

【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22年2月12日(2010.2.12)

【公表番号】特表2009-511609(P2009-511609A)

【公表日】平成21年3月19日(2009.3.19)

【年通号数】公開・登録公報2009-011

【出願番号】特願2008-535845(P2008-535845)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/568 (2006.01)
A 6 1 K 45/00 (2006.01)
A 6 1 K 31/566 (2006.01)
A 6 1 K 31/4196 (2006.01)
A 6 1 K 31/4355 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 9/08 (2006.01)
A 6 1 P 19/10 (2006.01)
A 6 1 P 15/10 (2006.01)
A 6 1 P 3/04 (2006.01)
A 6 1 P 15/00 (2006.01)
A 6 1 P 25/20 (2006.01)
A 6 1 P 25/04 (2006.01)
A 6 1 P 19/02 (2006.01)
A 6 1 P 11/04 (2006.01)
A 6 1 P 25/24 (2006.01)
A 6 1 P 1/14 (2006.01)
A 6 1 P 9/12 (2006.01)
A 6 1 P 25/22 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/568
A 6 1 K 45/00
A 6 1 K 31/566
A 6 1 K 31/4196
A 6 1 K 31/4355
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 9/08
A 6 1 P 19/10
A 6 1 P 15/10
A 6 1 P 3/04
A 6 1 P 15/00
A 6 1 P 25/20
A 6 1 P 25/04
A 6 1 P 19/02
A 6 1 P 11/04
A 6 1 P 25/24
A 6 1 P 1/14
A 6 1 P 9/12
A 6 1 P 25/22

【手続補正書】

【提出日】平成21年12月3日(2009.12.3)

【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】

乳癌と診断された対象におけるアロマターゼ阻害剤での治療に付随する1種以上の副作用を改善するための医薬組成物であって、(a)有効量のアンドロゲン剤及び(b)有効量のアロマターゼ阻害剤、並びに任意選択で医薬として許容し得る賦形剤及び/又は担体を含有する、前記医薬組成物。

【請求項2】

前記アンドロゲン剤が、テストステロン、メチルテストステロン、アンドロステンジオール、アンドロステンジオール-3-アセテート、アンドロステンジオール-17-アセテート、アンドロステンジオール-3,17-ジアセテート、アンドロステンジオール-17-ベンゾエート、アンドロステンジオール-3-アセテート-17-ベンゾエート、アンドロステンジオン、アドレノステロン、酢酸アンドロステロン、プロピオン酸アンドロステロン、安息香酸アンドロステロン、デヒドロエピアンドロステロン、デヒドロエピアンドロステロン硫酸ナトリウム、オキシメトロン、フルオキシメステロン、メタンドロステノロン、テストラクトン、プレグネノロン、17-メチルノルテストステロン、ノルエタンドロロン、ジヒドロテストステロン、5-ジヒドロテストステロン、ドロモスタノロン、プロピオン酸ドロモスタノロン、ナンドロロン、フェンプロピオン酸ナンドロロン、デカン酸ナンドロロン、フリルプロピオン酸ナンドロロン、シクロヘキサンプロピオン酸ナンドロロン、安息香酸ナンドロロン、シクロヘキサンカルボン酸ナンドロロン、ダナゾール、オキシメトロン、アンドロステロン、スタノゾロール、エチルエストレノール、オキサンドロロン、ボラステロン、メステロロン、プロピオン酸テストステロン、シピオン酸テストステロン、フェニル酢酸テストステロン、エナント酸テストステロン、酢酸テストステロン、テストステロンブシクラート、ヘプタン酸テストステロン、デカン酸テストステロン、ウンデカン酸テストステロン、カプリン酸テストステロン、イソカプリン酸テストステロン、並びに前記化合物の任意の異性体、代謝産物、誘導体及び前駆体、並びにこれらの組合せからなる群から選択される、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項3】

