

【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28年10月20日 (2016.10.20)

【公表番号】特表2015-530387(P2015-530387A)

【公表日】平成27年10月15日 (2015.10.15)

【年通号数】公開・登録公報2015-064

【出願番号】特願2015-530149(P2015-530149)

【国際特許分類】

A 6 1 K 33/24 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/04 (2006.01)

A 6 1 K 9/127 (2006.01)

A 6 1 K 9/12 (2006.01)

A 6 1 K 47/28 (2006.01)

A 6 1 K 47/24 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 33/24

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 35/04

A 6 1 K 9/127

A 6 1 K 9/12

A 6 1 K 47/28

A 6 1 K 47/24

【手続補正書】

【提出日】平成28年9月2日 (2016.9.2)

【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】

肺癌の治療を必要とする対象における肺癌を治療するための組成物であって、前記組成物が、脂質複合体化シスプラチンを含む、分散系の水相全体に分散している吸入用脂質シスプラチン（ILC）を含み、前記吸入用脂質シスプラチンが、 $18\text{ mg/m}^2 \sim 36\text{ mg/m}^2$ の用量で吸入投与されることを特徴とし、前記対象が、前記肺癌の外科的切除により肉眼的に無病であると特徴付けられている、組成物。

【請求項 2】

前記肺癌が骨肉腫の肺転移性疾患である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】

前記骨肉腫の肺転移性疾患が再発性骨肉腫である、請求項 2 に記載の組成物。

【請求項 4】

前記 ILC が、さらにリポソームを含む、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 5】

前記リポソームが、ステロールおよびホスファチジルコリンを含む、請求項 4 に記載の

組成物。

【請求項 6】

前記ステロールがコレステロールである、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 7】

前記ホスファチジルコリンが、ジパルミトイルホスファチジルコリン (DPPC) である、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 8】

前記組成物が、噴霧器により行われる吸入により投与されることを特徴とする、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 9】

前記組成物が、36 mg / m² の用量で吸入投与されることを特徴とする、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 10】

前記組成物が、少なくとも 24 mg / m² の用量で吸入投与されることを特徴とする、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 11】

前記組成物が、少なくとも 18 mg / m² の用量で吸入投与されることを特徴とする、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 12】

前記分散系が 1 μm 以下の粒径を有する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 13】

前記組成物が、20 分間、0.3 mL / 分の速度で吸入投与されることを特徴とする、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 14】

前記組成物が、14 日ごとに 1 日あたり 1 ~ 4 回吸入投与されることを特徴とする、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 15】

前記対象が、以前に、全身化学療法と原発性骨肉腫の外科的切除とを組み合わせた治療を受けている、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 16】

前記対象が、巨視的な肺転移の外科的切除を受けている、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 17】

前記巨視的肺転移が最初の肺再発である、請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 18】

前記巨視的肺転移が肺癌の肺再発である、請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 19】

前記肺再発が、2 回目以降の肺再発である、請求項 18 に記載の組成物。

【請求項 20】

さらに、無病の対照と比較するバイオマーカー測定によって、骨肉腫の再発が検出されている、請求項 3 に記載の組成物。

【請求項 21】

前記バイオマーカーが、体循環に見られるバイオマーカーである、請求項 20 に記載の組成物。

【請求項 22】

前記全身性バイオマーカーが、マイクロRNA - 21 (miRNA - 21)、マイクロRNA - 199a - 3p (miRNA - 199a - 3p)、マイクロRNA - 143 (miRNA - 143)、分化分子 117 のクラスター (CD117)、Stro - 1、骨特異的アルカリホスファターゼ (BALP)、乳酸脱水素酵素 (LDH)、およびコンドロイチン硫酸エピトープ WF6 (WF6) からなる群から選択される、請求項 21 に記載の組成物。

【請求項 23】

前記肺癌が、非小細胞肺癌（NSCLC）である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 24】

前記 NSCLC が細気管支肺胞癌（BAC）である、請求項 23 に記載の組成物。

【請求項 25】

巨視的肺転移がなく、原発性骨肉腫を患っている対象における骨肉腫の顕微鏡レベルでの肺転移性疾患を治療するための組成物であって、

前記組成物が、脂質複合体化シスプラチンを含む、分散系の水相全体に分散している吸入用脂質シスプラチン（ILC）を含み、前記吸入用脂質シスプラチンが、 18 mg/m^2 ~ 36 mg/m^2 の用量で吸入投与されることを特徴とし、

