

【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17年12月22日(2005.12.22)

【公表番号】特表2005-509663(P2005-509663A)

【公表日】平成17年4月14日(2005.4.14)

【年通号数】公開・登録公報2005-015

【出願番号】特願2003-545313(P2003-545313)

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 31/7072

A 6 1 P 35/00

C 0 7 D 403/14

【F I】

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 31/7072

A 6 1 P 35/00

C 0 7 D 403/14

【手続補正書】

【提出日】平成16年7月5日(2004.7.5)

【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

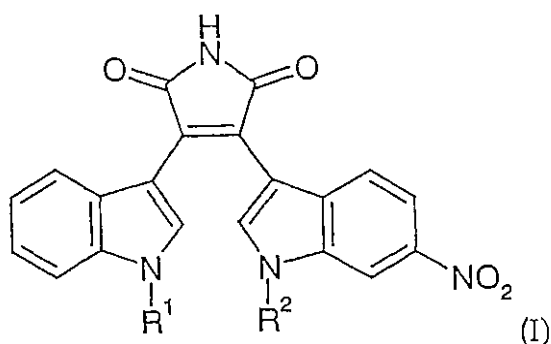
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

a) 下記式(I)：

【化1】



[式中、 R^1 は、 $-H$ 、 $-CH_3$ 及び $-CH_2OH$ から成る群から選択され、そして R^2 は $-CH_3$ である]
で表される化合物、又は医薬的に許容できるその塩もしくはエステルを含んで成る医薬組成物からなる成分；及び

b) 活性成分として、ゲムシタビン (gemcitabine) を含んで成る医薬組成物から成る成分；

ここで、式Iの化合物を含んで成る医薬組成物から成る成分は21～28日の処理期間にわたって約 $780\text{mg}/\text{m}^2$ ～約 $3000\text{mg}/\text{m}^2$ の合計量で投与され、そして活性成分としてゲムシ

