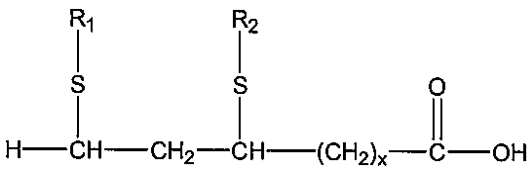
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成23年7月21日(2011.7.21)

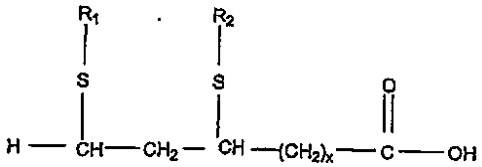
【公開番号】特開2010-248203(P2010-248203A)
【公開日】平成22年11月4日(2010.11.4)
【年通号数】公開・登録公報2010-044
【出願番号】特願2010-126848(P2010-126848)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｃ 323/52　　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｃ 323/52　　ＣＳＰ

【手続補正書】
【提出日】平成23年6月2日(2011.6.2)
【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】
リポ酸の誘導体であって、そのリポ酸分子のチオール部分にパラジウム以外の成分が結合されている上記のリポ酸誘導体。
【請求項２】
前記成分が金属または金属塩である、請求項１に記載のリポ酸誘導体。
【請求項３】
金属が白金、ニッケル、銀、ロジウム、カドミウム、金またはコバルトより成る群から選ばれる、請求項２に記載のリポ酸誘導体。
【請求項４】
リポ酸のチオール部分および／またはスルフヒドリル部分の一方または両方が、Ｎ－エチルマレイミド（NEM）、５，５－ジチオビス（２－ニトロ安息香酸）（DNTB）、ｐ－クロロ安息香酸水銀（PCMB）およびエチルクロロホルメート（ECF）を含むスルフヒドリル－反応性試薬によって誘導体化されている、請求項１に記載のリポ酸誘導体。
【請求項５】
前記成分が４酸化物である、請求項１に記載のリポ酸誘導体。
【請求項６】
式：
【化１】



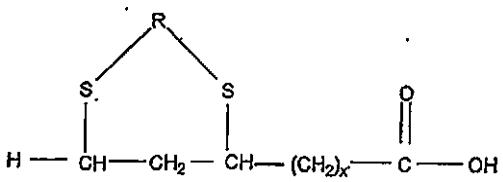
（式中、
ｘは０～１６であり；
R_1およびR_2は、独立に、（１）R_1およびR_2はのいずれかが水素であり、双方は水素でない；（２）アシル化アルキル基　$H(CH_2)_n(C=O)-$、ここで、ｎは１～１０である；（３）アシル化アリール基；（４）アルキル基　$C_nH_{2n-1}-$、ここで、ｎは１～１０である；（５）アルケニル基　$C_mH_{2m-1}-$、ここで、ｍは２～１

０である；（６）アルキニル基　C_mH_{2m-3}－、ここで、ｍは２～１０である；（７）芳香族　C_6H_5－から選ばれる。）
を含む化合物。
【請求項７】
アルケニル基がプロピレン、２，３－ジメチル－２－ブテンおよびヘプテンからなる群から選ばれる、請求項６に記載の化合物。
【請求項８】
アルキニル基がアセチレン、プロピンおよびオクチンからなる群から選ばれる請求項６に記載の化合物。
【請求項９】
芳香族基がベンジルまたはベンゼン誘導体である、請求項６に記載の化合物。
【請求項１０】
アルキル基がシクロプロパンである、請求項６に記載の化合物。
【請求項１１】
アルケニル基がシクロペンテンである、請求項６に記載の化合物。
【請求項１２】
疾患細胞の増殖を抑制するための治療薬の製造における試薬の使用であって、ここで、当該試薬が、当該試薬の有効量と接触させた疾患細胞中のPDCを特異的に阻害することにより抑制し、当該試薬が請求項６～１１のいずれかに記載の化合物のいずれかを含む、前記治療薬の製造における試薬の使用。
【請求項１３】
前記疾患細胞の増殖抑制が不可逆的である、請求項１２に記載の使用。
【請求項１４】
前記疾患細胞が腫瘍細胞であり、その腫瘍細胞の前記試薬との接触が当該腫瘍細胞を殺す、請求項１２に記載の使用。
【請求項１５】
前記疾患が腫瘍性の疾患を含む、請求項１２～１４のいずれかに記載の使用。
【請求項１６】
前記細胞が、真正細菌、古細菌、真菌、植物、藻類または原虫の寄生体より成る群から選ばれる、請求項１２に記載の使用。
【請求項１７】
式：
【化２】

