

【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 19 年 12 月 13 日 (2007.12.13)

【公表番号】特表 2007-509978 (P2007-509978A)

【公表日】平成 19 年 4 月 19 日 (2007.4.19)

【年通号数】公開・登録公報 2007-015

【出願番号】特願 2006-538354 (P2006-538354)

【国際特許分類】

C 0 7 D 311/72 (2006.01)

C 0 7 D 491/22 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

C 0 7 D 407/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/355 (2006.01)

C 0 7 H 15/244 (2006.01)

A 6 1 K 31/704 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/107 (2006.01)

A 6 1 K 47/48 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 311/72 1 0 2

C 0 7 D 491/22 C S P

A 6 1 K 31/437

C 0 7 D 407/12

A 6 1 K 31/355

C 0 7 H 15/244

A 6 1 K 31/704

A 6 1 K 31/496

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 9/107

A 6 1 K 47/48

【手続補正書】

【提出日】平成 19 年 10 月 26 日 (2007.10.26)

【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

$(T - L)_n (T)_m D$

を有する化合物であって、

式中、T はトコフェロール部分であり；

L はリンカー部分であり；

D は、タキサン、タキサン誘導体、カンプトテシン、またはカンプトテシン誘導体から選択される、治療薬部分であり；

n = 0、1、2、または 3 であり；

$m = 0、1、2、$ または3であり；そして

$m + n = 1、2、$ または3であり；

該 n 個の T - L 部分は該リンカー部分を介して該治療薬部分に共有結合され、該 m 個の トコフェロール部分が該治療薬部分に共有結合されている、化合物。

【請求項 2】

前記リンカー部分がスクシナートである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

前記治療薬部分がパクリタキセルまたはその誘導体である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

前記治療薬部分がドセタキセルまたはその誘導体である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

前記治療薬部分が 10 - ヒドロキシカンブトテシンまたはその誘導体である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

前記治療薬部分が 7 - エチル - 10 - ヒドロキシカンブトテシンまたはその誘導体である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

$n = 0$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

$m = 0$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

$m = 0$ であり、そして $n = 1$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

$m = 0$ であり、そして $n = 2$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

トコフェロールスクシナートパクリタキセル。

【請求項 12】

トコフェロールスクシナートドセタキセル。

【請求項 13】

トコフェロールスクシナートカンブトテシン。

【請求項 14】

トコフェロールスクシナート 10 - ヒドロキシカンブトテシン。

【請求項 15】

トコフェロールスクシナート 7 - エチル - 10 - ヒドロキシカンブトテシン。

【請求項 16】

エマルジョンであって：該エマルジョンは、

(a) 油相であって、該油相は、

(i) 式

$(T - L)_n (T)_m D$

を有する化合物であって、

式中、T は親油性部分であり；

L はリンカー部分であり；

D は、タキサン、タキサン誘導体、カンブトテシン、またはカンブトテシン誘導体から選択される、治療薬部分であり；

$n = 0、1、2、$ または3であり；

$m = 0、1、2、$ または3であり；そして

$m + n = 1、2、$ または3であり；

該 n 個の T - L 部分は該リンカー部分を介して該治療薬部分に共有結合され、該 m 個の親油性部分が該治療薬部分に共有結合されている、

化合物；および

(i i) 親油性媒体；

を含む、油相と；

(b) 水相と

を含む、エマルジョン。

【請求項 17】

前記治療薬部分が、パクリタキセル、ドセタキセル、またはそれらの誘導体の少なくとも 1 つである、請求項 16 に記載のエマルジョン。

【請求項 18】

前記親油性部分がトコフェロールである、請求項 16 に記載のエマルジョン。

【請求項 19】

前記リンカー部分がスクシナートである、請求項 16 に記載のエマルジョン。

【請求項 20】

前記親油性媒体がトコフェロールを含む、請求項 16 に記載のエマルジョン。

【請求項 21】

ミセル製剤であって、該ミセル製剤は：

(a) 式

$(T - L)_n (T)_m D$

を有する化合物であって、

式中、T は親油性部分であり；

L はリンカー部分であり；

D は、タキサン、タキサン誘導体、カンプトテシン、またはカンプトテシン誘導体から選択される、治療薬部分であり；

$n = 0、1、2、$ または 3 であり；

$m = 0、1、2、$ または 3 であり；そして

$m + n = 1、2、$ または 3 であり；

該 n 個の T - L 部分は該リンカー部分を介して該治療薬部分に共有結合され、該 m 個の親油性部分が該治療薬部分に共有結合されている、

化合物；および

(b) 水相

を含む、ミセル製剤。

【請求項 22】

前記治療薬部分が、パクリタキセル、ドセタキセル、またはそれらの誘導体の少なくとも 1 つである、請求項 21 に記載の製剤。

【請求項 23】

前記親油性部分がトコフェロールである、請求項 21 に記載の製剤。

【請求項 24】

前記リンカー部分がスクシナートである、請求項 21 に記載の製剤。

【請求項 25】

細胞増殖疾患を治療する ための組成物であって、該組成物は、
式

$(T - L)_n (T)_m D$

を有する化合物

を含み、

式中、T はトコフェロール部分であり；

L はリンカー部分であり；

D は細胞増殖疾患を治療するのに有効な治療薬化合物から誘導された治療薬部分であり；

$n = 0、1、2、$ または 3 であり；

$m = 0、1、2、$ または 3 であり；そして

$m + n = 1、2、$ または3であり；

該 n 個の T - L 部分は該リンカー部分を介して該治療薬部分に共有結合され、該 m 個の トコフェロール 部分が該治療薬部分に共有結合されている、
組成物。

【請求項 26】

前記化合物は、エマルジョン中に含まれている、請求項 25 に記載の組成物。

【請求項 27】

前記化合物は、ミセル製剤中に含まれている、請求項 25 に記載の組成物。

【請求項 28】

前記治療薬部分がパクリタキセルまたはその誘導体である、請求項 25 に記載の組成物。

【請求項 29】

前記治療薬部分がドセタキセルまたはその誘導体である、請求項 25 に記載の組成物。

【請求項 30】

前記治療薬部分がカンプトテシンまたはその誘導体である、請求項 25 に記載の組成物。

【請求項 31】

医薬品の製造における請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項 32】

細胞増殖疾患を治療するための組成物であって、該組成物は、
エマルジョン

を含み、該エマルジョンは：

(a) 油相であって、該油相は、

(i) 式

$(T - L)_n (T)_m D$

を有する化合物であって、

式中、T は親油性部分であり；

L はリンカー部分であり；

D は、タキサン、タキサン誘導体、カンプトテシン、またはカンプトテシン誘導体から選択される、治療薬部分であり；

$n = 0、1、2、$ または3であり；

$m = 0、1、2、$ または3であり；そして

$m + n = 1、2、$ または3であり；

該 n 個の T - L 部分は該リンカー部分を介して該治療薬部分に共有結合され、該 m 個の親油性部分が該治療薬部分に共有結合されている、
化合物；および

(ii) 親油性媒体；

を含む、油相と；

(b) 水相と

を含む、

組成物。