

【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24年5月17日 (2012.5.17)

【公表番号】特表2011-517455(P2011-517455A)

【公表日】平成23年6月9日 (2011.6.9)

【年通号数】公開・登録公報2011-023

【出願番号】特願2011-503034(P2011-503034)

【国際特許分類】

C 07 D 409/12 (2006.01)

A 61 K 31/381 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 K 9/08 (2006.01)

A 61 K 9/107 (2006.01)

A 61 K 47/10 (2006.01)

A 61 K 47/02 (2006.01)

A 61 K 47/44 (2006.01)

A 61 K 47/14 (2006.01)

【F I】

C 07 D 409/12 C S P

A 61 K 31/381

A 61 P 35/00

A 61 K 9/08

A 61 K 9/107

A 61 K 47/10

A 61 K 47/02

A 61 K 47/44

A 61 K 47/14

【手続補正書】

【提出日】平成24年3月26日 (2012.3.26)

【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

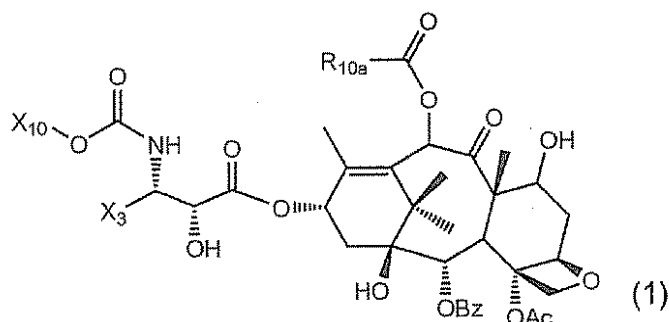
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (1) :

【化 1】



〔式中、 R_{10a} はエチルまたはシクロプロピルであり、 X_3 はチエニルであり、 X_{10} はシクロ

ブチルまたはシクロペンチルである]
で示される構造を持つタキサン。

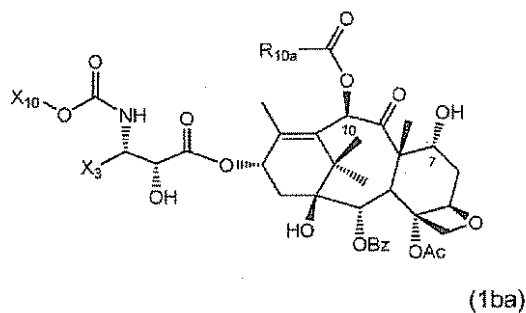
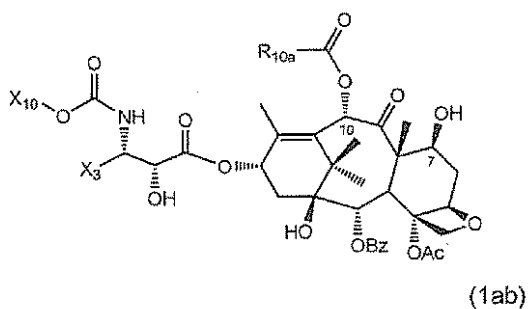
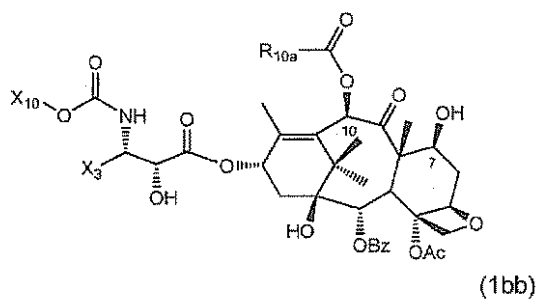
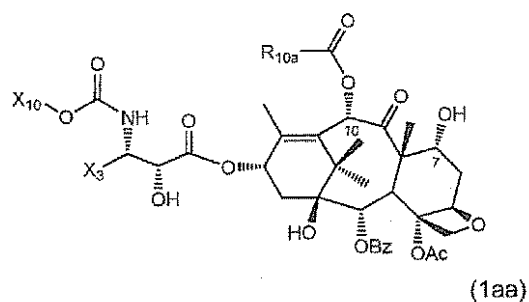
【請求項 2】

R_{10a} がエチルであり、 X_{10} がシクロブチルもしくはシクロペンチルであるか、
 R_{10a} がシクロプロピルであり、 X_{10} がシクロブチルもしくはシクロペンチルであるか、
 R_{10a} がエチルもしくはシクロプロピルであり、 X_{10} がシクロブチルであるか、または
 R_{10a} がエチルもしくはシクロプロピルであり、 X_{10} がシクロペンチルであり、
 X_3 が 2-チエニルである、請求項 1 に記載のタキサン。

