

【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29年1月26日 (2017.1.26)

【公表番号】特表2016-503063(P2016-503063A)

【公表日】平成28年2月1日 (2016.2.1)

【年通号数】公開・登録公報2016-007

【出願番号】特願2015-549772(P2015-549772)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/7135 (2006.01)

A 6 1 K 39/395 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

C 0 7 H 5/08 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/7135

A 6 1 K 39/395 N

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 P 35/00

C 0 7 H 5/08

【手続補正書】

【提出日】平成28年12月7日 (2016.12.7)

【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】

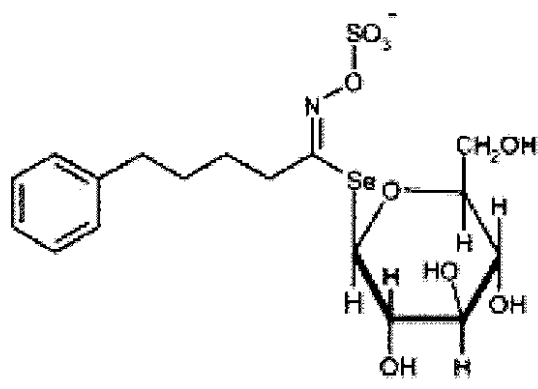
セツキシマブ及び I S C - 4 ; 又は
セツキシマブ及び I S C - 4 プロドラッグ

