

【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3月3日 (2011.3.3)

【公表番号】特表2010-516626(P2010-516626A)

【公表日】平成22年5月20日 (2010.5.20)

【年通号数】公開・登録公報2010-020

【出願番号】特願2009-545734(P2009-545734)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/166 (2006.01)

A 6 1 K 47/40 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 K 47/14 (2006.01)

A 6 1 K 47/20 (2006.01)

A 6 1 K 47/10 (2006.01)

A 6 1 K 47/18 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 35/04 (2006.01)

A 6 1 P 7/06 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 K 9/08 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/166

A 6 1 K 47/40

A 6 1 K 47/32

A 6 1 K 47/14

A 6 1 K 47/20

A 6 1 K 47/10

A 6 1 K 47/18

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 35/04

A 6 1 P 7/06

A 6 1 P 35/02

A 6 1 K 9/08

【手続補正書】

【提出日】平成23年1月14日 (2011.1.14)

【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

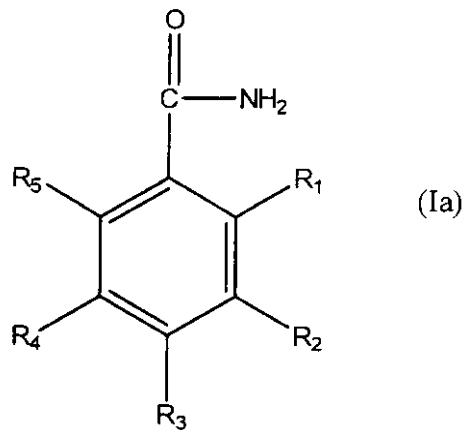
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

医薬組成物であり、式 (I a)

【化 1】



[式中、

R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 は独立して水素、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、ヨード、ブromo、フルオロ、クロロ、($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ、($C_3 - C_7$) シクロアルキルおよびフェニルからなる群より選択され、5 個の R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 置換基のうち少なくとも 2 個は常に水素であり、5 個の置換基のうち少なくとも 1 個は常にニトロであり、そしてニトロに隣接して位置する少なくとも 1 個の置換基は常にヨードである]

で表される化合物、又はその医薬として許容される塩；

リン酸緩衝剤；及び

- シクロデキストリン；

を含み、ここで、該 - シクロデキストリンが、前記組成物の 20 ~ 40 % (w/v) の濃度で存在する、前記組成物。

【請求項 2】

前記 - シクロデキストリンがヒドロキシプロピル - - シクロデキストリンである、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

前記 - シクロデキストリンがスルホブチルエーテル - - シクロデキストリンである、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

前記式 (Ia) で表される化合物が、4 - ヨード - 3 - ニトロベンズアミドである、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

前記式 (Ia) で表される化合物が 4 - ヨード - 3 - ニトロベンズアミドで、前記 - シクロデキストリンが 25 % (w/v) のヒドロキシプロピル - - シクロデキストリンで、そして前記リン酸緩衝剤が 10 mM リン酸緩衝剤である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

ガンの治療に使用される、請求項 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

前記 4 - ヨード - 3 - ニトロベンズアミドの濃度が 1 % (w/v) である、請求項 5 又は 6 のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 8】

前記リン酸緩衝剤が、リン酸水素二ナトリウム十二水和物、及びリン酸二水素ナトリウム二水和物を含む、請求項 5 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

非経口送達、静脈内送達、又は経口送達用に製剤化される、請求項 5 ～ 8 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

ガンの治療に使用される、1 ～ 8 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

前記ガンが乳ガン、卵巣ガン、肺ガン、膵臓ガン、肉腫（成人軟組織ガン）、及び C N S 腫瘍からなる群の一員である、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