前記アンドロゲン剤が、テストステロンである、請求項2記載の医薬組成物。

【請求項4】

前記アンドロゲン剤が、ウンデカン酸テストステロンである、請求項2記載の医薬組成物。

【請求項5】

前記有効量が、1日当たり約40mgである、請求項4記載の医薬組成物。

【請求項6】

前記アンドロゲン剤が、メチルテストステロンである、請求項2記載の医薬組成物。

【請求項7】

前記アンドロゲン剤が、DHTである、請求項2記載の医薬組成物。

【請求項8】

前記アロマターゼ阻害剤が、ステロイド性アロマターゼ阻害剤、又はその異性体である、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項9】

前記ステロイド性アロマターゼ阻害剤が、エキセメスタン又はフォルメスタンからなる群から選択される、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項10】

前記アロマターゼ阻害剤が、非ステロイド性アロマターゼ阻害剤、又はその異性体である、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項11】

前記非ステロイド性アロマターゼ阻害剤が、アナストロゾール、レトロゾール、ボロゾール又はファドロゾールからなる群から選択される、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項12】

前記非ステロイド性アロマターゼ阻害剤が、アナストロゾールである、請求項11記載の医薬組成物。

【請求項13】

前記有効量が、1日当たり約1mgである、請求項12記載の医薬組成物。

【請求項14】

(a)有効量が約40mgであるウンデカン酸テストステロン、及び(b)有効量が約1mgであるアナストロゾールを含有する、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項15】

前記副作用が、血管拡張、骨粗鬆症、骨減少症、性欲減退、体重増加、膣乾燥、睡眠障害、寝汗、無気力、疼痛性交、疼痛、関節炎、関節痛、乳房痛、咽頭炎、抑鬱、腹部膨満、恶心、発疹、気分動搖、頭痛、高血圧、不眠、リンパ浮腫、背部痛、末梢性浮腫、冷汗、腹部痛、損傷、便秘、咳、下痢、骨折、高コレステロール血症、感染症、関節症、めまい、呼吸困難、感覚異常、尿路感染症、外陰腔炎、不安、骨痛、胸部痛、消化不良、インフルエンザ症候群、胃腸障害、発汗及び帯下を含む、請求項1~14のいずれか一項記載の医薬組成物。

【請求項16】

乳癌と診断された対象におけるアロマターゼ阻害剤での治療に付随する1種以上の副作用を改善するための医薬組成物であって、有効量のアンドロゲン剤、並びに任意選択で医薬として許容し得る賦形剤及び/又は担体を含有する、前記医薬組成物。

【請求項17】

前記アンドロゲン剤が、テストステロン、メチルテストステロン、アンドロステンジオール、アンドロステンジオール-3-アセテート、アンドロステンジオール-17-アセテート、アンドロステンジオール-3,17-ジアセテート、アンドロステンジオール-17-ベンゾエート、アンドロステンジオール-3-アセテート-17-ベンゾエート、アンドロステンジオン、アドレノステロン、酢酸アンドロステロン、プロピオン酸アンドロステロン、安息香酸アンドロステロン、デヒドロエピアンドロステロン、デヒドロエピアンドロステロン硫酸ナトリウム、オキシメトロン、フルオキシメステロン、メタンドロステノロン、テストラクトン、プレグネノロン、17-メチルノルテストステロン、ノルエタンドロロン、ジヒドロテストステロン、5-ジヒドロテストステロン、ドロモスタノロン、プロピオン酸ドロモスタノロン、ナンドロロン、フェンプロピオン酸ナンドロロン、デカン酸ナンドロロン、フリルプロピオン酸ナンドロロン、シクロヘキサンプロピオン酸ナンドロロン、安息香酸ナンドロロン、シクロヘキサンカルボン酸ナンドロロン、ダナゾール、オキシメトロン、アンドロステロン、スタノゾロール、エチルエストレノール、オキサンドロロン、ボラステロン、メステロロン、プロピオン酸テストステロン、シビオン酸テストステロン、フェニル酢酸テストステロン、エナント酸テストステロン、酢酸テストステロン、テストステロンブシクラート、ヘプタン酸テストステロン、デカン酸テストステロン、ウンデカン酸テストステロン、カプリン酸テストステロン、イソカプリン酸テストステロン、並びに前記化合物の任意の異性体、代謝産物、誘導体及び前駆体、並びにこれらの組合せからなる群から選択される、請求項16記載の医薬組成物。

