

【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17年8月11日(2005.8.11)

【公表番号】特表2001-512418(P2001-512418A)

【公表日】平成13年8月21日(2001.8.21)

【出願番号】特願平10-530017

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 31/59

A 6 1 K 9/30

A 6 1 K 9/52

A 6 1 K 31/17

A 6 1 K 31/198

A 6 1 K 31/407

A 6 1 K 31/513

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 31/565

A 6 1 K 31/573

A 6 1 K 31/704

A 6 1 K 33/24

A 6 1 P 13/00

A 6 1 P 35/00

//(A 6 1 K 31/59

A 6 1 K 31:565)

(A 6 1 K 31/59

A 6 1 K 31:573)

【F I】

A 6 1 K 31/59

A 6 1 K 9/30

A 6 1 K 9/52

A 6 1 K 31/17

A 6 1 K 31/198

A 6 1 K 31/407

A 6 1 K 31/513

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 31/565

A 6 1 K 31/573

A 6 1 K 31/704

A 6 1 K 33/24

A 6 1 P 13/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 31/59

A 6 1 K 31:565

A 6 1 K 31/59

A 6 1 K 31:573

【手続補正書】

【提出日】平成16年12月10日(2004.12.10)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】補正の内容のとおり
【補正方法】変更
【補正の内容】

手 続 補 正 書

平成 16.12.10 年 月 日

特許庁長官 小 川 洋 殿



1. 事件の表示 平成 10 年特許願第 5 3 0 0 1 7 号

2. 補正をする者

事件との関係 出 願 人

名 称 ボーン ケア インターナショナル
インコーポレイテッド

3. 代 理 人

住 所 東京都千代田区丸の内 3 丁目 3 番 1 号
電話 (代) 3211-8741

氏 名 (5995) 弁理士 中 村 稔



4. 補正命令の日付 自 発

5. (本補正により請求の範囲に記載された請求項の数は合計「23」
となりました。)

6. 補正対象書類名 明細書

7. 補正対象項目名 請求の範囲

8. 補正の内容 別紙記載の通り



請求の範囲

1. 患者におけるヒト前立腺がん又は前立腺肥大症を治療するための経口医薬組成物であって、マトリックス内に含まれた 1α -ヒドロキシプレビタミン D 又は活性ビタミン D であるビタミン D 化合物の有効量を含有し、前記マトリックスが持続した時間にわたって前記活性ビタミン D を放出可能に結合しかつ制御可能に放出する手段をもつことを特徴とする、前記医薬組成物。

2. 更に、前記ビタミン D 化合物の放出を防止する腸溶コーティングを含み、前記コーティングが患者の胃での溶解に抵抗するが患者の腸での溶解を受けやすく、それにより組成物が該腸内に至るまで前記ビタミン D 化合物の放出を防止する、請求項 1 記載の医薬組成物。

3. 該小腸が隣接部分、中間部分及び末端部分を有し、前記腸溶コーティングが更に、該腸の隣接部分での溶解に抵抗するが該腸の中間部分と末端部分での溶解を受けやすく、それにより組成物が該腸の中間部分に達するまで前記ビタミン D 化合物の放出を防止する、請求項 2 記載の医薬組成物。

4. 前記腸溶コーティングが pH 6.0 未満の環境において溶解に抵抗する、請求項 2 または 3 記載の医薬組成物。

5. 前記 1α -ヒドロキシプレビタミン D が $1\alpha,25$ -ジヒドロキシプレビタミン D_3 、 $1\alpha,24$ -ジヒドロキシプレビタミン D_3 、 1α -ヒドロキシプレビタミン D_3 、 $1\alpha,25$ -ジヒドロキシプレビタミン D_2 、 $1\alpha,24$ -ジヒドロキシプレビタミン D_2 、 1α -ヒドロキシプレビタミン D_2 、 $1\alpha,24$ -ジヒドロキシプレビタミン D_4 、 $1\alpha,25$ -ジヒドロキシプレビタミン D_4 又は 1α -ヒドロキシプレビタミン D_4 である、請求項 1 記載の医薬組成物。

6. 前記活性ビタミン D が $1\alpha,25$ -ジヒドロキシビタミン D_3 、 $1\alpha,24$ -ジヒドロキシビタミン D_3 、 1α -ヒドロキシビタミン D_3 、 $1\alpha,25$ -ジヒドロキシビタミン D_2 、 $1\alpha,24$ -ジヒドロキシビタミン D_2 、 1α -ヒドロキシビタミン D_2 、 $1\alpha,24$ -ジヒドロキシビタミン D_4 、 $1\alpha,25$ -ジヒドロキシビタミン D_4 又は 1α -ヒドロキシビタミン D_4 である、請求項 1 記載の医薬組成物。

7. 異常な細胞分化又は細胞増殖を特徴とする前立腺疾患の治療用経口医薬組成物であって、マトリックス内に含まれた 1α -ヒドロキシプレビタミン D 化合物又はビタミン D 化合物の有効な細胞増殖阻止量を含有し、前記ビタミン D 化合物が

活性ビタミンD又は 1α -ヒドロキシプレビタミンDであり、前記マトリックスが持続した時間にわたって前記ビタミンD化合物を放出可能に結合しかつ制御可能に放出する手段をもつことを特徴とする、前記医薬組成物。

