

【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ISC-4；又は

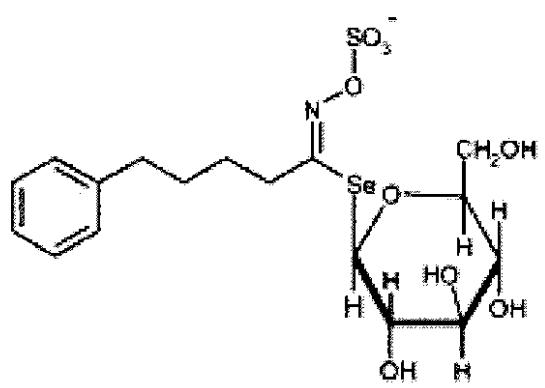
セツキシマブ及びISC-4プロドラッグ

を含む組成物。

【請求項2】

前記ISC-4プロドラッグが、以下の構造式：

【化1】



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。

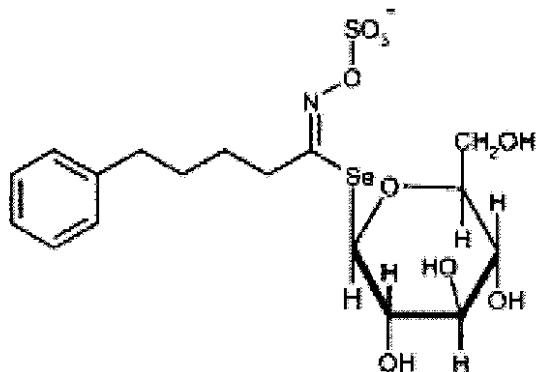
【請求項 3】

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。

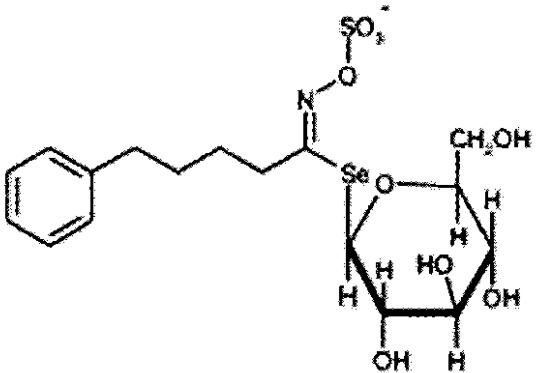
【請求項 8】

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、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 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 I S C - 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 I S C - 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 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 I S C - 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 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 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 I S C - 4 プロドラッグを同時に投与する、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 26】

前記セツキシマブと I S C - 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。

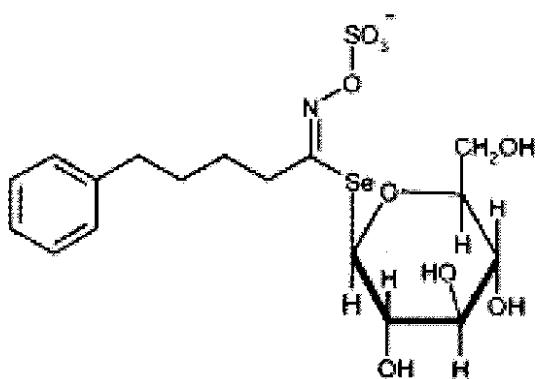
【請求項 27】

前記セツキシマブと I S C - 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 I S C - 4 プロドラッグが、以下の構造式：

【化 4】



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 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 K R A S 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 K R A S がヒト K R A S を基準として、コドン 12、13 又は 61 に活性化 K R A S 変異を有さない野生型 K R A S 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10～31のいずれのがんを治療する治療剤。

【請求項33】

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34】

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。