

【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22年7月1日(2010.7.1)

【公表番号】特表2009-539862(P2009-539862A)
 【公表日】平成21年11月19日(2009.11.19)
 【年通号数】公開・登録公報2009-046
 【出願番号】特願2009-514424(P2009-514424)
 【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)
 A 6 1 K 47/12 (2006.01)
 A 6 1 K 38/00 (2006.01)
 A 6 1 K 9/20 (2006.01)
 A 6 1 K 9/48 (2006.01)
 A 6 1 K 9/16 (2006.01)
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)
 A 6 1 P 29/00 (2006.01)
 A 6 1 P 37/06 (2006.01)
 A 6 1 P 35/02 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 45/00
 A 6 1 K 47/12
 A 6 1 K 37/02
 A 6 1 K 9/20
 A 6 1 K 9/48
 A 6 1 K 9/16
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 43/00 1 0 5
 A 6 1 P 35/02

【手続補正書】

【提出日】平成22年5月13日(2010.5.13)

【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】

それぞれ以下に規定する、治療上有効量の薬物と強化剤とを腸に送達するのに有効な医薬組成物であって、該組成物はD A CまたはH D A Cインヒビターおよび強化剤を含み、該強化剤は6～20炭素原子の炭素鎖長を有する中鎖脂肪酸または中鎖脂肪酸誘導体を含み、室温で固体である、上記組成物。

【請求項2】

炭素鎖長が8～14炭素原子である、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

強化剤が、カプリル酸ナトリウム、カプリン酸ナトリウム、およびラウリン酸ナトリウムからなる群より選択される、請求項1に記載の組成物。

【請求項4】

薬物および強化剤が1：100，000～10：1（薬物：強化剤）の比で存在する、請求項1に記載の組成物。

【請求項5】

DACまたはHDACインヒビターが、短鎖脂肪酸、ヒドロキサム酸、プロペンアミド、アロイルピロリルヒドロキシアミド、トリコスタチン、スピルコスタチン（spiruchostatins）、サリナミド（salinamides）、環状テトラペプチド、アンタナペプチン（antanapeptins）、環状ヒドロキサム酸含有ペプチド、トラボキシニン、ベンズアミド、三環系ラクタム誘導体、三環系スルタム誘導体、アミジオール（amijiol）の酢酸誘導体、有機硫黄化合物、プサマプリン（psammaplins）、および求電子性ケトンからなる群より選択される、請求項1に記載の組成物。

【請求項6】

DACまたはHDACインヒビターが、ブチラート、フェニルブチラート、ピバロイルオキシメチルブチラート、N-ヒドロキシ-4-(3-メチル-2-フェニル-ブチリルアミノ)-ベンズアミド、4-(2,2-ジメチル-4-フェニルブチリルアミノ)-N-ヒドロキシベンズアミド、バルプロアート、バルプロ酸、スベロイル-アニリドヒドロキサム酸、オキサムフラチン、M-カルボキシケイ皮酸ビスヒドロキサミド、6-(3-ベンゾイル-ウレイド)-ヘキサノ酸ヒドロキシアミド、スベリックビスヒドロキサマート（suberic bishydroxamate）、N-ヒドロキシ-7-(2-ナフチルチオ)ヘプタノミド（N-hydroxy-7-(2-naphthylthio) heptanomide）、ニコチンアミド、スクリプタイド（scriptaid）、スクリプチド（scriptide）、スプリトマイシン（splitomicin）、ルナシン、ITF2357、A-161906、NVP-LAQ824、LBH589、ピロキサミド（pyroxamide）、CBHA、3-Cl-UCHA、SB-623、SB-624、SB-639、SK-7041、3-(4-ジメチルアミノ-フェニル)-N-ヒドロキシ-2-プロペンアミド、2-アミノ-8-オキソ-9,10-エポキシ-デカノイル、3-(4-アロイル-1H-ピロール-2-イル)-N-ヒドロキシ-2-プロペンアミド、MC1293、APHA化合物8、トリコスタチンA、トリコスタチンC、トラボキシニンA、トラボキシニンB、ロミデブシン、HC-トキシニン、クラミドシン、アンタナペプチンA、アンタナペプチンB、アンタナペプチンC、アンタナペプチンD、ジヘテロペプチン、WF-3161、Cyl-1、Cyl-2、アピシジン、FR225497、FR901375、スピルコスタチンA、スピルコスタチンB、スピルコスタチンC、サリナミドA、サリナミドB、M344、MS-275、CI-994、タセジナリン、シルチノール（sirtinol）、ジアリルジスルフィド、スルフォラファン、-ケトアミド、トリフルオロメチルケトン、ピメロイルアニリドo-アミノアニリド、デブデシン、プサマプリンA、プサマプリンF、チューバシン（tubacin）、クルクミン、ヒスタシン（histacin）、ピメロイルアニリドo-アミノアニリド、6-クロロ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-カルボキサミド、CRA-024781、CRA-026440、CG1521、PXD101、G2M-777、CAY10398、CTPB、MGCD0103、およびBL1521からなる群より選択される、請求項1に記載の組成物。

【請求項7】

治療上有効量のロミデブシンを送達するのに有効な医薬組成物であって、該組成物はロミデブシンおよび強化剤を含み、該強化剤は、カプリル酸ナトリウム、カプリン酸ナトリウム、ラウリン酸ナトリウム、およびそれらの組み合わせからなる群より選択される、上記組成物。