8. 1α -ヒドロキシプレビタミンDが $0.01\sim 2.0\mu\text{g/kg/日}$ の用量範囲で存在する、請求項7記載の医薬組成物。

9. 活性ビタミンDが $0.01\sim 2.0\mu\text{g/kg/日}$ の用量範囲で存在する、請求項7記載の医薬組成物。

10. ヒト前立腺がんの治療用医薬組成物であって、 1α -ヒドロキシプレビタミンD、徐放性の活性ビタミンD化合物又は遅効性でかつ徐放性の活性ビタミンD化合物である第1抗がん剤を含む、前記医薬組成物。

11. 高カルシウム血症の危険性が $1\alpha,25$ -ジヒドロキシビタミン D_3 よりかなり低い、請求項10記載の医薬組成物。

12. リン酸エストラムスチン、プレドニムスチン、シスプラチン、5-フルオロウラシル、メルファラン、ヒドロキシ尿素、マイトマイシン、イダルビシン、メトトレキセート、アドリアマイシン及びダウノマイシンからなる群より選ばれた第2抗がん剤を更に含む、請求項10記載の医薬組成物。

13. 前記第2抗がん剤が約 $0.002\sim 0.02\mu\text{g/kg/日}$ の用量範囲で存在する、請求項12記載の医薬組成物。

14. 医薬組成物であって、

(a) 1α -ヒドロキシプレビタミンD、SR活性ビタミンD、DSR活性ビタミンD、及びその組合わせからなる群より選ばれたビタミンD化合物である第1抗がん剤；及び

(b) (i) 第2抗がん剤、(ii) 骨剤、(iii) アンドロゲン制御剤、(iv) 5α -レダクターゼ阻害剤及びその組合わせからなる群より選ばれた薬剤を含む、前記医薬組成物。

15. 前記活性ビタミンD化合物が $1\alpha,25$ -ジヒドロキシビタミン D_3 、 $1\alpha,24$ -ジヒドロキシビタミン D_3 、 1α -ヒドロキシビタミン D_3 、 $1\alpha,25$ -ジヒドロキシビタミン D_2 、 $1\alpha,24$ -ジヒドロキシビタミン D_2 、 1α -ヒドロキシビタミン D_2 、 $1\alpha,24$ -ジヒドロキシビタミン D_4 、 $1\alpha,25$ -ジヒドロキシビタミン D_4 又は 1α -ヒドロキシビタミン D_4 からなる群より選ばれる、請求項14記載の医薬組成物。

16. 前記 1α -ヒドロキシプレビタミン D 化合物が $1\alpha,25$ -ジヒドロキシプレビタミン D_3 、 $1\alpha,24$ -ジヒドロキシプレビタミン D_3 、 1α -ヒドロキシプレビタミン D_3 、 $1\alpha,25$ -ジヒドロキシプレビタミン D_2 、 $1\alpha,24$ -ジヒドロキシプレビタミン D_2 、 1α -ヒドロキシプレビタミン D_2 、 $1\alpha,24$ -ジヒドロキシプレビタミン D_4 、 $1\alpha,25$ -ジヒドロキシプレビタミン D_4 及び 1α -ヒドロキシプレビタミン D_4 からなる群より選ばれる、請求項 14 記載の医薬組成物。

17. 前記第 2 抗がん剤がリン酸エストラムスチン、プレドニムスチン、シスプラチン、5-フルオロウラシル、メルファラン、ヒドロキシ尿素、マイトマイシン、イダルビシン、メトトレキセート、アドリアマイシン及びダウノマイシンからなる群より選ばれる、請求項 14 記載の医薬組成物。

18. 前記活性ビタミン D 化合物が約 $0.01 \sim 2.0 \mu\text{g/kg/日}$ の用量範囲で存在する、請求項 14 記載の医薬組成物。

19. 前記 1α -ヒドロキシプレビタミン D 化合物が約 $0.01 \sim 2.0 \mu\text{g/kg/日}$ の用量範囲で存在する、請求項 14 記載の医薬組成物。

20. 前記アンドロゲン制御剤がエストロゲン、LHRH 類縁体、抗エストロゲン及び抗アンドロゲンからなる群より選ばれる、請求項 14 記載の医薬組成物。

21. 前記 5α -レダクターゼ酵素阻害剤がフィナステリドである、請求項 14 記載の医薬組成物。

22. 前記骨剤が抱合卵胞ホルモン、抗エストロゲン、カルシトニン、フッ化ナトリウム、ビスホスホネート、カルシウム剤、コバラミン、百日咳毒素及びボロンからなる群より選ばれる、請求項 14 記載の医薬組成物。

23. 前立腺がん又は前立腺肥大症の過剰増殖性細胞活性を緩和するための医薬組成物であって、徐放性又は遅効性でかつ徐放性の製剤であり、及び 1α -ヒドロキシプレビタミン D 又は活性ビタミン D の治療的有効量を含み、前立腺がん又は前立腺肥大細胞活性を低下又は安定化しかつ高カルシウム血症の危険性を減少させる、上記組成物。