

【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 3 年 12 月 9 日 (2021.12.9)

【公表番号】特表 2021-501203 (P2021-501203A)

【公表日】令和 3 年 1 月 14 日 (2021.1.14)

【年通号数】公開・登録公報 2021-002

【出願番号】特願 2020-543260 (P2020-543260)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4745 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/502 (2006.01)

A 6 1 K 33/26 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/4745

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 P 37/04

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 31/502

A 6 1 K 33/26

【手続補正書】

【提出日】令和 3 年 10 月 29 日 (2021.10.29)

【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

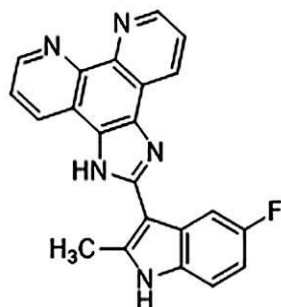
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

対象のがんの予防、軽減または治療に用いる医薬組成物であって、治療上有効な量の下記の化合物 I、

【化 1】



またはその製薬学的に許容可能な塩、遊離塩基、水和物、錯体もしくはキレートを含み、

前記対象が、DNA修復遺伝子に変異を有する前記医薬組成物。

【請求項2】

前記DNA修復遺伝子が、相同組み換え遺伝子である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項3】

前記DNA修復遺伝子が、相同組み換え（HR）依存性のデオキシリボ核酸（DNA）二本鎖切断（DSB）修復経路の遺伝子である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項4】

前記DNA修復遺伝子が、BRCA-1、BRCA-2、ATM、ATR、CHK1、CHK2、Rad51、RPA及びXRCC3からなる群から選択した1つ以上の遺伝子である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項5】

前記DNA修復遺伝子が、BRCA-1及び／またはBRCA-2である、請求項2に記載の医薬組成物。

【請求項6】

前記対象では、DNA修復遺伝子における変異がヘテロ接合型である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項7】

前記対象では、前記相同組み換え（HR）依存性のデオキシリボ核酸（DNA）二本鎖切断（DSB）修復経路の遺伝子における変異がヘテロ接合型である、請求項6に記載の医薬組成物。

【請求項8】

前記対象では、BRCA1またはBRCA2における変異がヘテロ接合型である、請求項6に記載の医薬組成物。

【請求項9】

前記対象では、BRCA1またはBRCA2における変異がホモ接合型である、請求項6に記載の医薬組成物。

【請求項10】

前記がんが、造血癌、結腸直腸癌、卵巣癌、乳癌、子宮頸癌、肺癌、肝臓癌、膵臓癌、リンパ節癌、白血病、腎臓癌、大腸癌、前立腺癌、脳腫瘍、頭頸部癌、骨癌、咽頭口腔癌、ユーイング肉腫、皮膚癌、腎臓癌及び心臓癌からなる群から選択される、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項11】

前記がんが、乳癌、肺癌、リンパ節癌、大腸癌、白血病、腎臓癌及び前立腺癌からなる群から選択される、請求項10に記載の医薬組成物。

【請求項12】

前記がんが、乳癌である、請求項11に記載の医薬組成物。

【請求項13】

前記がんが、BRCA関連癌である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項14】

前記BRCA関連癌が、BRCA-1及び／またはBRCA-2遺伝子の1つ以上の変異を有する、請求項13に記載の医薬組成物。

【請求項15】

前記対象が、ヒトである、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項16】

第2の治療有効剤を治療上有効な量投与することをさらに含む、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項17】

前記対象に化合物Iを投与前、投与中または投与後に、前記第2の治療有効剤を投与する、請求項16に記載の医薬組成物。

【請求項18】

前記第 2 の治療有効剤が、免疫療法剤、抗がん剤及び血管新生剤からなる群のうちの 1 つ以上から選択される、請求項 16 に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

前記第 2 の治療有効剤が、PARP 阻害剤である、請求項 18 に記載の医薬組成物。

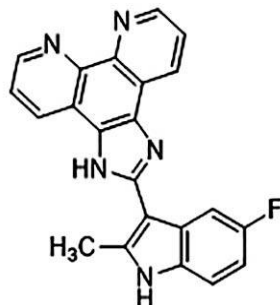
【請求項 20】

前記 PARP 阻害剤が、オラパリブである、請求項 19 に記載の医薬組成物。

【請求項 21】

前記対象で、下記の化合物 I、

【化 2】



またはその製薬学的に許容可能な塩、遊離塩基、水和物、錯体もしくはキレート进行治疗上有効な量投与されなかった対象と比べて、骨髓活性の低下が 90 % 未満となる、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 22】

