

【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16年12月9日(2004.12.9)

【公表番号】特表2000-508643(P2000-508643A)

【公表日】平成12年7月11日(2000.7.11)

【出願番号】特願平9-536454

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 31/565

A 6 1 K 31/17

A 6 1 K 31/475

A 6 1 K 31/513

A 6 1 K 31/517

A 6 1 K 31/675

A 6 1 K 31/7064

【F I】

A 6 1 K 31/565

A 6 1 K 31/17

A 6 1 K 31/475

A 6 1 K 31/505 6 0 2

A 6 1 K 31/505 6 0 5

A 6 1 K 31/675

A 6 1 K 31/70 6 1 7

【手続補正書】

【提出日】平成16年4月1日(2004.4.1)

【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】

手続補正書

平成16年4月1日



特許庁長官 殿

1. 事件の表示

平成9年特許願第536454号

2. 補正をする者

住所 アメリカ合衆国 バージニア 23227, リッチモンド,  
ブロック ロード 3219

名称 ロリア, ロジャー エム.

3. 代理人

住所 〒540-6015 大阪府大阪市中央区城見一丁目2番27号  
クリスタルタワー15階

氏名 (7828) 弁理士 山本 秀策

電話 (大阪) 06-6949-3910



4. 補正対象書類名

請求の範囲

5. 補正対象項目名

請求の範囲

6. 補正の内容

請求の範囲を別紙のとおり補正します。

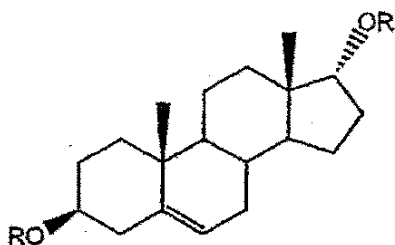


特許



## 請求の範囲

1. 1つ以上のキャリアならびに以下の式の $3\beta$ ,  $17\alpha$ -ジヒドロキシアンドロステ-5-エンおよびそのエステルまたはエーテルからなる群から選択される化合物を含む薬学的処方物であって：



ここで、Rは、H、独立して、2～8炭素のアルケニル、1～8炭素のアルキル、アルキルが1～4炭素を有するフェニルアルキル、フェニルまたはCOR<sub>2</sub>であり、ここで、R<sub>2</sub>は、H、1～8炭素のアルキル、2～8炭素のアルケニル、アルキルが1～4炭素を有するフェニルアルキル（ベンジルを含む）、またはフェニルであり、そして任意のフェニル部分は、3つまでの以下から独立して選択された置換基を有し得る：ヒドロキシ、1～4炭素のカルボキシ、ハロ、1～4炭素のアルコキシ、1～4炭素のアルキル、または2～4炭素のアルケニル、ここで任意のアルキルは、直鎖、分枝鎖であり得、あるいは該アルキルは、全体的にまたは部分的に環化され得る、処方物。

2. 前記薬学的処方物が全身投与に適応される、請求項1に記載の薬学的処方物。

3. 前記薬学的処方物が、経口送達、非経口送達、頬送達、舌下送達、陰送達、頸部送達、直腸送達、鼻腔送達、噴霧送達、ミスト送達または洞送達に適応される、請求項1に記載の薬学的処方物。

4. 前記化合物が、 $3\beta$ ,  $17\alpha$ -ジヒドロキシアンドロステ-5-エンである、請求項1、2または3に記載の薬学的処方物。

5. 錠剤、カプセルまたは滅菌液体の形態の、請求項1、2または3に記載の薬学的処方物。

6. 前記滅菌液体が、等張性溶液である、請求項5に記載の薬学的処方物。

7. 前記薬学的処方物が、シクロデキストリン封入複合体中の化合物を含む、請求項5に記載の薬学的処方物。

8. 容器中の単位投薬形態の形態である、請求項1、2または3に記載の薬学的処方物。

9. 前記化合物が、固体支持体上にある、請求項1に記載の薬学的処方物。

10. 皮膚に適用するためのパッチまたはスポンジの形態である、請求項9に記載の薬学的処方物。

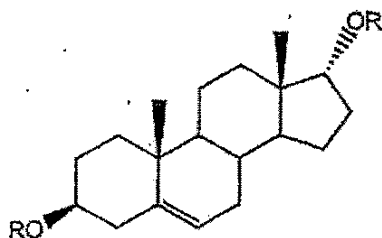
11. 前記キャリアが、グリコール、ポリエチレングリコール、ポリプロピレングリコール、プロピレングリコール、エタノール、DMSO、シクロデキストリン、TweenおよびSpanのうちの1つ以上を含む、請求項1、2または3に記載の薬学的処方物。

12. 第2の活性剤として、第2の抗癌剤をさらに含む、請求項1、2または3に記載の薬学的処方物。

13. 前記第2の抗癌剤が、抗アンドロゲン、抗エストロゲン、尿素、アルキル化剤、代謝拮抗剤、DNAインターカレート剤、インターフェロン、インターロイキン、核酸インヒビター、白金剤、コルチコステロイド、アスパラギナーゼ、

