

【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28年7月21日(2016.7.21)

【公表番号】特表2015-518902(P2015-518902A)

【公表日】平成27年7月6日(2015.7.6)

【年通号数】公開・登録公報2015-043

【出願番号】特願2015-516246(P2015-516246)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/196 (2006.01)
A 6 1 K 31/473 (2006.01)
A 6 1 K 31/4704 (2006.01)
A 6 1 K 31/382 (2006.01)
A 6 1 K 31/343 (2006.01)
A 6 1 K 31/255 (2006.01)
A 6 1 K 31/402 (2006.01)
A 6 1 K 31/4025 (2006.01)
A 6 1 K 31/341 (2006.01)
A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
A 6 1 K 31/357 (2006.01)
A 6 1 K 31/404 (2006.01)
A 6 1 K 31/405 (2006.01)
A 6 1 K 31/427 (2006.01)
A 6 1 K 31/381 (2006.01)
A 6 1 K 31/496 (2006.01)
A 6 1 K 31/4245 (2006.01)
A 6 1 K 31/34 (2006.01)
A 6 1 K 31/428 (2006.01)
A 6 1 K 31/426 (2006.01)
A 6 1 K 31/4709 (2006.01)
A 6 1 K 31/53 (2006.01)
A 6 1 K 45/00 (2006.01)
A 6 1 P 37/02 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 17/10 (2006.01)
A 6 1 P 27/14 (2006.01)
A 6 1 P 11/02 (2006.01)
A 6 1 P 7/10 (2006.01)
A 6 1 P 1/02 (2006.01)
A 6 1 P 19/02 (2006.01)
A 6 1 P 11/06 (2006.01)
A 6 1 P 9/10 (2006.01)
A 6 1 P 37/08 (2006.01)
A 6 1 P 17/00 (2006.01)
A 6 1 P 37/06 (2006.01)
A 6 1 P 7/06 (2006.01)
A 6 1 P 1/16 (2006.01)
A 6 1 P 9/00 (2006.01)
A 6 1 P 11/00 (2006.01)
A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)
A 6 1 P 21/00 (2006.01)
A 6 1 P 13/12 (2006.01)
A 6 1 P 19/06 (2006.01)
A 6 1 P 7/04 (2006.01)
A 6 1 P 29/00 (2006.01)
A 6 1 P 25/00 (2006.01)
A 6 1 P 21/04 (2006.01)
A 6 1 P 1/18 (2006.01)
A 6 1 P 15/00 (2006.01)
A 6 1 P 17/04 (2006.01)
A 6 1 P 5/14 (2006.01)
A 6 1 P 35/02 (2006.01)
A 6 1 K 9/20 (2006.01)
A 6 1 K 9/06 (2006.01)
A 6 1 K 9/107 (2006.01)
A 6 1 K 9/12 (2006.01)
A 6 1 K 9/48 (2006.01)
A 6 1 K 9/08 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/196
A 6 1 K 31/473
A 6 1 K 31/4704
A 6 1 K 31/382
A 6 1 K 31/343
A 6 1 K 31/255
A 6 1 K 31/402
A 6 1 K 31/4025
A 6 1 K 31/341
A 6 1 K 31/5377
A 6 1 K 31/357
A 6 1 K 31/404
A 6 1 K 31/405
A 6 1 K 31/427
A 6 1 K 31/381
A 6 1 K 31/496
A 6 1 K 31/4245
A 6 1 K 31/34
A 6 1 K 31/428
A 6 1 K 31/426
A 6 1 K 31/4709
A 6 1 K 31/53
A 6 1 K 45/00
A 6 1 P 37/02
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 17/10
A 6 1 P 27/14
A 6 1 P 11/02
A 6 1 P 7/10
A 6 1 P 1/02

A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 11/06
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 37/08
 A 6 1 P 17/00
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 7/06
 A 6 1 P 1/16
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 21/00
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 P 19/06
 A 6 1 P 7/04
 A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 21/04
 A 6 1 P 1/18
 A 6 1 P 15/00
 A 6 1 P 17/04
 A 6 1 P 5/14
 A 6 1 P 35/02
 A 6 1 K 9/20
 A 6 1 K 9/06
 A 6 1 K 9/107
 A 6 1 K 9/12
 A 6 1 K 9/48
 A 6 1 K 9/08

