

【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26年9月25日(2014.9.25)

【公開番号】特開2014-144962(P2014-144962A)

【公開日】平成26年8月14日(2014.8.14)

【年通号数】公開・登録公報2014-043

【出願番号】特願2014-48595(P2014-48595)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/7076 (2006.01)

A 6 1 K 31/7072 (2006.01)

A 6 1 K 31/7068 (2006.01)

A 6 1 K 31/675 (2006.01)

A 6 1 K 31/522 (2006.01)

A 6 1 K 31/52 (2006.01)

A 6 1 K 31/513 (2006.01)

A 6 1 K 31/282 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/06 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 33/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/7076

A 6 1 K 31/7072

A 6 1 K 31/7068

A 6 1 K 31/675

A 6 1 K 31/522

A 6 1 K 31/52

A 6 1 K 31/513

A 6 1 K 31/282

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 45/06

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 33/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 43/00 1 2 1

【手続補正書】

【提出日】平成26年7月17日(2014.7.17)

【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】

癌の治療を必要としている被験者における癌の治療用薬剤の製造のための、治療上有効な量の、製薬上許容される担体中のダブルカクテルまたはトリプルカクテルを含むバックグラウンド療法の癌の発生または増殖を制限する使用であって、

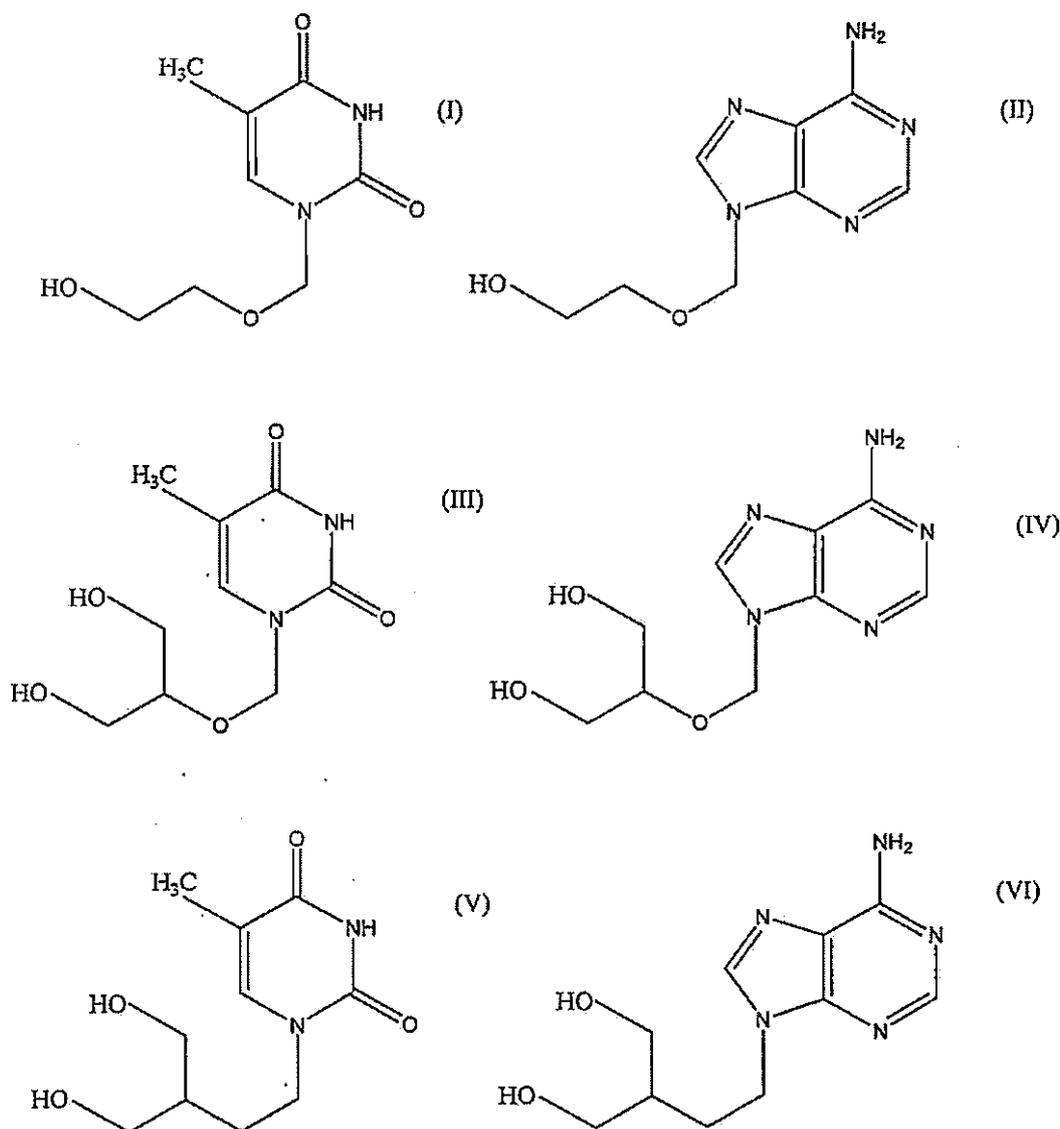
ただし、ヘルペスウイルス、アデノウイルス、ポリオーマウイルス、パピローマウイルス(HPV)、Epstein-Barrウイルスおよび肝炎DNAウイルスからなる群から選択されるウイルスによる感染に関連するウイルス関連の癌の治療は除外され、

前記ダブルカクテルが、

a)テロメラーゼ逆転写酵素(TERT)インヒビターである第1のヌクレオシド類似体または第1のヌクレオシド類似体のパリンエステルであって、前記第1のヌクレオシド類似体为非環状ヌクレオシド類似体である、前記第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、

b)Line-1レトロトランスポゾンがコードする逆転写酵素(L1RT)インヒビターであり、第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステルと同じものではなく、式(I)~(VI):

【化1】



で示される化合物を含まない第2のヌクレオシド類似体または第2のヌクレオシド類似体のパリンエステルを含み、

前記トリプルカクテルが、

a) 前記第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、

b) 前記第2のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、

c) TERTでもL1RTでもない逆転写酵素(RT)のインヒビターであり、第1および第2のヌクレオシド類似体またはそれらのパリンエステルと同じものではない、第3のヌクレオシド類似体または第3のヌクレオシド類似体のパリンエステルを含む、前記使用。

【請求項2】

前記被験者がヒト以外の哺乳類である、請求項1に記載の使用。

【請求項3】

前記被験者がヒトである、請求項1に記載の使用。

【請求項4】

前記バックグラウンド療法が、治療上有効な量の、製薬上許容される担体中のトリプルカクテルを含んでいる、請求項3に記載の使用。

【請求項5】

前記トリプルカクテルが非環状ヌクレオシド類似体を含んでいる、請求項4に記載の使用。

【請求項6】

前記非環状ヌクレオシド類似体がアシクロビルまたはそのプロドラッグである、請求項5に記載の使用。

【請求項7】

前記非環状ヌクレオシド類似体がガンシクロビルまたはそのプロドラッグである、請求項5に記載の使用。

【請求項8】

前記非環状ヌクレオシド類似体がペンシクロビルまたはそのプロドラッグである、請求項5に記載の使用。

【請求項9】

前記トリプルカクテルがアジド-2',3'-ジデオキシチミジン(AZT)を含んでいる、請求項4に記載の使用。

【請求項10】

前記トリプルカクテルが2',3'-ジデオキシイノシン(ddI)を含んでいる、請求項4に記載の使用。

【請求項11】

前記トリプルカクテルが全身投与に適するものである、請求項4に記載の使用。

【請求項12】

前記トリプルカクテルが局所投与に適するものである、請求項4に記載の使用。

【請求項13】

別の抗増殖療法と組み合わせてバックグラウンド療法を施すことをさらに含んでいる、請求項1に記載の使用。

【請求項14】

前記別の抗増殖療法がDNA損傷療法である、請求項13に記載の使用。

【請求項15】

前記DNA損傷療法が、遺伝子毒性化学療法、放射線療法、および光線力学的療法のうちの少なくとも1つである、請求項14に記載の使用。

【請求項16】

前記遺伝子毒性化学療法が、癌を治療するために開発された抗癌剤の使用を含んでなり、該抗癌剤がシクロホスファミド、カペシタビン、タキソール、シスプラチン、カルボプラチン、カンプトテシン、およびドキシソルピシンからなる群から選択されるものである、請求項15に記載の使用。

