

【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21年6月25日(2009.6.25)

【公表番号】特表2008-540499(P2008-540499A)

【公表日】平成20年11月20日(2008.11.20)

【年通号数】公開・登録公報2008-046

【出願番号】特願2008-510642(P2008-510642)

【国際特許分類】

| | | |
|---------|-------|-----------|
| A 6 1 K | 45/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 43/00 | (2006.01) |
| A 6 1 P | 35/00 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 31/18 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 9/08 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 9/14 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 9/16 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 9/20 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 9/19 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 47/40 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 47/18 | (2006.01) |
| A 6 1 K | 47/26 | (2006.01) |

【F I】

| | | |
|---------|-------|-------|
| A 6 1 K | 45/00 | |
| A 6 1 P | 43/00 | 1 1 1 |
| A 6 1 P | 35/00 | |
| A 6 1 K | 31/18 | |
| A 6 1 K | 9/08 | |
| A 6 1 K | 9/14 | |
| A 6 1 K | 9/16 | |
| A 6 1 K | 9/20 | |
| A 6 1 K | 9/19 | |
| A 6 1 K | 47/40 | |
| A 6 1 K | 47/18 | |
| A 6 1 K | 47/26 | |

【手続補正書】

【提出日】平成21年5月8日(2009.5.8)

【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】

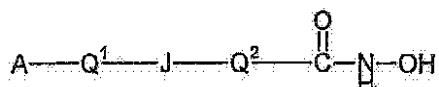
【特許請求の範囲】

【請求項1】

(a) HDAC阻害剤；並びに

(b) シクロデキストリン、アルギニン及びメグルミンから選択される1以上の成分；
を含む医薬組成物であって、前記HDAC阻害剤が以下の式の化合物、並びにその製薬上許容
される塩、溶媒和物、アミド、エステル、及びエーテルから選択される、上記医薬組成物