前記ガンが乳ガンである、請求項 10 に記載の医薬組成物。

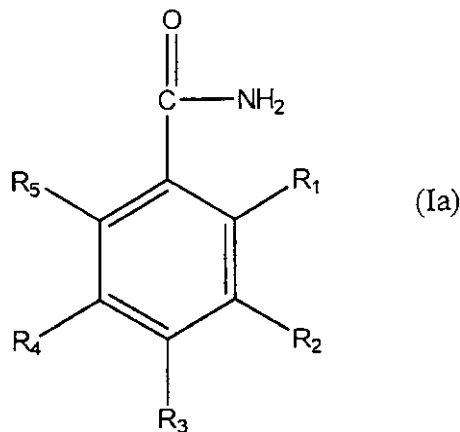
【請求項 13】

前記ガンが卵巣ガンである、請求項 10 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

医薬組成物であり、式（I a）

【化 2】



[式中、

R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 は独立して水素、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、ヨード、ブromo、フルオロ、クロロ、（ $C_1 - C_6$ ）アルキル、（ $C_1 - C_6$ ）アルコキシ、（ $C_3 - C_7$ ）シクロアルキルおよびフェニルからなる群より選択され、5 個の R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 置換基のうち少なくとも 2 個は常に水素であり、5 個の置換基のうち少なくとも 1 個は常にニトロであり、そしてニトロに隣接して位置する少なくとも 1 個の置換基は常にヨードである]

で表される化合物、又はその医薬として許容される塩；及び

- シクロデキストリン；

を含み、ここで、該 - シクロデキストリンが、前記組成物の 20 ～ 40 %（w / v）の濃度で存在し、但し、4 - ヨード - 3 - ニトロベンズアミド、25 %（w / v）ヒドロキシプロピル - - シクロデキストリン及び水で構成されるものではない、前記組成物。

【請求項 15】

前記 - シクロデキストリンがヒドロキシプロピル - - シクロデキストリンである、請求項 14 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

前記 - シクロデキストリンがスルホブチルエーテル - - シクロデキストリンである、請求項 14 に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

前記式（I a）で表される化合物が、4 - ヨード - 3 - ニトロベンズアミドである、請

求項 1 4 - 1 6 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

前記式 (I a) で表される化合物が 4 - ヨード - 3 - ニトロベンズアミドで、更にリン酸緩衝剤を含む、請求項 1 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 9】

前記リン酸緩衝剤が、リン酸水素二ナトリウム十二水和物、及びリン酸二水素ナトリウム二水和物を含む、請求項 1 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 0】

非経口送達、静脈内送達、又は経口送達用に製剤化される、請求項 1 4 ~ 1 9 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 1】

ガンの治療に使用される、請求項 1 4 ~ 2 0 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 2 2】

前記ガンが乳ガン、卵巣ガン、肺ガン、膵臓ガン、肉腫（成人軟組織ガン）、及び C N S 腫瘍からなる群の一員である、請求項 2 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 3】

前記ガンが乳ガンである、請求項 2 1 に記載の医薬組成物。

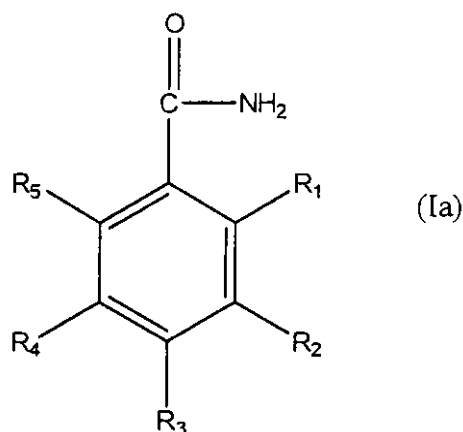
【請求項 2 4】

前記ガンが卵巣ガンである、請求項 2 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 5】

医薬組成物の使用であり、該医薬組成物が、式 (I a)

【化 3】



[式中、

R₁、R₂、R₃、R₄ および R₅ は独立して水素、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、ヨード、プロモ、フルオロ、クロロ、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₃ - C₇) シクロアルキルおよびフェニルからなる群より選択され、5 個の R₁、R₂、R₃、R₄ および R₅ 置換基のうち少なくとも 2 個は常に水素であり、5 個の置換基のうち少なくとも 1 個は常にニトロであり、そしてニトロに隣接して位置する少なくとも 1 個の置換基は常にヨードである]