【請求項17】

前記バックグラウンド療法が、異常に増殖する細胞塊を有している患者の治療のための

手術と組み合わせて使用される、請求項 1 3 に記載の使用。

【請求項 1 8】

前記バックグラウンド療法が、異常に増殖する細胞塊の除去のための手術を既に受けた患者の治療のために使用される、請求項 1 3 に記載の使用。

【請求項 1 9】

癌が固形腫瘍である、請求項 1 3 に記載の使用。

【請求項 2 0】

前記腫瘍が、胃癌、非小細胞肺癌、前立腺癌、膵臓癌、腎臓癌、結腸癌、卵巣癌、および黒色腫からなる群から選択されるものである、請求項 1 9 に記載の使用。

【請求項 2 1】

哺乳類を別の抗癌療法または別の抗増殖療法に対して増感させるための薬剤の製造のための、増感のために有効な量の、製薬上許容される担体中に入れたダブルカクテルまたはトリプルカクテルの使用であって、

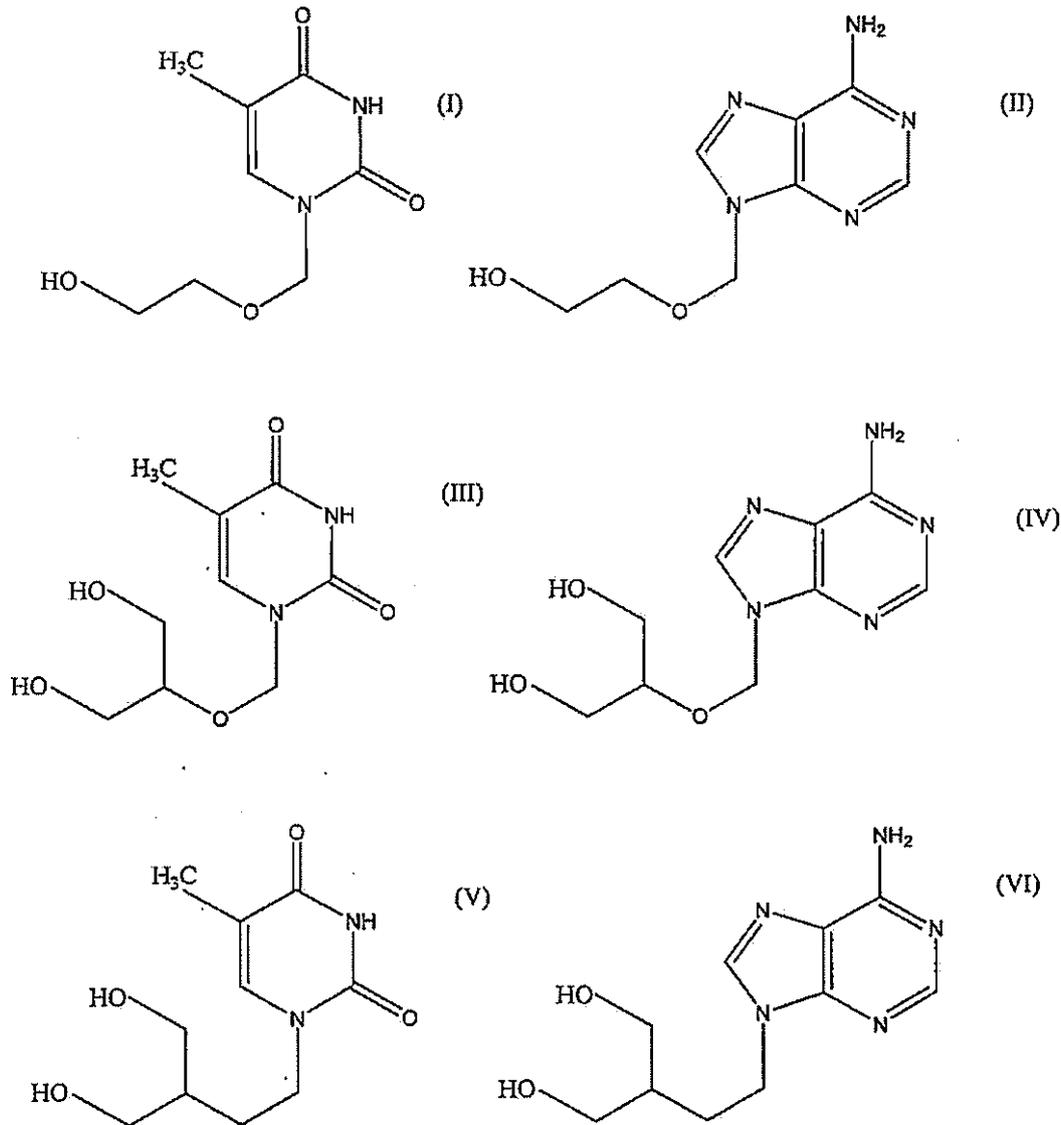
ただし、ヘルペスウイルス、アデノウイルス、ポリオーマウイルス、パピローマウイルス(HPV)、Epstein-Barrウイルスおよび肝炎DNAウイルスからなる群から選択されるウイルスによる感染に関連するウイルス関連の癌の治療は除外され、

前記ダブルカクテルが、

a)テロメラーゼ逆転写酵素(TERT)インヒビターである第1のヌクレオシド類似体または第1のヌクレオシド類似体のパリンエステルであって、前記第1のヌクレオシド類似体为非環状ヌクレオシド類似体である、前記第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、

b)Line-1レトロトランスポゾンがコードする逆転写酵素(L1RT)インヒビターであり、第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステルと同じものではなく、式(I)~(VI):

【化2】



で示される化合物を含まない第2のヌクレオシド類似体または第2のヌクレオシド類似体の
 パリンエステルを含み、

前記トリプルカクテルが、

a) 前記第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、

b) 前記第2のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、

c) TERTでもL1RTでもない逆転写酵素(RT)のインヒビターであり、第1および第2のヌク
 レオシド類似体またはそれらのパリンエステルと同じものではない、第3のヌクレオシド
 類似体または第3のヌクレオシド類似体のパリンエステルを含む、前記使用。

【請求項22】

前記哺乳類がヒトである、請求項21に記載の使用。

【請求項23】

前記別の抗癌療法または別の抗増殖療法が、遺伝子毒性化学療法、放射線療法、および
 光線力学的療法のうちの1つ以上から選択されるものである、請求項21に記載の使用。

【請求項24】

前記別の抗癌療法が放射線療法を含んでいる、請求項23に記載の使用。

【請求項25】

前記別の抗癌療法が放射線療法である、請求項24に記載の使用。

【請求項26】

前記別の抗癌療法が、5-フルオロウラシル(5-FU)、シクロホスファミド、シスプラチン

、オキサリプラチン、カペシタピン、ブスルファン、カルボプラチン、カルムスチン、クロラムブシル、ドキシソルピシン、ダウノルビシン、エピルビシン、エトポシド、イダルビシン、テモゾロマイド、イフォスファミド、ロムスチン、ダカルバジン、メクロレタミン、メルファラン、マイトマイシンC、ミトキサントロン、イリノテカン、およびトポテカンのうちの1つ以上である、請求項23に記載の使用。

