

【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 12 月 21 日 (2006.12.21)

【公表番号】特表 2006-507271 (P2006-507271A)

【公表日】平成 18 年 3 月 2 日 (2006.3.2)

【年通号数】公開・登録公報 2006-009

【出願番号】特願 2004-545192 (P2004-545192)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/454 (2006.01)
A 6 1 K 31/203 (2006.01)
A 6 1 K 31/4745 (2006.01)
A 6 1 K 31/475 (2006.01)
A 6 1 K 31/496 (2006.01)
A 6 1 K 31/506 (2006.01)
A 6 1 K 31/522 (2006.01)
A 6 1 K 31/573 (2006.01)
A 6 1 K 35/14 (2006.01)
A 6 1 K 35/28 (2006.01)
A 6 1 K 35/44 (2006.01)
A 6 1 K 35/50 (2006.01)
A 6 1 K 39/395 (2006.01)
A 6 1 K 45/00 (2006.01)
A 6 1 P 7/06 (2006.01)
A 6 1 P 35/02 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
C 0 7 D 401/04 (2006.01)
A 6 1 K 38/00 (2006.01)
A 6 1 K 38/22 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/454
 A 6 1 K 31/203
 A 6 1 K 31/4745
 A 6 1 K 31/475
 A 6 1 K 31/496
 A 6 1 K 31/506
 A 6 1 K 31/522
 A 6 1 K 31/573
 A 6 1 K 35/14 Z
 A 6 1 K 35/28
 A 6 1 K 35/44
 A 6 1 K 35/50
 A 6 1 K 39/395 N
 A 6 1 K 45/00
 A 6 1 P 7/06
 A 6 1 P 35/02
 A 6 1 P 43/00 1 2 1
 C 0 7 D 401/04
 A 6 1 K 37/02
 A 6 1 K 37/24

【手続補正書】

【提出日】平成18年10月11日(2006.10.11)

【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

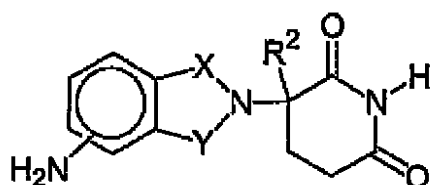
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(1)：

【化1】



(I)

(式中、XおよびYのうちの一方はC=Oであり、XおよびYのうちの他方はC=OまたはCH₂であり、R²は水素または低級アルキルである)

で表される化合物またはその製薬上許容可能な塩、溶媒和物もしくは立体異性体を有効成分として含有する、骨髓異形成症候群の治療用組成物。

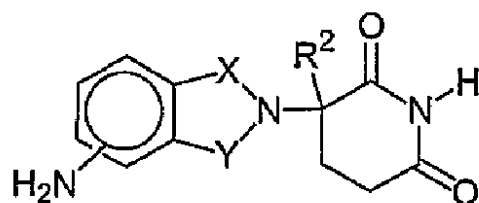
【請求項2】

R²が水素である、請求項1に記載の組成物。

【請求項3】

化合物が、式(1)：

【化2】



(I)

(式中、XおよびYのうちの一方はC=Oであり、XおよびYのうちの他方はC=OまたはCH₂であり、R²は水素または低級アルキルである)

で表される、請求項1に記載の組成物。

【請求項4】

化合物が製薬上許容可能な塩である、請求項1に記載の組成物。

【請求項5】

化合物が製薬上許容可能な溶媒和物である、請求項1に記載の組成物。

【請求項6】

化合物が製薬上許容可能な立体異性体である、請求項1に記載の組成物。

【請求項7】

立体異性体が鏡像異性体的に純粋なR体である、請求項6に記載の組成物。

【請求項8】

立体異性体が鏡像異性体的に純粋なS体である、請求項6に記載の組成物。

【請求項 9】

化合物が、4-(アミノ)-2-(2,6-ジオキソ(3-ピペリジル))-イソインドリン-1,3-ジオンである、請求項1に記載の組成物。

【請求項 10】

化合物が、3-(4-アミノ-1-オキソ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-ピペリジン-2,6-ジオンである、請求項1に記載の組成物。