タピンを含んで成る医薬組成物から成る成分は21～28日の処理期間にわたって約1200mg / m²～約3600mg / m²の合計量で投与される、

を活性成分として含んで成る医薬組合せの、癌の処理のための薬剤の調製のためへの使用。

【請求項2】

前記両化合物が、同時に投与される請求項1記載の使用。

【請求項3】

前記両化合物が、連続的に投与される請求項1記載の使用。

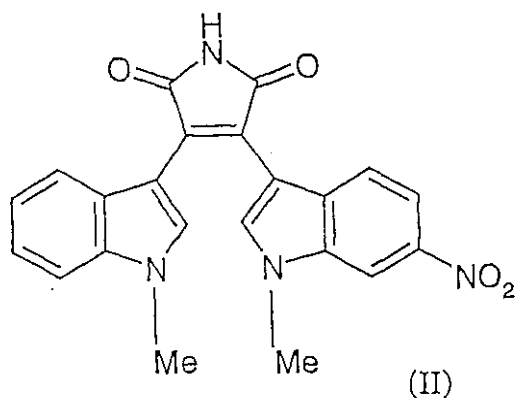
【請求項4】

式Iの化合物を含んで成る医薬組成物から成る成分が、経口単位用量形である請求項1～3のいずれか1項記載の使用。

【請求項5】

前記式Iの化合物が、下記式：

【化2】

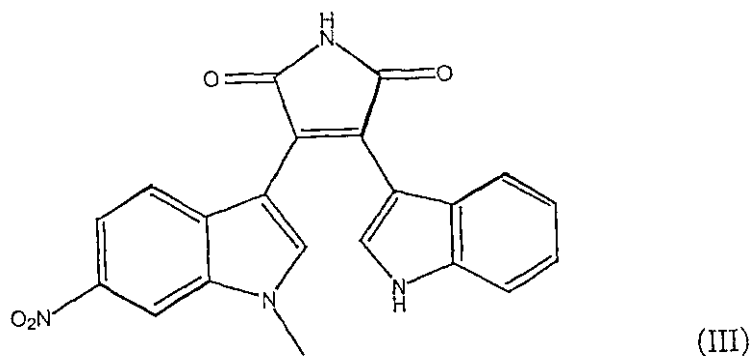


で表される化合物、又は医薬的に許容できるその塩もしくはエステルである請求項1～4のいずれか1項記載の使用。

【請求項6】

前記式Iの化合物が、下記式：

【化3】

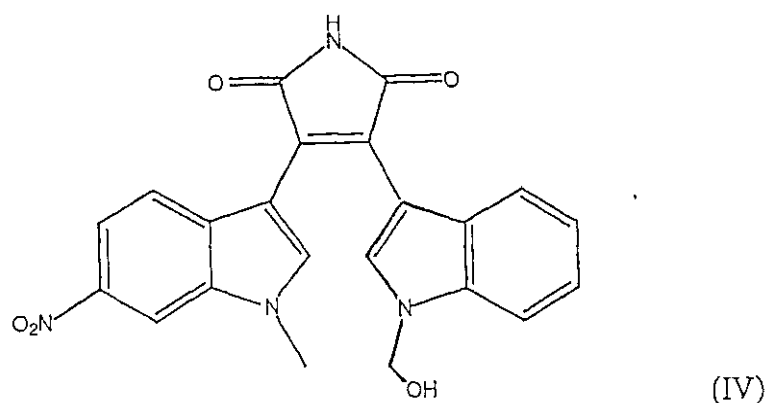


で表される化合物、又は医薬的に許容できるその塩もしくはエステルである請求項1～4のいずれか1項記載の使用。

【請求項7】

前記式Iの化合物が、下記式：

【化 4】



で表される化合物、又は医薬的に許容できるその塩もしくはエステルである請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項記載の使用。

【請求項 8】

前記式 I の化合物の量が、約 14 日までの期間にわたって投与される約 $1040\text{mg}/\text{m}^2$ ~ 約 $3000\text{mg}/\text{m}^2$ である請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項記載の使用。

【請求項 9】

前記式 I の化合物の量が、約 $1480\text{mg}/\text{m}^2$ ~ 約 $2360\text{mg}/\text{m}^2$ である請求項 8 記載の使用。

【請求項 10】

前記式 I の化合物の量が、約 7 日の期間にわたって約 $1040\text{mg}/\text{m}^2$ ~ 約 $3000\text{mg}/\text{m}^2$ である請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項記載の使用。

【請求項 11】

前記式 I の化合物の量が、約 $1480\text{mg}/\text{m}^2$ ~ 約 $2360\text{mg}/\text{m}^2$ である請求項 10 記載の使用。

【請求項 12】

前記式 I の化合物の量が、約 4 日の期間にわたって約 $780\text{mg}/\text{m}^2$ ~ 約 $2250\text{mg}/\text{m}^2$ である請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項記載の使用。

【請求項 13】

前記式 I の化合物の量が、約 4 日の期間にわたって約 $1110\text{mg}/\text{m}^2$ ~ 約 $1770\text{mg}/\text{m}^2$ である請求項 12 記載の使用。

【請求項 14】

前記式 I の化合物の用量強度が、約 $260\text{mg}/\text{m}^2/\text{週}$ ~ 約 $750\text{mg}/\text{m}^2/\text{週}$ である請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項記載の使用。

【請求項 15】

前記式 I の化合物の用量強度が、約 $370\text{mg}/\text{m}^2/\text{週}$ ~ 約 $590\text{mg}/\text{m}^2/\text{週}$ である請求項 14 項記載の使用。

【請求項 16】

前記ゲムシタピンの量が、約 8 日までの期間にわたって投与される約 $1200\text{mg}/\text{m}^2$ ~ 約 $2400\text{mg}/\text{m}^2$ である請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項記載の使用。

【請求項 17】

前記ゲムシタピンの量が、約 8 日までの期間にわたって投与される約 $1600\text{mg}/\text{m}^2$ ~ 約 $2000\text{mg}/\text{m}^2$ である請求項 16 記載の使用。

