

【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】

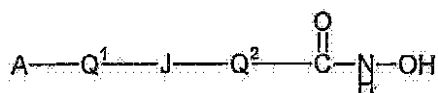
【請求項1】

(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 C_{6-20} カルボアリール又は C_{5-20} ヘテロアリールであり；

Q^1 は、共有結合、又は置換されているか、若しくは非置換の C_{1-7} アルキレン又は C_{2-7} 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；

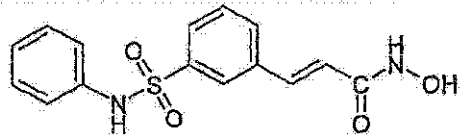
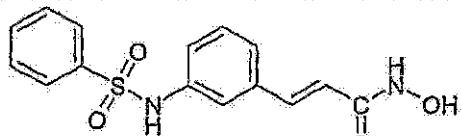
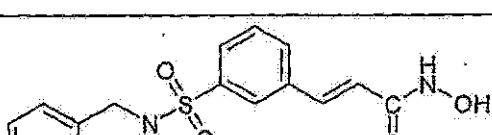
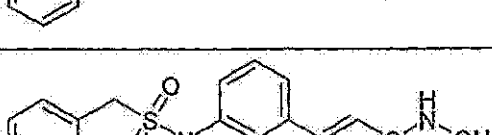
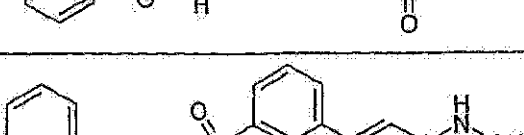
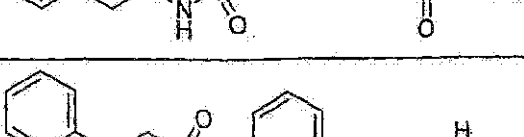
R^N は、 $-H$ 又は置換されているか、若しくは非置換の C_{1-7} アルキル、 C_{3-20} ヘテロシクリル、 C_{6-20} カルボアリール、 C_{5-20} ヘテロアリール、 C_{6-20} カルボアリール- C_{1-7} アルキル又は C_{5-20} ヘテロアリール- C_{1-7} アルキルであり；

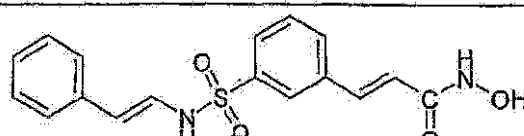
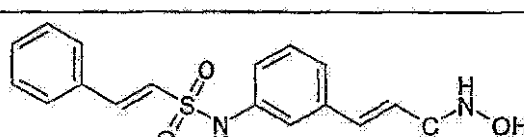
Q^2 は、置換されているか、若しくは非置換の C_{6-20} カルボアリーレン、 C_{5-20} ヘテロアリーレン、 C_{6-20} カルボアリーレン- C_{1-7} アルキレン、 C_{5-20} ヘテロアリーレン- C_{1-7} アルキレン、 C_{6-20} カルボアリーレン- C_{2-7} アルケニレン、 C_{5-20} ヘテロアリーレン- C_{2-7} アルケニレン、 C_{1-7} アルキレン- C_{6-20} カルボアリーレン、 C_{1-7} アルキレン- C_{5-20} ヘテロアリーレン、 C_{2-7} アルケニレン- C_{6-20} カルボアリーレン、 C_{2-7} アルケニレン- C_{5-20} ヘテロアリーレン、 C_{1-7} アルキレン- C_{6-20} カルボアリーレン- C_{1-7} アルキレン、 C_{1-7} アルキレン- C_{5-20} ヘテロアリーレン- C_{1-7} アルキレン、 C_{2-7} アルケニレン- C_{6-20} カルボアリーレン- C_{1-7} アルキレン、 C_{2-7} アルケニレン- C_{5-20} ヘテロアリーレン- C_{1-7} アルキレン、 C_{1-7} アルキレン- C_{6-20} カルボアリーレン- C_{2-7} アルケニレン、 C_{1-7} アルキレン- C_{5-20} ヘテロアリーレン- C_{2-7} アルケニレン、 C_{2-7} アルケニレン- C_{6-20} カルボアリーレン- C_{2-7} アルケニレン又は C_{2-7} アルケニレン- C_{5-20} ヘテロアリーレン- C_{2-7} 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】

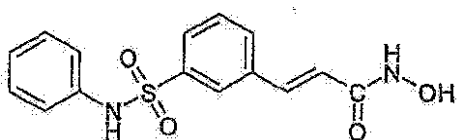
1	
2	
3	
4	
5	
6	

7	
8	

【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 3】



【請求項 4】

HDAC阻害剤が

O=C(O)C=Cc1ccc(cc1)S(=O)(=O)Nc2ccccc2

【請求項 5】

- 【請求項 6】

- 【請求項 7】

- 【請求項 8】

- 【請求項 9】

- 【請求項 10】

- 【請求項 1 1】

- 【請求項 1 2】

【請求項 13】

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 14】

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 15】

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 16】

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 17】

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 18】

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 19】

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 20】

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 21】

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 22】

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 23】

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 24】

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 25】

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 26】

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 27】

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、リンゲル溶液又は乳酸加リンゲ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 28】

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 29】

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 30】

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 31】

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 3 2】

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 3 3】

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 3 4】

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 3 5】

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 3 6】

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 3 7】

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 3 8】

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 3 9】

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 4 0】

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 4 1】

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 4 2】

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 4 3】

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 4 4】

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 4 5】

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 4 6】

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 4 7】

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 4 8】

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 49】

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 50】

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 51】

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 52】

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 53】

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 54】

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。