【請求項18】

前記アンドロゲン剤が、テストステロンである、請求項17記載の医薬組成物。

【請求項19】

前記アンドロゲン剤が、ウンデカン酸テストステロンである、請求項18記載の医薬組成物。

【請求項 20】

前記有効量が、1日当たり約40mgである、請求項19記載の医薬組成物。

【請求項 21】

前記アンドロゲン剤が、メチルテストステロンである、請求項17記載の医薬組成物。

【請求項 22】

前記アンドロゲン剤が、DHTである、請求項17記載の医薬組成物。

【請求項 23】

前記副作用が、血管拡張、骨粗鬆症、骨減少症、性欲減退、体重増加、膣乾燥、睡眠障害、寝汗、無気力、疼痛性交、疼痛、関節炎、関節痛、乳房痛、咽頭炎、抑鬱、腹部膨満、恶心、発疹、気分動搖、頭痛、高血圧、不眠、リンパ浮腫、背部痛、末梢性浮腫、冷汗、腹部痛、損傷、便秘、咳、下痢、骨折、高コレステロール血症、感染症、関節症、めまい、呼吸困難、感覚異常、尿路感染症、外陰膿炎、不安、骨痛、胸部痛、消化不良、インフルエンザ症候群、胃腸障害、発汗及び帯下を含む、請求項16～22のいずれか一項記載の医薬組成物。

【請求項 24】

乳癌と診断された対象におけるアロマターゼ阻害剤での治療に付随する1種以上の副作用を改善する方法であって、前記対象に請求項1～14及び16～22のいずれか一項記載の医薬組成物を投与することを含む、前記方法。

【請求項 25】

アンドロゲン剤及びアロマターゼ阻害剤のどちらか又は双方が、経口、腹腔内、皮内、経皮、経粘膜、皮下、舌下、静脈内、動脈内、腔内、頭蓋内、筋内、非経口又は局所、或いはこれらの組合せで投与される、請求項24記載の方法。

【請求項 26】

前記医薬組成物が、経口で投与される、請求項25記載の方法。

【請求項 27】

前記医薬組成物が、錠剤として投与される、請求項26記載の方法。

【請求項 28】

前記錠剤が、1日1回投与される、請求項27記載の方法。

【請求項 29】

前記副作用が、血管拡張、骨粗鬆症、骨減少症、性欲減退、体重増加、膣乾燥、睡眠障害、寝汗、無気力、疼痛性交、疼痛、関節炎、関節痛、乳房痛、咽頭炎、抑鬱、腹部膨満、恶心、発疹、気分動搖、頭痛、高血圧、不眠、リンパ浮腫、背部痛、末梢性浮腫、冷汗、腹部痛、損傷、便秘、咳、下痢、骨折、高コレステロール血症、感染症、関節症、めまい、呼吸困難、感覚異常、尿路感染症、外陰膿炎、不安、骨痛、胸部痛、消化不良、インフルエンザ症候群、胃腸障害、発汗及び帯下を含む、請求項24記載の方法。

【請求項 30】

前記対象が、閉経後の女性である、請求項24記載の方法。

【請求項 31】

乳癌を有する対象の健康状態を改善する方法であって、前記対象が、アロマターゼ阻害剤での治療に付随する副作用を有し、請求項1～14及び16～22のいずれか一項記載の医薬組成物を投与することを含む、前記方法。

