

【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】令和6年8月30日(2024.8.30)

【国際公開番号】WO2022/047083

【公表番号】特表2023-539625(P2023-539625A)

【公表日】令和5年9月15日(2023.9.15)

【年通号数】公開公報(特許)2023-175

【出願番号】特願2023-513704(P2023-513704)

【国際特許分類】

A 6 1 K 3 1 / 4 7 4 5 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 3 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

【F I】

A 6 1 K 3 1 / 4 7 4 5

A 6 1 P 3 5 / 0 0

10

【手続補正書】

【提出日】令和6年8月22日(2024.8.22)

【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

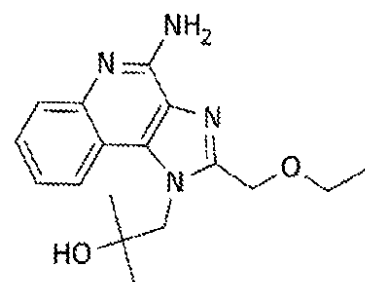
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

がんの処置を必要とする患者においてがんを処置する方法において使用するための、

【化2】



30

またはその薬学的に許容され得る塩、(化合物A)を含む組成物であって、前記方法は、前記組成物を、単剤治療として、前記遊離塩基の 0.10 mg/m^2 から 1.2 mg/m^2 という投与量で投与することを含む、組成物。

【請求項2】

化合物Aの前記投与量が、前記遊離塩基の 0.30 mg/m^2 から 0.75 mg/m^2 である、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

化合物Aの前記投与量が、前記遊離塩基の約 0.75 mg/m^2 である、請求項1に記載の組成物。

【請求項4】

前記患者が以前に免疫チェックポイント阻害治療で処置されたことがある、請求項1～3のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項5】

前記患者のがんが前記以前の処置中に進行した、請求項4に記載の組成物。

50

【請求項 6】

化合物 A の単剤治療が、前記以前の処置の最後の投与後 2 週間から 6 ヶ月に開始される、請求項 4 または 5 に記載の組成物。

【請求項 7】

化合物 A の単剤治療が、前記以前の処置の最後の投与後 1 2 週間以内に開始される、請求項 6 に記載の組成物。

【請求項 8】

前記以前の処置が化学療法をさらに含んでいた、請求項 4 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 9】

前記化学療法が細胞傷害性治療であった、請求項 8 に記載の組成物。

10

【請求項 10】

前記化学療法が標的治療であった、請求項 8 に記載の組成物。

【請求項 11】

前記免疫チェックポイント阻害剤治療が、PD - 1 / PD - L 1 遮断であった、請求項 4 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 12】

PD - 1 / PD - L 1 遮断が抗 PD - 1 抗体の投与を含んでいた、請求項 11 に記載の組成物。

【請求項 13】

PD - 1 / PD - L 1 遮断が抗 PD - L 1 抗体の投与を含んでいた、請求項 11 に記載の組成物。

20

【請求項 14】

前記方法が、ベースラインレベルを確立するための化合物 A の最初の投与前、および応答レベルを決定するための化合物 A の 6 回投与後の、血漿または全血中のインターフェロン誘導性タンパク質 10 (IP - 10) 濃度または転写レベルの定量をさらに含む、請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 15】

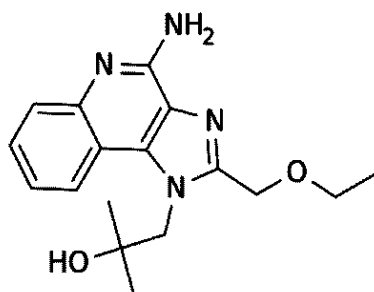
化合物 A の 6 回投与後の IP - 10 の前記血漿または全血濃度が IP - 10 の前記ベースラインレベルの少なくとも 2 倍以下である場合、化合物 A の最初の投与量が 0 . 90 mg / m² 未満であれば化合物 A の前記投与量を増加させる、請求項 14 に記載の組成物。

