

【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】

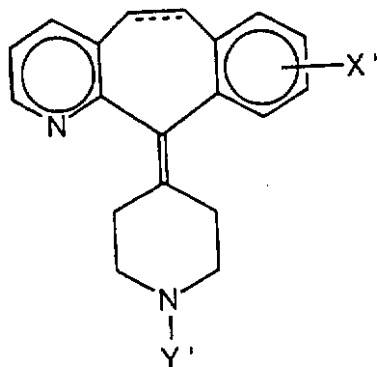
【特許請求の範囲】

【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) F P T インヒビターを含有し

；

但し、前記 F P T 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】



A

ここで：

破線は、任意の2重結合を表し；

X' は水素またはハロゲンであり；および

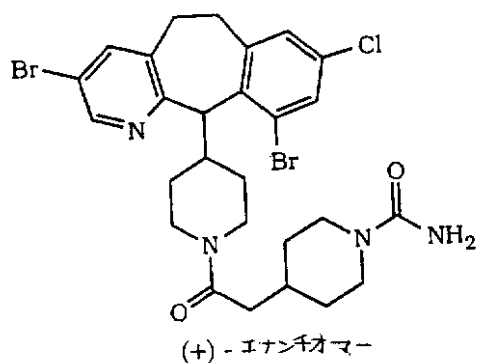
Y' は水素、-COOR'であり、ここでR'はC₁～C₁₂アルキルまたは置換アルキル、フェニル、置換フェニル、C₇～C₁₂アリールアルキルまたは置換アリールアルキル、2-、3-、もしくは4-ピペリジルまたはN-置換ピペリジルであり、ここで前記置換されたC₁～C₁₂アルキル上の前記置換基は、アミノおよび置換アミノから選択され、そして前記置換アミノ上の前記置換基は、C₁～C₆アルキルから選択され、前記置換フェニルおよび前記C₇～C₁₂アリールアルキルの前記置換アリール部分上の前記置換基は、C₁～C₆アルキルおよびハロゲンから選択され、そして前記N-置換ピペリジル上の前記置換基は、C₁～C₄アルキル、または-SO₂R'であり、ここでR'は、C₁～C₁₂アルキル、フェニル、置換フェニル、C₇～C₁₂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C₇～C₁₂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、C₁～C₆アルキルおよびハロゲンから選択される、場合；

化学療法剤は、ビンカルカロイド、エ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】

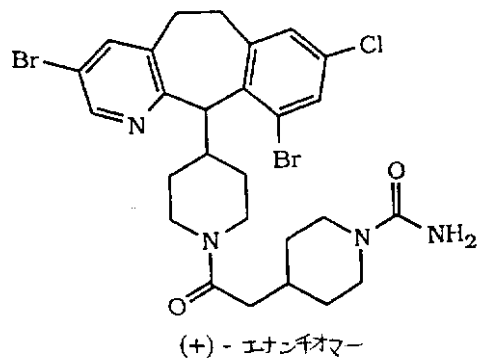


を含有し、ここで、該 F P T インヒビターは、抗腫瘍剤および / または放射線治療と、同時に、逐次的にまたは同時に投与されるために処方される、薬学的組成物。

【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) F P T 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) F P T インヒビター：

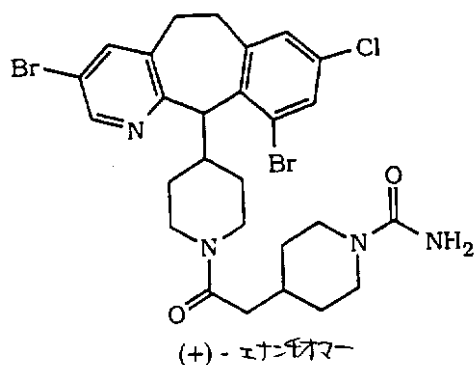
【化 3】



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) F P T 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、骨髄性白血病、黒色腫、濾胞性甲状腺ガン、膀胱ガン、神経膠腫、骨髄形成異常症候群、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、ウラシルマスタード、クロルメチン、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、ピポプロマン、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、ビンブラスチン、ピンクリスチン、ビンデシン、プレオマイシン、ダクチノマイシン、ダウノルビシン、ドキソルビシン、エビルビシン、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、プレドニゾン、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、メチルプレドニゾロン、メチルテストステロン、プレドニゾロン、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(Navelbene)、CPT-11、アナストラジゾール(Anastrozole)、レトラゾール(Letrozole)、カペシタビン(Capécitabine)、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、 γ -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、ウラシルマスタード、クロルメチン、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、シタラピン、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、ゲムシタピン、ピンブラスチン、ピンクリスチン、ビンデシン、プレオマイシン、ダクチノマイシン、ダウノルピシン、ドキソルピシン、エビルピシン、イダルピシン、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、プレドニゾン、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、メチルプレドニゾロン、メチルテストステロン、プレドニゾロン、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、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、ナベルペン、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、またはピ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 F P T インヒビターが、50 ~ 400 mg / 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ピンが、4 週間のうち 3 週間、1 週間に 750 ~ 1350 mg / m² 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 F P T 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 F P T 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。