で表される化合物、又はその医薬として許容される塩；

リン酸緩衝剤；及び

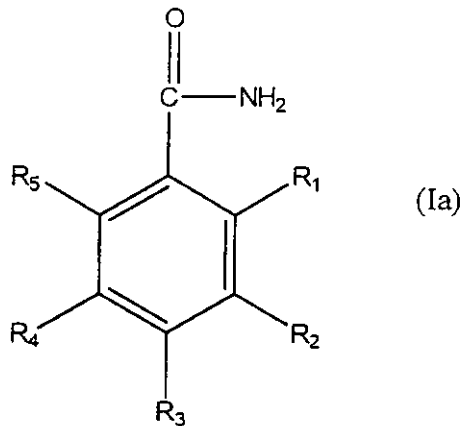
- シクロデキストリン；

を含み、ここで、該 - シクロデキストリンが、前記組成物の 2 0 ~ 4 0 % (w / v) の濃度で存在する、ウイルス性疾患に罹患した疑いのある対象のウイルス性疾患を処置するための医薬を製造するための、前記医薬組成物の使用。

【請求項 26】

医薬組成物の使用であり、該医薬組成物が、式 (Ia)

【化 4】



[式中、

R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 は独立して水素、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、ヨード、ブロモ、フルオロ、クロロ、($C_1 - C_6$) アルキル、($C_1 - C_6$) アルコキシ、($C_3 - C_7$) シクロアルキルおよびフェニルからなる群より選択され、5 個の R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_5 置換基のうち少なくとも 2 個は常に水素であり、5 個の置換基のうち少なくとも 1 個は常にニトロであり、そしてニトロに隣接して位置する少なくとも 1 個の置換基は常にヨードである]

で表される化合物、又はその医薬として許容される塩；及び

- シクロデキストリン；

を含み、ここで、該 - シクロデキストリンが、前記組成物の 20 ~ 40 % (w/v) の濃度で存在する、ガンに罹患した疑いのある対象のガンを処置するための医薬を製造するための、前記医薬組成物の使用。

【請求項 27】

前記組成物が更にリン酸緩衝剤を含む、請求項 26 に記載の使用。

【請求項 28】

前記 - シクロデキストリンが、ヒドロキシプロピル - シクロデキストリン又はスルホブチルエーテル - シクロデキストリンである、請求項 26 に記載の使用。

【請求項 29】

前記式 (Ia) で表される化合物が 4 - ヨード - 3 - ニトロベンズアミドであり、前記 - シクロデキストリンが 25 % (w/v) の濃度のヒドロキシプロピル - シクロデキストリンであり、そして前記リン酸緩衝剤が 10 mM リン酸緩衝剤である、請求項 27 に記載の使用。