【請求項27】

前記別の抗癌療法がシクロホスファミド、カルボプラチン、またはカペシタピンである、請求項26に記載の使用。

【請求項28】

前記別の抗癌療法が単剤療法としてのシクロホスファミド、カルボプラチン、またはカペシタピンである、請求項27に記載の使用。

【請求項29】

シクロホスファミド、カルボプラチン、またはカペシタピンが約1~5週間間隔で使用される、請求項28に記載の使用。

【請求項30】

シクロホスファミド、カルボプラチン、またはカペシタピンが約2、3、または4週間間隔で使用される、請求項29に記載の使用。

【請求項31】

哺乳類において、該哺乳類が副作用からの回復または該副作用を消すために十分な時間、別の療法が停止される期間を通じて、別の抗癌療法または別の抗増殖療法の該副作用を軽減するための薬剤の製造のための、増感に有効な量の、製薬上許容される担体中のダブルカクテルまたはトリプルカクテルの使用であって、

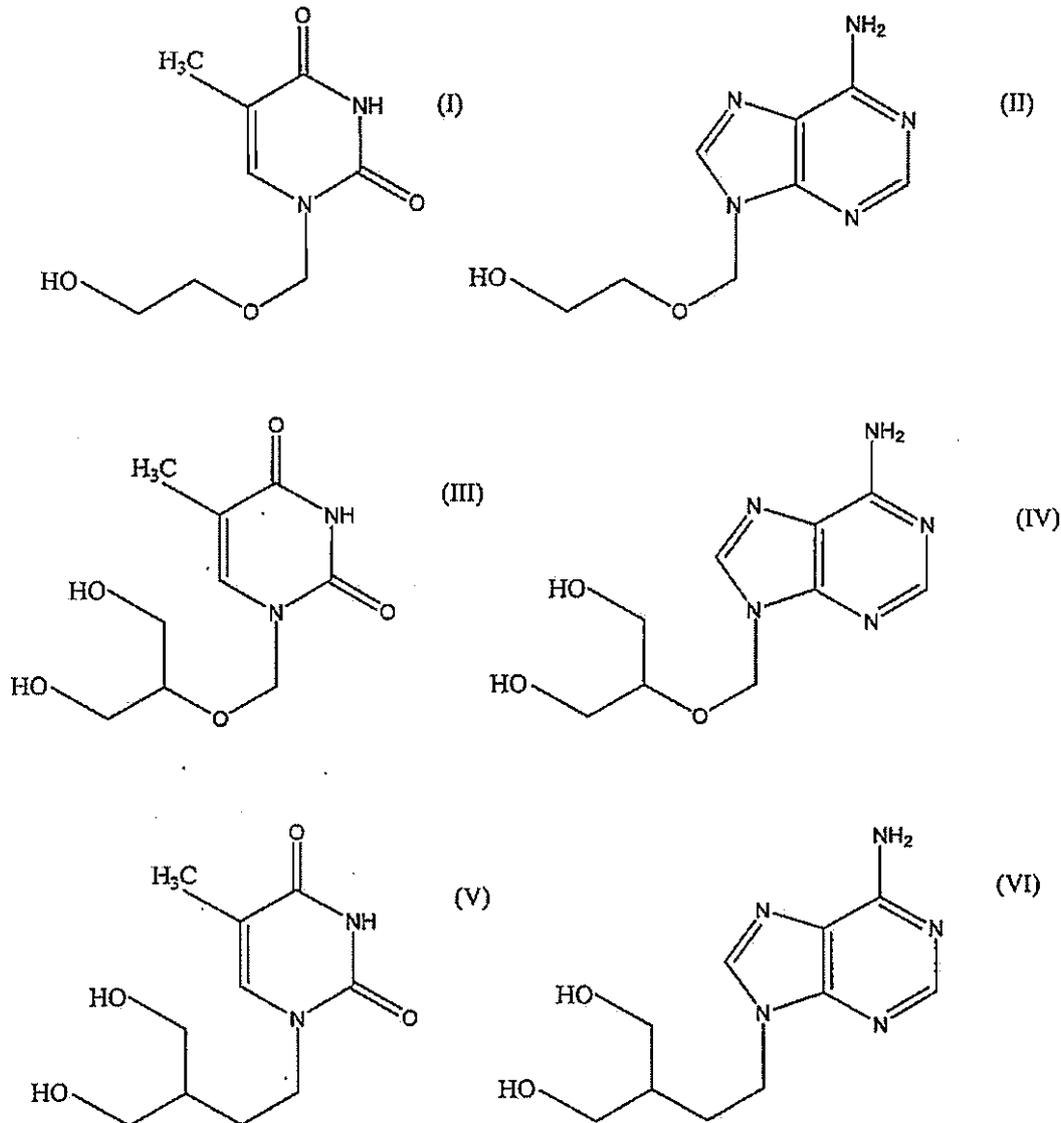
ただし、ヘルペスウイルス、アデノウイルス、ポリオーマウイルス、パピローマウイルス(HPV)、Epstein-Barrウイルスおよび肝炎DNAウイルスからなる群から選択されるウイルスによる感染に関連するウイルス関連の癌の治療は除外され、

前記ダブルカクテルが、

a)テロメラーゼ逆転写酵素(TERT)インヒビターである第1のヌクレオシド類似体または第1のヌクレオシド類似体のパリンエステルであって、前記第1のヌクレオシド類似体为非環状ヌクレオシド類似体である、前記第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、

b)Line-1レトロトランスポゾンがコードする逆転写酵素(L1RT)インヒビターであり、第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステルと同じものではなく、式(I)~(VI):

【化3】



で示される化合物を含まない第2のヌクレオシド類似体または第2のヌクレオシド類似体のパリンエステルを含み、

前記トリプルカクテルが、

a) 前記第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、

b) 前記第2のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、

c) TERTでもL1RTでもない逆転写酵素(RT)のインヒビターであり、第1および第2のヌクレオシド類似体またはそれらのパリンエステルと同じものではない、第3のヌクレオシド類似体または第3のヌクレオシド類似体のパリンエステルを含む、前記使用。