【手続補正書】

【提出日】平成28年5月30日(2016.5.30)

【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】

1以上の表1に記載の化合物を含む、Pin1を阻害するための医薬組成物。

【請求項2】

細胞内に存在するPin1を阻害するための、請求項1記載の組成物。

【請求項3】

該細胞がヒト細胞である、請求項2記載の組成物。

【請求項4】

1以上の表1に記載の化合物を含む、対象における免疫障害を治療するための医薬組成物

。

【請求項5】

1以上の表1に記載の化合物を含む、増殖性障害の治療のための医薬組成物。

【請求項6】

組成物の投与の前にPin1マーカのレベルの上昇を有すると決定された対象に用いるための、請求項4～5のいずれか1項記載の医薬組成物。

【請求項7】

Pin1マーカレベルの上昇を有すると決定された対象に用いるための、1以上の表1に記載の化合物を含む、免疫障害の治療のための医薬組成物。

【請求項8】

Pin1マーカレベルの上昇を有すると決定された対象に用いるための、1以上の表1に記載の化合物を含む、増殖性障害の治療のための医薬組成物。

【請求項9】

抗炎症化合物、抗微生物化合物、抗ウイルス化合物または抗癌化合物である第2治療用化合物との併用療法用の、請求項1～8のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項10】

該Pin1マーカがPin1のSer71リン酸化の低下である、請求項7～9のいずれか1項記載の組成物。

【請求項11】

表1の化合物の投与後に取得された対象由来サンプルにおけるPin1マーカレベルが決定されるためのものである、請求項7～9のいずれか1項記載の組成物。

【請求項12】

Pin1マーカレベルを決定するための対象由来サンプルが、血液、尿、組織生検、リンパ液、唾液、粘液、脳脊髄液および膿からなる群から選択されるサンプルである、請求項7～9のいずれか1項記載の組成物。

【請求項13】

Pin1マーカレベルの上昇を決定するための対象由来サンプルが罹患組織に由来するサンプルである、請求項7～12のいずれか1項記載の組成物。

【請求項14】

該罹患組織が、腫瘍生検または分画血液からなる群から選択される、請求項13記載の組成物。

【請求項15】

Pin1マーカレベルの上昇が遺伝性形質または体細胞突然変異によるものである、請求項6～14のいずれか1項記載の組成物。

【請求項16】

第2治療用化合物が、コルチコステロイド、NSAID、COX-2インヒビター、生物製剤、小分子免疫調節物質、非ステロイドイムノフィリン依存性免疫抑制物質、5-アミノサリチル酸、DMARD、ヒドロキシクロロキン硫酸塩およびペニシラミンからなる群から選択される、請求項9記載の組成物。

【請求項17】

第2治療用化合物が、微小管インヒビター、トポイソメラーゼインヒビター、プラチン、アルキル化剤および代謝拮抗物質からなる群から選択される、請求項9記載の組成物。

【請求項18】

第2治療用化合物が、1-D-リボフラノシル-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド、9->2-ヒドロキシ-エトキシメチルグアニン、アダマンタンアミン、5-ヨード-2'-デオキシウリジン、トリフルオロチミジン、インターフェロン、アデニンアラビノシド、プロテアーゼインヒビター、チミジンキナーゼインヒビター、糖または糖タンパク質合成インヒビター、構造タンパク質合成インヒビター、付着および吸着インヒビター、ならびにヌクレオシド類似体、アシクロビル、ペンシクロビル、パラシクロビルおよびガンシクロビルからなる群から選択される、請求項9記載の組成物。

【請求項19】

第2治療用化合物が、MK-2206、ON 013105、RTA 402、BI 2536、ソラフェニブ、ISIS-ST AT3Rx、微小管インヒビター、トポイソメラーゼインヒビター、プラチン、アルキル化剤