【請求項 3】

式 (1aa)、(1bb)、(1ab)、および (1ba) :

【化 2】

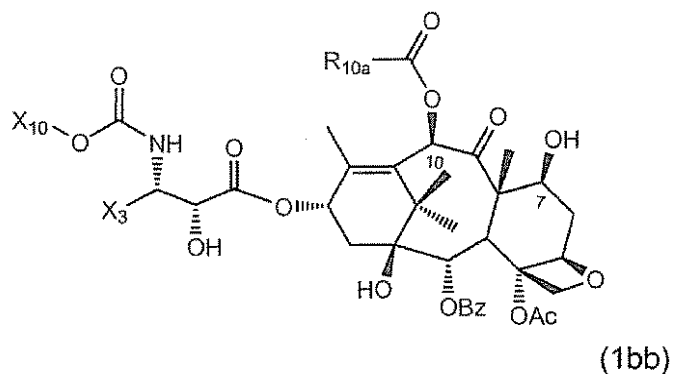


のいずれかで示される構造を持つ、請求項 1 または 2 に記載のタキサン。

【請求項 4】

式 (1bb) :

【化 3】

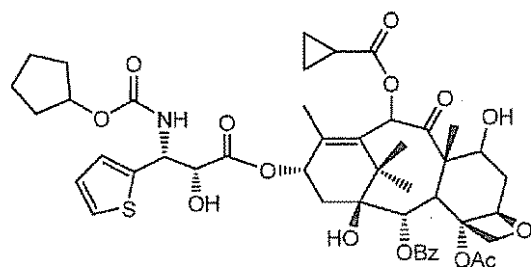


で示される構造を持つ、請求項 1 または 2 に記載のタキサン。

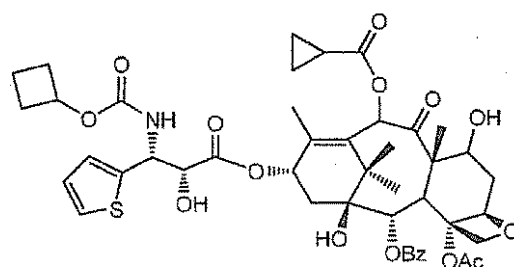
【請求項 5】

式(1A)、(1B)、(1C)、および(1D)：

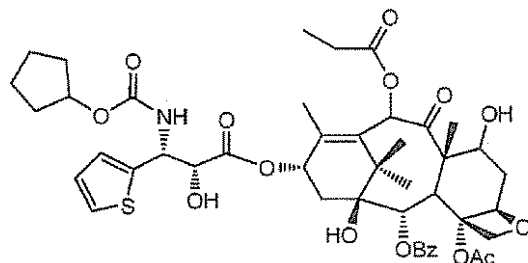
【化 4】



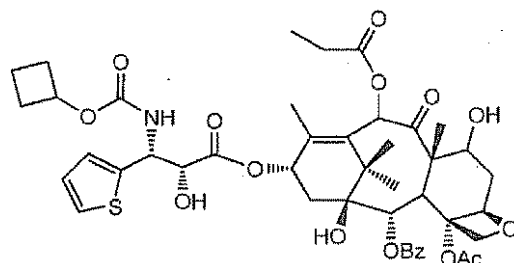
(1A)



(1B)



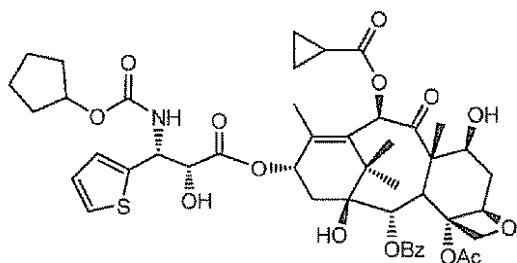
(1C)



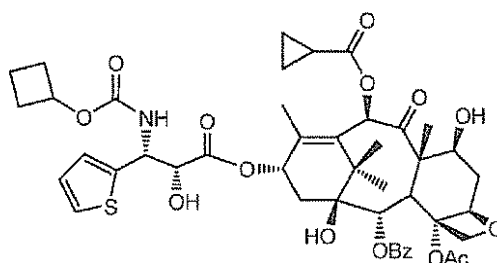
(1D)