【請求項32】

前記別の抗癌療法または別の抗増殖療法が、該別の療法の初回投与量の約10~75%で再開される、請求項31に記載の使用。

【請求項33】

前記哺乳類がヒトである、請求項32に記載の使用。

【請求項34】

患者における癌の治療用薬剤の製造のための、治療上有効な量のトリプルカクテルの別の抗増殖療法と組み合わせた使用であって、

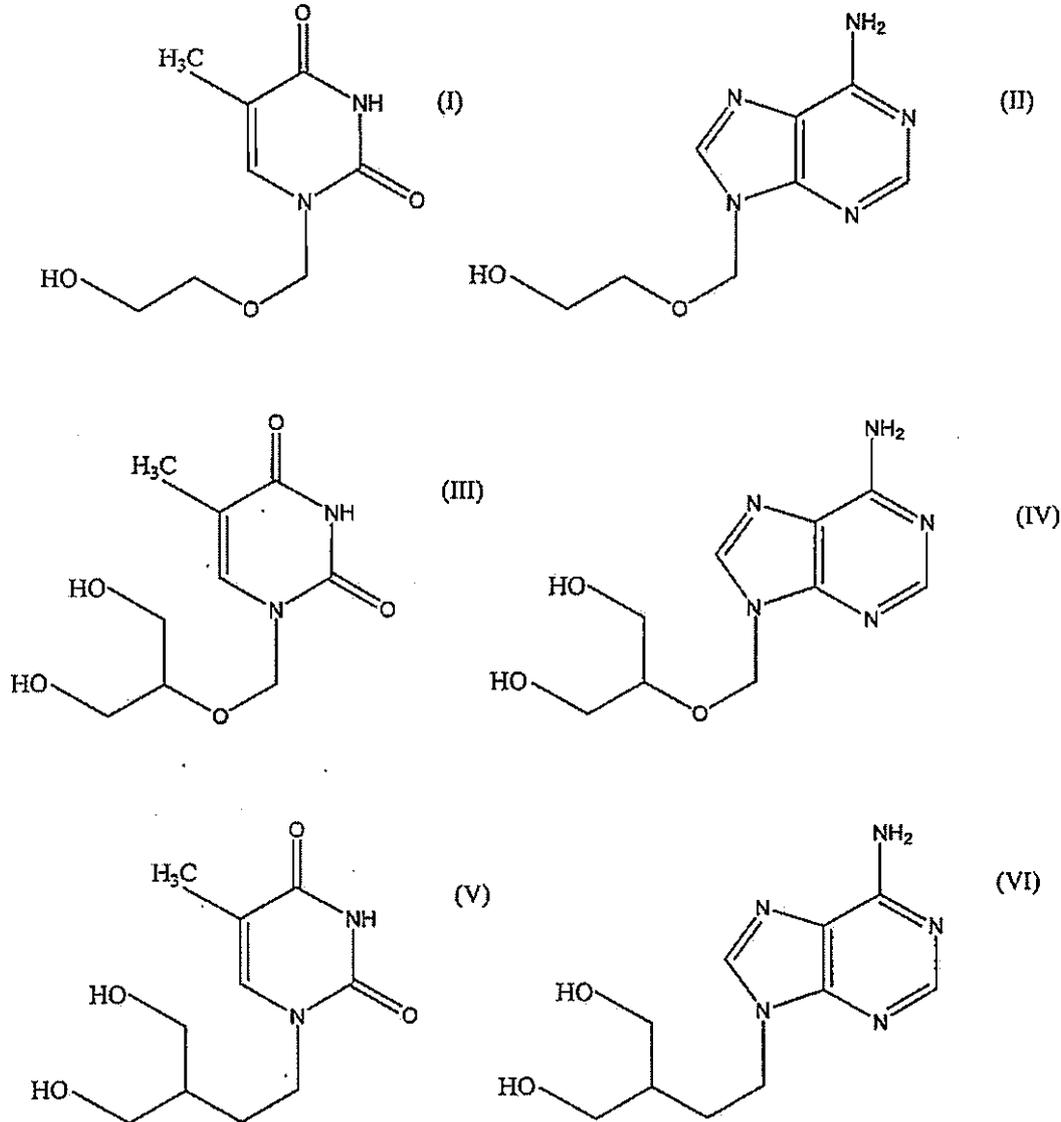
ただし、ヘルペスウイルス、アデノウイルス、ポリオーマウイルス、パピローマウイルス(HPV)、Epstein-Barrウイルスおよび肝炎DNAウイルスからなる群から選択されるウイルスによる感染に関連するウイルス関連の癌の治療は除外され、

前記トリプルカクテルが、

a) テロメラーゼ逆転写酵素 (TERT) インヒビターである第1のヌクレオシド類似体または第1のヌクレオシド類似体のパリンエステルであって、前記第1のヌクレオシド類似体为非環状ヌクレオシド類似体である、前記第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、

b) Line-1レトロトランスポゾンがコードする逆転写酵素 (L1RT) インヒビターであり、第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステルと同じものではなく、式 (I) ~ (VI):

【化4】



で示される化合物を含まない第2のヌクレオシド類似体または第2のヌクレオシド類似体のパリンエステル、

c) TERTでもL1RTでもない逆転写酵素 (RT) のインヒビターであり、第1および第2のヌクレオシド類似体またはそれらのパリンエステルと同じものではない、第3のヌクレオシド類似体または第3のヌクレオシド類似体のパリンエステルを含む、前記使用。

【請求項35】

異常な哺乳類細胞増殖を特徴とする症状を有している被験者を治療するための薬剤の製造のための、増殖を阻害するために有効な量のダブルカクテルまたはトリプルカクテルの使用であって、

該症状がさらに、正常な細胞と比較するとき連続的な細胞分裂においてテロメアの維持が見られる、異常に増殖している細胞を特徴とするものであり、

ただし、ヘルペスウイルス、アデノウイルス、ポリオーマウイルス、パピローマウイルス

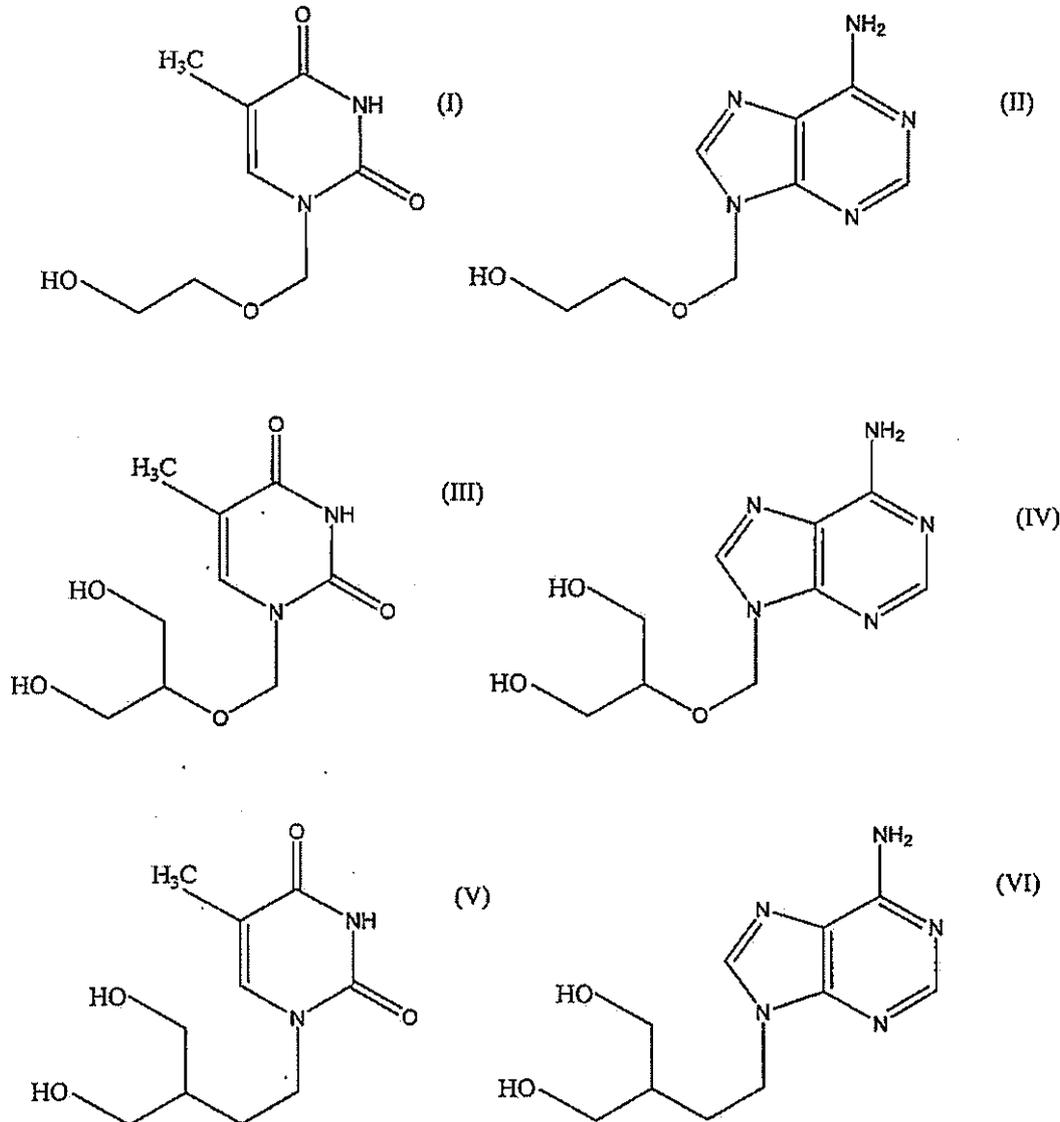
ス(HPV)、Epstein-Barrウイルスおよび肝炎DNAウイルスからなる群から選択されるウイルスによる感染に関連するウイルス関連の癌の治療は除外され、

