬。

【請求項25】

前記選択的CDK4/6阻害剤またはその薬学上許容可能な塩が、前記エリブリンまた

50

はその薬学上許容可能な塩の投与前約30分以内に、前記ヒトに投与される、請求項18または19に記載の組合せ医薬。

【請求項26】

癌の処置が行われているヒトにおいて造血幹および前駆細胞(HSPC)を保護するための組合せ医薬であって、

前記組合せ医薬は、有効量の選択的CDK4/6阻害剤と、有効量のエリブリンまたはその薬学上許容可能な塩とを含んでなり、

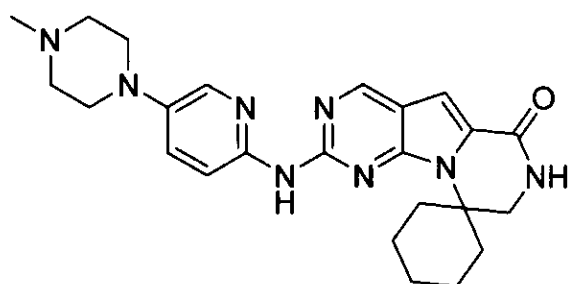
前記エリブリンは、28日間の化学療法サイクルの1日目、8日目および15日目に投与され、

前記選択的CDK4/6阻害剤は、28日間の化学療法サイクルの1日目、8日目および15日目に投与され、

前記選択的CDK4/6阻害剤は、前記エリブリンの投与前4時間以内に投与され、

前記選択的CDK4/6阻害剤は、

【化4】



(化合物1)

またはその薬学上許容可能な塩である、前記組合せ医薬。

【請求項27】

前記エリブリンの薬学上許容可能な塩がメシル酸エリブリンである、請求項26に記載の組合せ医薬。

【請求項28】

前記癌が、乳癌、切除不能/転移性脂肪肉腫、非小細胞性肺癌、前立腺癌、膵臓癌、結腸直腸癌、膀胱癌、骨肉腫、平滑肉腫、卵巣癌、子宮頸癌、結腸癌、頭頸部癌、肉腫、再発性/難治性横紋筋肉腫、非横紋筋肉腫性軟部組織肉腫、ユーイング肉腫、血管肉腫、類上皮型血管内皮腫および尿路上皮細胞癌からなる群から選択される、請求項26または27に記載の組合せ医薬。

【請求項29】

前記乳癌が、転移性乳癌、トリプルネガティブ乳癌、トリプルポジティブ乳癌、HER2陰性乳癌、HER2陽性乳癌、エストロゲン受容体陽性乳癌、エストロゲン受容体陰性乳癌、プロゲステロン受容体陽性乳癌、プロゲステロン受容体陰性乳癌、非浸潤性乳管癌(OCIS)、浸潤性乳管癌、浸潤性小葉癌、炎症性乳癌、乳頭のパジェット病、フィロデス腫瘍およびホルモン応答性癌からなる群から選択される、請求項28に記載の組合せ医薬。

【請求項30】

前記癌がCDK4/6複製依存性癌である、請求項26または27に記載の組合せ医薬。

【請求項31】

前記癌がRb陽性癌である、請求項26または27に記載の組合せ医薬。

【請求項32】

前記癌がCDK4/6複製非依存性癌である、請求項26または27に記載の組合せ医薬。

【請求項33】

前記選択的CDK4/6阻害剤またはその薬学上許容可能な塩が、前記エリブリンまたはその薬学上許容可能な塩の投与前約30分以内に、前記ヒトに投与される、請求項2.6または2.7に記載の組合せ医薬。

【請求項3.4】

前記組合せ医薬が、抗ホルモン剤をさらに含んでなり、

前記抗ホルモン剤が、SERM（選択的エストロゲン受容体調節薬）、SERD（選択的エストロゲン受容体分解薬）、完全なエストロゲン受容体分解薬、または別の形態の部分エストロゲン拮抗薬もしくは完全なエストロゲン拮抗薬、選択的アンドロゲン受容体調節薬、選択的アンドロゲン受容体分解薬、完全なアンドロゲン受容体分解薬、または別の形態の部分アンドロゲン拮抗薬もしくは完全なアンドロゲン拮抗薬からなる群から選択される、請求項4、1.3、2.1および2.9のいずれか一項に記載の組合せ医薬。

10

【請求項3.5】

前記抗ホルモン剤が、フルベストラント、タモキシフェン、アナストロゾール、レトロゾール、エキセメスタン、ゴセレリン、ロイプロリド、酢酸メゲストロールおよびトレミフェンからなる群から選択される、請求項3.4に記載の組合せ医薬。

20

30

40

50