

【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12月13日(2018.12.13)

【公表番号】特表2017-535601(P2017-535601A)

【公表日】平成29年11月30日(2017.11.30)

【年通号数】公開・登録公報2017-046

【出願番号】特願2017-543329(P2017-543329)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/5377	(2006.01)
A 6 1 P	35/04	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 K	31/44	(2006.01)
A 6 1 K	31/4178	(2006.01)
A 6 1 K	31/439	(2006.01)
A 6 1 K	31/404	(2006.01)
A 6 1 K	31/519	(2006.01)
A 6 1 K	39/395	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
C 07 K	16/32	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 P	35/04	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	43/00	1 2 1
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 K	31/44	
A 6 1 K	31/4178	
A 6 1 K	31/439	
A 6 1 K	31/404	
A 6 1 K	31/519	
A 6 1 K	39/395	T
A 6 1 P	13/12	
C 07 K	16/32	

【手続補正書】

【提出日】平成30年11月5日(2018.11.5)

【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】

療法有効量のアピリモド、またはその医薬的に許容できる塩を含む組成物であって、腎癌を伴う対象において腎癌を処置する方法における使用のための前記組成物。

【請求項2】

アピリモドがアピリモド・ジメシレートである、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

前記方法が、さらに、少なくとも 1 種類の追加の有効薬剤を投与することを含む、請求項 1 または 2 に記載の組成物であって、

少なくとも 1 種類の追加の有効薬剤が、療法剤もしくは非療法剤、または療法剤と非療法剤の組合せであってもよい、前記組成物。

【請求項 4】

少なくとも 1 種類の追加の有効薬剤が、プロテインキナーゼ阻害剤、P D - 1 / P D - L 1 経路阻害剤、チェックポイント阻害剤、白金ベースの抗新生物剤、トポイソメラーゼ阻害剤、ヌクレオシド代謝阻害剤、アルキル化剤、インターフェラート剤、チューブリン結合剤、およびその組合せからなる群から選択される療法剤である、請求項 3 に記載の組成物。

【請求項 5】

療法剤がプロテインキナーゼ阻害剤である、請求項 4 に記載の組成物であって、

プロテインキナーゼ阻害剤が、パゾパニブもしくはソラフェニブまたはその組合せであってもよい、前記組成物。

【請求項 6】

療法剤が P D - 1 / P D - L 1 経路阻害剤である、請求項 4 に記載の組成物であって、療法剤が、ベンプロリズマブ (Keytruda (商標))、アベルマブ、アテゾリズマブ (MPDL3280A)、ニボルマブ (BMS-936558)、ピジリズマブ (MK-3475)、MSB0010718C、およびMEDI4736 から選択されてもよい、前記組成物。

【請求項 7】

前記方法が、さらに、アピリモドの 1 以上の副作用を改善するために選択された非療法剤を投与することを含む、請求項 2 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 8】

少なくとも 1 種類の追加の有効薬剤が非療法剤である、請求項 3 に記載の組成物。

【請求項 9】

非療法剤が、

a) オンダンセトロン、グラニセトロン、ドルセトロンおよびパロノセトロンからなる群から選択されるか、又は

b) ピンドロールおよびリスペリドンからなる群から選択される、

請求項 7 または 8 に記載の組成物。

【請求項 10】

アピリモド又はアピリモド・ジメシレートの療法有効量が、対象の癌細胞における PI Kfyve キナーゼ活性を阻害するのに有効な量である、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 11】

腎癌が標準治療に対して難治性であるかまたは転移性である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 12】

腎癌が、透明細胞腎癌、移行上皮癌、ウィルムス腫瘍（腎芽細胞腫）、腎肉腫、および良性（非癌性）腎腫瘍、腎腺癌、膨大細胞腫、および血管筋脂肪腫から選択される、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 13】

組成物が経口または静脈内投与に適した形態である、請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 14】

腎癌細胞の増殖を阻害するための方法において使用するための、アピリモド又はその医薬的に許容できる塩を含む組成物であって、当該方法が、癌細胞をその細胞の増殖を阻害

するのに有効な量のアピリモドまたはその医薬的に許容できる塩と接触させることを含む、前記組成物。

【請求項 1 5】

腎癌細胞の生存を阻害するための方法において使用するための、アピリモド又はその医薬的に許容できる塩を含む組成物であって、当該方法が、癌細胞をその癌細胞におけるPIKfyveキナーゼ活性を阻害するのに有効な量のアピリモドまたはその医薬的に許容できる塩と接触させることを含む、前記組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0149