【請求項 18】

前記ゲムシタピンの量が、約 15 日までの期間にわたって投与される約 $1800\text{mg}/\text{m}^2$ ~ 約 $3600\text{mg}/\text{m}^2$ である請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項記載の使用。

【請求項 19】

前記ゲムシタピンの量が、約 15 日までの期間にわたって投与される約 $2400\text{mg}/\text{m}^2$ ~ 約 $3000\text{mg}/\text{m}^2$ である請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項記載の使用。

0mg/m²である請求項18記載の使用。

【請求項20】

前記ゲムシタピンが、21日の処理サイクルの1日及び8日目に投与される請求項1～6のいずれか1項記載の使用。

【請求項21】

前記ゲムシタピンの用量強度が、約460mg/m²/週～約800mg/m²/週である請求項20記載の使用。

【請求項22】

前記ゲムシタピンの用量強度が、約530mg/m²/週～約670mg/m²/週である請求項21記載の使用。

【請求項23】

前記ゲムシタピンが、21～28日の処理サイクルの1日及び8日目に投与される請求項1～6のいずれか1項記載の使用。

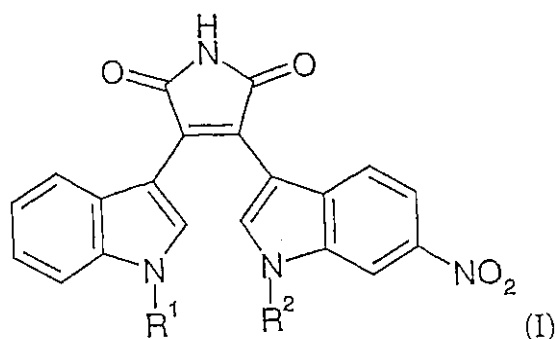
【請求項24】

前記ゲムシタピンが、28日の処理サイクルの1日、8日及び15日目に投与される請求項1～6のいずれか1項記載の使用。

【請求項25】

a) 下記式：

【化5】



[式中、R¹は、-H、-CH₃及び-CH₂OHから成る群から選択され、そしてR²は-CH₃である]
 で表される化合物、又は医薬的に許容できるその塩もしくはエステルを、活性成分として含んで成る医薬組成物から成る成分、ここで前記成分中の活性成分は、投与期間にわたって分割される約780mg/m²～約3000mg/m²の合計量で、約14日までの投与期間、経口持効性配合物として毎日、投与される；及び

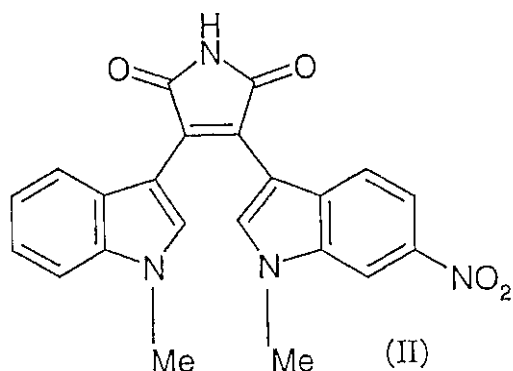
b) 活性成分として、ゲムシタピンを含んで成る医薬組成物から成る成分、ここで前記ゲムシタピンは、21～28日のサイクルの第1日目に始まって、約15日間、約1200mg/m²～約3600mg/m²の合計量で投与され、前記処理サイクルが任意には、21～28日ごとに反復される；

を含んで成る、癌、特に固形癌性腫瘍の処理のための組合せ医薬。

【請求項26】

a) 下記式；

【化 6】



で表される化合物、又は医薬的に許容できるその塩もしくはエステルを、活性成分として含んで成る医薬組成物から成る成分、ここで前記式IIの化合物は、28日サイクルの第1日目に始まって、約14日までの間、約70mg/m²/日～約220mg/m²/日の量で投与される；及び