前記対象が、組み合わせた全身化学療法の治療の有無にかかわらず、前記原発性骨肉腫の外科的切除により肉眼的に無病であると特徴づけられている、組成物。

【請求項 26】

前記 ILC が、さらにリボソームを含む、請求項 25 に記載の組成物。

【請求項 27】

前記リボソームが、ステロールおよびホスファチジルコリンを含む、請求項 26 に記載の組成物。

【請求項 28】

前記ステロールがコレステロールである、請求項 27 に記載の組成物。

【請求項 29】

前記ホスファチジルコリンが、ジパルミトイルホスファチジルコリン（DPPC）である、請求項 27 に記載の組成物。

【請求項 30】

前記組成物が噴霧器により行われる吸入により投与されることを特徴とする、請求項 25 に記載の組成物。

【請求項 31】

前記組成物が、 36 mg/m^2 の用量で吸入投与されることを特徴とする、請求項 25 に記載の組成物。

【請求項 32】

前記組成物が、少なくとも 24 mg/m^2 の用量で吸入投与されることを特徴とする、請求項 25 に記載の組成物。

【請求項 33】

前記組成物が、少なくとも 18 mg/m^2 の用量で吸入投与されることを特徴とする、請求項 25 に記載の組成物。

【請求項 34】

前記分散系が $1\text{ }\mu\text{m}$ 以下の粒径を有する、請求項 25 に記載の組成物。

【請求項 35】

前記組成物が、20 分間、 0.3 mL/分 の速度で吸入投与されることを特徴とする、請求項 25 に記載の組成物。

【請求項 36】

前記組成物が、14 日ごとに 1 日あたり 1 ~ 4 回吸入投与されることを特徴とする、請求項 25 に記載の組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0240

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0240】

本発明は、肺癌を治療するのに有用な方法および組成物を提供する。

本発明は、例えば、以下の項目も提供する。

(項目1)

それを必要とする対象における肺癌を治療するための方法であって、

(1) 前記対象が肉眼的に無病であると特徴付けられるように、前記肺癌を外科的に切除することと、

(2) 脂質複合体化シスプラチンを含み、分散系の水相全体に分散している吸入用脂質シスプラチン (ILC) を $18 \text{ mg} / \text{m}^2 \sim 36 \text{ mg} / \text{m}^2$ の用量で吸入投与することと、を含む方法。

(項目2)

前記肺癌が骨肉腫の肺転移性疾患である、項目1に記載の方法。

(項目3)

前記骨肉腫の肺転移性疾患が再発性骨肉腫である、項目2に記載の方法。

(項目4)

前記 ILC が、さらにリボソームを含む、項目1に記載の方法。

(項目5)

前記リボソームが、ステロールおよびホスファチジルコリンを含む、項目4に記載の方法。

(項目6)

前記ステロールがコレステロールである、項目5に記載の方法。

(項目7)

前記ホスファチジルコリンが、ジパルミトイルホスファチジルコリン (DPPC) である、項目5に記載の方法。

(項目8)

前記吸入投与が噴霧器により行われる、項目1に記載の方法。

(項目9)

前記吸入投与が $36 \text{ mg} / \text{m}^2$ の用量での投与である、項目1に記載の方法。

(項目10)

前記吸入投与が、少なくとも $24 \text{ mg} / \text{m}^2$ の用量での投与である、項目1に記載の方法。

(項目11)

前記吸入投与が、少なくとも $18 \text{ mg} / \text{m}^2$ の用量での投与である、項目1に記載の方法。

(項目12)

前記分散系が $1 \mu\text{m}$ 以下の粒径を有する、項目1に記載の方法。

(項目13)

前記吸入投与が、20分間、 $0.3 \text{ mL} / \text{分}$ の速度で行われる、項目1に記載の方法。

(項目14)

前記吸入投与が、14日ごとに1日あたり1～4回行われる、項目1に記載の方法。

(項目15)

前記対象が、以前に、全身化学療法と原発性骨肉腫の外科的切除とを組み合わせた治療を受けている、項目1に記載の方法。

(項目16)

前記対象が、巨視的な肺転移の外科的切除を受けている、項目1に記載の方法。

(項目17)

前記巨視的肺転移が最初の肺再発である、項目16に記載の方法。

(項目18)

前記巨視的肺転移が肺癌の肺再発である、項目16に記載の方法。

(項目19)

前記肺再発が、2回目以降の肺再発である、項目18に記載の方法。

(項目 2 0)

さらに、無病の対照と比較するバイオマーカー測定によって、骨肉腫の再発を検出することを含む、項目 3 に記載の方法。

(項目 2 1)

