

【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23年10月13日 (2011.10.13)

【公表番号】特表2011-500841 (P2011-500841A)

【公表日】平成23年1月6日 (2011.1.6)

【年通号数】公開・登録公報2011-001

【出願番号】特願2010-531264 (P2010-531264)

【国際特許分類】

C 0 7 D 491/22 (2006.01)

A 6 1 K 31/4745 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 491/22 C S P

A 6 1 K 31/4745

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成23年8月22日 (2011.8.22)

【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

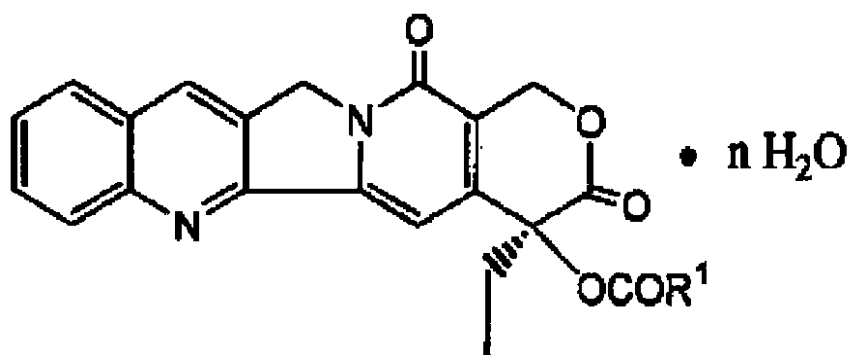
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 ( I ) :

【化 1】



(式中、n は 1 ~ 10 の範囲の数を含み、R 1 は C 2 ~ C 6 アルキル基) の結晶性カンプトテシン水和物。

【請求項 2】

R 1 がエチルである、請求項 1 に記載の結晶性カンプトテシン水和物。

【請求項 3】

該結晶性カンプトテシン水和物の融点が約 240 ~ 約 243 である、請求項 2 に記載の結晶性カンプトテシン水和物。

【請求項 4】

n が 1 ~ 3 の範囲の数を含む、請求項 1 に記載の結晶性カンプトテシン水和物。

【請求項 5】

患者において癌又は悪性腫瘍を治療する方法であって、有効量の請求項 1 に記載の結晶

性カンプトテシン水和物を含む組成物を投与することを含み、前記癌又は前記悪性腫瘍が前記組成物に応答性である、患者において癌又は悪性腫瘍を治療する方法。

【請求項 6】

前記癌が、白血病、黒色腫、肝臓癌、乳癌、卵巣癌、前立腺癌、胃癌、膀胱癌、線維形成性小円形細胞腫瘍 (DSRCT)、脾臓癌、肺癌、腎臓癌、結腸癌又は中枢神経系の癌である、請求項 5 に記載の方法。

【請求項 7】

R 1 がエチルである、請求項 5 又は 6 に記載の方法。

【請求項 8】

該結晶性カンプトテシン水和物を経口投与する、請求項 5 に記載の方法。

【請求項 9】

有効量の請求項 1 に記載の結晶性カンプトテシン水和物と薬学的に許容可能な担体とを含む医薬組成物。

【請求項 10】

該担体が脂質又は脂質様乳化剤である、請求項 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 11】

最大耐量として  $2000 \text{ mg/kg}$  を使用する場合、前記結晶性カンプトテシン水和物を、腫瘍異種移植片を有するヌードマウスに投与することにより求められる、前記結晶性カンプトテシン水和物の治療指数が  $2 \sim 500$  である、請求項 1 に記載の結晶性カンプトテシン水和物。

【請求項 12】

$(0.10 \sim 0.50) \times (0.01 \sim 0.10) \times (0.01 \sim 0.05) \text{ mm}^3$  の大きさ、及び  $100^3 \sim 5000^3$  の体積の単斜晶系を有する、請求項 1 に記載の結晶性カンプトテシン水和物。

【請求項 13】

結晶性カンプトテシン 20 - プロピオネート水和物である、請求項 12 に記載の結晶性カンプトテシン水和物。