

【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30年7月5日(2018.7.5)

【公表番号】特表2017-516784(P2017-516784A)

【公表日】平成29年6月22日(2017.6.22)

【年通号数】公開・登録公報2017-023

【出願番号】特願2016-569606(P2016-569606)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/357	(2006.01)
A 6 1 K	31/519	(2006.01)
A 6 1 K	31/4184	(2006.01)
A 6 1 K	31/416	(2006.01)
A 6 1 K	31/502	(2006.01)
A 6 1 K	31/55	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 K	33/24	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/357
A 6 1 K	31/519
A 6 1 K	31/4184
A 6 1 K	31/416
A 6 1 K	31/502
A 6 1 K	31/55
A 6 1 K	45/00
A 6 1 K	33/24
A 6 1 P	35/00

【手続補正書】

【提出日】平成30年5月25日(2018.5.25)

【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】

がんを患っている又は発症するリスクのある対象の治療用の医薬組成物であって、

(i)エリブリン又はその医薬的に許容可能な塩を含有する、前記エリブリン又はその医薬的に許容可能な塩とポリ(ADPリボース)ポリメラーゼ(PARP)阻害剤又はその医薬的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物若しくは非晶質固体との併用療法において用いられる、医薬組成物、

又は、

(ii)前記PARP阻害剤又はその医薬的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物若しくは非晶質固体を含有する、前記PARP阻害剤又はその医薬的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物若しくは非晶質固体と前記エリブリン又はその医薬的に許容可能な塩との併用療法において用いられる、医薬組成物。

【請求項2】

前記がんは、相同組換え(HR)-欠損である、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項3】**

前記HR欠損がんは、BRCA1、BRCA2、PTEN、ATM、MRE11、PALB2、RAD54、RAD54B、RAD50、RAD51、RAD51B、RAD51C、RAD51D、DMC1、XRCC2、SRCC3、RAD52、BRIP1、NBS1、WRN、BLM、Ku70、Ku80、ATR chk1、chk2、FANCA、FANCB、FANCC、FANCD1、FANCD2、FANCE、FANCF、FANCG、RAD1、RAD9、FEN-1、Mus81、Eme1、DDS1、BARD、XRCC1、ADPRT(PARP-1)、ADPRT L2(PARP-2)、CTPS、RPA、RPA1、RPA2、RPA3、XPD、ERCC1、XPF又はMMS19欠損である、請求項2に記載の医薬組成物。

**【請求項4】**

前記対象は、ヒト患者である、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項5】**

前記対象は、がんの治療中において、又は、がんからの治療後回復期において、がんであると診断されている、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項6】**

前記がんは、原発腫瘍である、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項7】**

前記がんは、転移がんである、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項8】**

前記がんは、固形腫瘍である、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項9】**

前記がんは、乳がん(例えば、エストロゲンレセプター陽性若しくは陰性、プロゲステロンレセプター陽性若しくは陰性、HER-2陽性若しくは陰性、三種陰性乳がん又はBRCA1及び/若しくはBRCA2陽性若しくは陰性)、肺がん(例えば、非小細胞肺がん及び小細胞肺がん)、卵巣がん、子宮体がん、前立腺がん、咽頭がん、食道がん、グリア芽細胞腫、副腎がん、B細胞悪性腫瘍、胆道がん、膀胱がん、骨がん、脳がん、子宮頸がん、絨毛膜癌腫、結腸がん、大腸がん、結合組織がん、消化器系のがん、胆嚢がん、胃がん、頭と首のがん、肝細胞癌腫、上皮内新生物、腎臓がん、肝がん、リンパ腫、皮膚がん(例えば、メラノーマ及び基底細胞癌腫)、神経芽腫、中皮腫、神経膠腫、口腔がん、小児がん、脾臓がん、胰性内分泌腫瘍、下垂体線腫、胸腺腫、腎細胞癌腫、呼吸器系がん、唾液腺がん、肉腫(例えば、ユーリング肉腫、線維肉腫及び横紋筋肉腫)、小腸がん、精巣がん、甲状腺がん、尿管がん、泌尿器系がん、及び血液がん(例えば、急性顆粒球性白血病及び多発性骨髄腫)からなる群より選択される、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項10】**

