

【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22年10月21日(2010.10.21)

【公表番号】特表2010-502731(P2010-502731A)

【公表日】平成22年1月28日(2010.1.28)

【年通号数】公開・登録公報2010-004

【出願番号】特願2009-527546(P2009-527546)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 39/395 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/166 (2006.01)

G 0 1 N 27/62 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 43/00 1 2 3

A 6 1 K 39/395 N

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 31/166

G 0 1 N 27/62 V

G 0 1 N 27/62 D

【手続補正書】

【提出日】平成22年9月6日(2010.9.6)

【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】

疾患の治療における脂肪酸合成を阻害する P A R P 阻害剤又はその代謝産物の治療有効性を試験する方法であって、以下のステップ：

(i) 上記 P A R P 阻害剤又はその代謝産物の投与前の患者から得られた第一サンプルから、第一脂肪酸レベルを取得し；

(ii) 上記 P A R P 阻害剤又はその代謝産物の投与後の患者から得られた第二サンプルから、第二脂肪酸レベルを取得し；

(iii) 上記第一脂肪酸レベルと第二脂肪酸レベルを比較し；そして

(iv) 上記第二脂肪酸レベルが、第一脂肪酸レベルよりも低い場合、上記の P A R P

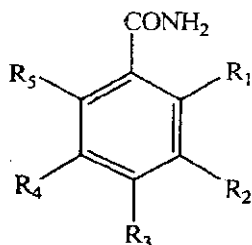
阻害剤又はその代謝産物が患者の疾患の治療に治療的に有効であると決定し；又は上記第二脂肪酸レベルが、第一脂肪酸レベルよりも高い場合、上記PARP阻害剤又はその代謝産物が患者の疾患の治療に治療的に有効ではないと決定する

を含んで成る、前記方法。

【請求項2】

前記PARP阻害剤又はその代謝産物が、以下の式（I）：

【化1】



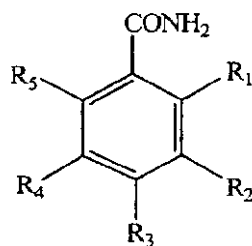
式 I

{式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、及び R_5 が、水素、ヒドロキシ、場合により置換されているアミン、カルボキシル、エステル、ニトロソ、ニトロ、ハロゲン、場合により置換されている（ C_1 - C_6 ）アルキル、場合により置換されている（ C_1 - C_6 ）アルコキシ、場合により置換されている（ C_3 - C_7 ）シクロアルキル、場合により置換されている（ C_3 - C_7 ）複素環系、場合により置換されているアリール、及び含硫部分から成る群から独立に選択される}によって表される化合物、医薬として許容されるその塩、又はそのプロドラッグである、請求項1に記載の方法。

【請求項3】

前記PARP阻害剤又はその代謝産物が、以下の式（II）：

【化2】



式 II

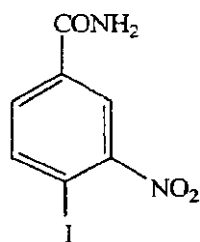
[式中、 R_1 、 R_3 、 R_4 、及び R_5 が、水素、ヒドロキシ、場合により置換されているアミン、カルボキシル、エステル、ニトロソ、ニトロ、ハロゲン、場合により置換されている（ C_1 - C_6 ）アルキル、場合により置換されている（ C_1 - C_6 ）アルコキシ、場合により置換されている（ C_3 - C_7 ）シクロアルキル、場合により置換されている（ C_3 - C_7 ）複素環系、場合により置換されているアリール、及び $-SR_6$ から成る群から独立に選択され； R_2 が、ニトロ又はニトロソのいずれかであり；且つ、式中、 R_1 、 R_3 、 R_4 、及び R_5 置換基のうち少なくとも2つのが、常に水素であり；ここで、 R_6 が、 $-SR_6$ {式中、 R_6 が、水素、 C_1 - C_6 アシル、場合により置換されている（ C_1 - C_6 ）アルキル、場合により置換されている（ C_3 - C_7 ）シクロアルキル、場合により置換されている（ C_3 - C_7 ）複素環系、及び場合により置換されている

アリール、並びに任意の置換基から成る群から選択される} である] によって表される化合物、医薬として許容されるその塩、又はそのプロドラッグである、請求項2に記載の方法。

【請求項 4】

前記PARP阻害剤が、以下の式 (III) :

【化 3】



式 III

によって表される化合物、医薬として許容されるその塩、又はそのプロドラッグである、請求項3に記載の方法。

【請求項 5】

前記脂肪酸合成の阻害が、グルコース経路又は脂肪酸生合成経路のうちの少なくとも1種類の酵素を阻害するステップを含んで成る、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 6】

前記第一脂肪酸レベルと第二脂肪酸レベルが、アッセイ技術によって測定される、請求項1に記載の方法。

【請求項 7】

前記第一脂肪酸レベルと第二脂肪酸レベルが、質量分析法によって測定される、請求項1に記載の方法。

【請求項 8】

前記質量分析法が、マス・アイソトポマー分布解析である、請求項7に記載の方法。

【請求項 9】

前記の疾患が、癌、心臓血管、糖尿病、又は肥満である、請求項1に記載の方法。

【請求項 10】

前記第一サンプル中の第一の脂肪酸レベルが、前記患者の病歴から決定される、請求項1に記載の方法。