

【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6月1日(2006.6.1)

【公表番号】特表2002-517449(P2002-517449A)

【公表日】平成14年6月18日(2002.6.18)

【出願番号】特願2000-553081(P2000-553081)

【国際特許分類】

A 6 1 K	38/22	(2006.01)
A 6 1 K	31/566	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 K	38/00	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	37/24	
A 6 1 K	31/566	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 K	37/02	

【手続補正書】

【提出日】平成18年4月3日(2006.4.3)

【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】 i ) スルファメート基を含む化合物(「スルファメート化合物」)；および ii ) 生物学的応答修飾因子を含む、組成物。

【請求項2】 前記生物学的応答修飾因子がサイトカインである、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】 前記サイトカインが腫瘍壊死因子(TNF)である、請求項2に記載の組成物。

【請求項4】 前記スルファメート化合物が、エストロンスルファターゼ(E.C.3.1.6.2)のインヒビターとしての使用に適切である、請求項1～3のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項5】 前記スルファメート化合物上のスルファメート基が、スルフェート基で置換されスルフェート化合物を形成するとき、該スルフェート化合物が、ステロイドスルファターゼ酵素(E.C.3.1.6.2)により加水分解される、請求項1～4のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項6】 前記スルファメート化合物上のスルファメート基が、スルフェート基で置換されスルフェート化合物を形成し、そしてステロイドスルファターゼ酵素(E.C.3.1.6.2)とpH7.4および37℃でインキュベートしたとき、50mMより小さいK<sub>m</sub>値を提供する、請求項1～5のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項7】 前記スルファメート化合物上のスルファメート基が、スルフェート基で置換されスルフェート化合物を形成し、そしてステロイドスルファターゼ酵素(E.C.3.1.6.2)とpH7.4および37℃でインキュベートしたとき、50μMより小さいK<sub>m</sub>値を提供する、請求項1～6のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項8】 前記スルファメート化合物が環状化合物である、請求項1～7のいず

れか 1 項に記載の組成物。

【請求項 9】 前記スルファメート化合物が多環式化合物である、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 10】 前記スルファメート化合物がステロイド構造を有する、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 11】 前記スルファメート化合物が、ステロイド核の A 環の 3 位に結合している少なくとも 1 つのスルファメート基を有する、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 12】 前記スルファメート化合物が、好ましくは式 C<sub>1-6</sub>O の基である、少なくとも 1 つのオキシヒドロカルビル基を含む、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 13】 前記の基 C<sub>1-6</sub>O が、ステロイド核の A 環の 2 位に結合している、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 14】 前記スルファメート化合物のスルファメート基が以下の式を有する、請求項 1 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の組成物：

【化 1】

ここで、R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> の各々が独立して H またはヒドロカルビル基から選択される。

【請求項 15】 前記スルファメート化合物が、オキシヒドロカルビルステロイドスルファメート化合物（好ましくは 2 - メトキシエストロン - 3 - O - スルファメート）、またはその薬学的に活性な塩である、請求項 1 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 16】 前記組成物が、薬学的に受容可能なキャリア、希釈剤、または賦形剤をさらに含む、請求項 1 ~ 15 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 17】 スルファメート基を含む前記化合物が 2 - メトキシエストロン - 3 - O - スルファメートであり、そして前記生物学的応答修飾因子が腫瘍壞死因子（TNF - ）である、請求項 1 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 18】 医薬における使用のための、請求項 1 ~ 17 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 19】 腫瘍増殖を予防および / または阻害するための医薬の製造における、請求項 1 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の組成物の使用。

【請求項 20】 腫瘍によるグルコース取り込みを予防または抑制すること；

腫瘍血管形成を予防および / または阻害すること；

微小管を破壊すること；

アポトーシスを誘導すること、

のいずれか 1 つ以上を行う医薬の製造における、請求項 1 ~ 19 のいずれか 1 項に記載の組成物の使用。

【請求項 21】 腫瘍によるグルコース取り込みを予防または抑制すること；

腫瘍血管形成を予防および / または阻害すること；

微小管を破壊すること；

アポトーシスを誘導すること、

のいずれか 1 つ以上を行う医薬の製造における、オキシヒドロカルビルステロイドスルファメート化合物の使用。

【請求項 22】 腫瘍によるグルコース取り込みを予防または抑制し；および / または腫瘍血管形成を予防および / または阻害し；および / または微小管を破壊し；および / またはアポトーシスを誘導するための組成物であって、該組成物は、請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 項に記載の組成物であるか、またはオキシヒドロカルビルステロイドスルファメート化合物を含む、組成物。

【請求項 23】 ホルモン活性に影響し得、そして免疫応答に影響し得る組成物であって、請求項 1 ~ 22 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 24】 本明細書に実質的に記載されているとおりの組成物。