

【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 61 K 31/498 (2006.01)

A 61 K 47/44 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

C 07 D 241/46 (2006.01)

【F I】

A 61 K 31/498

A 61 K 47/44

A 61 P 35/00

C 07 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

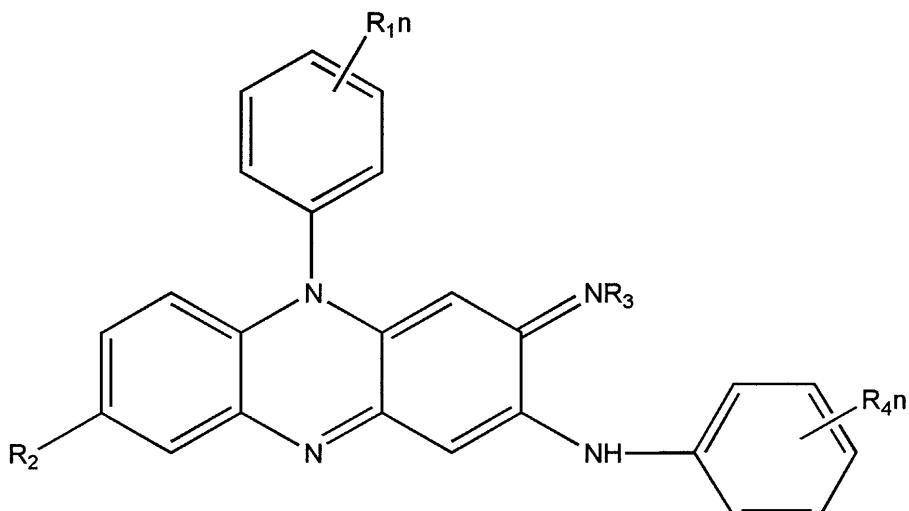
【補正の内容】

【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】



ここで、R<sub>1</sub>及びR<sub>4</sub>は、水素原子、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>のアルキル基、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>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<sub>2</sub>は、水素及びハロゲン原子からなる群から選択され、R<sub>3</sub>は、水素原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>のアルキル、N,N-ジアルキルアミノアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>12</sub>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、ペリジル、アルキル置換ペリジル及びN-ベンジル置換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<sub>1</sub>は、1の位置で有し、CIである請求項1記載の使用。

【請求項3】

n=1であり、R<sub>1</sub>はCIであり、R<sub>2</sub>はHであり、R<sub>3</sub>はCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>であり、かつ、R<sub>4</sub>はCI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、肝臓の動脈経由である請求項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、主動脈を通ってポンプ経由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。

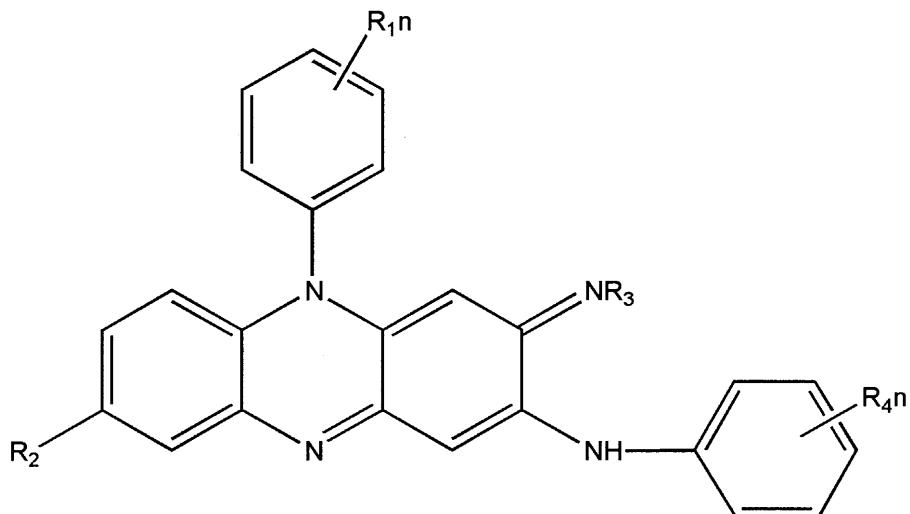
【請求項15】

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ス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0.1μM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<sub>1</sub>及びR<sub>4</sub>は、水素原子、ハロゲン原子、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>のアルキル基、C<sub>1</sub> - C<sub>3</sub>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<sub>2</sub>は、水素及びハロゲン原子からなる群から選択され、R<sub>3</sub>は、水素及びハロゲン原子からなる群から選択され、R<sub>3</sub>は、水素原子、C<sub>1</sub> - C<sub>4</sub>のアルキル、N,N-ジアルキルアミノアルキル、C<sub>3</sub> - C<sub>12</sub>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スからなる群から選択される。

## 【請求項17】

R<sub>1</sub>は、1の位置で有し、CIである請求項16記載の組成物。

## 【請求項18】

n=1であり、R<sub>1</sub>はCIであり、R<sub>2</sub>はHであり、R<sub>3</sub>はCH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>であり、かつ、R<sub>4</sub>はCI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 μM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 μM以上10 μM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。