、代謝拮抗物質、パクリタキセル、ゲムシタピン、ドキソルビシン、ビンブラスチン、エトポシド、5-フルオロウラシル、カルボプラチン、アルトレタミン、アミノグルテチミド、アマサクリン、アナストロゾール、アザシチジン、プレオマイシン、ブスルファン、カルムスチン、クロラムブシル、2-クロロデオキシアデノシン、シスプラチン、コルヒチン、シクロホスファミド、シタラビン、サイトキサン、ダカルバジン、ダクチノマイシン、ダウノルビシン、ドセタキセル、リン酸エストラムスチン、フロクスウリジン、フルダラビン、ゲンツズマブ、ヘキサメチルメラミン、ヒドロキシウレア、イホスファミド、イマチニブ、インターフェロン、イリノテカン、ロムスチン、メクロレタミン、メルファレン、6-メルカプトプリン、メトトレキサート、マイトマイシン、ミトタン、ミトキサントロン、ペントスタチン、プロカルバジン、リツキシマブ、ストレプトゾシン、タモキシフェン、テモゾロミド、テニポシド、6-チオグアニン、トポテカン、トラスツズマブ、ピンクリスチン、ビンデシンおよび/またはビノレルピンからなる群から選択される、請求項9記載の組成物。

【請求項20】

第2治療用化合物が低用量で投与されるためのものである、請求項9記載の組成物。

【請求項21】

該免疫障害が、尋常性ざ瘡、急性呼吸窮迫症候群、アジソン病、副腎皮質機能不全、副腎性器症候群、アレルギー性結膜炎、アレルギー性鼻炎、アレルギー性眼内炎症性疾患、ANCA関連小血管血管炎、血管性浮腫、強直性脊椎炎、アフタ性口内炎、関節炎、喘息、アテローム性動脈硬化症、アトピー性皮膚炎、自己免疫疾患、自己免疫性溶血性貧血、自己免疫性肝炎、ベーチェット病、ベル麻痺、ベリリウム症、気管支喘息、水疱性疱疹状皮膚炎、水疱性類天疱瘡、心臓炎、セリアック病、脳虚血、慢性閉塞性肺疾患、肝硬変、コーガン症候群、接触性皮膚炎、COPD、クローン病、クッシング症候群、皮膚筋炎、糖尿病、円板状エリテマトーデス、好酸球性筋膜炎、上顎炎、結節性紅斑、剥脱性皮膚炎、線維筋痛症、巣状系球体硬化症、巨細胞性動脈炎、痛風、痛風性関節炎、移植片対宿主病、手湿疹、ヘノッホ・シェーンライン紫斑病、妊娠ヘルペス、多毛症、過敏性薬物反応、特発性角膜強膜炎、特発性肺線維症、特発性血小板減少性紫斑病、炎症性腸または胃腸障害、炎症性皮膚疾患、若年性関節リウマチ、喉頭浮腫、扁平苔癬、レフラー症候群、ループス腎炎、尋常性狼瘡、リンパ腫気管支炎、黄斑浮腫、多発性硬化症、筋骨格および結合組織障害、重症筋無力症、筋炎、閉塞性肺疾患、眼炎症、臓器移植拒絶、骨関節炎、膵炎、妊娠性類天疱瘡、尋常性天疱瘡、結節性多発動脈炎、リウマチ性多発筋痛、一次性副腎皮質不全、原発性胆汁性肝硬変、陰囊痒み、痒み/炎症、乾癬、乾癬性関節炎、ライター病、再発性多発性軟骨炎、リウマチ性心臓炎、リウマチ熱、関節リウマチ、サルコイドーシスにより引き起こされる酒さ、強皮症により引き起こされる酒さ、スイート症候群により引き起こされる酒さ、全身性エリテマトーデスにより引き起こされる酒さ、蕁麻疹により引き起こされる酒さ、帯状疱疹関連疼痛により引き起こされる酒さ、サルコイドーシス、強皮症、分節性系球体硬化症、敗血症性ショック症候群、血清病、肩腱炎または滑液包炎、シェーグレン症候群、スティル病、脳卒中誘発性脳細胞死、スウィート病、全身皮膚筋炎、全身性エリテマトーデス、全身性硬化症、高安動脈炎、側頭動脈炎、甲状腺炎、中毒性表皮壊死症、結核、1型糖尿病、潰瘍性大腸炎、ブドウ膜炎、血管炎およびウェゲナー肉芽腫症からなる群から選択される、請求項4または7記載の組成物。