ピンカアルカロイドまたはRU486である、請求項12に記載の薬学的処方物。

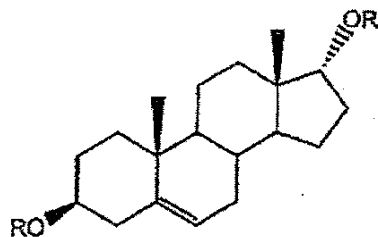
14. 医薬の調製のための化合物の使用であって、該化合物が、以下の式の3β, 17α-ジヒドロキシアンドロステ-5-エンおよびそのエステルまたはエーテルからなる群から選択され:



ここで、Rは、独立して、H、2～8炭素のアルケニル、1～8炭素のアルキル、アルキルが1～4炭素を有するフェニルアルキル、フェニルまたはCOR<sub>2</sub>であり、ここで、R<sub>2</sub>は、H、1～8炭素のアルキル、2～8炭素のアルケニル、アルキルが1～4炭素を有するフェニルアルキル（ベンジルを含む）、またはフェニルであり、そして任意のフェニル部分は、3つまでの以下から独立して選択された置換基を有し得る：ヒドロキシ、1～4炭素のカルボキシ、ハロ、1～4炭素のアルコキシ、1～4炭素のアルキル、または2～4炭素のアルケニル、ここで任意のアルキルは、直鎖、分枝鎖であり得、あるいは該アルキルは、全体的にまたは部分的に環化され得る、使用。

15. 前記化合物が、3β, 17α-ジヒドロキシアンドロステ-5-エンである、請求項14に記載の使用。

16. ヒトまたは動物の癌を予防または処置するための医薬の調製のための化合物の使用であって、該医薬が、以下の式の3β, 17α-ジヒドロキシアンドロステ-5-エンおよびそのエステルまたはエーテルからなる群から選択される有効量の化合物を含み:



ここで、Rは、独立して、H、2～8炭素のアルケニル、1～8炭素のアルキル、アルキルが1～4炭素を有するフェニルアルキル、フェニルまたはCOR<sub>2</sub>であり、ここで、R<sub>2</sub>は、H、1～8炭素のアルキル、2～8炭素のアルケニル、アルキルが1～4炭素を有するフェニルアルキル（ベンジルを含む）、またはフェニルであり、そして任意のフェニル部分は、3つまでの以下から独立して選択された置換基を有し得る：ヒドロキシ、1～4炭素のカルボキシ、ハロ、1～4炭素のアルコキシ、1～4炭素のアルキル、または2～4炭素のアルケニル、ここで任意のアルキルは、直鎖、分枝鎖であり得、あるいは該アルキルは、全体的にまたは部分的に環化され得る、使用。

17. 請求項16に記載の使用であって、前記動物が、ヒトであり、そして前記癌が、血液形成器官もしくは感覚器官の癌、または肝臓、結腸、膵臓、甲状腺、副腎、下垂体、卵巣、精巣、乳房、中枢神経系、骨、結合組織、肺、肝臓、胃腸系、子宮、粘膜、口、舌、腹膜壁もしくはリンパ系の癌である、使用。

18. 前記癌が、肺癌、乳癌または肝臓癌である、請求項17に記載の使用。

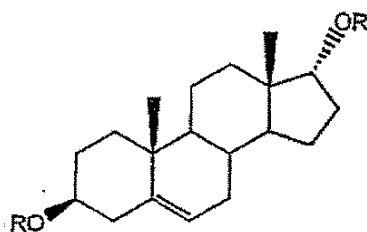
19. 前記化合物が、3β, 17α-ジヒドロキシアンドロステ-5-エンである、請求項16、17または18に記載の使用。

20. 第2の活性剤としての第2の抗癌剤の使用をさらに含む、請求項16、17、18または19に記載の使用。

21. 前記第2の抗癌剤が、抗アンドロゲン、抗エストロゲン、尿素、アルキル化剤、代謝拮抗剤、DNAインターカレート剤、インターフェロン、インターロイキン-2、核酸インヒビター、白金剤、コルチコステロイド、アスパラギナーゼ、ビンカアルカロイドまたはRU486である、請求項20に記載の使用。

22. 前記癌が、エストロゲン依存性癌、プロゲステロン依存性癌またはアンドロゲン依存性癌である、請求項16に記載の使用。

23. ヒトまたは動物の癌細胞の細胞老化またはプログラム細胞死を促進するための医薬の調製のための化合物の使用であって、該医薬が、以下の式の $3\beta$ ,  $17\alpha$ -ジヒドロキシアンドロステ-5-エンおよびそのエステルまたはエーテルからなる群から選択される有効量の化合物を含み：