前記がんは、乳がん及び肺がんから選択される、請求項9に記載の医薬組成物。

**【請求項11】**

前記エリブリンの医薬的に許容可能な塩は、エリブリンメシル酸塩である、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項12】**

前記エリブリン又はその医薬的に許容可能な塩を含有する医薬組成物は、静脈内注入による投与に用いられる、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項13】**

前記静脈内注入は、約1～約20分又は約2～約5分間ある、請求項12に記載の医薬組成物。

**【請求項14】**

前記エリブリン又はその医薬的に許容可能な塩を含有する医薬組成物は、約 $0.1\text{mg}/\text{m}^2$ ～約 $20\text{mg}/\text{m}^2$ の前記エリブリン又はその医薬的に許容可能な塩の範囲の量での、又は、約 $0.7\text{mg}/\text{m}^2$ 、 $1.1\text{mg}/\text{m}^2$ 若しくは $1.4\text{mg}/\text{m}^2$ の前記エリブリン又はその医薬的に許容可能な塩の量での投与に用いられる、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項15】**

前記エリブリン又はその医薬的に許容可能な塩を含有する医薬組成物は、21日サイクルの1日目及び8日目に一日一回投与として用いられる、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項 1 6】**

前記PARP阻害剤は、E7449、オラパリブ、ニラパリブ、ルカパリブ、ベリパリブ及びBMN 673並びにその医薬的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物又は非晶質固体からなる群より選択される、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項 1 7】**

前記PARP阻害剤は、E7449又はその医薬的に許容可能な塩である、請求項1 6に記載の医薬組成物。

**【請求項 1 8】**

前記E7449の医薬的に許容可能な塩は、L-酒石酸塩である、請求項1 7に記載の医薬組成物。

**【請求項 1 9】**

前記E7449又はその医薬的に許容可能な塩は、経口的に投与される、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項 2 0】**

前記E7449又はその医薬的に許容可能な塩を含有する医薬組成物は、約100mg～約1000mgの前記E7449又はその医薬的に許容可能な塩の範囲の量での、又は、約200、400、600若しくは800 mgの前記E7449又はその医薬的に許容可能な塩の量での投与に用いられる、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項 2 1】**

前記PARP阻害剤又はその医薬的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物若しくは非晶質固体を含有する医薬組成物は、21日サイクルの間、一日一回投与として用いられる、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項 2 2】**

プラチナに基づく抗腫瘍薬を含有する医薬組成物が、前記併用療法において更に用いられる、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項 2 3】**

前記プラチナに基づく抗腫瘍薬は、シスプラチン、カルボプラチン、オキサリプラチン、サトラプラチン、ピコプラチン、ネダプラチン、トリプラチン及びリポラチンからなる群より選択される、請求項2 2に記載の医薬組成物。

**【請求項 2 4】**

前記プラチナに基づく抗腫瘍薬を含有する医薬組成物は、21日サイクルの間、一回投与として用いられる、請求項2 2に記載の医薬組成物。

**【請求項 2 5】**

前記治療は、(i)がん細胞の数を減少させる；(ii)腫瘍体積を減少させる；(iii)腫瘍退縮率を増加させる；(iv)がん細胞の末梢器官への浸潤を低下させる若しくは遅らせる；(v)腫瘍転移を低下させる若しくは遅らせる；(vi)腫瘍成長を低下させる若しくは阻害させる；(vii)がんの発生若しくは再発を予防する若しくは遅らせる及び/若しくは無疾患若しくは無腫瘍生存期間を延長する；(viii)全生存期間を延ばす；(ix)治療の頻度を減少させる；並びに/又は(x)がんと関連する1又は複数の症状を緩和させることである、請求項1に記載の医薬組成物。

**【請求項 2 6】**

対象の腫瘍サイズを減少させるための医薬組成物であって、

(i)エリブリン又はその医薬的に許容可能な塩を含有する、前記エリブリン又はその医薬的に許容可能な塩とポリ(ADPリボース)ポリメラーゼ(PARP)阻害剤又はその医薬的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物若しくは非晶質固体との併用療法において用いられる、医薬組成物、