【化1】



[式中、

Aは、置換されているか、若しくは非置換のC₆₋₂₀カルボアリール又はC₅₋₂₀ヘテロアリールであり；

Q¹は、共有結合、又は置換されているか、若しくは非置換のC₁₋₇アルキレン又はC₂₋₇アルケニレンであり；

Jは、-NR^N-S(=O)₂-又は-S(=O)₂-NR^N-であり；

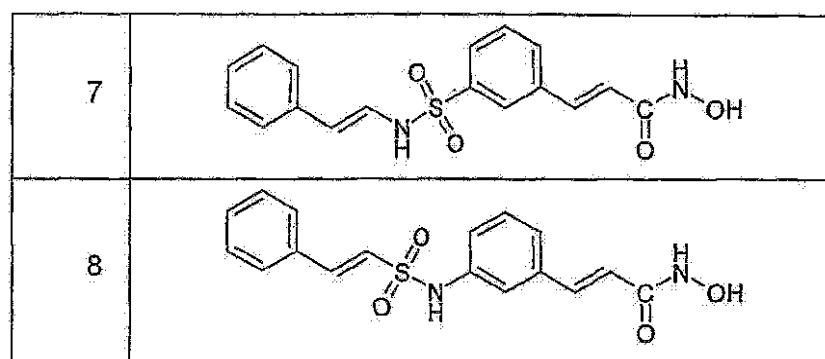
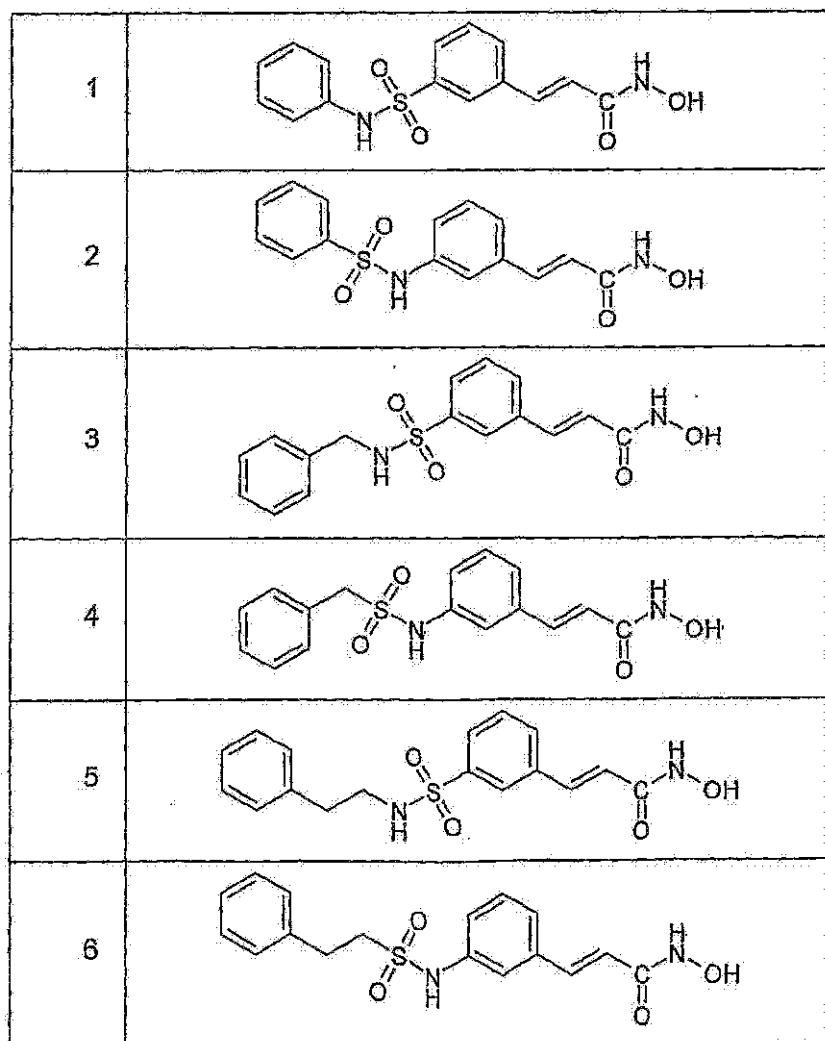
R^Nは、-H又は置換されているか、若しくは非置換のC₁₋₇アルキル、C₃₋₂₀ヘテロシクリル、C₆₋₂₀カルボアリール、C₅₋₂₀ヘテロアリール、C₆₋₂₀カルボアリール-C₁₋₇アルキル又はC₅₋₂₀ヘテロアリール-C₁₋₇アルキルであり；

Q²は、置換されているか、若しくは非置換のC₆₋₂₀カルボアリーレン、C₅₋₂₀ヘテロアリーレン、C₆₋₂₀カルボアリーレン-C₁₋₇アルキレン、C₅₋₂₀ヘテロアリーレン-C₁₋₇アルキレン、C₆₋₂₀カルボアリーレン-C₂₋₇アルケニレン、C₅₋₂₀ヘテロアリーレン-C₂₋₇アルケニレン、C₁₋₇アルキレン-C₆₋₂₀カルボアリーレン、C₁₋₇アルキレン-C₅₋₂₀ヘテロアリーレン、C₂₋₇アルケニレン-C₆₋₂₀カルボアリーレン、C₂₋₇アルケニレン-C₅₋₂₀ヘテロアリーレン、C₁₋₇アルキレン-C₆₋₂₀カルボアリーレン-C₁₋₇アルキレン、C₁₋₇アルキレン-C₅₋₂₀ヘテロアリーレン-C₁₋₇アルキレン、C₂₋₇アルケニレン-C₆₋₂₀カルボアリーレン-C₁₋₇アルキレン、C₁₋₇アルキレン-C₅₋₂₀ヘテロアリーレン-C₁₋₇アルキレン、C₂₋₇アルケニレン-C₅₋₂₀ヘテロアリーレン-C₁₋₇アルキレン、C₁₋₇アルキレン-C₆₋₂₀カルボアリーレン-C₂₋₇アルケニレン、C₁₋₇アルキレン-C₅₋₂₀ヘテロアリーレン-C₂₋₇アルケニレン、C₂₋₇アルケニレン-C₆₋₂₀カルボアリーレン-C₂₋₇アルケニレン又はC₂₋₇アルケニレン-C₅₋₂₀ヘテロアリーレン-C₂₋₇アルケニレンである。]。