前記ダブルカクテルが、

a) テロメラーゼ逆転写酵素(TERT)インヒビターである第1のヌクレオシド類似体または第1のヌクレオシド類似体のパリンエステルであって、前記第1のヌクレオシド類似体为非環状ヌクレオシド類似体である、前記第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、

b) Line-1レトロトランスポゾンがコードする逆転写酵素(L1RT)インヒビターであり、第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステルと同じものではなく、式(I)~(VI):

【化5】



で示される化合物を含まない第2のヌクレオシド類似体または第2のヌクレオシド類似体のパリンエステルを含み、

前記トリプルカクテルが、

a) 前記第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、

b) 前記第2のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、

c) TERTでもL1RTでもない逆転写酵素(RT)のインヒビターであり、第1および第2のヌクレオシド類似体またはそれらのパリンエステルと同じものではない、第3のヌクレオシド類似体または第3のヌクレオシド類似体のパリンエステルを含む、前記使用。

【請求項36】

細胞内で1種以上の逆転写酵素を阻害することを必要としている哺乳類に該阻害を行う

ための薬剤の製造のための、製薬上許容される担体中に入れた有効量のダブルカクテルまたはトリプルカクテルの使用であって、

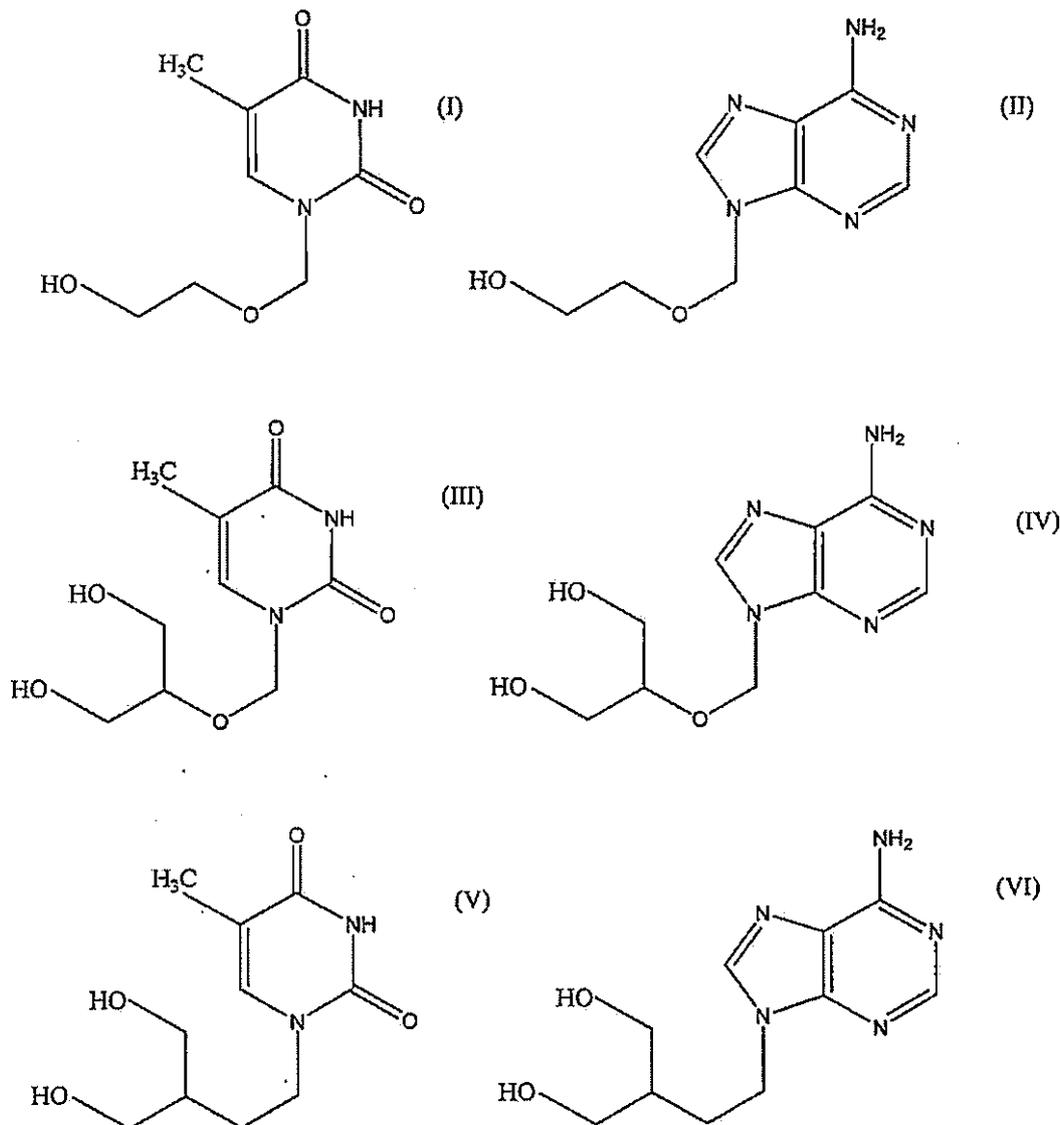
ただし、ヘルペスウイルス、アデノウイルス、ポリオーマウイルス、パピローマウイルス(HPV)、Epstein-Barrウイルスおよび肝炎DNAウイルスからなる群から選択されるウイルスによる感染に関連するウイルス関連の癌の治療は除外され、

前記ダブルカクテルが、

a) テロメラーゼ逆転写酵素(TERT)インヒビターである第1のヌクレオシド類似体または第1のヌクレオシド類似体のパリンエステルであって、前記第1のヌクレオシド類似体为非環状ヌクレオシド類似体である、前記第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、

b) Line-1レトロトランスポゾンがコードする逆転写酵素(L1RT)インヒビターであり、第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステルと同じものではなく、式(I)~(VI):

【化6】



で示される化合物を含まない第2のヌクレオシド類似体または第2のヌクレオシド類似体のパリンエステルを含み、

前記トリプルカクテルが、

a) 前記第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、

b) 前記第2のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、

c) TERTでもL1RTでもない逆転写酵素(RT)のインヒビターであり、第1および第2のヌクレオシド類似体またはそれらのパリンエステルと同じものではない、第3のヌクレオシド