30

【請求項 16】

がんの処置を必要とする患者においてがんを処置するための、

【化 6】



40

またはその薬学的に許容され得る塩を含む組成物であって、前記患者に投与されて、

a . 8 ng / mL を超える化合物 A の遊離塩基の最大血漿濃度 (C_{max}) ; および / または

b . 3 ng / mL * 日 を超える化合物 A の遊離塩基の曲線下面積 (AUC)

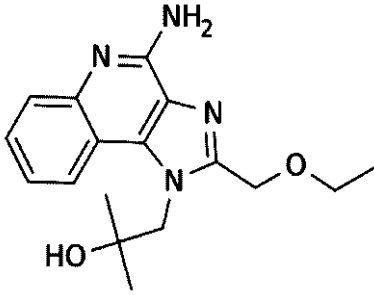
を含む前記患者における血漿濃度プロファイルを得ることを特徴とする、組成物。

【請求項 17】

がんの処置を必要とする患者においてがんを処置するための、

50

【化 7】



10

またはその薬学的に許容され得る塩および抗PD-1抗体を含む組合せ物であって、前記患者に投与されて、

a. 7 ng/mL を超える化合物Aの遊離塩基の最大血漿濃度 (C_{max}) ; および / または

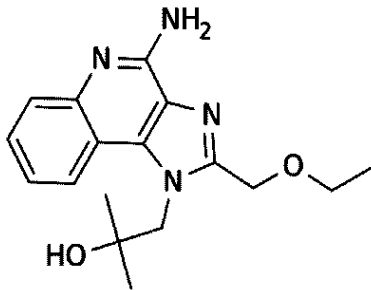
b. 2 ng/mL * 日 を超える化合物Aの遊離塩基の曲線下面積 (AUC)

を含む前記患者における血漿濃度プロファイルを得ることを特徴とする、組合せ物。

【請求項 18】

がんの処置を必要とする患者においてがんを処置するための、

【化 8】



20

またはその薬学的に許容され得る塩および抗PD-L1抗体を含む組合せ物であって、前記患者に投与されて、

30

a. 10 ng/mL を超える化合物Aの遊離塩基の最大血漿濃度 (C_{max}) ; および / または

b. 2 ng/mL * 日 を超える化合物Aの遊離塩基の曲線下面積 (AUC)

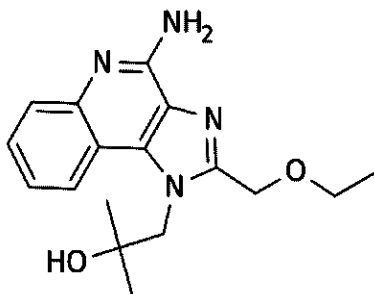
を含む前記患者における血漿濃度プロファイルを得ることを特徴とする、組合せ物。

【請求項 19】

C_{max} までの平均時間 (T_{max}) が前記投与後 15 ~ 90 分である、請求項 16 に記載の組成物または請求項 17 もしくは 18 に記載の組合せ物。

【請求項 20】

【化 9】



40

またはその薬学的に許容され得る塩が全身投与される剤形に含められている、請求項 16 に記載の組成物または請求項 17 もしくは 18 に記載の組合せ物。

50

【請求項 2 1】

前記剤形が、静脈内、腹腔内、筋肉内、皮下、または皮内を含む非経口注射経路を介して投与される、請求項 2 0 に記載の組成物または組合せ物。

【請求項 2 2】

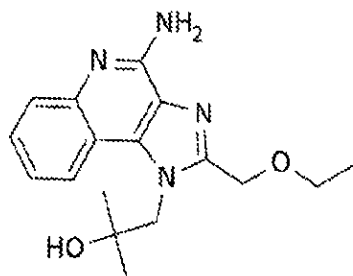
前記静脈内経路が、静脈内ボラスまたは静脈内注入を含む、請求項 2 1 に記載の組成物または組合せ物。

