

【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18年2月9日(2006.2.9)

【公表番号】特表2001-526224(P2001-526224A)

【公表日】平成13年12月18日(2001.12.18)

【出願番号】特願2000-525105(P2000-525105)

【国際特許分類】

A 6 1 K	45/06	(2006.01)
A 6 1 K	31/337	(2006.01)
A 6 1 K	31/437	(2006.01)
A 6 1 K	31/444	(2006.01)
A 6 1 K	31/4545	(2006.01)
A 6 1 K	31/496	(2006.01)
A 6 1 K	31/675	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
C 0 7 D	401/12	(2006.01)
C 0 7 D	401/14	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	45/06
A 6 1 K	31/337
A 6 1 K	31/437
A 6 1 K	31/444
A 6 1 K	31/4545
A 6 1 K	31/496
A 6 1 K	31/675
A 6 1 P	35/00
C 0 7 D	401/12
C 0 7 D	401/14
A 6 1 K	31/444
A 6 1 K	45:00
A 6 1 K	31/4545
A 6 1 K	45:00
A 6 1 K	31/496
A 6 1 K	45:00

【手続補正書】

【提出日】平成17年12月14日(2005.12.14)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

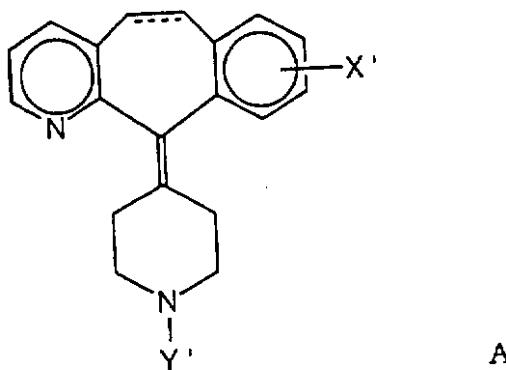
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 増殖性の疾患の処置を必要とする患者の増殖性の疾患を処置するための薬学的組成物であって、該薬学的組成物は、有効量の(1)FPTインヒビターを含有し;

但し、前記FPTインヒビターが以下の式の化合物である場合であって：

【化1】



ここで：

破線は、任意の2重結合を表し；

X'は水素またはハロであり；および

Y'は水素、-COOR'であり、ここでR'はC<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>アルキルまたは置換アルキル、フェニル、置換フェニル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>アリールアルキルまたは置換アリールアルキル、2-、3-、もしくは4-ピペリジルまたはN-置換ピペリジルであり、ここで前記置換されたC<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>アルキル上の前記置換基は、アミノおよび置換アミノから選択され、そして前記置換アミノ上の前記置換基は、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルから選択され、前記置換フェニルおよび前記C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>アリールアルキルの前記置換アリール部分上の前記置換基は、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルおよびハロから選択され、そして前記N-置換ピペリジル上の前記置換基は、C<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキル、または-SO<sub>2</sub>R'であり、ここでR'は、C<sub>1</sub>～C<sub>12</sub>アルキル、フェニル、置換フェニル、C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>アリールアルキルまたは置換アリールアルキルであり、ここで、前記置換フェニルおよび前記C<sub>7</sub>～C<sub>12</sub>アリールアルキルの前記置換アリール部分上の前記置換基は、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキルおよびハロから選択される、場合；

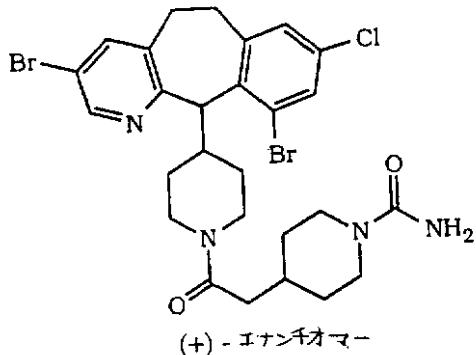
化学療法剤は、ビンカアルカロイド、エピポドフィロトキシン、アントラサイクリン抗生物質、アクチノマイシンD、プリカマイシン、ピューロマイシン、グラミシジンD、タキソール、コルヒチン、サイトカラシンB、エメチン、メイタンシン、およびアムサクリンからなる群から選択されず、