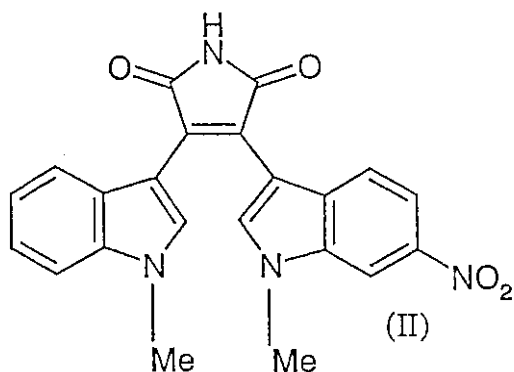
b) 任意には反復される28日サイクルの第1、8及び9日目に、約800mg/m²～約1000mg/m²の量で投与されるゲムシタピンを活性成分として含んで成る注射用溶液から成る成分；

を含んで成る、癌、特に固形癌性腫瘍の処理のための組合せ医薬。

【請求項 2 7】

a) 下記式；

【化 7】



で表される化合物、又は医薬的に許容できるその塩もしくはエステルを、活性成分として含んで成る医薬組成物から成る成分、ここで前記式IIの化合物は、28日サイクルの第1日目に始まって、約7日までの間、約200mg/m²/日～約340mg/m²/日の量で投与される；及び

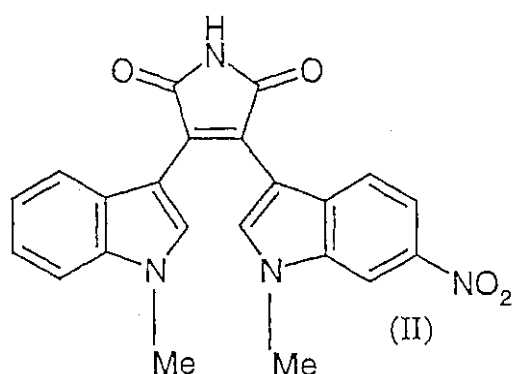
b) 任意には反復される28日サイクルの第1、及び8日目に、約600mg/m²～約1200mg/m²の量で投与されるゲムシタピンを活性成分として含んで成る注射用溶液から成る成分；

を含んで成る、癌、特に固形癌性腫瘍の処理のための組合せ医薬。

【請求項 2 8】

a) 下記式；

【化 8】



で表される化合物、又は医薬的に許容できるその塩もしくはエステルを、活性成分として含んで成る医薬組成物から成る成分、ここで前記式IIの化合物は、21日サイクルの第1日目に始まって、約4日までの間、約 $270\text{mg}/\text{m}^2/\text{日}$ ～約 $450\text{mg}/\text{m}^2/\text{日}$ の量で投与される；及び

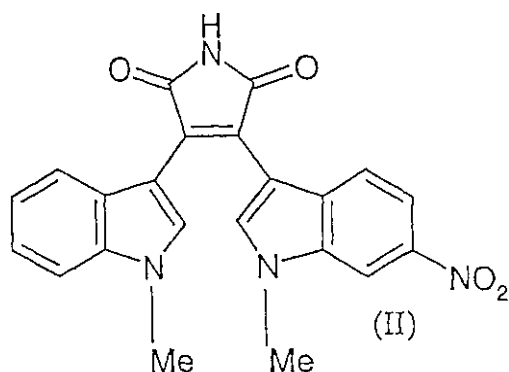
b) 任意には反復される21日サイクルの第1、及び8日目に、約 $800\text{mg}/\text{m}^2$ ～約 $1000\text{mg}/\text{m}^2$ の量で投与されるゲムシタピンを活性成分として含んで成る注射用溶液から成る成分；

を含んで成る、癌、特に固形癌性腫瘍の処理のための組合せ医薬。

【請求項 29】

a) 下記式；

【化 9】



で表される化合物、又は医薬的に許容できるその塩もしくはエステルを、活性成分として含んで成る医薬組成物から成る成分、ここで前記式IIの化合物は、21日サイクルの第1日目に始まって、約4日までの間、約 $190\text{mg}/\text{m}^2/\text{日}$ ～約 $570\text{mg}/\text{m}^2/\text{日}$ の量で投与される；及び

