

【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 pH 7.4 および 37 でインキュベートしたとき、50 mM より小さい K_m 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 pH 7.4 および 37 でインキュベートしたとき、50 μ M より小さい K_m 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

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 $C_{1-6}O$ 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 $C_{1-6}O$ 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_1 および R_2 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壊死因子（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。