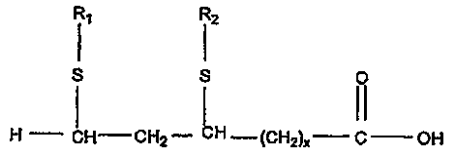


（式中、
　ｘは０～１６であり；
　R_1およびR_2は、独立に、（１）水素；（２）アシル化アルキル　$H(CH_2)_n(C=O)$－（ここで、ｎは１～１０）；（３）アシル化アリール；（４）アルキル　C_nH_{2n+1}－（ここで、ｎは１～１０）；（５）アルケニル　C_mH_{2m-1}－（ここで、ｍは２～１０）；（６）アルキニル　C_mH_{2m-3}－（ここで、ｍは２～１０）（７）芳香族　C_6H_5－である。）
からなる化合物および薬剤学上許容できるキャリアーを含んで成る医薬組成物。
【請求項１８】
第二の試薬をさらに含んでいる、請求項１７に記載の医薬組成物。
【請求項１９】
第二試薬がジクロロアセテートである、請求項１８に記載の医薬組成物。

【請求項２０】
式：
【化３】

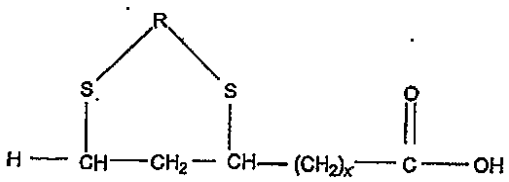


（式中、
ｘは０～１６であり；そして
Ｒは共有結合、非－パラジウム金属キレートまたは他の金属錯体であり、ここで該金属はパラジウムではない。）
のリポ酸誘導体および薬剤学上許容できるキャリアーを含んで成る医薬組成物。
【請求項２１】
リポ酸誘導体がリポ酸－金属錯体であり、ここで該金属はパラジウムではない、請求項２０に記載の医薬組成物。
【請求項２２】
リポ酸－金属錯体が溶液の形で１０μＭ以上の濃度を得るのに十分な治療上有効な量で与えられている、請求項２１に記載の医薬組成物。
【請求項２３】
金属が白金、ニッケル、銀、ロジウム、カドミウム、金またはコバルトより成る群から選ばれる、請求項２１に記載の医薬組成物。
【請求項２４】
リポ酸のチオール部分の一方または両方が硫酸基に酸化されている、請求項２０に記載の医薬組成物。
【請求項２５】
疾患細胞の増殖を抑制するための治療薬の製造における試薬の使用であって、ここで、当該試薬が、当該試薬の有効量と接触させた疾患細胞中のPDCを特異的に阻害することにより抑制する、前記治療薬の製造における試薬の使用。
【請求項２６】
疾患細胞の増殖抑制が不可逆的である、請求項２５に記載の使用。
【請求項２７】
試薬がリポ酸誘導体である、請求項２５に記載の使用。
【請求項２８】
前記疾患細胞が腫瘍細胞であり、その腫瘍細胞の前記リポ酸誘導体との接触が当該腫瘍細胞を殺す、請求項２７に記載の使用。
【請求項２９】
前記細胞が、真正細菌、古細菌、真菌、植物、藻類または原虫の寄生体より成る群から選ばれる、請求項２５に記載の使用。
【請求項３０】
患者の疾患を治療するための治療薬の製造における試薬の使用であって、当該疾患がリポ酸誘導体に対する感受性によって特徴付けられ、治療量の式：
【化４】



（式中、
ｘは０～１６であり；そして

R_1およびR_2は、独立に、（１）水素；（２）アシル化アルキル　H（CH_2）$_n$（C＝O）－（ここで、ｎは１～１０）；（３）アシル化アリール；（４）アルキル　C_nH_{2n+1}－（ここで、ｎは１～１０）；（５）アルケニル　C_mH_{2m-1}－（ここで、ｍは２～１０）；（６）アルキニル　C_mH_{2m-3}－（ここで、ｍは２～１０）（７）芳香族　C_6H_5－である。）
のリポ酸化合物を含む上記患者の疾患を治療するための治療薬の製造における試薬の使用。
【請求項３１】
疾患を治療するための治療薬の製造における試薬の使用であって、該疾患細胞がリポ酸誘導体に対する感受性によって特徴付けられ、医薬が治療量の式：
【化５】



（式中、
ｘは０～１６であり；そして
Ｒは共有結合、非－パラジウム金属キレートまたは金属錯体であり、ここで該金属はパラジウムではない。）
を含む上記疾患細胞を治療するための治療薬の製造における試薬の使用。
【請求項３２】
疾患が腫瘍性疾患から成る、請求項３０または３１に記載の使用。
【請求項３３】
リポ酸のチオール基に結合したパラジウム以外の金属又は金属塩を含むリポ酸の誘導体であって、前記結合が共有結合又は配位結合またはキレート化錯体である、前記リポ酸の誘導体。
【請求項３４】
前記金属塩が、臭化白金、塩化白金、ヨウ化白金、ホウ酸ニッケル、ホウ化ニッケル、臭化ニッケル、塩化ニッケル、ヨウ化ニッケル、フッ化ニッケル、臭素酸銀、臭化銀、塩化銀、フッ化銀、ヨウ化銀、塩化ロジウム、臭化カドミウム、塩化カドミウム、フッ化カドミウム、ヨウ化カドミウム、臭化金、塩化金、ヨウ化金、臭化コバルト、塩化コバルト、フッ化コバルト、又はヨウ化コバルトのうちの少なくとも１つである、請求項３３に記載のリポ酸誘導体。