【請求項22】

該増殖性障害が、急性白血病、急性リンパ性白血病、急性骨髄性白血病、急性骨髄芽球性白血病、急性前骨髄球性白血病、急性骨髄単球性白血病、急性単球性白血病、急性赤白血病、慢性白血病、慢性骨髄性白血病、慢性リンパ性白血病、ホジキン病、非ホジキン病、線維肉腫、粘液肉腫、脂肪肉腫、軟骨肉腫、骨肉腫、脊索腫、血管肉腫、内皮肉腫、リンパ管肉腫、リンパ管内皮肉腫、滑膜腫、中皮腫、ユーイング腫瘍、平滑筋肉腫、横紋筋肉腫、結腸癌、膵臓癌、乳癌、卵巣癌、前立腺癌、扁平上皮癌、基底細胞癌、腺癌、汗腺癌、皮脂腺癌、乳頭状癌、乳頭状腺癌、嚢胞腺癌、髄様癌、気管支癌、腎細胞癌、肝癌、胆管癌、絨毛癌、セミノーマ、胎生期癌、ウィルムス腫瘍、子宮頸癌、子宮癌、精巣癌、

肺癌、小細胞肺癌、膀胱癌、上皮癌、神経膠腫、星状細胞腫、髄芽腫、頭蓋咽頭腫、上衣腫、松果体腫、血管芽細胞腫、聴神経腫、乏突起神経膠腫、神経鞘腫、髄膜腫、黒色腫、神経芽細胞腫および網膜芽細胞腫からなる群から選択される、請求項5または8記載の組成物。

【請求項23】

表1の化合物を含む医薬組成物。

【請求項24】

該化合物が丸剤、軟膏剤、クリーム剤、泡剤、カプセル剤または液体として製剤化されている、請求項1～23のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0200

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0200】

他の実施形態も特許請求の範囲内に含まれる。

[1] Pin1を表1の化合物と接触させることによりPin1を阻害する方法。

[2] 該Pin1が細胞内に存在する、1記載の方法。

[3] 該細胞がヒト細胞である、1記載の方法。

[4] 免疫障害の治療を要する対象に表1の化合物の治療的有効量を投与する工程を含む、対象における免疫障害の治療方法。

[5] 増殖性障害の治療を要する対象に表1の化合物の治療的有効量を投与する工程を含む、増殖性障害の治療方法。

[6] 該対象が該投与の前にPin1マーカのレベルの上昇を有すると決定される、4～5のいずれか1項記載の方法。

[7] 対象からのサンプルにおけるPin1マーカレベルを決定し、該対象からのサンプルがPin1マーカレベルの上昇を有すると決定された場合に、表1の化合物の治療的有効量を該対象に投与する工程を含む、対象における免疫障害の治療方法。

[8] 対象からのサンプルにおけるPin1マーカレベルを決定し、該対象からのサンプルがPin1マーカレベルの上昇を有すると決定された場合に、表1の化合物の治療的有効量を該対象に投与する工程を含む、対象における増殖性障害の治療方法。