前記対象で、骨髓活性の低下が 10 % 未満となる、請求項 21 に記載の医薬組成物。

【請求項 23】

前記対象で、骨髓活性の低下が見られない、請求項 21 に記載の医薬組成物。

【請求項 24】

前記対象が、すでにかんである、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 25】

前記対象で、がんに関連する腫瘍のサイズの低減または縮小が見られる、請求項 24 に記載の医薬組成物。

【請求項 26】

前記対象で、前記がんに関連する前記腫瘍が完全に消失する、請求項 25 に記載の医薬組成物。

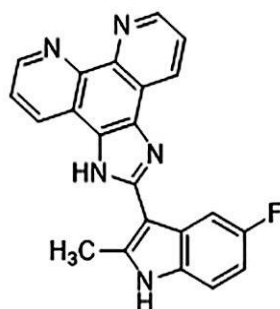
【請求項 27】

前記対象で、がんに関連する腫瘍における新生血管形成または血管新生が阻害、減少または低減される、請求項 24 に記載の医薬組成物。

【請求項 28】

がん細胞の殺傷に用いる医薬組成物であって、治療上有効な量の下記の化合物 I、

【化 3】



またはその製薬学的に許容可能な塩、遊離塩基、水和物、錯体もしくはキレートを含み、前記細胞と、前記化合物 I またはその製薬学的に許容可能な塩、遊離塩基、水和物、錯体

もしくはキレートを接触させることを含む前記医薬組成物。

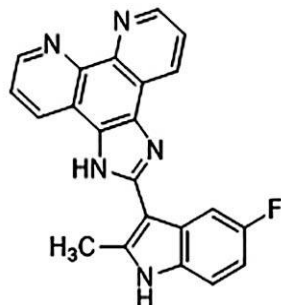
【請求項 29】

前記がん細胞が、BRCA-1、BRCA-2、ATM、ATR、CHK1、CHK2、Rad51、RPA及びXRCC3からなる群から選択した1つ以上の遺伝子を欠損している、請求項28に記載の医薬組成物。

【請求項 30】

がん細胞における細胞周期停止の誘導に用いる医薬組成物であって、治療上有効な量の
下記の化合物 I、

【化 4】



またはその製薬学的に許容可能な塩、遊離塩基、水和物、錯体もしくはキレートを含み、
前記細胞と、前記化合物 I またはその製薬学的に許容可能な塩、遊離塩基、水和物、錯体
もしくはキレートを接触させることを含む前記医薬組成物。

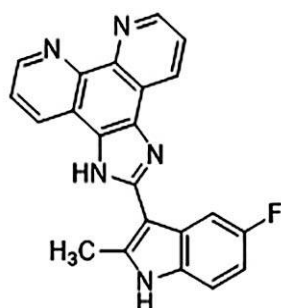
【請求項 31】

前記がん細胞が、BRCA-1、BRCA-2、ATM、ATR、CHK1、CHK2、Rad51、RPA及びXRCC3からなる群から選択した1つ以上の遺伝子を欠損している、請求項30に記載の医薬組成物。

【請求項 32】

対象のがんの予防、軽減または治療に用いる医薬組成物であって、1つ以上の金属原子
との錯体で、治療上有効な量の

【化 5】



の1つ以上の分子を含み、前記対象が、DNA修復遺伝子に変異を有する前記医薬組成物。

【請求項 33】

前記1つ以上の金属原子が、鉄、亜鉛、アルミニウム、マグネシウム、白金、銀、金、クロム、ニッケル、チタン、銅、スカンジウム、ジルコニウム、バナジウム、モリブデン、マンガン、タングステン及びコバルトからなる群から選択される、請求項32に記載の医薬組成物。

【請求項 34】

前記1つ以上の金属原子が、鉄である、請求項33に記載の医薬組成物。

【請求項 35】

前記錯体が、下記の構造を有する、請求項34に記載の医薬組成物。

【化 6】