【請求項2】

HDAC阻害剤が以下の化合物、並びにその製薬上許容される塩、溶媒和物、アミド類、エステル類、及びエーテル類から選択される、請求項1に記載の医薬組成物。

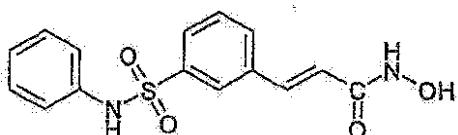
【化2】



【請求項3】

HDAC阻害剤が以下の化合物、並びにその製薬上許容される塩、溶媒和物、アミド類、エカルペル類、及びエーテル類から選択される、請求項1に記載の医薬組成物。

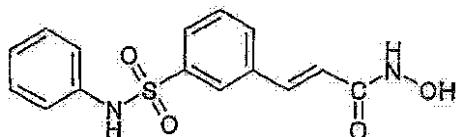
【化3】



【請求項4】

HDAC阻害剤が

【化 4】



である、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

- (a) 前記HDAC阻害剤；と
(b) シクロデキストリン

とを含む、請求項1～4のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【 請求項 6 】

- (a) 前記HDAC阻害剤；と
(b) アルギニン；

とを含む、請求項1～4のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

- (a) 前記HDAC阻害剤；と
(b) メグルミン；

とを含む、請求項1～4のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項8】

- (a) 前記HDAC阻害剤；と
 (b) シクロデキストリン及びアルギニン；

とを含む、請求項1～4のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項9】

- (a) 前記HDAC阻害剤；と
 (b) シクロデキストリン及びメグルミン；

とを含む、請求項1～4のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

- (a) 前記HDAC阻害剤；と
 (b) アルギニン及びメグルミン

とを含む、請求項1～4のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

- (a) 前記HDAC阻害剤；と
 (b) シクロデキストリン、アルギニン及びメグルミン；

とを含む、請求項1～4のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 2】

前記シクロデキストリンが、含まれる場合、 - シクロデキストリン、 - シクロデキストリン、 - シクロデキストリン、 - シクロデキストリン、 (C₁₋₄アルキル) - - シクロデキストリン、 (C₁₋₄アルキル) - - シクロデキストリン、 (C₁₋₄アルキル) - - シクロデキストリン、 (C₁₋₄アルキル) - - シクロデキストリン、 (ヒドロキシ-C₁₋₄アルキル) - - シクロデキストリン、 (ヒドロキシ-C₁₋₄アルキル) - - シクロデキストリン、 (ヒドロキシ-C₁₋₄アルキル) - - シクロデキストリン、 (カルボキシ-C₁₋₄アルキル) - - シクロデキストリン、 (カルボキシ-C₁₋₄アルキル) - - シクロデキストリン、 (カルボキシ-C₁₋₄アルキル) - - シクロデキストリンの糖エーテル、 - シクロデキストリンの糖エーテル、 - シクロデキストリンの糖エーテル、及び - シクロデキストリン、 - シクロデキストリン又は - シクロデキストリンのスルホブチルエーテルから選択される、請求項1~11のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 3】

前記シクロデキストリンが、含まれる場合、ヒドロキシプロピル - - - シクロデキストリンである、請求項1～12のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 4】

前記アルギニンが、含まれる場合、遊離のアルギニン又はアルギニンの製薬上許容される塩である、請求項1～13のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

前記アルギニンが、含まれる場合、遊離のL-アルギニン又はL-アルギニンの製薬上許容される塩である、請求項1～13のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 6】

前記メグルミンが、含まれる場合、遊離のメグルミン又はメグルミンの製薬上許容される塩である、請求項1～15のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 7】

シクロデキストリンが含まれる場合、前記HDAC阻害剤に対するシクロデキストリンのモル比が少なくとも0.5である、請求項1～16のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

シクロデキストリンが含まれる場合、前記HDAC阻害剤に対するシクロデキストリンのモル比が0.5～5である、請求項1～16のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 9】

アルギニンが含まれる場合、前記HDAC阻害剤に対するアルギニンのモル比が少なくとも0.5である、請求項1～18のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 0】