類似体または第3のヌクレオシド類似体のパリンエステルを含む、前記使用。

【請求項37】

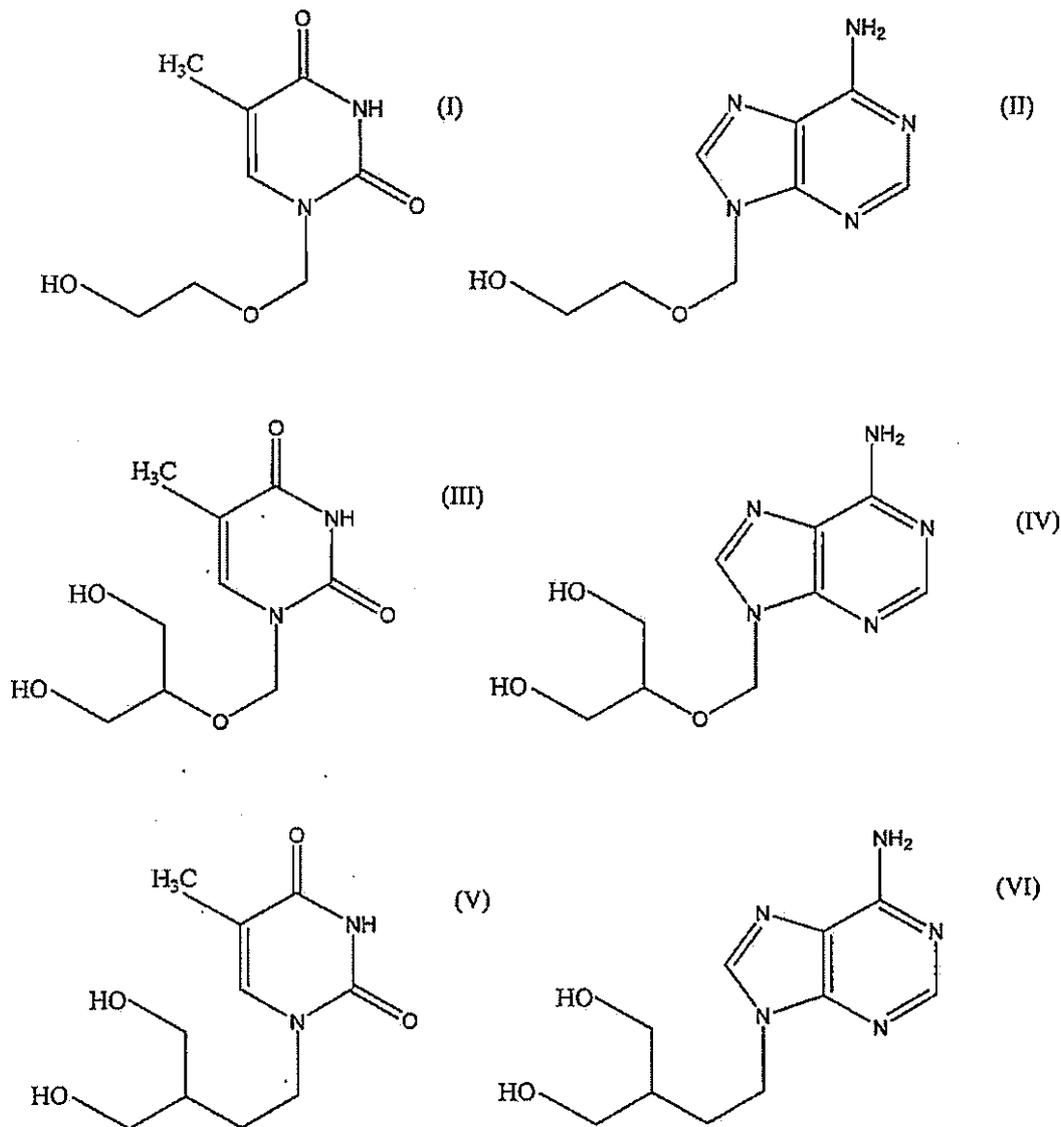
腫瘍細胞のアポトーシスを誘導することを必要としている哺乳類に該誘導を行うための薬剤の製造のための、製薬上許容される担体中に入れた治療上有効な量のダブルカクテルまたはトリプルカクテルの使用であって、

前記ダブルカクテルが、

a) テロメラーゼ逆転写酵素(TERT)インヒビターである第1のヌクレオシド類似体または第1のヌクレオシド類似体のパリンエステルであって、前記第1のヌクレオシド類似体为非環状ヌクレオシド類似体である、前記第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、

b) Line-1レトロトランスポゾンがコードする逆転写酵素(L1RT)インヒビターであり、第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステルと同じものではなく、式(I)~(VI):

【化7】



で示される化合物を含まない第2のヌクレオシド類似体または第2のヌクレオシド類似体のパリンエステルを含み、

前記トリプルカクテルが、

a) 前記第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、

b) 前記第2のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、

c) TERTでもL1RTでもない逆転写酵素(RT)のインヒビターであり、第1および第2のヌクレオシド類似体またはそれらのパリンエステルと同じものではない、第3のヌクレオシド