ここで、該FPTインヒビターは、抗腫瘍剤および/または放射線治療と、同時に、同時的にまたは逐次的に投与されるために処方される、

薬学的組成物。

【請求項2】増殖性の疾患の処置を必要とする患者の増殖性の疾患を処置するための薬学的組成物であって、該薬学的組成物は、有効量の(1)FPTインヒビター：

【化2】

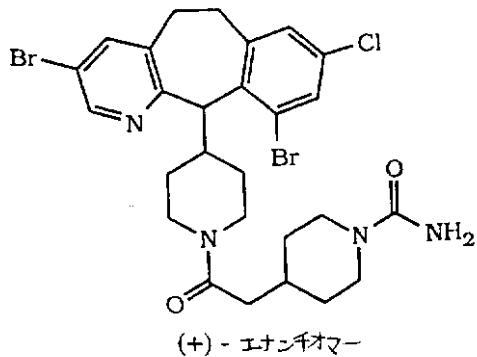


を含有し、ここで、該 FPT インヒビターは、抗腫瘍剤および／または放射線治療と、同時に、逐次的にまたは同時に投与されるために処方される、  
薬学的組成物。

【請求項 3】 増殖性の疾患の処置を必要とする患者の増殖性の疾患を処置するための薬学的組成物であって、該薬学的組成物は、同時に、同時にまたは逐次的に投与されるために処方される、有効量の(1) FPT インヒビターおよび(2)ゲムシタピンを含有する、薬学的組成物。

【請求項 4】 増殖性の疾患の処置を必要とする患者の増殖性の疾患を処置するための薬学的組成物であって、該薬学的組成物が、同時にまたは逐次的に投与されるために処方される、有効量の(1) FPT インヒビター：

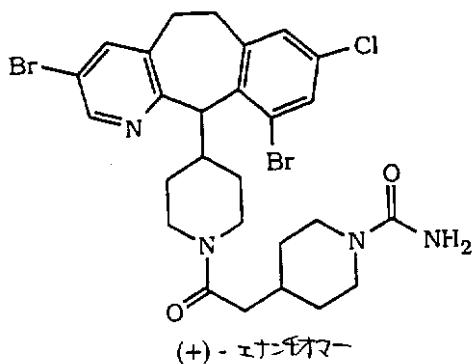
【化 3】



および(2)ゲムシタピンを含有する、薬学的組成物。

【請求項 5】 増殖性の疾患の処置を必要とする患者の増殖性の疾患を処置するための薬学的組成物であって、該薬学的組成物が、同時にまたは逐次的に投与されるために処方される、有効量の(1) FPT インヒビター：

【化 4】



および(2)微小管影響剤を含有する、薬学的組成物。

【請求項6】前記FPTインヒビターが、縮合環の三環式ベンゾシクロヘプタピリジン、オリゴペプチド、ペプチド-擬態化合物、ファルネシル化されたペプチド-擬態化合物、およびファルネシル誘導体からなる群から選択される、請求項1または3のいずれかに記載の薬学的組成物。

【請求項7】前記FPTインヒビターが、縮合環の三環式ベンゾシクロヘプタピリジンである、請求項6に記載の薬学的組成物。

【請求項8】前記増殖性の疾患が：肺ガン、膵臓ガン、結腸ガン、骨髓性白血病、黒色腫、濾胞性甲状腺ガン、膀胱ガン、神経膠腫、骨髓形成異常症候群、乳ガン、または前立腺ガンである、請求項1または2のいずれかに記載の薬学的組成物。

【請求項9】前記抗腫瘍剤が、ウラシルマスター、クロルメチニン、シクロホスファミド、イホスファミド、メルファラン、クロランブシル、ピポブロマン、トリエチレンメラミン、トリエチレンチオホスホラミン、ブスルファン、カルムスチン、ロムスチン、ストレプトゾシン、ダカルバジン、テモゾロミド、メトトレキセート、5-フルオロウラシル、フロクスウリジン、シタラビン、6-メルカブトブリニン、6-チオグアニン、フルダラビンホスフェート、ペントスタチン、ゲムシタビン、ビンプラスチン、ビンクリスチン、ビンデシン、ブレオマイシン、ダクチノマイシン、ダウノルビシン、ドキソルビシン、エピルビシン、イダルビシン、パクリタキセル、ミトラマイシン、デオキシコホルマイシン、マイトイマイシン-C、L-アスパラギナーゼ、インターフェロン、エトポシド、テニポシド、17-エチニルエストラジオール、ジエチルスチルベストロール、テストステロン、ブレドニゾン、フルオキシメステロン、ドロモスタノロンプロピオネート、テストラクトン、メゲストロールアセテート、タモキシフェン、メチルブレドニゾロン、メチルテストステロン、ブレドニゾロン、トリアムシノロン、クロロトリアニセン、ヒドロキシプロゲステロン、アミノグルテチミド、エストラムスチン、メドゴキシプロゲステロンアセテート、ロイプロリド、フルタミド、トレミフェン、ゴセレリン、シスプラチニン、カルボプラチニン、ヒドロキシ尿素、アムサクリニン、プロカルバジン、ミトタン、ミトザントロン、レバミゾール、ナベルベン(Navelbene)、CPT-11、アナストラジゾール(Anastrazole)、レトラゾール(Letrazole)、カペシタビン(Capcitabine)、レオキサフィン(Reloxafine)、ドロロキサフィン(Droloxafine)、またはヘキサメチルメラミンから選択される、請求項1に記載の薬学的組成物。