【請求項 11】

治療または予防有効成分として第2の有効成分をさらに含む、請求項1～10のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項 12】

第2の有効成分が血球形成を改善し得るものである、請求項11に記載の組成物。

【請求項 13】

第2の有効成分が、サイトカイン、造血成長因子、抗癌剤、抗生物質、プロテアソーム阻害剤、または免疫抑制剤である、請求項11に記載の組成物。

【請求項 14】

第2の有効成分が、エタネルセプト、イマチニブ、抗TNF-抗体、インフリキシマブ、G-CSF、GM-CSF、EPO、トポテカン、ペントキシフィリン、シプロフロキサシン、イリノテカン、ビンブラスチン、デキサメタゾン、IL2、IL8、IL18、Ara-C、ビノレルピン、イソトレチノイン、13-cis-レチノイン酸、三酸化ヒ素、またはその薬理学的に有効な変異体もしくは誘導体である、請求項11に記載の組成物。

【請求項 15】

骨髄異形成症候群が、不応性貧血、環状鉄芽球を伴う不応性貧血、過剰芽球を伴う不応性貧血、急性転化を来した過剰芽球を伴う不応性貧血、または慢性骨髄単球性白血病である、請求項1～14のいずれか1項に記載の組成物。

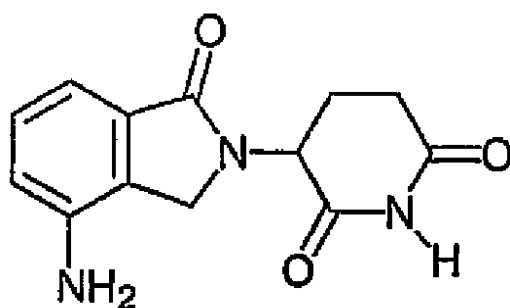
【請求項 16】

臍帯血、胎盤血、末梢血幹細胞、造血幹細胞調製物、または骨髄を患者へ移植する前、途中または後に投与される、請求項1～15のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項 17】

以下の式：

【化 3】



を有する3-(4-アミノ-1-オキソ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-ピペリジン-2,6-ジオンまたはその製薬上許容可能な塩、溶媒和物もしくは立体異性体を有効成分として含有し、化合物に基づいて1日当たり5～50mgの量で投与される、骨髄異形成症候群の治療用組成物。

【請求項 18】

化合物が製薬上許容可能な塩である、請求項17に記載の組成物。

【請求項 19】

化合物が製薬上許容可能な溶媒和物である、請求項17に記載の組成物。

【請求項 20】

化合物が製薬上許容可能な立体異性体である、請求項17に記載の組成物。

【請求項 2 1】

立体異性体が鏡像異性体的に純粋なR体である、請求項20に記載の組成物。

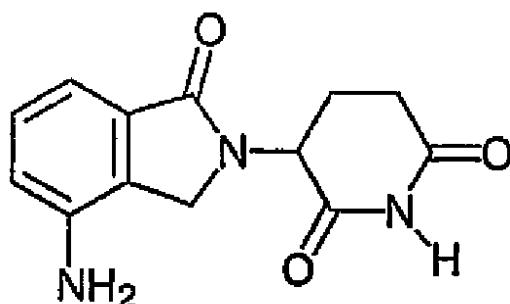
【請求項 2 2】

立体異性体が鏡像異性体的に純粋なS体である、請求項20に記載の組成物。

【請求項 2 3】

化合物が、以下の式：

【化 4】



を有する3-(4-アミノ-1-オキソ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-ピペリジン-2,6-ジオンである、請求項17に記載の組成物。

【請求項 2 4】

治療または予防有効成分として第2の有効成分をさらに含む、請求項17～23のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項 2 5】