【請求項 30】

4 - ヨード - 3 - ニトロベンズアミドの濃度が 1 % (w/v) である、請求項 29 に記載の使用。

【請求項 31】

前記リン酸緩衝剤が、リン酸水素二ナトリウム十二水和物、及びリン酸二水素ナトリウム二水和物を含む、請求項 29 に記載の医薬組成物の使用。

【請求項 32】

非経口送達、静脈内送達、又は経口送達用に製剤化される、請求項 26 に記載の医薬組成物の使用。

【請求項 33】

請求項 26 ~ 32 のいずれか 1 項に記載の使用であり、前記ガンが、副腎皮質細胞ガン

、肛門ガン、再生不良性貧血、胆管ガン、膀胱ガン、骨ガン、骨転移、CNS腫瘍、末梢CNSガン、乳ガン、キャスルマン病、子宮頸ガン、幼年期非ホジキンリンパ腫、結腸および直腸ガン、子宮内膜ガン、食道ガン、ユーイング系腫瘍、眼ガン、胆嚢ガン、消化管カルチノイド腫瘍、消化管間質腫瘍、妊娠性絨毛性疾患、有毛細胞白血病、ホジキン病、カボジ肉腫、腎臓ガン、喉頭および下咽頭ガン、急性リンパ性白血病、急性骨髄性白血病、小児白血病、慢性リンパ性白血病、慢性骨髄性白血病、肝ガン、肺ガン、肺カルチノイド腫瘍、非ホジキンリンパ腫、男性乳ガン、悪性中皮腫、多発性骨髄腫、骨髄異形成症候群、骨髄増殖性疾患、鼻腔および副鼻腔ガン、鼻咽腔ガン、神経芽細胞腫、口腔および口腔咽頭ガン、骨肉腫、卵巣ガン、膵臓ガン、陰茎ガン、下垂体ガン、前立腺ガン、網膜芽腫、横紋筋肉腫、唾液腺ガン、肉腫（成人軟組織ガン）、黒色腫皮膚ガン、非黒色腫皮膚ガン、胃ガン、睾丸ガン、胸腺ガン、甲状腺ガン、子宮肉腫、膣ガン、外陰ガン、ヴァルデンストレームマクログロブリン血症、並びにウイルス性ガンからなる群の一員である、前記使用。

【請求項 3 4】

前記ガンが、乳ガン、卵巣ガン、肺ガン、膵臓ガン、肉腫（成人軟組織ガン）、及びCNS腫瘍からなる群の一員である、請求項 2 6 ~ 3 2 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 3 5】

前記ガンが乳ガンである、請求項 2 6 ~ 3 2 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 3 6】

前記ガンが卵巣ガンである、請求項 2 6 ~ 3 2 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 3 7】

添付の実施例及び / 又は図面を参照して実質的に上記に記載されているのと同然の、請求項 1 ~ 2 4 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

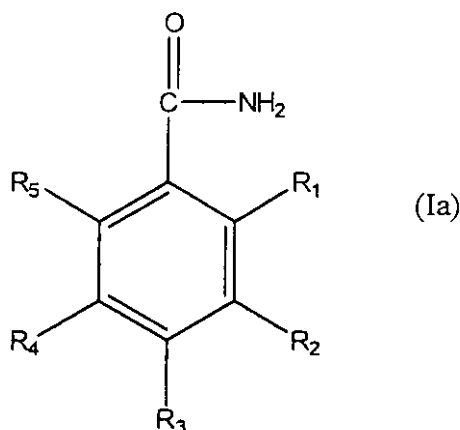
【請求項 3 8】

添付の実施例及び / 又は図面を参照して実質的に上記に記載されているのと同然の、請求項 2 5 ~ 3 6 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 3 9】

キットであり、式 (I a)

【化 5】



[式中、

R₁、R₂、R₃、R₄ および R₅ は独立して水素、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、ヨード、プロモ、フルオロ、クロロ、(C₁ - C₆) アルキル、(C₁ - C₆) アルコキシ、(C₃ - C₇) シクロアルキルおよびフェニルからなる群より選択され、5 個の R₁、R₂、R₃、R₄ および R₅ 置換基のうち少なくとも 2 個は常に水素であり、5 個の置換基のうち少なくとも 1 個は常にニトロであり、そしてニトロに隣接して位置する少なくと

も 1 個の置換基は常にヨードである]

で表される化合物、又はその医薬として許容される塩 ;

リン酸緩衝剤 ; 及び

- シクロデキストリン ;

を含み、ここで、前記化合物、リン酸緩衝剤及び - シクロデキストリンを組み合わせたとき、該 - シクロデキストリンが 20 ~ 40 % (w / v) の濃度で存在する、前記キット。

【請求項 40】

前記 - シクロデキストリンがヒドロキシプロピル - - シクロデキストリンである、請求項 39 に記載のキット。

【請求項 41】

前記 - シクロデキストリンがスルホブチルエーテル - - シクロデキストリンである、請求項 39 に記載のキット。

【請求項 42】

前記式 (I a) で表される化合物が 4 - ヨード - 3 - ニトロベンズアミドである、請求項 39 ~ 41 のいずれか 1 項に記載のキット。

【請求項 43】

4 - ヨード - ニトロベンズアミド、25 % (w / v) のヒドロキシプロピル - - シクロデキストリン、及び 10 mM のリン酸緩衝剤を含むキット。