前記バイオマーカーが、体循環に見られるバイオマーカーである、項目 2 0 に記載の方法。

(項目 2 2)

前記全身性バイオマーカーが、マイクロRNA - 21 (miRNA - 21)、マイクロRNA - 199a - 3p (miRNA - 199a - 3p)、マイクロRNA - 143 (miRNA - 143)、分化分子 117 のクラスター (CD117)、Stro-1、骨特異的アルカリホスファターゼ (BALP)、乳酸脱水素酵素 (LDH)、およびコンドロイチン硫酸エピトープ WF6 (WF6) からなる群から選択される、項目 2 1 に記載の方法。

(項目 2 3)

前記肺癌が、非小細胞肺癌 (NSCLC) である、項目 1 に記載の方法。

(項目 2 4)

前記 NSCLC が細気管支肺胞癌 (BAC) である、項目 2 3 に記載の方法。

(項目 2 5)

巨視的肺転移がなく、原発性骨肉腫を患っている対象における骨肉腫の顕微鏡レベルでの肺転移性疾患を治療するための方法であって、

(1) 前記対象が肉眼的に無病であると特徴づけられるように、組み合わせた全身化学療法の治療の有無にかかわらず、前記原発性骨肉腫を外科的に切除することと、

(2) 脂質複合体化シスプラチンを含み、分散系の水相全体に分散している吸入用脂質シスプラチン (ILC) を $18 \text{ mg} / \text{m}^2 \sim 36 \text{ mg} / \text{m}^2$ の用量で吸入投与することと、を含む方法。

(項目 2 6)

前記 ILC が、さらにリボソームを含む、項目 2 5 に記載の方法。

(項目 2 7)

前記リボソームが、ステロールおよびホスファチジルコリンを含む、項目 2 6 に記載の方法。

(項目 2 8)

前記ステロールがコレステロールである、項目 2 7 に記載の方法。

(項目 2 9)

前記ホスファチジルコリンが、ジパルミトイルホスファチジルコリン (DPPC) である、項目 2 7 に記載の方法。

(項目 3 0)

前記吸入投与が噴霧器により行われる、項目 2 5 に記載の方法。

(項目 3 1)

前記吸入投与が $36 \text{ mg} / \text{m}^2$ の用量での投与である、項目 2 5 に記載の方法。

(項目 3 2)

前記吸入投与が、少なくとも $24 \text{ mg} / \text{m}^2$ の用量での投与である、項目 2 5 に記載の方法。

(項目 3 3)

前記吸入投与が、少なくとも $18 \text{ mg} / \text{m}^2$ の用量での投与である、項目 2 5 に記載の方法。

(項目 3 4)

前記分散系が $1 \mu \text{m}$ 以下の粒径を有する、項目 2 5 に記載の方法。

(項目 3 5)

前記吸入投与が、20 分間、 $0.3 \text{ mL} / \text{分}$ の速度で行われる、項目 2 5 に記載の方法。

(項目 3 6)

前記吸入投与が、14日ごとに1日あたり1～4回行われる、項目25に記載の方法。

(項目 3 7)

その必要のある対象における肺癌を治療するための治療量の吸入用脂質シスプラチン (I L C) の使用であって、

(1) 前記対象が肉眼的に無病であると特徴づけられるように、前記肺癌を外科的に切除することと、

(2) 脂質複合体化シスプラチンを含み、分散系の水相全体に分散している I L C を $18 \text{ mg} / \text{m}^2 \sim 36 \text{ mg} / \text{m}^2$ の用量で吸入投与することと、
を含む使用。

(項目 3 8)

前記肺癌が骨肉腫の肺転移性疾患である、項目37に記載の使用。

(項目 3 9)

前記骨肉腫の肺転移性疾患が再発性骨肉腫である、項目38に記載の使用。

(項目 4 0)

前記 I L C が、さらにリポソームを含む、項目37に記載の使用。

(項目 4 1)

前記リポソームが、ステロールおよびホスファチジルコリンを含む、項目40に記載の使用。

(項目 4 2)

前記ステロールがコレステロールである、項目41に記載の使用。

(項目 4 3)

前記ホスファチジルコリンが、ジパルミトイルホスファチジルコリン (D P P C) である、項目41に記載の使用。

(項目 4 4)

前記吸入投与が噴霧器により行われる、項目37に記載の使用。

(項目 4 5)

前記吸入投与が $36 \text{ mg} / \text{m}^2$ の用量での投与である、項目37に記載の使用。

(項目 4 6)