【請求項 32】

アンドロゲン剤及びアロマターゼ阻害剤のどちらか又は双方が、経口、腹腔内、皮内、経皮、経粘膜、皮下、舌下、静脈内、動脈内、腔内、頭蓋内、筋内、非経口又は局所、或いはこれらの組合せで投与される、請求項31記載の方法。

【請求項 33】

前記医薬組成物が、経口で投与される、請求項32記載の方法。

【請求項 34】

前記医薬組成物が、錠剤として投与される、請求項33記載の方法。

【請求項 35】

前記錠剤が、1日1回投与される、請求項34記載の方法。

【請求項36】

前記副作用が、血管拡張、骨粗鬆症、骨減少症、性欲減退、体重増加、膣乾燥、睡眠障害、寝汗、無気力、疼痛性交、疼痛、関節炎、関節痛、乳房痛、咽頭炎、抑鬱、腹部膨満、恶心、発疹、気分動搖、頭痛、高血圧、不眠、リンパ浮腫、背部痛、末梢性浮腫、冷汗、腹部痛、損傷、便秘、咳、下痢、骨折、高コレステロール血症、感染症、関節症、めまい、呼吸困難、感覚異常、尿路感染症、外陰腫脹、不安、骨痛、胸部痛、消化不良、インフルエンザ症候群、胃腸障害、発汗及び帯下を含む、請求項31記載の方法。

【請求項37】

前記対象が、閉経後の女性である、請求項31記載の方法。

【請求項38】

請求項1～14及び16～22のいずれか一項記載の医薬組成物の製造方法であって、アンドロゲン剤を選択することを含む、前記方法。

【請求項39】

アロマターゼ阻害剤を加えることをさらに含む、請求項38記載の方法。

【請求項40】

乳癌と診断された対象におけるアロマターゼ阻害剤での治療に付随する1種以上の副作用を改善するためのキットであって、(a)アンドロゲン剤及び(b)アロマターゼ阻害剤、並びに任意選択で化合物(a)及び(b)を投与するための説明書を含む、前記キット。

【請求項41】

前記アンドロゲン剤が、テストステロン、メチルテストステロン、アンドロステンジオール、アンドロステンジオール-3-アセテート、アンドロステンジオール-17-アセテート、アンドロステンジオール-3,17-ジアセテート、アンドロステンジオール-17-ベンゾエート、アンドロステンジオール-3-アセテート-17-ベンゾエート、アンドロステンジオン、アドレノステロン、酢酸アンドロステロン、プロピオン酸アンドロステロン、安息香酸アンドロステロン、デヒドロエピアンドロステロン、デヒドロエピアンドロステロン硫酸ナトリウム、オキシメトロン、フルオキシメステロン、メタンドロステノロン、テストラクトン、プレグネノロン、17-メチルノルテストステロン、ノルエタンドロロン、ジヒドロテストステロン、5-ジヒドロテストステロン、ドロモスタノロン、プロピオン酸ドロモスタノロン、ナンドロロン、フェンプロピオン酸ナンドロロン、デカン酸ナンドロロン、フリルプロピオン酸ナンドロロン、シクロヘキサンプロピオン酸ナンドロロン、安息香酸ナンドロロン、シクロヘキサンカルボン酸ナンドロロン、ダナゾール、オキシメトロン、アンドロステロン、スタノゾロール、エチルエストレノール、オキサンドロロン、ボラステロン、メステロロン、プロピオン酸テストステロン、シビオン酸テストステロン、フェニル酢酸テストステロン、エナント酸テストステロン、酢酸テストステロン、テストステロンブシクラート、ヘプタン酸テストステロン、デカン酸テストステロン、ウンデカン酸テストステロン、カプリン酸テストステロン、イソカプリン酸テストステロン、並びに前記化合物の任意の異性体、代謝産物、誘導体及び前駆体、並びにこれらの組合せからなる群から選択される、請求項40記載のキット。