アルギニンが含まれる場合、前記HDAC阻害剤に対するアルギニンのモル比が0.5～5である、請求項1～18のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 1】

メグルミンが含まれる場合、前記HDAC阻害剤に対するアルギニンのモル比が少なくとも0.5である、請求項1～20のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 2】

メグルミンが含まれる場合、前記HDAC阻害剤に対するアルギニンのモル比が0.5～5である、請求項1～20のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 3】

1以上の製薬上許容される追加成分をさらに含む、請求項1～22のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 4】

無菌であり、発熱性物質を含まない、請求項1～23のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 5】

液体である、請求項1～24のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 6】

水性の液体である、請求項1～24のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 7】

注射用水、生理食塩水、グルコース水溶液、注射／点滴用の生理食塩水、注射／点滴用のグルコース、リングル溶液又は乳酸加リングル溶液をさらに含む、請求項1～26のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 8】

生理食塩水又はグルコース水溶液をさらに含む、請求項1～26のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 9】

0.1～1000mg/mLの濃度で前記HDAC阻害剤を含む、請求項25～28のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 3 0】

100～1000mg/mLの濃度で前記HDAC阻害剤を含む、請求項25～28のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 3 1】

0.3～3000mMの濃度で前記HDAC阻害剤を含む、請求項25～28のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項32】

100～1000mMの濃度で前記HDAC阻害剤を含む、請求項25～28のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項33】

0.01～300mg/mLの濃度で前記HDAC阻害剤を含む、請求項25～28のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項34】

1.0～5mg/mLの濃度で前記HDAC阻害剤を含む、請求項25～28のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項35】

0.01～100mMの濃度で前記HDAC阻害剤を含む、請求項25～28のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項36】

0.1～5mMの濃度で前記HDAC阻害剤を含む、請求項25～28のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項37】

前記組成物が患者への非経口投与に好適である、請求項1～36のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項38】

前記組成物が注射による患者への投与に好適である、請求項1～36のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項39】

前記組成物が点滴による患者への投与に好適である、請求項1～36のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項40】

固体である、請求項1～24のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項41】

粉末、顆粒、錠剤又は凍結乾燥物／凍結乾燥品の形態である、請求項1～24のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項42】

請求項25～39のいずれか1項に記載の医薬組成物を含有する静脈内(IV)点滴用バッグ。

【請求項43】

請求項1～41のいずれか1項に記載の医薬組成物を含有するバイアル又はアンプル。

【請求項44】

人体又は動物の体を治療する方法で使用される、請求項1～41のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項45】

HDACが介在する症状を治療する方法で使用される、請求項1～41のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項46】

増殖状態を治療する方法で使用される、請求項1～41のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項47】

癌を治療する方法で使用される、請求項1～41のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項48】

HDACが介在する症状を治療するための薬剤の製造における、請求項1～41のいずれか1項に記載の医薬組成物の使用。

【請求項 4 9】

増殖状態を治療するための薬剤の製造における、請求項1～41のいずれか1項に記載の医薬組成物の使用。

【請求項 5 0】

癌治療薬の製造における、請求項1～41のいずれか1項に記載の組成物の使用。

【請求項 5 1】

HDACが介在する症状を治療するための薬剤の製造における、請求項1～24のいずれか1項で定義されるような、(a) HDAC阻害剤、並びに(b)シクロデキストリン、アルギニン及びメグルミンのうちの1以上の使用。

【請求項 5 2】

増殖状態を治療するための薬剤の製造における、請求項1～24のいずれか1項で定義されるような、(a) HDAC阻害剤、並びに(b)シクロデキストリン、アルギニン及びメグルミンのうちの1以上の使用。

【請求項 5 3】

癌治療薬の製造における、請求項1～24のいずれか1項で定義されるような、(a) HDAC阻害剤、並びに(b)シクロデキストリン、アルギニン及びメグルミンのうちの1以上の使用。

【請求項 5 4】

請求項1～41のいずれか1項に記載の医薬組成物と、細胞とを接触させることを含む、インビトロにおける、(a)細胞増殖を調節する(例えば、阻害する)；(b)細胞周期の進行を阻害する；(c)アポトーシスを促進する；又は(d)これらの1以上を組み合わせた方法。