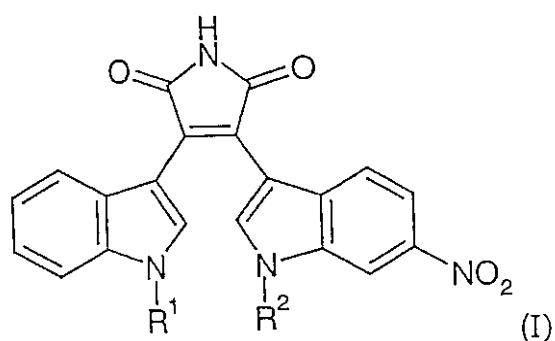
b) 任意には反復される21日サイクルの第1、及び8日目に、約 $700\text{mg}/\text{m}^2$ ～約 $1200\text{mg}/\text{m}^2$ の量で投与されるゲムシタピンを活性成分として含んで成る注射用溶液から成る成分；

を含んで成る、癌、特に固形癌性腫瘍の処理のための組合せ医薬。

【請求項 30】

a) 下記式 I ；

【化 1 0】



[式中、 R^1 は、 $-H$ 、 $-CH_3$ 及び $-CH_2OH$ から成る群から選択され、そして R^2 は $-CH_3$ である]
 で表される化合物、又は医薬的に許容できるその塩もしくはエステルから選択された化合物である活性成分約50mg～約200mgを含んで成る、活性成分の1又は複数の経口単位用量形を含んで成る成分；及び

b) 約200mg～約1mgのゲムシタピンを、活性成分として含んで成る、単一の注射用溶液用量又は複数の注射用溶液用量を含む、バイアル又は一連のバイアルを含む成分；
 を含んで成るキット。

【請求項 3 1】

a) 患者が、1日当たり約600mgの式Iの化合物、又は医薬的に許容できるその塩もしくはエステルを、約4～約14日間、投与できるよう十分な数の単位を含んで成る成分；及び

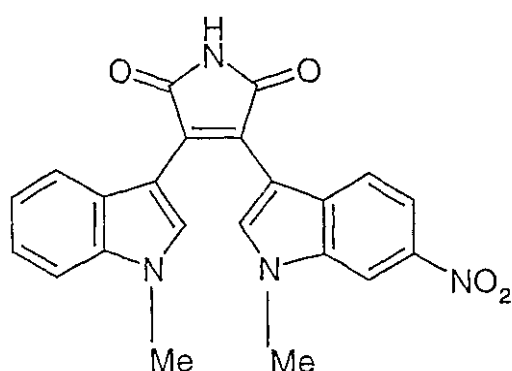
b) 患者が、1日当たり約2600mgのゲムシタピンを、約3日間、投与できるよう十分な数の用量を含んで成る成分；