[9] 抗炎症化合物、抗微生物化合物、抗ウイルス化合物または抗癌化合物である第2治療用化合物の投与を更に含む、前記のいずれか1項記載の方法。

[10] 該Pin1マーカがPin1のSer71リン酸化の低下である、7～9のいずれか1項記載の方法。

[11] 表1の化合物の投与の後で該サンプルにおけるPin1マーカレベルを決定することを更に含む、7～9のいずれか1項記載の方法。

[12] 該サンプルが、血液、尿、組織生検、リンパ液、唾液、粘液、脳脊髄液および膿からなる群から選択される、7～9のいずれか1項記載の方法。

[13] 該サンプルが罹患組織に由来する、7～12のいずれか1項記載の方法。

[14] 該罹患組織が、腫瘍生検または分画血液からなる群から選択される、13記載の方法。

[15] Pin1マーカレベルの上昇が遺伝性形質または体細胞突然変異によるものである、6～14のいずれか1項記載の方法。

[16] 第2治療用化合物が、コルチコステロイド、NSAID、COX-2インヒビター、生物製剤、小分子免疫調節物質、非ステロイドイムノフィリン依存性免疫抑制物質、5-アミノサリチル酸、DMARD、ヒドロキシクロロキン硫酸塩およびペニシラミンからなる群から選択される、9記載の方法。

[17] 第2治療用化合物が、微小管インヒビター、トポイソメラーゼインヒビター、プラチン、アルキル化剤および代謝拮抗物質からなる群から選択される、9記載の方法。

[1 8] 第2治療用化合物が、1-D-リボフラノシル-1,2,4-トリアゾール-3-カルボキサミド、9->2-ヒドロキシ-エトキシメチルグアニン、アダマンタンアミン、5-ヨード-2'-デオキシウリジン、トリフルオロチミジン、インターフェロン、アデニンアラビノシド、プロテアーゼインヒビター、チミジンキナーゼインヒビター、糖または糖タンパク質合成インヒビター、構造タンパク質合成インヒビター、付着および吸着インヒビター、ならびにヌクレオシド類似体、例えばアシクロビル、ペンシクロビル、バラシクロビルおよびガンシクロビルからなる群から選択される、9記載の方法。

[1 9] 第2治療用化合物が、MK-2206、ON 013105、RTA 402、BI 2536、ソラフェニブ、ISIS-STAT3Rx、微小管インヒビター、トポイソメラーゼインヒビター、プラチン、アルキル化剤、代謝拮抗物質、パクリタキセル、ゲムシタピン、ドキシソルピシン、ピンブラスチン、エトポシド、5-フルオロウラシル、カルボプラチン、アルトレタミン、アミノグルテチミド、アムサクリン、アナストロゾール、アザシチジン、プレオマイシン、プスルファン、カルムスチン、クロラムブシル、2-クロロデオキシアデノシン、シスプラチン、コルヒチン、シクロホスファミド、シタラピン、サイトキサン、ダカルバジン、ダクチノマイシン、ダウノルピシン、ドセタキセル、リン酸エストラムスチン、フロクスウリジン、フルダラビン、ゲンツズマブ、ヘキサメチルメラミン、ヒドロキシウレア、イホスファミド、イマチニブ、インターフェロン、イリノテカン、ロムスチン、メクロレタミン、メルファレン、6-メルカプトプリン、メトトレキサート、マイトマイシン、ミトタン、ミトキサントロン、ベントスタチン、プロカルバジン、リツキシマブ、ストレプトゾシン、タモキシフェン、テモゾロミド、テニポシド、6-チオグアニン、トポテカン、トラスツズマブ、ピンクリスチン、ビンデシンおよび/またはビノレルピンからなる群から選択される、9記載の方法。