を含む組成物。

【請求項 2】

前記 I S C - 4 プロドラッグが、以下の構造式：

【化 1】



を有する I S C - 4 のグルコシノレートプロドラッグ又はその薬学的に許容される塩である、請求項 1 の組成物。

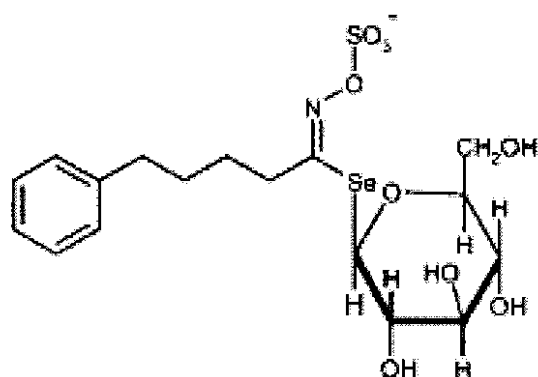
【請求項 3】

セツキシマブ及び I S C - 4 ; 又は
セツキシマブ及び I S C - 4 プロドラッグを含む市販用セット。

【請求項 4】

前記 I S C - 4 プロドラッグが、以下の構造式：

【化 2】



を有する I S C - 4 のグルコシノラートプロドラッグ又はその薬学的に許容される塩である、請求項 3 の市販用セット。

【請求項 5】

前記セツキシマブ及び I S C - 4 が単一の医薬製剤として提供される、請求項 3 の市販用セット。

【請求項 6】

前記セツキシマブ及び I S C - 4 が別個の医薬製剤として提供される、請求項 3 の市販用セット。

【請求項 7】

前記セツキシマブ及び I S C - 4 プロドラッグが単一の医薬製剤として提供される、請求項 3 又は 4 の市販用セット。

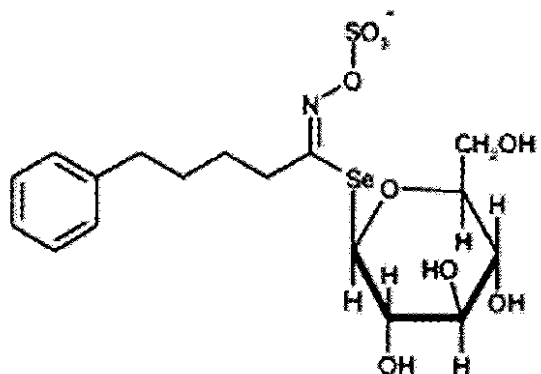
【請求項 8】

前記セツキシマブ及び I S C - 4 プロドラッグが別個の医薬製剤として提供される、請求項 3 又は 4 の市販用セット。

【請求項 9】

以下の構造式：

【化 3】



を有する I S C - 4 のグルコシノラートプロドラッグ又はその薬学的に許容される塩を含む組成物。

【請求項 10】

セツキシマブと I S C - 4 の組合せを複合製剤として又は別個に投与することを含む、がん治療を必要とする被験体のがんを治療する治療剤。

【請求項 1 1】

前記組合せの投与が相乗効果を提供する、請求項 1 0 の治療剤。

【請求項 1 2】

前記がんが、野生型 K R A S を特徴とする、請求項 1 0 又は 1 1 のがんを治療する治療剤。

【請求項 1 3】

前記がんが、野生型 K R A S を特徴とする大腸がんである、請求項 1 0 ~ 1 2 のいずれか1項に記載のがんを治療する治療剤。

【請求項 1 4】

更に、セツキシマブと I S C - 4 の前記組合せを投与する前に前記被験体からがん細胞を含有する又は含有する疑いのある第 1 の試料を得ること；

セツキシマブと I S C - 4 の前記組合せを投与した後に前記被験体からがん細胞を含有する又は含有する疑いのある第 2 の試料を得ること；及び

アポトーシスの 1 種以上のマーカーについて前記第 1 及び第 2 の試料を分析し、それによってセツキシマブと I S C - 4 の前記組合せを投与することの有効性を監視する、請求項 1 0 ~ 1 3 のいずれか1項に記載のがんを治療する治療剤。

【請求項 1 5】

更に、セツキシマブと I S C - 4 の前記組合せを投与する前に前記被験体からがん細胞を含有する又は含有する疑いのある第 1 の試料を得ること；

セツキシマブと I S C - 4 の前記組合せを投与した後に前記被験体からがん細胞を含有する又は含有する疑いのある第 2 の試料を得ること；及び

リン酸化 A k t について前記第 1 及び第 2 の試料を分析し、それによってセツキシマブと I S C - 4 の前記組合せを投与することの有効性を監視する、請求項 1 0 ~ 1 4 のいずれか1項に記載のがんを治療する治療剤。

【請求項 1 6】

前記セツキシマブと I S C - 4 を同時に投与する、請求項 1 0 ~ 1 5 いずれか1項に記載のがんを治療する治療剤。

【請求項 1 7】

前記セツキシマブと I S C - 4 を逐次的に投与する、請求項 1 0 ~ 1 5 のいずれか1項に記載のがんを治療する治療剤。

【請求項 1 8】

前記セツキシマブと I S C - 4 を、1 時間、2 時間、4 時間、8 時間、1 2 時間、及び 2 4 時間から選択される時間内で逐次的に投与する、請求項 1 0 ~ 1 5 及び 1 7 のいずれか1項に記載のがんを治療する治療剤。

【請求項 1 9】

セツキシマブと I S C - 4 プロドラッグの組合せを複合製剤として又は別個に投与することを含む、がん治療を必要とする被験体のがんを治療する治療剤。

【請求項 2 0】

前記組合せの投与が相乗効果を提供する、請求項 1 9 のがんを治療する治療剤。

【請求項 2 1】

前記がんが野生型 K R A S を特徴とする、請求項 1 9 又は 2 0 のいずれか1項に記載のがんを治療する治療剤。

【請求項 2 2】

前記がんが野生型 K R A S を特徴とする大腸がんである、請求項 1 9 ~ 2 1 のいずれか1項に記載のがんを治療する治療剤。

【請求項 2 3】

更に、セツキシマブと I S C - 4 プロドラッグの前記組合せを投与する前に前記被験体からがん細胞を含有する又は含有する疑いのある第 1 の試料を得ること；

セツキシマブとISC-4プロドラッグの前記組合せを投与した後に前記被験体からがん細胞を含有する又は含有する疑いのある第2の試料を得ること；及び

アポトーシスの1種以上のマーカーについて前記第1及び第2の試料を分析し、それによってセツキシマブとISC-4プロドラッグの前記組合せを投与することの有効性を監視する、請求項19～22のいずれか1項に記載のがんを治療する治療剤。