を含んで成る請求項30記載のキット。

【請求項 3 2】

前記式Iから選択された活性成分が、下記式：

【化 1 1】

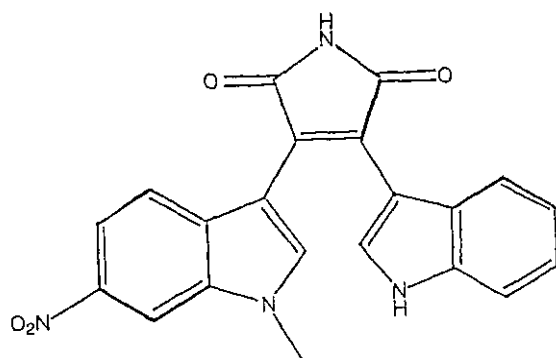


である請求項30又は31記載のキット。

【請求項 3 3】

前記式Iから選択された活性成分が、下記式：

【化 1 2】

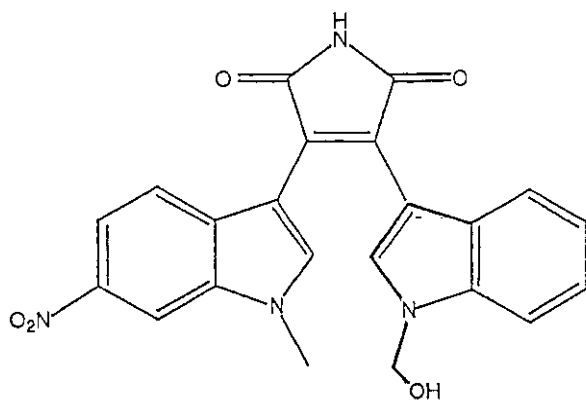


である請求項30又は31記載のキット。

【請求項 3 4】

前記式Iから選択された活性成分が、下記式：

【化 1 3】



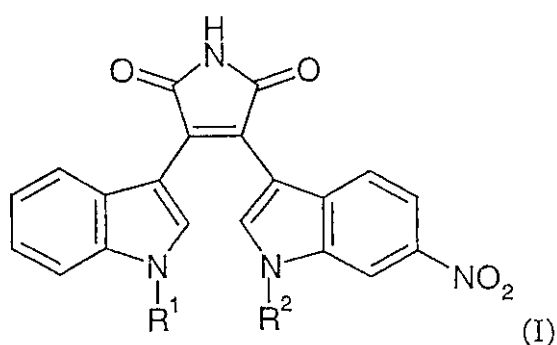
である請求項30又は31記載のキット。

【請求項 3 5】

癌、特に固形癌性腫瘍の処理のための薬剤の製造方法であって、

a) 下記式 (I)：

【化 1 4】



[式中、 R^1 は、 $-H$ 、 $-CH_3$ 及び $-CH_2OH$ から成る群から選択され、そして R^2 は $-CH_3$ である]
 で表される化合物、又は医薬的に許容できるその塩もしくはエステルを含んで成る医薬組成物からなる成分、ここで前記化合物は、21～28日の処理サイクルにわたって約780mg / m^2 ～約3000mg / m^2 の合計量で投与される；及び

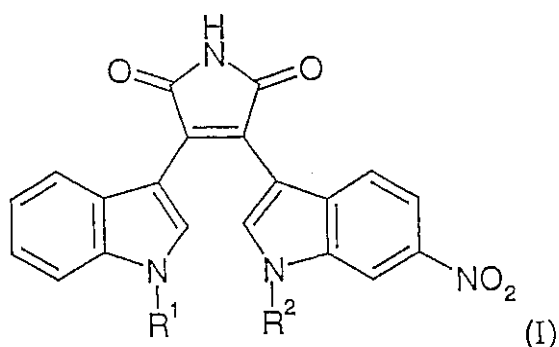
b) 活性成分として、ゲムシタピンを含んで成る医薬組成物から成る成分、ここで前記ゲムシタピンは、21～28日の処理期間にわたって約1200mg / m^2 ～約3600mg / m^2 の合計量で投与される；

を含んで成る医薬組合せが使用されることを特徴とする方法。

【請求項 3 6】

a) 下記式 (I)：

【化 1 5】



[式中、 R^1 は、 $-H$ 、 $-CH_3$ 及び $-CH_2OH$ から成る群から選択され、そして R^2 は $-CH_3$ である]
 で表される化合物、又は医薬的に許容できるその塩もしくはエステルを含んで成る医薬組成物からなる成分、ここで前記化合物は、21～28日の処理サイクルにわたって約780mg / m^2 ～約3000mg / m^2 の合計量で投与される；及び

b) 活性成分として、ゲムシタピンを含んで成る医薬組成物から成る成分、ここで前記ゲムシタピンは、21～28日の処理期間にわたって約1200mg / m^2 ～約3600mg / m^2 の合計量で投与される；

を含んで成る医薬組合せを含んで成る、癌、特に固形癌性腫瘍の処理のための医薬組成物。

【請求項 3 7】

前記医薬組合せが、放射性療法と組合して、又は他方では、もう1つの抗癌剤と一緒に存在する請求項36記載の医薬組成物。

【請求項 3 8】

上記に記載されるような新規使用、キット及び方法、及び医薬組成物。