

(19) 世界知的所有権機関  
国際事務局



(43) 国際公開日  
2005 年 12 月 22 日 (22.12.2005)

PCT

(10) 国際公開番号  
WO 2005/120480 A1

(51) 国際特許分類<sup>7</sup>: A61K 31/132,  
31/44, 31/506, 31/53, 33/24, A61P 35/00

(21) 国際出願番号: PCT/JP2005/010182

(22) 国際出願日: 2005 年 6 月 2 日 (02.06.2005)

(25) 国際出願の言語: 日本語

(26) 国際公開の言語: 日本語

(30) 優先権データ:  
特願2004-171520 2004 年 6 月 9 日 (09.06.2004) JP

(71) 出願人 (米国を除く全ての指定国について): 大鵬薬品工業株式会社 (TAIHO PHARMACEUTICAL CO., LTD.) [JP/JP]; 〒1010054 東京都千代田区神田錦町 1 丁目 2 7 番地 Tokyo (JP).

(72) 発明者; および

(75) 発明者/出願人 (米国についてのみ): 小泉 克久 (KOIZUMI, Katsuhisa) [JP/JP]; 〒7710194 徳島県徳島市川内町平石夷野 2 2 4 - 2 大鵬薬品工業株式会社内 Tokushima (JP). 内田 淳二 (UCHIDA, Junji) [JP/JP]; 〒7710194 徳島県徳島市川内町平石夷野 2 2 4 -

2 大鵬薬品工業株式会社内 Tokushima (JP). 武知 貞士 (TAKECHI, Teiji) [JP/JP]; 〒7710194 徳島県徳島市川内町平石夷野 2 2 4 - 2 大鵬薬品工業株式会社内 Tokushima (JP). 糠塚 守 (NUKATSUKA, Mamoru) [JP/JP]; 〒7710194 徳島県徳島市川内町平石夷野 2 2 4 - 2 大鵬薬品工業株式会社内 Tokushima (JP).

(74) 代理人: 三枝 英二, 外 (SAEGUSA, Eiji et al.); 〒5410045 大阪府大阪市中央区道修町 1 - 7 - 1 北浜 T N K ビル Osaka (JP).

(81) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の国内保護が可能): AE, AG, AL, AM, AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN, CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI, GB, GD, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE, KG, KM, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA, MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ, OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL, SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC, VN, YU, ZA, ZM, ZW.

(84) 指定国 (表示のない限り、全ての種類の広域保護が可能): ARIPO (BW, GH, GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM, ZW), ユーラシア (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM), ヨーロッパ (AT, BE,

/ 続葉有 /

(54) Title: ANTITUMOR EFFECT FORTIFIER, ANTITUMOR AGENT AND METHOD OF THERAPY FOR CANCER

(54) 発明の名称: 抗腫瘍効果増強剤、抗腫瘍剤及び癌治療方法

(57) Abstract: An antitumor effect fortifier comprising as an active ingredient an effective amount of platinum (II) cis-oxalato(1R,2R-diaminocyclohexane) so as to enhance the antitumor activity of antitumor agent containing a therapeutically effective amount of tegafur, an amount, effective for the enhancement of antitumor effect, of gimeracil and an amount, effective for the suppression of side effects, of oteracil potassium; and a relevant antitumor agent. Further, there is provided a method of therapy for cancer, characterized in that an amount, effective for the enhancement of antitumor effect, of platinum (II) cis-oxalato(1R,2R-diaminocyclohexane) is concomitantly administered to a mammal. Still further, there is provided an antitumor agent consisting of a pharmaceutical preparation form composed of at least two separate preparations containing efficacious ingredients consisting of tegafur, gimeracil, oteracil potassium and platinum (II) cis-oxalato(1R,2R-diaminocyclohexane) each alone or in an arbitrary combination, or a pharmaceutical preparation form constituted of a single preparation containing all the efficacious ingredients. Still further, there is provided a relevant kit.

(57) 要約:

有効量のシス-オキザラート (1 R, 2 R-ジアミノシクロヘキサン) 白金(II)を有効成分として含有する、治療有効量のテガフル、抗腫瘍効果増強有効量のギメラシル及び副作用抑制のための有効量のオテラシルカリウムを含有する抗腫瘍剤の抗腫瘍活性を増強させる、抗腫瘍効果増強剤; 該抗腫瘍剤、及び抗腫瘍効果増強のために有効な量のシス-オキザラート (1 R, 2 R-ジアミノシクロヘキサン) 白金(II)を哺乳動物に併用投与することを特徴とする癌治療方法。テガフル、ギメラシル、オテラシルカリウム、及びシス-オキザラート (1 R, 2 R-ジアミノシクロヘキサン) 白金(II)からなる有効成分をそれぞれ単独若しくは任意の組合せで含む二個以上の別個の製剤からなる製剤形態、又は全有効成分を含む一つの製剤からなる製剤形態である抗腫瘍剤、並びにキット。

WO 2005/120480 A1



BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI, FR, GB, GR, HU,  
IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO, SE, SI, SK, TR),  
OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN, GQ, GW, ML,  
MR, NE, SN, TD, TG).

2文字コード及び他の略語については、定期発行される  
各PCTガゼットの巻頭に掲載されている「コードと略語  
のガイダンスノート」を参照。

添付公開書類:

— 国際調査報告書