

【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 1 年 5 月 30 日 (2019.5.30)

【公表番号】特表 2018-514593 (P2018-514593A)

【公表日】平成 30 年 6 月 7 日 (2018.6.7)

【年通号数】公開・登録公報 2018-021

【出願番号】特願 2018-509731 (P2018-509731)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/137 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/04 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/137

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/04

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 19/10

【手続補正書】

【提出日】平成 31 年 4 月 17 日 (2019.4.17)

【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

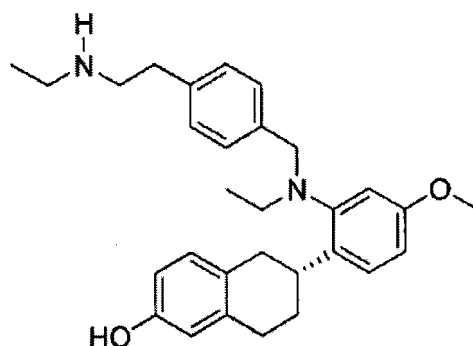
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

薬物耐性エストロゲン受容体アルファ陽性癌を有する対象において腫瘍成長を阻害するためのまたは腫瘍退縮を生じさせるための組成物であって、治療上有効量の、構造：

【化 1】

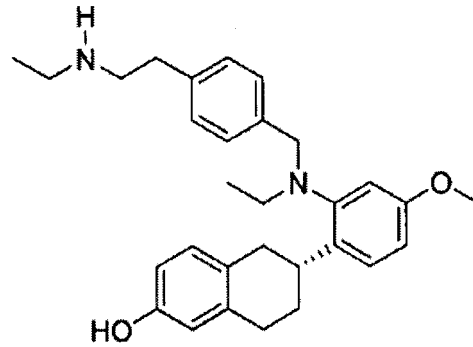


を有する RAD 1901 またはその塩もしくは溶媒和物を含む、組成物。

【請求項 2】

変異体エストロゲン受容体アルファ陽性癌を有する対象において腫瘍成長を阻害するためのまたは腫瘍退縮を生じさせるための組成物であって、治療上有効量の、構造：

【化 2】



を有する R A D 1 9 0 1 またはその塩もしくは溶媒和物を含む、組成物。

【請求項 3】

前記癌が、乳癌、子宮癌、卵巣癌、及び下垂体癌からなる群から選択される、請求項 1 または 2 に記載の組成物。

【請求項 4】

前記癌が、転移性癌である、請求項 1 または 2 に記載の組成物。

【請求項 5】

前記癌が、Y 5 3 7 X₁、L 5 3 6 X₂、P 5 3 5 H、V 5 3 4 E、S 4 6 3 P、V 3 9 2 I、E 3 8 0 Q、D 5 3 8 G 及びこれらの組み合わせからなる群から選択される 1 つ以上の変異を含む変異体エストロゲン受容体アルファに対して陽性であり、式中、

X₁ が、S、N、または C であり、X₂ が R または Q である、請求項 1 または 2 に記載の組成物。

【請求項 6】

前記変異が、Y 5 3 7 S である、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 7】

投与後の腫瘍中の R A D 1 9 0 1 またはその塩もしくは溶媒和物の濃度対血漿中の R A D 1 9 0 1 またはその塩もしくは溶媒和物の濃度の比 (T / P) が、少なくとも約 1.5 である、請求項 1 または 2 に記載の組成物。

【請求項 8】

前記対象が、骨粗鬆症または骨粗鬆症の高いリスクを有する、請求項 1 または 2 に記載の組成物。

【請求項 9】

前記対象が、閉経前の女性である、請求項 1 または 2 に記載の組成物。

【請求項 10】

前記対象が、S E R M 及び / 又は A I によるこれまでの治療後に、再発または進行している閉経後の女性である、請求項 1 または 2 に記載の組成物。

【請求項 11】

前記治療上有効量が、毎日約 150 ~ 約 1,500 mg である、請求項 1 または 2 に記載の組成物。

【請求項 12】

前記その塩が、R A D 1 9 0 1 二塩酸塩である、請求項 1 または 2 に記載の組成物。

【請求項 13】

前記腫瘍が、抗エストロゲン、アロマターゼ阻害剤、及びこれらの組み合わせからなる群から選択される薬物に耐性を示す、請求項 1 または 2 に記載の組成物。

【請求項 14】

前記抗エストロゲンが、タモキシフェンまたはフルベストラントである、請求項 13 に記載の組成物。

【請求項 15】

前記アロマターゼ阻害剤が、アロマシンである、請求項 1 3 に記載の組成物。

【請求項 1 6】

前記治療上有効量が、150mg～2,000mgである、請求項 1 または 2 に記載の組成物。

【請求項 1 7】

前記治療上有効量が、200mg、400mg、または500mgである、請求項 1 6 に記載の組成物。