第2の有効成分が血球形成を改善し得るものである、請求項24に記載の組成物。

【請求項 2 6】

第2の有効成分が、サイトカイン、造血成長因子、抗癌剤、抗生物質、プロテアソーム阻害剤、または免疫抑制剤である、請求項24に記載の組成物。

【請求項 2 7】

第2の有効成分が、エタネルセプト、イマチニブ、抗TNF-抗体、インフリキシマブ、G-CSF、GM-CSF、EPO、トボテカン、ペントキシフィリン、シプロフロキサシン、イリノテカン、ビンブラスチン、デキサメタゾン、IL2、IL8、IL18、Ara-C、ピノレルピン、イソトレチノイン、13-cis-レチノイン酸、三酸化ヒ素、またはその薬理学的に有効な変異体もしくは誘導体である、請求項26に記載の組成物。

【請求項 2 8】

骨髄異形成症候群が、不応性貧血、環状鉄芽球を伴う不応性貧血、過剰芽球を伴う不応性貧血、急性転化を来した過剰芽球を伴う不応性貧血、または慢性骨髄単球性白血病である、請求項17～27のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項 2 9】

臍帯血、胎盤血、末梢血幹細胞、造血幹細胞調製物、または骨髄を患者へ移植する前、途中または後に投与される、請求項17～28のいずれか1項に記載の組成物。

【請求項 3 0】

第2の有効成分がデキサメタゾンである、請求項27に記載の組成物。

【請求項 3 1】

組成物を投与される患者が、骨髄異形成症候群について以前には治療を受けていない、請求項17に記載の組成物。

【請求項 3 2】

組成物を投与される患者が、骨髄異形成症候群について以前に治療を受けている、請求項17に記載の組成物。

【請求項 3 3】

経口投与される、請求項17に記載の組成物。

【請求項 3 4】

カプセルまたは錠剤の形状で投与される、請求項33に記載の組成物。

【請求項35】

周期的に投与される、請求項17に記載の組成物。

【請求項36】

16～24週間、毎日1回または2回投与される、請求項35に記載の組成物。

【請求項37】

1サイクルが、組成物の投与と、少なくとも1週間、2週間、または3週間の休止を含む、請求項35に記載の組成物。

【請求項38】

周期数が、1～12サイクルである、請求項35に記載の組成物。

【請求項39】

3-(4-アミノ-1-オキソ-1,3-ジヒドロ-イソインドール-2-イル)-ピペリジン-2,6-ジオンを含む組成物が、化合物に基づいて1日当たり5～25mgの量を28日中21日間、16～24週間にわたり投与される、請求項35に記載の組成物。

【請求項40】

溶媒和物が水和物である、請求項19に記載の組成物。

【請求項41】

化合物に基づいて1日当たり5～25mgの量で投与される、請求項23に記載の組成物。

【請求項42】

化合物に基づいて1日当たり10mgの量で投与される、請求項23に記載の組成物。

【請求項43】

化合物に基づいて1日当たり15mgの量で投与される、請求項23に記載の組成物。

【請求項44】

化合物に基づいて1日当たり25mgの量で投与される、請求項23に記載の組成物。

【請求項45】

化合物に基づいて1日おきに25～50mgの量で投与される、請求項23に記載の組成物。

【請求項46】

約16週間の周期で、毎日1回または2回投与される、請求項23に記載の組成物。

【請求項47】

周期が少なくとも1週間、2週間、または3週間の休止を含む、請求項46に記載の組成物。

【請求項48】

化合物に基づいて1日当たり10mgまたは15mgの量で、28日間のブロック中、21日間投与される、請求項23に記載の組成物。

【請求項49】

カプセルとして、化合物に基づいて1日当たり5mgの量で経口投与される、請求項23に記載の組成物。

【請求項50】

カプセルとして、化合物に基づいて1日当たり10mgの量で経口投与される、請求項23に記載の組成物。