【請求項10】前記抗腫瘍剤が、5-フルオロウラシルである、請求項1または2のいずれかに記載の薬学的組成物。

【請求項11】前記抗腫瘍剤が、テモゾロミドである、請求項1または2のいずれかに記載の薬学的組成物。

【請求項12】前記放射線が、-線である、請求項1に記載の薬学的組成物。

【請求項13】前記抗腫瘍剤が、ウラシルマスター、クロルメチニン、シクロホスフ

アミド、イホスファミド、メルファラン、クロランブシル、ピポブロマン、トリエチレンメラミン、トリエチレンチオホスホラミン、ブスルファン、カルムスチン、ロムスチン、ストレプトゾシン、ダカルバジン、テモゾロミド、メトトレキセート、5-フルオロウラシル、フロクスウリジン、シタラビン、6-メルカプトプリン、6-チオグアニン、フルダラビンホスフェート、ペントスタチン、ゲムシタビン、ビンプラスチン、ビンクリスチン、ビンデシン、ブレオマイシン、ダクチノマイシン、ダウノルビシン、ドキソルビシン、エピルビシン、イダルビシン、パクリタキセル、ミトラマイシン、デオキシコホルマイシン、マイトマイシン-C、L-アスパラギナーゼ、インターフェロン、エトポシド、テニポシド、17-エチニルエストラジオール、ジエチルスチルベストロール、テストステロン、ブレドニゾン、フルオキシメステロン、ドロモスタノロンプロピオネート、テストラクトン、メゲストロールアセテート、タモキシフェン、メチルブレドニゾロン、メチルテストステロン、ブレドニゾロン、トリアムシノロン、クロロトリアニセン、ヒドロキシプログステロン、アミノグルテチミド、エストラムスチン、メドゴキシプログステロンアセテート、ロイブロリド、フルタミド、トレミフェン、ブセレリン、シスプラチン、カルボプラチン、ヒドロキシ尿素、アムサクリン、プロカルバジン、ミトタン、ミトザントロン、レバミゾール、ナベルベン、CPT-11、アナストラジゾール、レトラゾール、カペシタビン、レオキサフィン、ドロロキサフィン、またはヘキサメチルメラミンから選択される、請求項2に記載の薬学的組成物。

【請求項14】前記抗腫瘍剤が、シクロホスファミド、5-フルオロウラシル、またはビンクリスチンから選択される、請求項2に記載の薬学的組成物。

【請求項15】前記抗腫瘍剤が、シクロホスファミドである、請求項2に記載の薬学的組成物。

【請求項16】前記増殖性の疾患が、上皮ガンである、請求項3に記載の薬学的組成物。

【請求項17】前記増殖性の疾患が、前立腺ガン、肺ガン、または膵臓ガンである、請求項3または4のいずれかに記載の薬学的組成物。

【請求項18】前記増殖性の疾患が、膵臓ガンである、請求項3、4または5のいずれかに記載の薬学的組成物。

【請求項19】前記FPTインヒビターが、50~400mg/日の量で経口的に投与されるために処方され、そして前記ゲムシタビンが、4週間のうち3週間、1週間に750~1350mg/m<sup>2</sup>の量で投与されるために処方される、請求項4に記載の薬学的組成物。

【請求項20】前記抗腫瘍剤が、微小管影響剤である、請求項1に記載の薬学的組成物。

【請求項21】前記FPTインヒビターが、縮合環の三環式ベンゾシクロヘプタピリジン、オリゴペプチド、ペプチド-擬態化合物、ファルネシル化されたペプチド-擬態化合物、およびファルネシル誘導体からなる群から選択される、請求項20に記載の薬学的組成物。

【請求項22】前記FPTインヒビターが、縮合環の三環式ベンゾシクロヘプタピリジンである、請求項21に記載の薬学的組成物。

【請求項23】前記微小管影響剤が、パクリタキセルまたはパクリタキセル誘導体である、請求項5または20のいずれかに記載の薬学的組成物。

【請求項24】前記微小管影響剤が、タキソテールである、請求項20に記載の薬学的組成物。

【請求項25】前記増殖性の疾患が、前立腺ガン、肺ガン、膵臓ガン、結腸ガン、または膀胱ガンである、請求項20に記載の薬学的組成物。

【請求項26】前記増殖性の疾患が、前立腺ガンである、請求項5または20のいずれかに記載の薬学的組成物。

【請求項27】前記増殖性の疾患が、肺ガンである、請求項5または20のいずれかに記載の薬学的組成物。

【請求項 28】 前記増殖性の疾患が、脾臓ガンである、請求項20に記載の薬学的組成物。