前記吸入投与が、少なくとも $24 \text{ mg} / \text{m}^2$ の用量での投与である、項目37に記載の使用。

(項目 4 7)

前記吸入投与が、少なくとも $18 \text{ mg} / \text{m}^2$ の用量での投与である、項目37に記載の使用。

(項目 4 8)

前記分散系が $1 \mu \text{m}$ 以下の粒径を有する、項目37に記載の使用。

(項目 4 9)

前記吸入投与が、20分間、 $0.3 \text{ mL} / \text{分}$ の速度で行われる、項目37に記載の使用。

(項目 5 0)

前記吸入投与が、14日ごとに1日あたり1～4回行われる、項目37に記載の使用。

(項目 5 1)

前記対象が、以前に、全身化学療法と原発性骨肉腫の外科的切除とを組み合わせた治療を受けている、項目37に記載の使用。

(項目 5 2)

前記対象が、巨視的な肺転移の外科的切除を受けている、項目37に記載の使用。

(項目 5 3)

前記巨視的肺転移が最初の肺再発である、項目52に記載の使用。

(項目 5 4)

前記巨視的肺転移が肺癌の肺再発である、項目52に記載の使用。

(項目 5 5)

前記肺再発が、2 回目以降の肺再発である、項目 5 4 に記載の使用。

(項目 5 6)

さらに、無病の対照と比較するバイオマーカー測定によって、前記骨肉腫の再発を検出することを含む、項目 3 9 に記載の使用。

(項目 5 7)

前記バイオマーカーが、体循環に見られるバイオマーカーである、項目 5 6 に記載の使用。

(項目 5 8)

前記全身性バイオマーカーが、マイクロRNA - 21 (miRNA - 21)、マイクロRNA - 199 a - 3 p (miRNA - 199 a - 3 p)、マイクロRNA - 143 (miRNA - 143)、分化分子 117 のクラスター (CD117)、Stro - 1、骨特異的アルカリホスファターゼ (BALP)、乳酸脱水素酵素 (LDH)、およびコンドロイチン硫酸エピトープ WF6 (WF6) からなる群から選択される、項目 5 7 に記載の使用。

(項目 5 9)

前記肺癌が、非小細胞肺癌 (NSCLC) である、項目 3 7 に記載の使用。

(項目 6 0)

前記 NSCLC が細気管支肺胞癌 (BAC) である、項目 5 9 に記載の使用。

(項目 6 1)

巨視的肺転移がなく、原発性骨肉腫を患っている対象における骨肉腫の顕微鏡レベルでの肺転移性疾患を治療するための治療量の吸入用脂質シスプラチン (ILC) の使用であって、

(1) 前記対象が肉眼的に無病であると特徴づけられるように、組み合わせた全身化学療法の治療の有無にかかわらず、前記原発性骨肉腫を外科的に切除することと、

(2) 脂質複合体化シスプラチンを含み、分散系の水相全体に分散している ILC を $18 \text{ mg} / \text{m}^2 \sim 36 \text{ mg} / \text{m}^2$ の用量で吸入投与することと、

を含む使用。

(項目 6 2)

前記 ILC が、さらにリポソームを含む、項目 6 1 に記載の使用。

(項目 6 3)

前記リポソームが、ステロールおよびホスファチジルコリンを含む、項目 6 2 に記載の使用。

(項目 6 4)

前記ステロールがコレステロールである、項目 6 3 に記載の使用。

(項目 6 5)

前記ホスファチジルコリンが、ジパルミトイルホスファチジルコリン (DPPC) である、項目 6 3 に記載の使用。

(項目 6 6)

前記吸入投与が噴霧器により行われる、項目 6 1 に記載の使用。

(項目 6 7)

前記吸入投与が $36 \text{ mg} / \text{m}^2$ の用量での投与である、項目 6 1 に記載の使用。

(項目 6 8)

前記吸入投与が、少なくとも $24 \text{ mg} / \text{m}^2$ の用量での投与である、項目 6 1 に記載の使用。

(項目 6 9)

前記吸入投与が、少なくとも $18 \text{ mg} / \text{m}^2$ の用量での投与である、項目 6 1 に記載の使用。

(項目 7 0)

前記分散系が $1 \mu \text{m}$ 以下の粒径を有する、項目 6 1 に記載の使用。

(項目 7 1)

前記吸入投与が、20分間、0.3mL / 分の速度で行われる、項目61に記載の使用

°

(項目 7 2)

前記吸入投与が、14日ごとに1日あたり1～4回行われる、項目61に記載の使用。