類似体または第3のヌクレオシド類似体のパリンエステルを含む、前記使用。

【請求項38】

前記ダブルカクテルまたはトリプルカクテルが非環状ヌクレオシド類似体およびアジド-2',3'-ジデオキシチミジン(AZT)を含んでいる、請求項37に記載の使用。

【請求項39】

前記トリプルカクテルがさらに2',3'-ジデオキシイノシン(ddI)を含んでいる、請求項37に記載の使用。

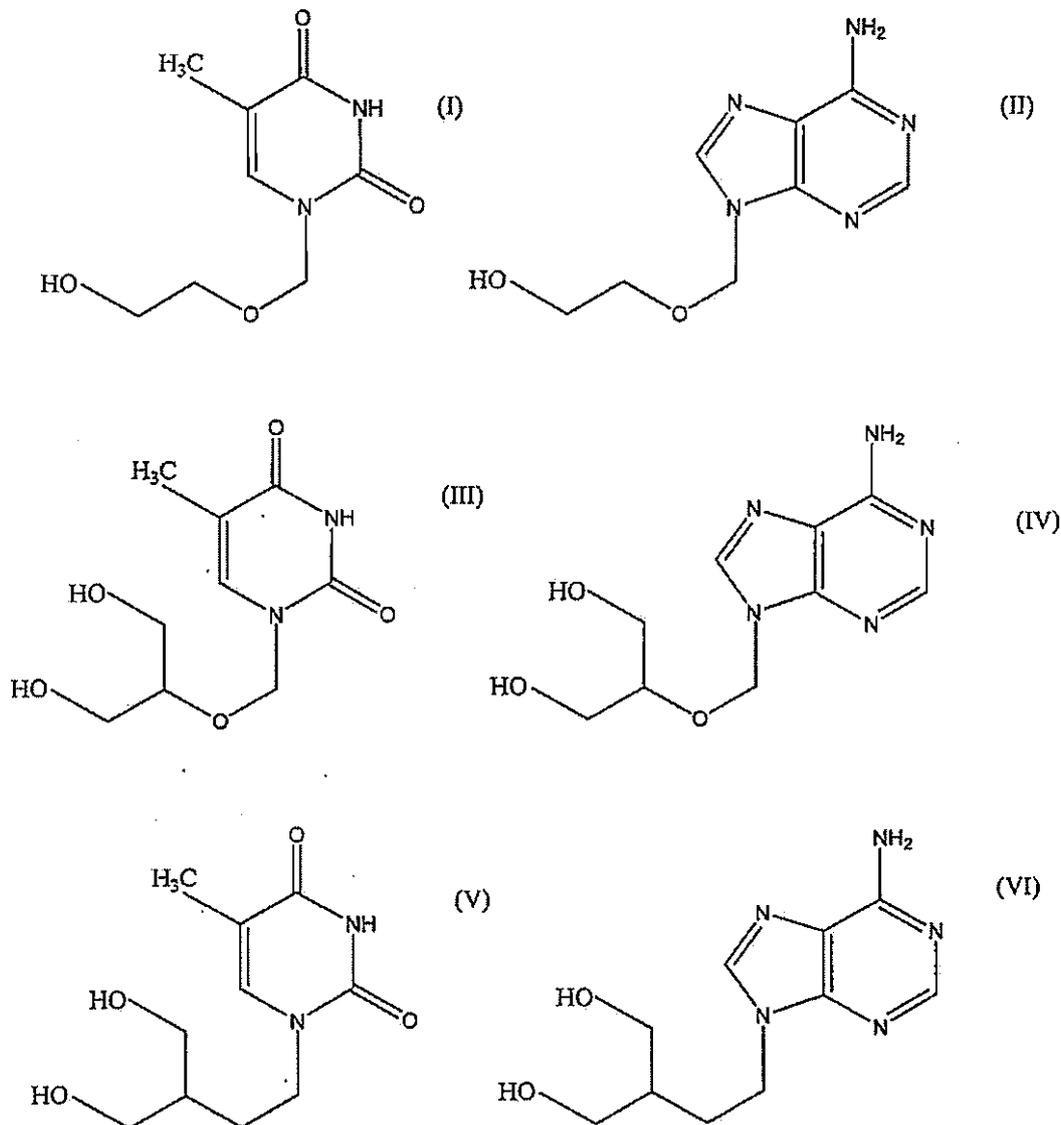
【請求項40】

アポトーシスの誘導を起こさせるように癌細胞内でアポトーシスを誘導するための薬剤の製造のための、製薬上許容される担体中に入れたトリプルカクテルの使用であって、前記トリプルカクテルが、

a) テロメラーゼ逆転写酵素(TERT)インヒビターである第1のヌクレオシド類似体または第1のヌクレオシド類似体のパリンエステルであって、前記第1のヌクレオシド類似体为非環状ヌクレオシド類似体である、前記第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、

b) Line-1レトロトランスポゾンがコードする逆転写酵素(L1RT)インヒビターであり、第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステルと同じものではなく、式(I)~(VI):

【化8】



で示される化合物を含まない第2のヌクレオシド類似体または第2のヌクレオシド類似体のパリンエステル、

c) TERTでもL1RTでもない逆転写酵素(RT)のインヒビターであり、第1および第2のヌクレオシド類似体またはそれらのパリンエステルと同じものではない、第3のヌクレオシド類似体または第3のヌクレオシド類似体のパリンエステルを含む、前記使用。

【請求項 4 1】

前記トリプルカクテルが非環状ヌクレオシド類似体およびアジド-2',3'-ジデオキシチミジン(AZT)を含んでいる、請求項 4 0 に記載の使用。

【請求項 4 2】

前記トリプルカクテルが2',3'-ジデオキシイノシン(ddI)を含んでいる、請求項 4 0 に記載の使用。

【請求項 4 3】

化合物の組み合わせを含む、哺乳類の癌の治療に使用するための医薬組成物であって、前記化合物の組み合わせが、

テロメラーゼ逆転写酵素(TERT)インヒビターである第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、

Line-1レトロトランスポゾンがコードする逆転写酵素(L1RT)インヒビターである第2のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、および任意で

逆転写酵素(RT)のインヒビターである第3のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、

の有効量を含んでおり、RTはTERTでもL1RTでもなく、第2のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステルは第1のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステルと同じものではなく、第3のヌクレオシド類似体またはそのパリンエステルは第1および第2のヌクレオシド類似体またはそれらのパリンエステルと同じものではない、前記医薬組成物。

【請求項 4 4】

前記第1、第2、および第3のヌクレオシド類似体またはそれらに対応するパリンエステルが3つの別々の医薬組成物の形態であるか、または単一の医薬組成物の形態である、請求項 4 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 5】

前記第1のヌクレオシド類似体が非環状ヌクレオシド類似体もしくはそのパリンエステルであり、前記第2のヌクレオシド類似体が非環状ヌクレオシド類似体もしくはそのパリンエステル、またはアジド-2',3'-ジデオキシチミジン(AZT)であり、前記第3のヌクレオシド類似体が2',3'-ジデオキシイノシン(ddI)である、請求項 4 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 6】

癌に罹患しているヒト患者を治療するための薬剤の製造のための請求項 4 5 に記載の医薬組成物の使用であって、ただし、ヘルペスウイルス、アデノウイルス、ポリオーマウイルス、パピローマウイルス(HPV)、Epstein-Barrウイルスおよび肝炎DNAウイルスからなる群から選択されるウイルスによる感染に関連するウイルス関連の癌の治療は除外される、前記使用。

【請求項 4 7】

前記第1のヌクレオシドがアシクロビルもしくはアシクロビルのプロドラッグまたはガンシクロビルのプロドラッグであり、前記第2のヌクレオシド類似体がAZTである、請求項 4 6 に記載の使用。

【請求項 4 8】

前記組み合わせがダブルカクテルまたはトリプルカクテルである、請求項 4 7 に記載の使用。

【請求項 4 9】

前記ダブルカクテルまたはトリプルカクテルを遺伝子毒性化学療法と組み合わせてさらに含んでいる、請求項 4 8 に記載の使用。

【請求項 5 0】

前記遺伝子毒性化学療法が、癌を治療するために開発された抗癌剤を含んでおり、該抗癌剤がシクロホスファミド、カペシタビン、およびカルボプラチンからなる群から選択さ

れるものである、請求項 49 に記載の使用。

【請求項 51】

前記抗癌剤の使用が約1~5週間間隔である、請求項 50 に記載の使用。

【請求項 52】

前記使用が約2、3、または4週間間隔である、請求項 51 に記載の使用。

【請求項 53】

腫瘍が、胃癌、非小細胞肺癌、前立腺癌、膵臓癌、腎臓癌、結腸癌、卵巣癌、および黒色腫からなる群から選択されるものである、請求項 52 に記載の使用。

【請求項 54】

哺乳類の癌の治療に使用するための医薬カクテルであって、製薬上許容される担体中に組み合わされて治療上有効な量の

非環状ヌクレオシド類似体またはそのパリンエステル、

アジド-2',3'-ジデオキシチミジン(AZT)、および

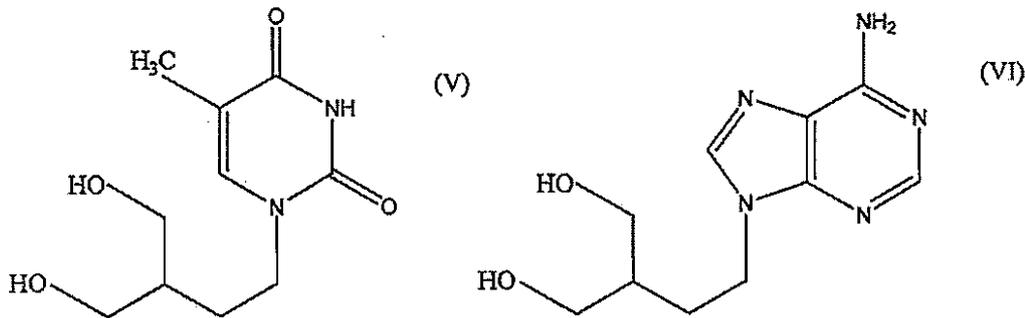
2',3'-ジデオキシイノシン(ddI)、

を含んでいる、前記カクテル。

【請求項 55】

治療上有効な量の式(V)および(VI):

