

【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 18 年 1 月 5 日 (2006.1.5)

【公表番号】特表 2004-536857 (P2004-536857A)

【公表日】平成 16 年 12 月 9 日 (2004.12.9)

【年通号数】公開・登録公報 2004-048

【出願番号】特願 2003-513564 (P2003-513564)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/498 (2006.01)

A 6 1 K 47/44 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

C 0 7 D 241/46 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/498

A 6 1 K 47/44

A 6 1 P 35/00

C 0 7 D 241/46

【手続補正書】

【提出日】平成 17 年 7 月 8 日 (2005.7.8)

【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

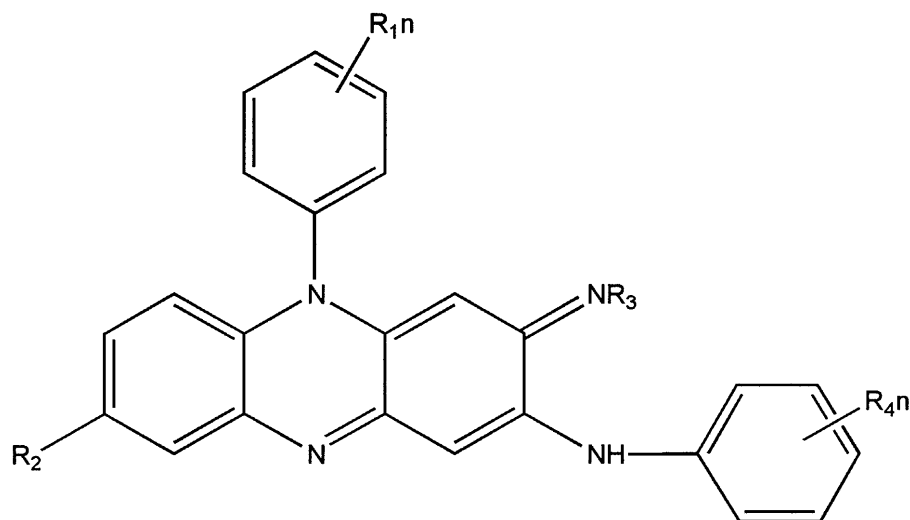
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

処置は、腫瘍のサイトに、治療上の有効量の下記構造式 I の化合物、それらの類似物、又は、それらの代謝物を含有している組成物の領域送達を含む、対象物の腫瘍の処置のために使用される医薬組成物を製造するための前記組成物の使用：

【化 1】



構造式 I

ここで、 R_1 及び R_4 は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_3$ のアルキル基、 $C_1 - C_3$ のアルコキシ基、フルオロメトキシ及びトリフルオロメチル基からなる群から選択され、 R_2 は、水素及びハロゲン原子からなる群から選択され、 R_3 は、水素原子、 $C_1 - C_4$ のアルキル、 N, N - ジアルキルアミノアルキル、 $C_3 - C_{12}$ のシクロアルキル、メチルシクロヘキシル、ヒドロキシシクロヘキシル、シクロアルキルメチル、ピペリジル、アルキル置換ピペリジル及び N - ベンジル置換ピペリジルからなる群から選択され、また、 n は、1 以上 3 以下の数である。

【請求項 2】

R_1 は、1 の位置で有し、Cl である請求項 1 記載の 使用。

【請求項 3】

$n = 1$ であり、 R_1 は Cl であり、 R_2 は H であり、 R_3 は $CH(CH_3)_2$ であり、かつ、 R_4 は Cl である請求項 1 又は 2 記載の 使用。

【請求項 4】

リミノフェナジン化合物は、クロファジミンである請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の 使用。

【請求項 5】

前記腫瘍は、肝臓癌又は肝臓中の二次癌である請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の 使用。

【請求項 6】

前記領域送達は、肝臓の動脈経路である請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の 使用。

【請求項 7】

前記腫瘍は、結腸直腸癌、肺癌、乳癌、前立腺癌、膵臓癌、腎臓癌及び 他の器官の二次転移 からなる群から選択される請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の 使用。

【請求項 8】

前記組成物は、主動脈を通過してポンプ経路で溶液の連続的な輸液として投与される請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載の 使用。