【請求項24】

更に、セツキシマブとISC-4プロドラッグの前記組合せを投与する前に前記被験体からがん細胞を含有する又は含有する疑いのある第1の試料を得ること；

セツキシマブとISC-4プロドラッグの前記組合せを投与した後に前記被験体からがん細胞を含有する又は含有する疑いのある第2の試料を得ること；及び

リン酸化Aktについて前記第1及び第2の試料を分析し、それによってセツキシマブとISC-4プロドラッグの前記組合せを投与することの有効性を監視する、請求項19～23のいずれか1項に記載のがんを治療する治療剤。

【請求項25】

前記セツキシマブとISC-4プロドラッグを同時に投与する、請求項19～24いずれか1項に記載のがんを治療する治療剤。

【請求項26】

前記セツキシマブとISC-4プロドラッグを逐次的に投与する、請求項19～24のいずれか1項に記載のがんを治療する治療剤。

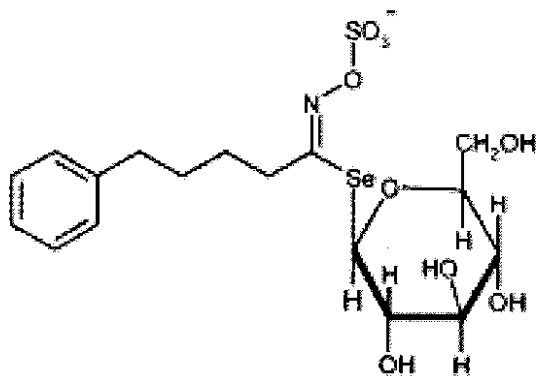
【請求項27】

前記セツキシマブとISC-4プロドラッグを、1時間、2時間、4時間、8時間、12時間、及び24時間から選択される時間内で逐次的に投与する、請求項19～24及び26のいずれか1項に記載のがんを治療する治療剤。

【請求項28】

前記ISC-4プロドラッグが、以下の構造式：

【化4】



を有するISC-4のグルコシノラートプロドラッグ又はその薬学的に許容される塩である、請求項19～27のいずれか1項に記載のがんを治療する治療剤。

【請求項29】

前記がんが5-フルオロウラシルに抵抗性である、請求項10～28のいずれか1項に記載のがんを治療する治療剤。

【請求項30】

前記がんが、5-フルオロウラシルに抵抗性であり、かつ野生型KRASを特徴とする、請求項10～29のいずれのがんを治療する治療剤。

【請求項31】

前記がんが、5-フルオロウラシルに抵抗性であり、かつ前記野生型KRASがヒトKRASを基準として、コドン12、13又は61に活性化KRAS変異を有さない野生型KRASを特徴とする、請求項10～30のいずれのがんを治療する治療剤。

【請求項32】

前記がんが、５ - フルオロウラシルに抵抗性であり、かつ前記野生型 K R A S がヒト K R A S を基準として、活性化 K R A S 変異 Q 6 1 H、G 1 2 S、G 1 2 V、G 1 2 A 又は G 1 3 D を有さない野生型 K R A S を特徴とする、請求項 1 0 ～ 3 1 のいずれのがんを治療する治療剤。

【請求項 3 3】

がんの治療に使用される

セツキシマブ及び I S C - 4、又は

セツキシマブ及び I S C - 4 プロドラッグ。

【請求項 3 4】

医薬として使用するための

セツキシマブ及び I S C - 4、又は

セツキシマブ及び I S C - 4 プロドラッグ、の組合せ。