【請求項8】

治療上有効量のDACまたはHDACインヒビターおよび強化剤を腸に送達するのに有効な医薬組成物であって、該組成物はDACインヒビターおよび強化剤を含み、該強化剤

は、以下のもの：

(i) 6 ~ 20 炭素原子の炭素鎖長を有する中鎖脂肪酸の塩またはその塩；

(i i) 6 ~ 20 炭素原子の炭素鎖長を有する、中鎖脂肪酸ハロゲン化物誘導体、中鎖脂肪酸無水物誘導体、または中鎖脂肪酸グリセリド誘導体；

(i i i) 脂肪酸塩の反対側の末端に、酸ハロゲン化物部分、酸無水物部分、またはグリセリド部分を有する、上記項 (i) の脂肪酸塩；

(i v) ハロゲン化物部分の反対側の末端に、酸ハロゲン化物部分、酸無水物部分、またはグリセリド部分を有する、上記項 (i i) の酸ハロゲン化物誘導体；

(v) 無水物の反対側の末端に、酸無水物部分、酸ハロゲン化物部分、またはグリセリド部分を有する、上記項 (i i) の無水物誘導体；または

(v i) グリセリド部分の反対側の末端に、グリセリド部分、酸ハロゲン化物部分、または酸無水物部分を有する、上記項 (i i) のグリセリド誘導体；

を含み、かつ該強化剤は室温で固体である、上記組成物。

【請求項 9】

治療上有効量の D A C または H D A C インヒビターおよび強化剤を腸に送達するのに有効な医薬組成物であって、該組成物は D A C または H D A C インヒビターおよび強化剤を含み、該強化剤は、(1) 6 ~ 20 炭素原子の炭素鎖長を有する中鎖脂肪酸または中鎖脂肪酸誘導体を含み、(2) 該組成物中に存在する唯一の強化剤であり、かつ (3) 下層循環への D A C または H D A C インヒビターの腸送達を促進する、上記組成物。

【請求項 10】

剤形が、錠剤、カプセル、または多粒子剤形である、請求項 1、8 または 9 に記載の剤形。

【請求項 11】

強化剤が、8 ~ 14 炭素原子の炭素鎖長を有する脂肪酸の塩である、請求項 8 または請求項 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

脂肪酸塩が、カプリル酸ナトリウム、カプリン酸ナトリウム、およびラウリン酸ナトリウムからなる群より選択される、請求項 11 に記載の医薬組成物。

【請求項 13】

D A C または H D A C インヒビターが、短鎖脂肪酸、ヒドロキサム酸、プロペンアミド、アロイルピロリルヒドロキシアミド、トリコスタチン、スピルコスタチン、サリナミド、環状テトラペプチド、アンタナペプチン、環状ヒドロキサム酸含有ペプチド、トラボキシン、ベンズアミド、三環系ラクタム誘導体、三環系スルタム誘導体、アミジオールの酢酸誘導体、有機硫黄化合物、プサマプリン、および求電子性ケトンからなる群より選択される、請求項 8 または 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

D A C または H D A C インヒビターが、ブチラート、フェニルブチラート、ピバロイルオキシメチルブチラート、N - ヒドロキシ - 4 - (3 - メチル - 2 - フェニル - ブチリルアミノ) - ベンズアミド、4 - (2 , 2 - ジメチル - 4 - フェニルブチリルアミノ) - N - ヒドロキシベンズアミド、バルプロアート、バルプロ酸、スベロイル - アニリドヒドロキサム酸、オキサムフラチン、M - カルボキシケイ皮酸ビスヒドロキサミド、6 - (3 - ベンゾイル - ウレイド) - ヘキサ酸ヒドロキシアミド、スベリックビスヒドロキサマート、N - ヒドロキシ - 7 - (2 - ナフチルチオ) ヘプタノミド、ニコチンアミド、スクリプタイド、スクリプチド、スプリトマイシン、ルナシン、I T F 2 3 5 7、A - 1 6 1 9 0 6、N V P - L A Q 8 2 4、L B H 5 8 9、ピロキサミド、C B H A、3 - C 1 - U C H A、S B - 6 2 3、S B - 6 2 4、S B - 6 3 9、S K - 7 0 4 1、3 - (4 - ジメチルアミノ - フェニル) - N - ヒドロキシ - 2 - プロペンアミド、2 - アミノ - 8 - オキソ - 9 , 1 0 - エポキシ - デカノイル、3 - (4 - アロイル - 1 H - ピロール - 2 - イル) - N - ヒドロキシ - 2 - プロペンアミド、M C 1 2 9 3、A P H A 化合物 8、トリコスタチン A、トリコスタチン C、トラボキシン A、トラボキシン B、ロミデプシン、H C -

トキシシン、クラミドシン、アンタナペプチンA、アンタナペプチンB、アンタナペプチンC、アンタナペプチンD、ジヘテロペプチン、WF-3161、Cy1-1、Cy1-2、アピシジン、FR225497、FR901375、スピルコスタチンA、スピルコスタチンB、スピルコスタチンC、サリナミドA、サリナミドB、M344、MS-275、CI-994、タセジナリン、シルチノール、ジアリルジスルフィド、スルフォラファン、 β -ケトアミド、トリフルオロメチルケトン、ピメロイルアニリド α -アミノアニリド、デブデシン、プサマブリンA、プサマブリンF、チューバシン、クルクミン、ヒスタシン、ピメロイルアニリド α -アミノアニリド、6-クロロ-2,3,4,9-テトラヒドロ-1H-カルバゾール-1-カルボキサミド、CRA-024781、CRA-026440、CG1521、PXD101、G2M-777、CAY10398、CTPB、MGCD0103、およびBL1521からなる群より選択される、請求項8または9に記載の医薬組成物。

【請求項15】

DACまたはHDACインヒビターがロミデブシンである、請求項8または9に記載の医薬組成物。

【請求項16】

請求項1、7、8、または9に記載の医薬組成物を含む固体経口投与剤形。

【請求項17】

錠剤、カプセル、または多粒子組成物の形態の、請求項16に記載の固体経口投与剤形

。