

【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23年4月7日(2011.4.7)

【公表番号】特表2010-518173(P2010-518173A)

【公表日】平成22年5月27日(2010.5.27)

【年通号数】公開・登録公報2010-021

【出願番号】特願2009-549760(P2009-549760)

【国際特許分類】

C 0 7 D 239/94 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 239/94 C S P

A 6 1 K 31/517

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成23年1月31日(2011.1.31)

【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

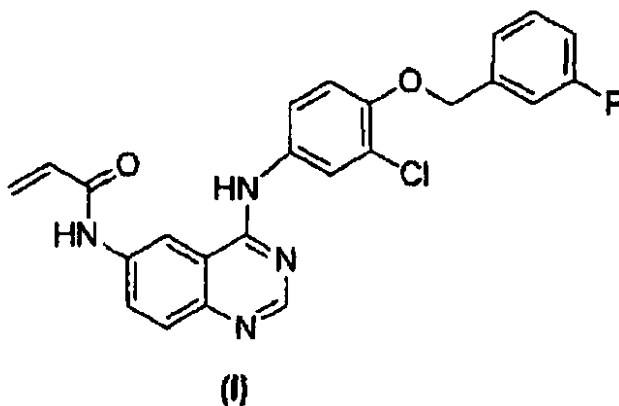
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の化合物の医薬的に許容できる塩：

【化 1】



【請求項 2】

前記塩は、式 (I) の前記化合物と無機酸もしくは有機酸とから形成される酸付加塩、または式 (I) の前記化合物と無機塩基もしくは有機塩基とから形成される塩基付加塩である、請求項 1 に記載の塩。

【請求項 3】

前記塩は、前記酸付加塩である、請求項 2 に記載の塩。

【請求項 4】

前記酸付加塩は、臭化水素酸塩、塩酸塩、硫酸塩、重硫酸塩、炭酸塩、重炭酸塩、亜硫酸塩、リン酸塩、重リン酸塩、ホウ酸塩、酢酸塩、シュウ酸塩、マロン酸塩、吉草酸塩、

安息香酸塩、p - トルエンスルホン酸塩、メタンスルホン酸塩、酒石酸塩、乳酸塩、安息香酸塩、トルエン酸塩、クエン酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、リンゴ酸塩、パモ酸塩、サリチル酸塩、バニリン酸塩、マンデル酸塩およびコハク酸塩からなる群から選択される、請求項 3 に記載の塩。

【請求項 5】

前記酸付加塩は、塩酸塩、硫酸塩、リン酸塩、炭酸塩、p - トルエンスルホン酸塩、メタンスルホン酸塩、安息香酸塩、サリチル酸塩、シュウ酸塩、酢酸塩、吉草酸塩、マロン酸塩および酒石酸塩からなる群から選択される、請求項 4 に記載の塩。

【請求項 6】

前記酸付加塩は、塩酸塩または p - トルエンスルホン酸塩である、請求項 5 に記載の塩。

【請求項 7】

前記塩は、塩基付加塩である、請求項 2 に記載の塩。

【請求項 8】

前記塩基付加塩は、アルカリ金属塩、アルカリ土類金属塩、四級アンモニウムカチオン塩およびアミン塩からなる群から選択される、請求項 7 に記載の塩。

【請求項 9】

前記塩基付加塩は、ナトリウム塩、カリウム塩、カルシウム塩、マグネシウム塩、テトラメチル四級アンモニウム塩、テトラエチル四級アンモニウム塩、メチルアミン塩、ジメチルアミン塩、トリメチルアミン塩、トリエチルアミン塩およびエチルアミン塩からなる群から選択される、請求項 8 に記載の塩。

【請求項 10】

前記塩基付加塩は、トリエチルアミン塩である、請求項 9 に記載の塩。

【請求項 11】

悪性腫瘍の治療または予防のための、請求項 1 から 10 のいずれかに記載の塩。

【請求項 12】

請求項 1 から 10 のいずれかに記載の前記塩を調製するための方法であって、

(a) 式(I)の前記化合物を有機溶剤に溶解し、攪拌しながら酸含有溶剤または塩基含有溶剤を滴下して添加するステップと、

(b) その結果得られる混合物を直接にまたは濃縮後にろ過して固体を得、前記固体を水で洗浄し、乾燥させて、前記塩を得るステップとを備える、方法。

【請求項 13】

前記有機溶剤は、メタノール、エタノール、酢酸エチル、テトラヒドロフラン、トリエチルアミン、ジエチルエーテル、1, 4 - ジオキサンおよびそれらの混合物からなる群から選択される、請求項 12 に記載の方法。

【請求項 14】

請求項 1 から 10 のいずれかに記載の前記塩および医薬的に許容できる担体を備える、医薬組成物。

【請求項 15】

付加的な抗腫瘍剤をさらに備える、請求項 14 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

抗腫瘍剤の調製における、請求項 1 から 10 のいずれかに記載の前記塩の使用。

【請求項 17】

前記腫瘍は、乳癌、非小細胞肺癌、卵巣癌、胃癌、結腸癌、すい臓癌および扁平上皮癌からなる群から選択される、請求項 16 に記載の使用。

【請求項 18】

非ヒト哺乳動物の悪性腫瘍を治療または予防するための方法であって、

請求項 1 から 10 のいずれかに記載の前記塩の有効量を、前記治療または予防を必要とする非ヒト哺乳動物に投与するステップを備える、方法。

【請求項 19】

前記腫瘍は、乳癌、非小細胞肺癌、卵巣癌、胃癌、結腸癌、すい臓癌および扁平上皮癌からなる群から選択される、請求項 18 に記載の方法。

【請求項 20】

付加的な抗腫瘍剤を請求項 1 から 10 のいずれかに記載の前記塩と組合せて、前記治療を必要とする前記非ヒト哺乳動物に同時にまたは経時的に投与するステップをさらに備える、請求項 19 に記載の方法。