【請求項 2 3】

がんの処置を必要とする患者においてがんを処置するための、免疫チェックポイント阻害剤および

【化 3】

10



またはその薬学的に許容され得る塩、(化合物 A)を含む組合せ物であって、前記免疫チェックポイント阻害剤が、少なくとも 1 ~ 3 用量で投与されて、前記化合物 A が、前記遊離塩基の $0.10 \text{ mg} / \text{m}^2$ から $1.2 \text{ mg} / \text{m}^2$ の投与量で投与されることを特徴とする、組合せ物。

20

【請求項 2 4】

化合物 A の最初の投与の後に、さらなる用量の前記免疫チェックポイント阻害剤が投与されない、請求項 2 3 に記載の組合せ物。

【請求項 2 5】

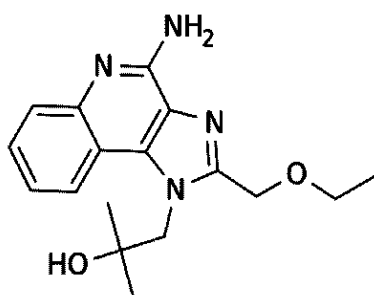
前記免疫チェックポイント阻害剤による処置が、化合物 A による処置と併せて継続される、請求項 2 3 に記載の組合せ物。

【請求項 2 6】

がんの処置を必要とする患者においてがんを処置するための、

30

【化 1 0】



40

またはその薬学的に許容され得る塩を含む組成物であって、前記患者に抗 PD - 1 抗体と組み合わせて投与されて、

a . $7 \text{ ng} / \text{mL}$ を超える化合物 A の遊離塩基の最大血漿濃度 (C_{max}) ; および / または

b . $2 \text{ ng} / \text{mL} \cdot \text{日}$ を超える化合物 A の遊離塩基の曲線下面積 (AUC)

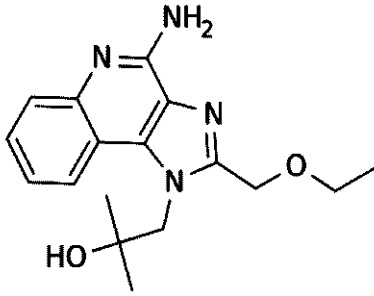
を含む前記患者における血漿濃度プロファイルを得ることを特徴とする、組成物。

【請求項 2 7】

がんの処置を必要とする患者においてがんを処置するための、抗 PD - 1 抗体を含む組成物であって、前記患者に

50

【化 1 1】



10

またはその薬学的に許容され得る塩と組み合わせて投与されて、

a . 7 n g / m L を超える化合物 A の遊離塩基の最大血漿濃度 (C m a x) ; および / または

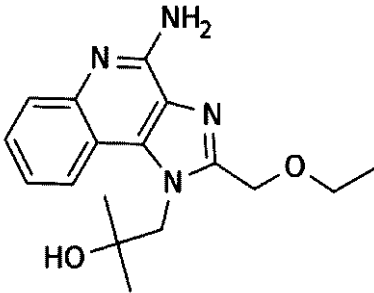
b . 2 n g / m L * 日 を超える化合物 A の遊離塩基の曲線下面積 (A U C)

を含む前記患者における血漿濃度プロファイルを得ることを特徴とする、組成物。

【請求項 2 8】

がんの処置を必要とする患者においてがんを処置するための、

【化 1 2】



20

またはその薬学的に許容され得る塩を含む組成物であって、前記患者に抗 P D - L 1 抗体と組み合わせて投与されて、

a . 1 0 n g / m L を超える化合物 A の遊離塩基の最大血漿濃度 (C m a x) ; および / または 30

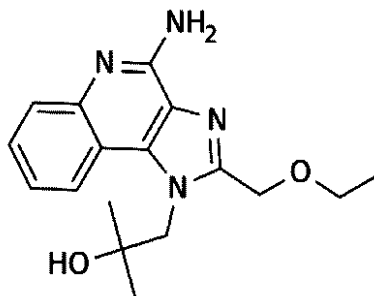
b . 2 n g / m L * 日 を超える化合物 A の遊離塩基の曲線下面積 (A U C)