又は、

(ii)前記PARP阻害剤又はその医薬的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物若しくは非晶質固体を含有する、前記PARP阻害剤又はその医薬的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物若しくは非晶質固体と前記エリブリン又はその医薬的に許容可能な塩との併用療法において用

いられる、医薬組成物。

【請求項 27】

前記腫瘍は、HR欠損がん細胞を含む、請求項26に記載の医薬組成物。

【請求項 28】

前記PARP阻害剤は、E7449又はその医薬的に許容可能な塩である、請求項26又は27に記載の医薬組成物。

【請求項 29】

前記E7449の医薬的に許容可能な塩は、L-酒石酸塩である、請求項28に記載の医薬組成物。

【請求項 30】

前記エリブリンの医薬的に許容可能な塩は、エリブリンメシル酸塩である、請求項26に記載の医薬組成物。

【請求項 31】

プラチナに基づく抗腫瘍薬を含有する医薬組成物が、前記併用療法において更に用いられる、請求項26に記載の医薬組成物。

【請求項 32】

前記エリブリン若しくはその医薬的に許容可能な塩の量及び/又は前記PARP阻害剤若しくはその医薬的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物若しくは非晶質固体の量は、個々の効果の合計よりも相乗効果が大きい、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項 33】

前記エリブリン又はその医薬的に許容可能な塩の量、前記PARP阻害剤若しくはその医薬的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物若しくは非晶質固体の量及び/又は前記プラチナに基づく抗腫瘍薬の量は、個々の効果の合計よりも相乗効果が大きい、請求項22に記載の医薬組成物。

【請求項 34】

前記エリブリン若しくはその医薬的に許容可能な塩を含有する医薬組成物又は前記PARP阻害剤又はその医薬的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物若しくは非晶質固体を含有する医薬組成物は、共投与される、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項 35】

前記エリブリン若しくはその医薬的に許容可能な塩を含有する医薬組成物又は前記PARP阻害剤若しくはその医薬的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物若しくは非晶質固体を含有する医薬組成物は、順次投与される、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項 36】

プラチナに基づく抗悪性腫瘍薬を含有する医薬組成物が、前記エリブリン若しくはその医薬的に許容可能な塩を含有する医薬組成物又は前記PARP阻害剤若しくはその医薬的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物若しくは非晶質固体を含有する医薬組成物の一方又は両方と共にでの共投与に用いられる、又は、

プラチナに基づく抗悪性腫瘍薬を含有する医薬組成物が、前記エリブリン若しくはその医薬的に許容可能な塩を含有する医薬組成物又は前記PARP阻害剤若しくはその医薬的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物若しくは非晶質固体を含有する医薬組成物に対する順次での投与に用いられる、請求項34に記載の医薬組成物。

【請求項 37】

がんを治療する又は腫瘍サイズを減少させるのに用いられるキットであって、(i)エリブリン又はその医薬的に許容可能な塩、及び(ii) PARP阻害剤又はその医薬的に許容可能な塩、水和物、溶媒和物若しくは非晶質固体を備える、キット。

【請求項 38】

前記PARP阻害剤は、E7449又はその医薬的に許容可能な塩である、請求項37に記載のキット。

【請求項 39】

前記E7449の医薬的に許容可能な塩は、L-酒石酸塩である、請求項38に記載のキット

。

【請求項 4 0】

前記エリブリンの医薬的に許容可能な塩は、エリブリンメシル酸塩である、請求項 3 7 に記載のキット。

【請求項 4 1】

前記キットは、プラチナに基づく抗腫瘍薬を更に備える、請求項 3 7 に記載のキット。

【請求項 4 2】

前記プラチナに基づく抗腫瘍薬は、シスプラチン、カルボプラチン、オキサリプラチン、サトラプラチン、ピコプラチン、ネダプラチン、トリプラチン及びリポラチンからなる群より選択される、請求項 4 1 に記載のキット。