【請求項 9】

前記組成物は、腹腔内に投与される請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載の 使用。

【請求項 10】

前記組成物は、さらに脂質を含有している請求項 1 ~ 9 のいずれかに記載の 使用。

【請求項 11】

前記脂質は、腫瘍が どん欲 であるための脂質である請求項 10 に記載の 使用。

【請求項 12】

前記脂質は、油であり、

油は、外部手段によってイメージされる請求項 10 又は 11 に記載の 使用。

【請求項 13】

前記油は、ヨード化油である請求項 11 記載の 使用。

【請求項 14】

前記油は、リピオドールである請求項 11 記載の 使用。

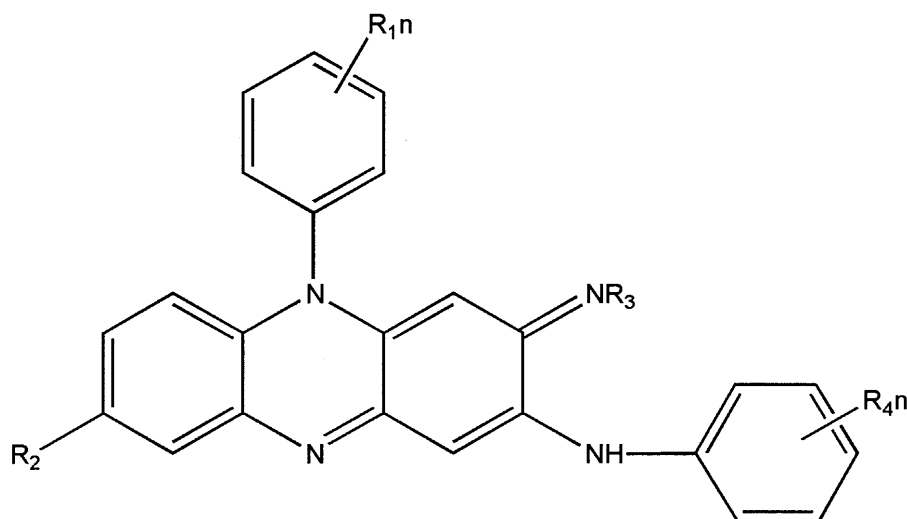
【請求項 15】

前記脂質は、大豆油、脂肪酸モノグリセリド、中鎖トリグリセライド、オリーブ油、落花生油、クルミ油、肝油、ニトロオキシル脂肪酸、エチルリノール酸塩、ポリヨード化トリグリセリド及びポリヨード化トリアシルグリセロールからなる群から選択される請求項 10 記載の 使用。

【請求項 16】

脂質キャリアー、及び、少なくとも $0.1 \mu M$ の濃度の下記構造式 I の化合物を含有している組成物である、対象物の腫瘍の処置において、使用するための製薬組成物：

【化 2】



構造式 I

ここで、 R_1 及び R_4 は、水素原子、ハロゲン原子、 $C_1 - C_3$ のアルキル基、 $C_1 - C_3$ のアルコキシ基、フルオロメトキシ及びトリフルオロメチル基からなる群から選択され、 R_2 は、水素及びハロゲン原子からなる群から選択され、 R_3 は、水素及びハロゲン原子からなる群から選択され、 R_3 は、水素原子、 $C_1 - C_4$ のアルキル、 N,N -ジアルキルアミノアルキル、 $C_3 - C_{12}$ のシクロアルキル、メチルシクロヘキシル、ヒドロキシシクロヘキシル、シクロアルキルメチルピペリジル、アルキル置換ピペリジル及び N -ベンジル置換ピペリジルからなる群から選択され、また、 n は、1 以上 3 以下の数であり、

前記脂質キャリアーは、ヨード化油、大豆油、脂肪酸モノグリセリド、中鎖トリグリセライド、オリーブ油、落花生油、クルミ油、肝油、ニトロオキシ脂肪酸、エチルリノール酸塩、ポリヨード化トリグリセリド及びポリヨード化トリアシルグリセロールからなる群から選択される。

【請求項 17】

R_1 は、1 の位置で有し、Cl である請求項 16 記載の組成物。

【請求項 18】

$n = 1$ であり、 R_1 は Cl であり、 R_2 は H であり、 R_3 は $CH(CH_3)_2$ であり、かつ、 R_4 は Cl である請求項 16 又は 17 記載の組成物。

【請求項 19】

リミノフェナジン化合物は、クロファジミンである請求項 16 ~ 18 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 20】

前記ヨード化油は、リピオドールである請求項 16 ~ 19 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 21】

リミノフェナジン化合物は、少なくとも $0.5 \mu M$ の濃度で組成物中に存在している請求項 16 ~ 20 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 22】

前記リミノフェナジン化合物の濃度は、 $0.1 \mu M$ 以上 $10 \mu M$ 以下の範囲である請求項 16 ~ 21 のいずれかに記載の組成物。