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0149】

【表 6】

表 6: 相乗性試験のまとめ

	RCC-ER	RCC-FG2	RCC-MF	769-P
パゾパニブ +LAM-002	相乗的	相乗的	相乗的	相乗的
ソラフェニブ +LAM-002	相乗的	相乗的	相乗的	相乗的

以下に、出願時の特許請求の範囲の記載を示す。

[請求項 1]

腎癌を伴う対象において腎癌を処置するための組成物であって、療法有効量のアピリモド、またはその医薬的に許容できる塩を含む、前記組成物。

[請求項 2]

アピリモドがアピリモド・ジメシレートである、請求項 1 に記載の組成物。

[請求項 3]

さらに、少なくとも 1 種類の追加の有効薬剤を含む、請求項 1 または 2 に記載の組成物。

[請求項 4]

少なくとも 1 種類の追加の有効薬剤が、療法剤もしくは非療法剤、または療法剤と非療法剤の組合せである、請求項 3 に記載の組成物。

[請求項 5]

少なくとも 1 種類の追加の有効薬剤が、プロテインキナーゼ阻害剤、PD-1 / PD-L1 経路阻害剤、チェックポイント阻害剤、白金ベースの抗新生物剤、トポイソメラーゼ阻害剤、ヌクレオシド代謝阻害剤、アルキル化剤、インターフェロン剤、チューブリン結合剤、およびその組合せからなる群から選択される療法剤である、請求項 4 に記載の組成物。

[請求項 6]

療法剤がプロテインキナーゼ阻害剤である、請求項 5 に記載の組成物。

[請求項 7]

プロテインキナーゼ阻害剤が、パゾパニブもしくはソラフェニブまたはその組合せである、請求項 6 に記載の組成物。

[請求項 8]

療法剤が P D - 1 / P D - L 1 経路阻害剤である、請求項 5 に記載の組成物。

[請求項 9]

療法剤が、ペンプロリズマブ (Keytruda (商標))、アベルマブ、アテゾリズマブ (MPDL3280A)、ニボルマブ (BMS-936558)、ピジリズマブ (MK-3475)、MSB0010718C、および MEDI4736 から選択される、請求項 8 に記載の組成物。

[請求項 10]

さらに、アピリモドの 1 以上の副作用を改善するために選択された非療法剤を含む、請求項 2 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の組成物。

[請求項 11]

少なくとも 1 種類の追加の有効薬剤が非療法剤である、請求項 4 に記載の組成物。

[請求項 12]

非療法剤が、オンダンセトロン、グラニセトロン、ドルセトロンおよびパロノセトロンからなる群から選択される、請求項 10 または 11 に記載の組成物。

[請求項 13]

非療法剤が、ピンドロールおよびリスペリドンからなる群から選択される、請求項 10 または 11 に記載の組成物。

[請求項 14]

組成物が、対象の癌細胞における PIKfyve キナーゼ活性を阻害するのに有効な量のアピリモド・ジメシレートを含む、請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の組成物。

[請求項 15]

腎癌が標準治療に対して難治性であるかまたは転移性である、請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の組成物。

[請求項 16]

腎癌が、透明細胞腎癌、移行上皮癌、ウィルムス腫瘍（腎芽細胞腫）、腎肉腫、および良性（非癌性）腎腫瘍、腎腺癌、膨大細胞腫、および血管筋脂肪腫から選択される、請求項 1 ~ 15 のいずれか 1 項に記載の組成物。

[請求項 17]

組成物が経口または静脈内投与に適した形態である、請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の組成物。

[請求項 18]

処置の必要がある対象において腎癌を処置するための方法であって、アピリモドまたはその医薬的に許容できる塩を含む療法有効量の組成物を対象に投与することを含む、前記方法。

[請求項 19]

アピリモドがアピリモド・ジメシレートである、請求項 18 に記載の方法。

[請求項 20]

療法有効量のアピリモドが、対象の腎癌細胞における PIKfyve キナーゼ活性を阻害するのに有効な量である、請求項 18 または 19 に記載の方法。

[請求項 21]

腎癌細胞の増殖を阻害するための方法であって、癌細胞をその細胞の増殖を阻害するのに有効な量のアピリモドまたはその医薬的に許容できる塩と接触させることを含む、前記方法。

[請求項 22]

腎癌細胞の生存を阻害するための方法であって、癌細胞をその癌細胞における PIKfyve キナーゼ活性を阻害するのに有効な量のアピリモドまたはその医薬的に許容できる塩と接触させることを含む、前記方法。