のいずれかで示される構造を持つか、または式(1AA)、(1BB)、(1CC)、および(1DD)：

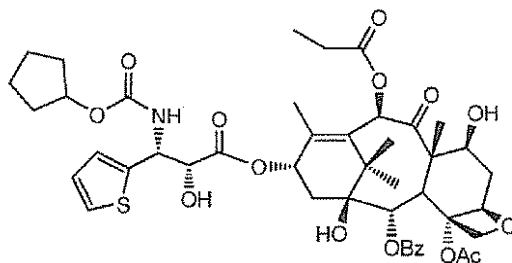
【化 5】



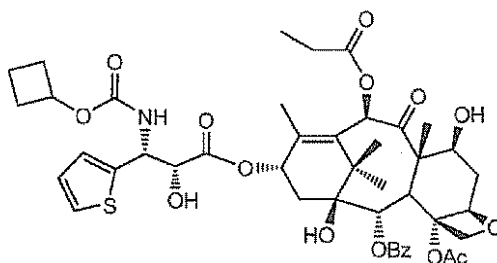
(1AA)



(1BB)



(1CC)



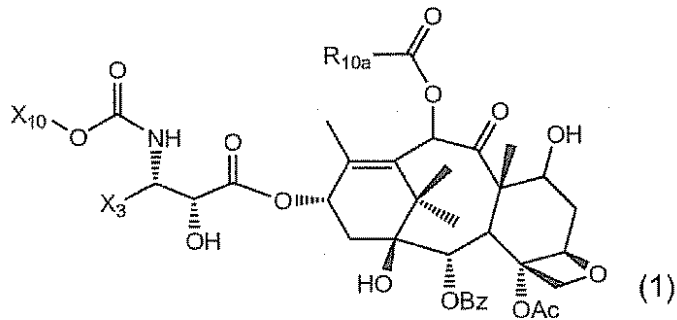
(1DD)

のいずれかで示される構造を持つ、請求項1に記載のタキサン。

【請求項 6】

式(1)：

【化 6】



[式中、 R_{10a} はエチルまたはシクロプロピルであり、 X_3 はチエニルであり、 X_{10} はシクロブチルまたはシクロペンチルである]

で示される構造を持つタキサンと、少なくとも1つの医薬上許容される担体とを含む医薬組成物。

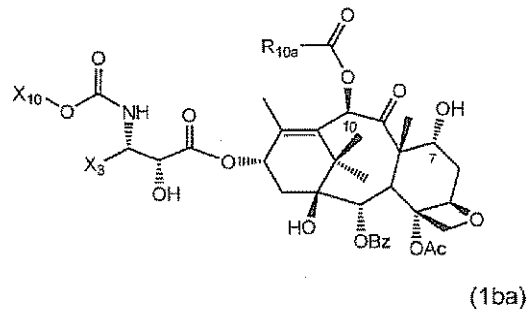
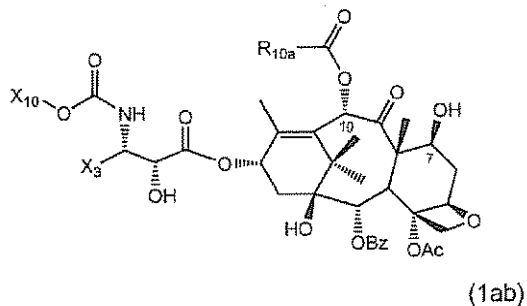
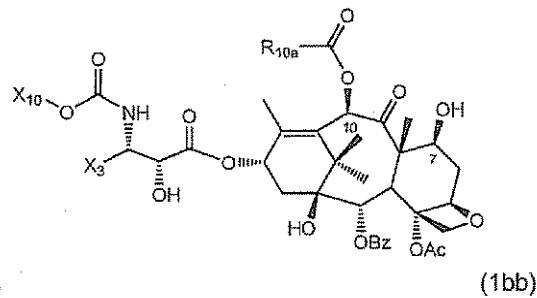
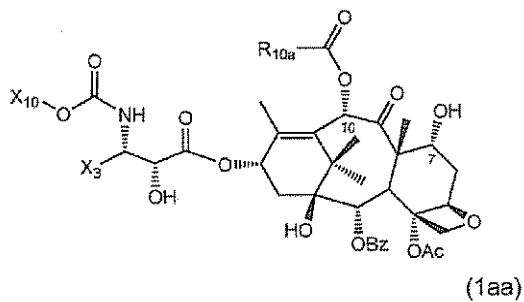
【請求項 7】

R_{10a} がエチルであり、 X_{10} がシクロブチルもしくはシクロペンチルであるか、
 R_{10a} がシクロプロピルであり、 X_{10} がシクロブチルもしくはシクロペンチルであるか、
 R_{10a} がエチルもしくはシクロプロピルであり、 X_{10} がシクロブチルであるか、または
 R_{10a} がエチルもしくはシクロプロピルであり、 X_{10} がシクロペンチルであり、
 X_3 が2-チエニルである、請求項6に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