【請求項42】

前記アンドロゲン剤が、テストステロンである、請求項41記載のキット。

【請求項43】

前記アンドロゲン剤が、ウンデカン酸テストステロンである、請求項42記載のキット。

【請求項44】

前記アンドロゲン剤が、メチルテストステロンである、請求項42記載のキット。

【請求項45】

前記アンドロゲン剤が、DHTである、請求項42記載のキット。

【請求項46】

前記アロマターゼ阻害剤が、ステロイド性アロマターゼ阻害剤、又はその異性体である、請求項40記載のキット。

【請求項 4 7】

前記ステロイド性アロマターゼ阻害剤が、エキセメスタン又はフォルメスタンからなる群から選択される、請求項46記載のキット。

【請求項 4 8】

前記アロマターゼ阻害剤が、非ステロイド性アロマターゼ阻害剤、又はその異性体である、請求項40記載のキット。

【請求項 4 9】

前記非ステロイド性アロマターゼ阻害剤が、アナストロゾール、レトロゾール、ボロゾール又はファドロゾールからなる群から選択される、請求項48記載のキット。

【請求項 5 0】

前記非ステロイド性アロマターゼ阻害剤が、アナストロゾールである、請求項49記載のキット。

【請求項 5 1】

前記副作用が、血管拡張、骨粗鬆症、骨減少症、性欲減退、体重増加、膣乾燥、睡眠障害、寝汗、無気力、疼痛性交、疼痛、関節炎、関節痛、乳房痛、咽頭炎、抑鬱、腹部膨満、恶心、発疹、気分動搖、頭痛、高血圧、不眠、リンパ浮腫、背部痛、末梢性浮腫、冷汗、腹部痛、損傷、便秘、咳、下痢、骨折、高コレステロール血症、感染症、関節症、めまい、呼吸困難、感覚異常、尿路感染症、外陰膿炎、不安、骨痛、胸部痛、消化不良、インフルエンザ症候群、胃腸障害、発汗及び/又は帯下を含む、請求項40記載のキット。

【請求項 5 2】

前記アロマターゼ阻害剤での治療が、既に化学療法を受けた前記対象へのアジュvant療法での治療である、請求項1～14及び16～22のいずれか一項記載の医薬組成物。

【請求項 5 3】

前記アロマターゼ阻害剤での治療が、既に化学療法を受けた前記対象へのアジュvant療法での治療である、請求項24記載の方法。

【請求項 5 4】

前記アロマターゼ阻害剤での治療が、既に化学療法を受けた前記対象へのアジュvant療法での治療である、請求項31記載の方法。

【請求項 5 5】

請求項1～14及び16～22のいずれか一項記載の医薬組成物を投与することを含む、アロマターゼ阻害剤の効果の増強方法。

【請求項 5 6】

乳癌と診断された対象におけるアロマターゼ阻害剤での治療に付随する1種以上の副作用を改善するための医薬組成物であって、(a)有効量のアンドロゲン剤、及び(b)有効量の、テストステロンからエストラジオールへの変換を遮断する薬剤を含有する、前記医薬組成物。

【請求項 5 7】

乳癌と診断された対象におけるアロマターゼ阻害剤での治療に付随する1種以上の副作用を改善する方法であって、請求項56記載の医薬組成物を投与することを含む、前記方法。

【請求項 5 8】

請求項1～14及び16～22のいずれか一項記載の医薬組成物を投与することを含む、アンドロゲン剤のバイオアベイラビリティーの増加方法。

【請求項 5 9】

前記アンドロゲン剤が、テストステロンである、請求項52記載の方法。

【請求項 6 0】

前記アロマターゼ阻害剤が、アナストロゾールである、請求項53記載の方法。

【請求項 6 1】

前記アロマターゼ阻害剤が、前記テストステロンからエストロゲンへの変換を遮断する、請求項53記載の方法。

【請求項 6 2】

前記変換が、小腸リンパ管及び肝臓中で遮断される、請求項55記載の方法。