[2 0] 第2治療用化合物を低用量で投与する、9記載の方法。

[2 1] 該免疫障害が、尋常性ざ瘡、急性呼吸窮迫症候群、アジソン病、副腎皮質機能不全、副腎性器症候群、アレルギー性結膜炎、アレルギー性鼻炎、アレルギー性眼内炎症性疾患、ANCA関連小血管血管炎、血管性浮腫、強直性脊椎炎、アフタ性口内炎、関節炎、喘息、アテローム性動脈硬化症、アトピー性皮膚炎、自己免疫疾患、自己免疫性溶血性貧血、自己免疫性肝炎、ベーチェット病、ベル麻痺、ペリリウム症、気管支喘息、水疱性疱疹状皮膚炎、水疱性類天疱瘡、心臓炎、セリアック病、脳虚血、慢性閉塞性肺疾患、肝硬変、コーガン症候群、接触性皮膚炎、COPD、クローン病、クッシング症候群、皮膚筋炎、糖尿病、円板状エリテマトーデス、好酸球性筋膜炎、上顎炎、結節性紅斑、剥脱性皮膚炎、線維筋痛症、巣状系球体硬化症、巨細胞性動脈炎、痛風、痛風性関節炎、移植片対宿主病、手湿疹、ヘノッホ・シェーンライン紫斑病、妊娠ヘルペス、多毛症、過敏性薬物反応、特発性角膜強膜炎、特発性肺線維症、特発性血小板減少性紫斑病、炎症性腸または胃腸障害、炎症性皮膚疾患、若年性関節リウマチ、喉頭浮腫、扁平苔癬、レフラー症候群、ループス腎炎、尋常性狼瘡、リンパ腫気管支炎、黄斑浮腫、多発性硬化症、筋骨格および結合組織障害、重症筋無力症、筋炎、閉塞性肺疾患、眼炎症、臓器移植拒絶、骨関節炎、脾炎、妊娠性類天疱瘡、尋常性天疱瘡、結節性多発動脈炎、リウマチ性多発筋痛、一次性副腎皮質不全、原発性胆汁性肝硬変、陰囊痒み、痒み/炎症、乾癬、乾癬性関節炎、ライター病、再発性多発性軟骨炎、リウマチ性心臓炎、リウマチ熱、関節リウマチ、サルコイドーシスにより引き起こされる酒さ、強皮症により引き起こされる酒さ、スイート症候群により引き起こされる酒さ、全身性エリテマトーデスにより引き起こされる酒さ、蕁麻疹により引き起こされる酒さ、帯状疱疹関連疼痛により引き起こされる酒さ、サルコイドーシス、強皮症、分節性系球体硬化症、敗血症性ショック症候群、血清病、肩腱炎または滑液包炎、シェーグレン症候群、スティル病、脳卒中誘発性脳細胞死、スウィート病、全身皮膚筋炎、全身性エリテマトーデス、全身性硬化症、高安動脈炎、側頭動脈炎、甲状腺炎、中毒性表皮壊死症、結核、1型糖尿病、潰瘍性大腸炎、ブドウ膜炎、血管炎およびウエゲナー肉芽腫症からなる群から選択される、4または7記載の方法。

[2 2] 該増殖性障害が、急性白血病、急性リンパ性白血病、急性骨髄性白血病、急性骨髄芽球性白血病、急性前骨髄球性白血病、急性骨髄単球性白血病、急性単球性白血病、急

性赤白血病、慢性白血病、慢性骨髄性白血病、慢性リンパ性白血病、ホジキン病、非ホジキン病、線維肉腫、粘液肉腫、脂肪肉腫、軟骨肉腫、骨肉腫、脊索腫、血管肉腫、内皮肉腫、リンパ管肉腫、リンパ管内皮肉腫、滑膜腫、中皮腫、ユーイング腫瘍、平滑筋肉腫、横紋筋肉腫、結腸癌、膵臓癌、乳癌、卵巣癌、前立腺癌、扁平上皮癌、基底細胞癌、腺癌、汗腺癌、皮脂腺癌、乳頭状癌、乳頭状腺癌、嚢胞腺癌、髓様癌、気管支癌、腎細胞癌、肝癌、胆管癌、絨毛癌、セミノーマ、胎生期癌、ウィルムス腫瘍、子宮頸癌、子宮癌、精巣癌、肺癌、小細胞肺癌、膀胱癌、上皮癌、神経膠腫、星状細胞腫、髓芽腫、頭蓋咽頭腫、上衣腫、松果体腫、血管芽細胞腫、聴神経腫、乏突起神経膠腫、神経鞘腫、髄膜腫、黒色腫、神経芽細胞腫および網膜芽細胞腫からなる群から選択される、5または8記載の方法

。_____
[2 3] 表1の化合物を含む医薬組成物。

[2 4] 該化合物が丸剤、軟膏剤、クリーム剤、泡剤、カプセル剤または液体として製剤化されている、23記載の医薬組成物。