タキサンが、式(1aa)、(1bb)、(1ab)、および(1ba)：

【化 7】

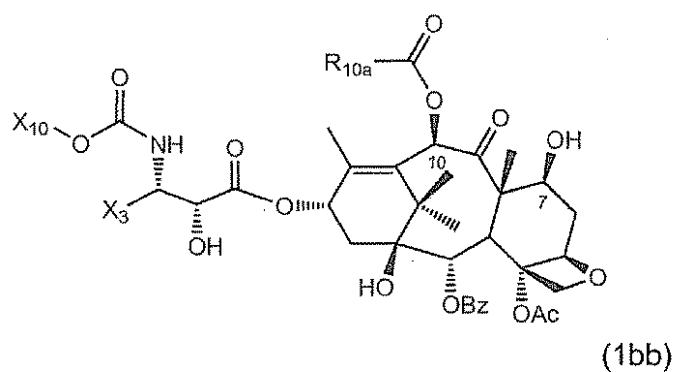


のいずれかで示される構造を持つ、請求項6または7に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

タキサンが、式(1bb)：

【化 8】

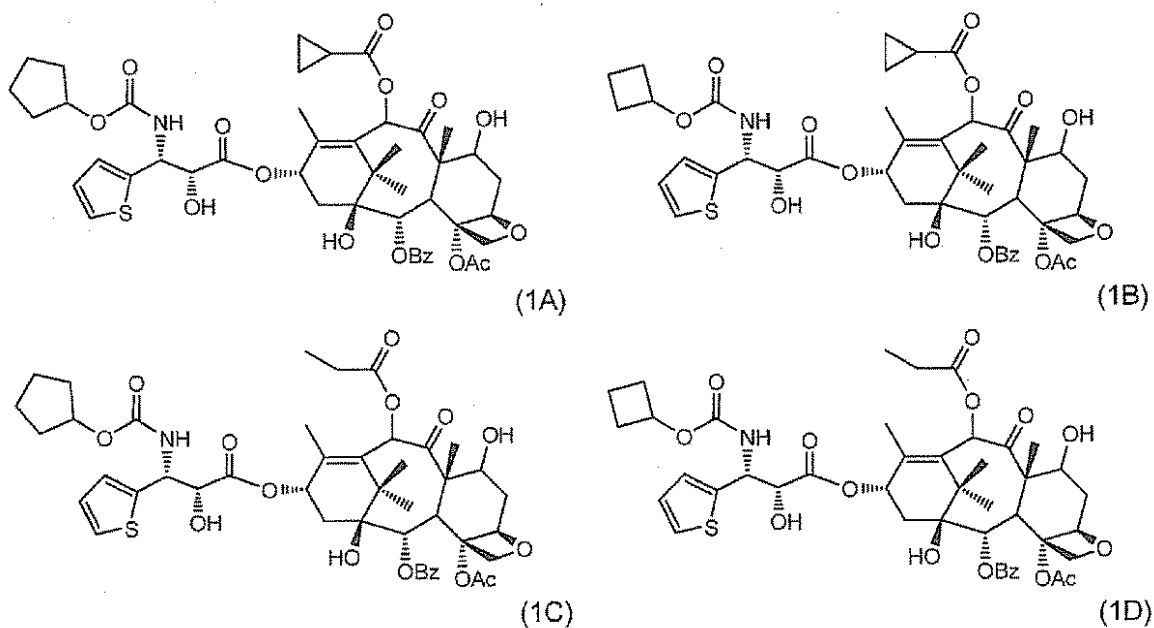


で示される構造を持つ、請求項6または7に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

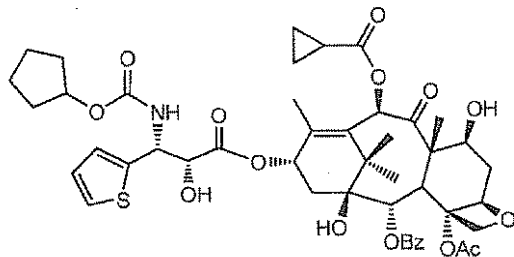
タキサンが、式(1A)、(1B)、(1C)、および(1D)：

【化 9】

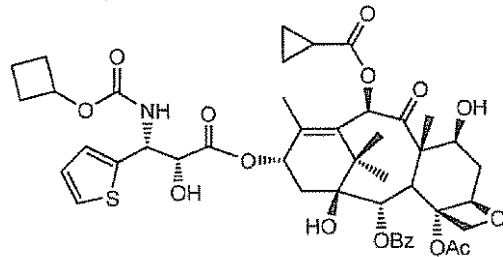


のいずれかで示される構造を持つか、または式(1AA)、(1BB)、(1CC)、および(1DD)：

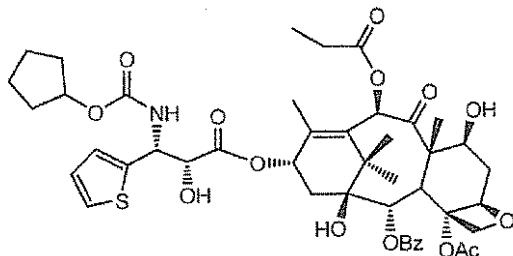
【化 10】



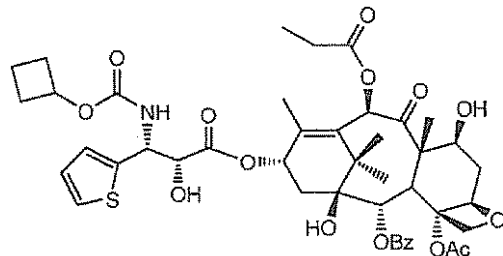
(1AA)



(1BB)



(1CC)



(1DD)

のいずれかで示される構造を持つ、請求項6に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

タキサンの濃度が約0.01mg/mL～10mg/mLである、請求項6に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

組成物が経口投与用の単一投与単位形であり、その投与単位形が患者の体表面積1m²あたり少なくとも20mg、または約25mg～約400mg、または約50mg～約200mgのタキサンを含有する、請求項6に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

組成物が非経口投与用の単一投与単位形であり、その投与単位形が患者の体表面積1m²あたり少なくとも20mg、または約40mg～約400mg、または約60mg～約350mg、または約50mg～約100mgのタキサンを含有する、請求項6に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

約10%までのエタノールを含む、請求項6に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

経口投与用、例えば経口溶液の形態である、請求項14に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

少なくとも約90%の蒸留水を含む経口溶液の形態である、請求項15に記載の医薬組成物。

【請求項 17】