ここで、Rは、独立して、H、2～8炭素のアルケニル、1～8炭素のアルキル、アルキルが1～4炭素を有するフェニルアルキル、フェニルまたはCOR<sub>2</sub>であり、ここで、R<sub>2</sub>は、H、1～8炭素のアルキル、2～8炭素のアルケニル、アルキルが1～4炭素を有するフェニルアルキル（ベンジルを含む）、またはフェニルであり、そして任意のフェニル部分は、3つまでの以下から独立して選択された置換基を有し得る：ヒドロキシ、1～4炭素のカルボキシ、ハロ、1～4炭素のアルコキシ、1～4炭素のアルキル、または2～4炭素のアルケニル、ここで任意のアルキルは、直鎖、分枝鎖であり得、あるいは該アルキルは、全体的にまたは部分的に環化され得る、使用。

24. 前記癌細胞が、インビトロにおける癌細胞である、請求項23に記載の使

用。

25. 前記癌細胞が、インビボにおける癌細胞である、請求項23に記載の使用。

26. 請求項23、24または25に記載の使用であって、前記癌細胞が、血液形成器官もしくは感覚器官の癌、または肝臓、結腸、膵臓、甲状腺、副腎、下垂体、卵巣、精巣、乳房、中枢神経系、骨、結合組織、肺、肝臓、胃腸系、子宮、粘膜、口、舌、腹膜壁もしくはリンパ系の癌由来のヒト癌細胞である、使用。

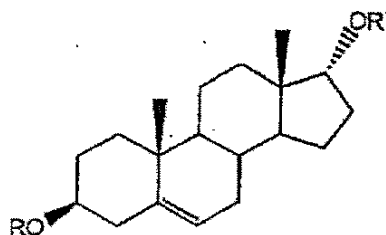
27. 前記癌細胞が、肺、乳房または肝臓の癌由来である、請求項26に記載の使用。

28. 前記化合物が、 $3\beta, 17\alpha$ -ジヒドロキシアンドロステ-5-エンである、請求項23、24または25に記載の使用。

29. 前記癌が、エストロゲン依存性癌、プロゲステロン依存性癌またはアンドロゲン依存性癌である、請求項23、24または25に記載の使用。

30. 前記化合物が、 $3\beta, 17\alpha$ -ジヒドロキシアンドロステ-5-エンであり、前記癌細胞が、ヒト癌細胞である、請求項29に記載の使用。

31. ヒトまたは動物の癌細胞の増殖を阻害するための医薬の調製のための化合物の使用であって、該医薬が、以下の式の $3\beta, 17\alpha$ -ジヒドロキシアンドロステ-5-エンおよびそのエステルまたはエーテルからなる群から選択される5 nM~10,000 nMの化合物を含み：



ここで、Rは、独立して、H、2～8炭素のアルケニル、1～8炭素のアルキル、アルキルが1～4炭素を有するフェニルアルキル、フェニルまたはCOR<sub>2</sub>であり、ここで、R<sub>2</sub>は、H、1～8炭素のアルキル、2～8炭素のアルケニル、アルキルが1～4炭素を有するフェニルアルキル（ベンジルを含む）、またはフェニルであり、そして任意のフェニル部分は、3つまでの以下から独立して選択された置換基を有し得る：ヒドロキシ、1～4炭素のカルボキシ、ハロ、1～4炭素のアルコキシ、1～4炭素のアルキル、または2～4炭素のアルケニル、ここで任意のアルキルは、直鎖、分枝鎖であり得、あるいは該アルキルは、全体的にまたは部分的に環化され得る、使用。

32. 前記細胞が、インビトロにおける癌細胞である、請求項31に記載の使用。

33. 前記細胞が、患者におけるインビボの癌細胞である、請求項31に記載の使用。

34. 請求項31、32または33に記載の使用であって、前記癌細胞が、血液形成器官もしくは感覚器官の癌、または肝臓、結腸、膵臓、甲状腺、副腎、下垂体、卵巣、精巣、乳房、中枢神経系、骨、結合組織、肺、肝臓、胃腸系、子宮、粘膜、口、舌、腹膜壁もしくはリンパ系の癌由来のヒト癌細胞である、使用。

35. 前記化合物が、3β, 17α-ジヒドロキシアンドロステ-5-エンである、請求項34に記載の使用。

36. 前記癌細胞が、肺、乳房または肝臓の癌由来である、請求項34に記載の使用。

37. 前記化合物が、 $3\beta, 17\alpha$ -ジヒドロキシアンドロステ-5-エンである、請求項31、32または33に記載の使用。

38. 前記癌が、エストロゲン依存性癌、プロゲステロン依存性癌またはアンドロゲン依存性癌である、請求項31、32または33に記載の使用。

39. 前記化合物が、 $3\beta, 17\alpha$ -ジヒドロキシアンドロステ-5-エンであり、前記癌細胞が、ヒト癌細胞である、請求項38に記載の使用。