を含む前記患者における血漿濃度プロファイルを得ることを特徴とする、組成物。

【請求項 2 9】

がんの処置を必要とする患者においてがんを処置するための、抗 P D - L 1 抗体を含む組成物であって、前記患者に

【化 1 3】



40

またはその薬学的に許容され得る塩と組み合わせて投与されて、

a . 1 0 n g / m L を超える化合物 A の遊離塩基の最大血漿濃度 (C m a x) ; および / または

b . 2 n g / m L * 日 を超える化合物 A の遊離塩基の曲線下面積 (A U C)

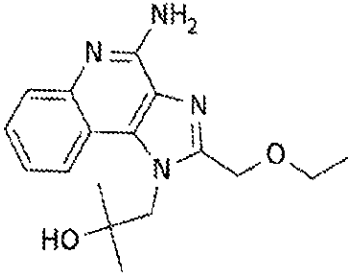
50

を含む前記患者における血漿濃度プロファイルを得ることを特徴とする、組成物。

【請求項 30】

がんの処置を必要とする患者においてがんを処置するための、免疫チェックポイント阻害剤を含む組成物であって、前記遊離塩基の $0.10 \text{ mg} / \text{m}^2$ から $1.2 \text{ mg} / \text{m}^2$ の投与量で投与される、

【化 4】



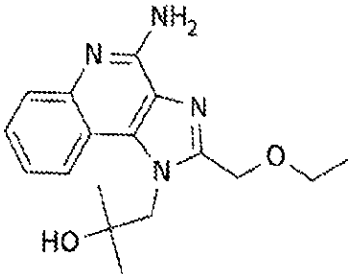
10

またはその薬学的に許容され得る塩、(化合物 A) と組み合わせて、少なくとも 1 ~ 3 用量の免疫チェックポイント阻害剤で投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項 31】

がんの処置を必要とする患者においてがんを処置するための、

【化 5】



20

またはその薬学的に許容され得る塩、(化合物 A) を含む組成物であって、少なくとも 1 ~ 3 用量の免疫チェックポイント阻害剤での免疫チェックポイント阻害剤と組み合わせて、前記遊離塩基の $0.10 \text{ mg} / \text{m}^2$ から $1.2 \text{ mg} / \text{m}^2$ の投与量で投与されることを特徴とする、組成物。

30

【請求項 32】

前記抗 PD - 1 抗体が、ペンブロリズマブである、請求項 17 に記載の組合せ物。

【請求項 33】

前記抗 PD - L1 抗体が、アテゾリズマブである、請求項 18 に記載の組合せ物。

【請求項 34】

前記免疫チェックポイント阻害剤が、抗 PD - 1 抗体である、請求項 23 に記載の組合せ物。

【請求項 35】

前記抗 PD - 1 抗体が、ペンブロリズマブである、請求項 34 に記載の組合せ物。

40

【請求項 36】

前記免疫チェックポイント阻害剤が、抗 PD - L1 抗体である、請求項 23 に記載の組合せ物。

【請求項 37】

前記抗 PD - 1 抗体が、アテゾリズマブである、請求項 36 に記載の組合せ物。

【請求項 38】

化合物 A が前記遊離塩基として投与されるものである、請求項 34 に記載の組合せ物。

【請求項 39】

化合物 A の前記投与量が、前記遊離塩基の $0.5 \text{ mg} / \text{m}^2$ から $0.9 \text{ mg} / \text{m}^2$ である、請求項 38 に記載の組合せ物。

50

【請求項 40】

化合物 A が硫酸塩として投与されるものである、請求項 34 に記載の組合せ物。

【請求項 41】

化合物 A 硫酸塩の前記投与量が、前記硫酸塩の $0.66 \text{ mg} / \text{m}^2$ から $1.2 \text{ mg} / \text{m}^2$ である、請求項 40 に記載の組合せ物。

10

20

30

40

50