約10%未満の界面活性剤、例えばポリソルベート80、ポリエトキシ化ヒマシ油、またはそれらの組み合わせを含む経口溶液の形態である、請求項15に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

非経口投与用である、請求項14に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

エマルションの形態である、請求項18に記載の医薬組成物。

【請求項 20】

エタノール溶液と脂肪エマルションとを混合することによって製造され、脂肪エマルションが例えば約10～約20%の脂肪を含有する、請求項19に記載の医薬組成物。

【請求項 21】

溶液、例えば少なくとも約85%の食塩液を含む溶液であり、約10%未満の界面活性剤、例えばポリソルベート80、ポリエトキシ化ヒマシ油、もしくはそれらの組み合わせを含んでもよい、請求項18に記載の医薬組成物。

【請求項 2 2】

哺乳動物において腫瘍成長を阻害するための、請求項6～21のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 2 3】

腫瘍が多剤耐性を示す腫瘍細胞を含み、多剤耐性腫瘍細胞は例えば薬物排出トランスポーターを過剰発現させる腫瘍細胞であり、薬物排出トランスポーターは例えばATP結合カセットトランスポーターであり、ATP結合カセットトランスポーターは例えばP-糖タンパク質、MDR関連タンパク質、乳がん耐性タンパク質、多剤耐性関連タンパク質、またはそれらの組み合わせである、請求項22に記載の医薬組成物。

【請求項 2 4】

腫瘍がパクリタキセルまたはドセタキセルに対して耐性である、請求項22または23に記載の医薬組成物。

【請求項 2 5】

腫瘍が上皮細胞癌である、請求項22～24のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 2 6】

腫瘍が、脳膠芽腫、乳癌、大腸癌、腎臓癌、肝臓癌、肺癌、卵巣癌、膵臓癌、腎臓癌、もしくは皮膚メラノーマ、またはSNB-19脳膠芽腫、HCT116大腸癌、HT-29大腸癌、DLD-1大腸癌、A549肺癌、HOP-18肺癌、MSTO-211H中皮腫、A375メラノーマ、MALME-3メラノーマ、SK-MEL-28メラノーマ、OVCAR4卵巣癌、OVCAR5卵巣癌、PANC-1膵臓癌、BxPC-3膵臓癌、786-0腎臓癌、もしくはTK-10腎臓癌である、請求項22～25のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 2 7】

経口投与または非経口投与される、請求項22～26のいずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 2 8】

界面活性剤、例えばポリソルベート80、ポリエトキシ化ヒマシ油、またはそれらの組み合わせを含む、請求項22～27のいずれかに記載の医薬組成物。