【化9】



からなる群から選択される式で示される化合物またはその生理学的に許容される塩、光学異性体もしくはパリンエステルを含む、ヒトの癌の治療に使用するための医薬組成物。

【請求項 56】

1-[4-ヒドロキシ-3-(ヒドロキシメチル)ブト-1-イル]-5-メチルウラシルを含む、請求項 55 に記載の医薬組成物。

【請求項 57】

9-[4-ヒドロキシ-3-(ヒドロキシメチル)ブト-1-イル]-アデニンを含む、請求項 55 に記載の医薬組成物。

【請求項 58】

前記化合物が光学異性体の形態である、請求項 55 ~ 57 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 59】

前記化合物が生理学的に許容される塩の形態である、請求項 55 ~ 57 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物。

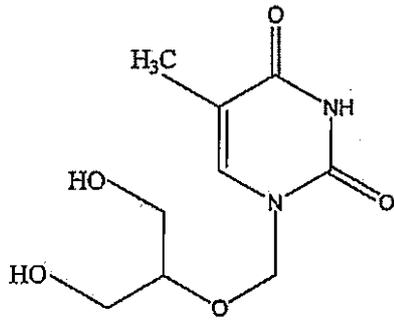
【請求項 60】

前記化合物がナトリウム塩または塩酸塩の形態である、請求項 59 に記載の医薬組成物。

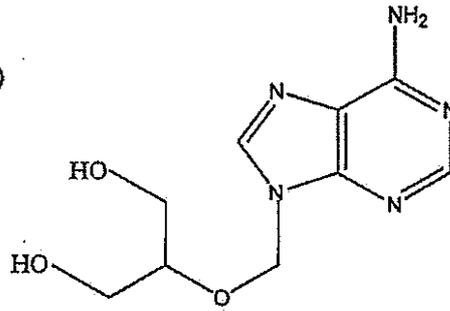
【請求項 61】

有効成分として治療上有効な量の式(III)、(IV)、(V)もしくは(VI):

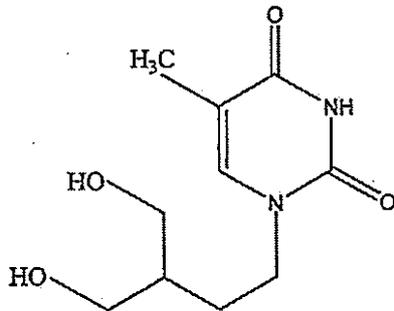
【化10】



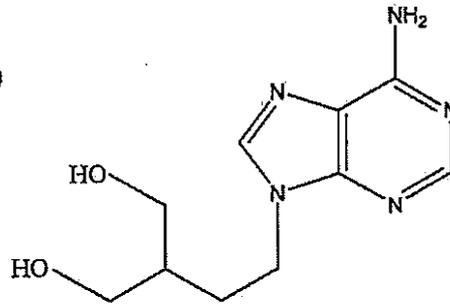
(III)



(IV)



(V)



(VI)

で示される化合物またはその生理学的に許容される塩もしくは光学異性体を、製薬上許容される担体とともに含んでいる、癌の治療を必要とする動物またはヒト宿主における癌の治療用薬剤の製造のための医薬組成物。

【請求項62】

全身投与用に設計された、請求項61に記載の医薬組成物。

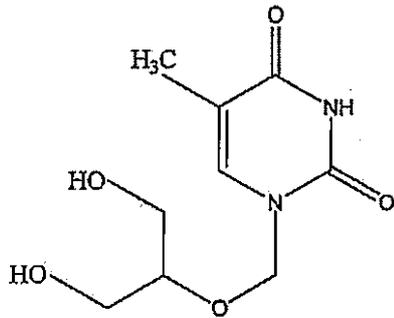
【請求項63】

局所投与用に設計された、請求項61に記載の医薬組成物。

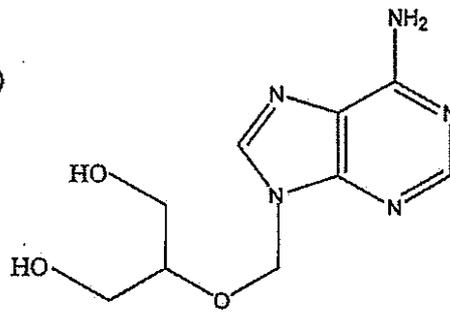
【請求項64】

癌の治療を必要とする動物またはヒト宿主における癌の治療用薬剤の製造のための治療上有効な量の組成物の使用であって、該組成物が製薬上許容される担体中に、有効成分として式(III)、(IV)、(V)もしくは(VI):

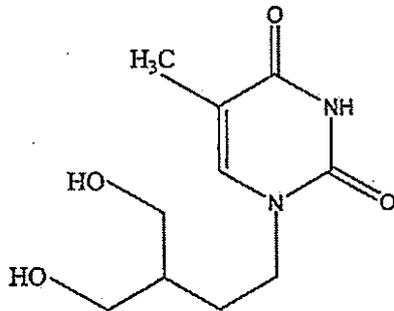
【化 1 1】



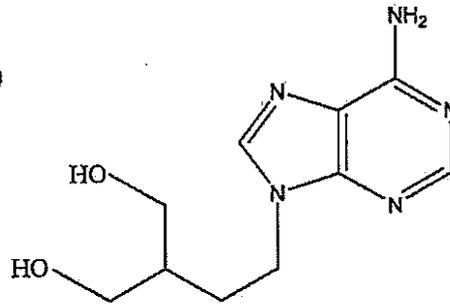
(III)



(IV)



(V)



(VI)

で示される化合物またはその生理学的に許容される塩もしくは光学異性体を、AZTおよびジダノシンと共に含んでいる、前記使用。

【請求項 6 5】

治療上有効な量の式(III)で示される化合物またはその生理学的に許容される塩の使用を含んでいる、請求項 6 4 に記載の使用。

【請求項 6 6】

治療上有効な量の式(IV)で示される化合物またはその生理学的に許容される塩の使用を含んでいる、請求項 6 4 に記載の使用。

【請求項 6 7】

前記組成物が、単位剤形中にAZTおよびジダノシンからなる群から選択される他のヌクレオシド類似体を少なくとも1種含む、請求項 6 4 に記載の使用。

【請求項 6 8】

ヌクレオシド類似体以外の抗癌剤を含んでいる組成物の治療上有効な量をさらに含んでいる、請求項 6 4 に記載の使用。

【請求項 6 9】

前記抗癌剤が、シクロホスファミド、カペシタビン、タキソール、シスプラチン、カルボプラチン、カンプトテシン、およびドキシソルピシンからなる群から選択されるものである、請求項 6 8 に記載の使用。

【請求項 7 0】

前記癌が固形腫瘍である、請求項 6 4 ~ 6 9 のいずれか 1 項に記載の使用。

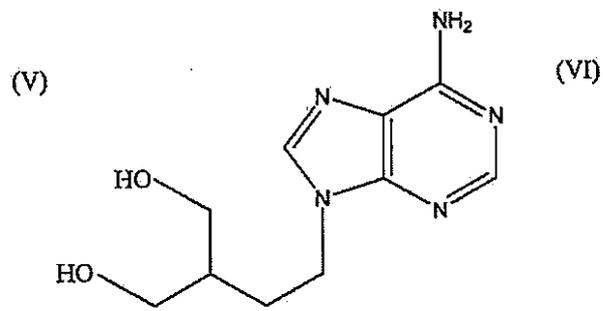
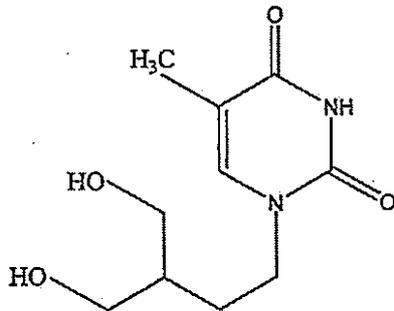
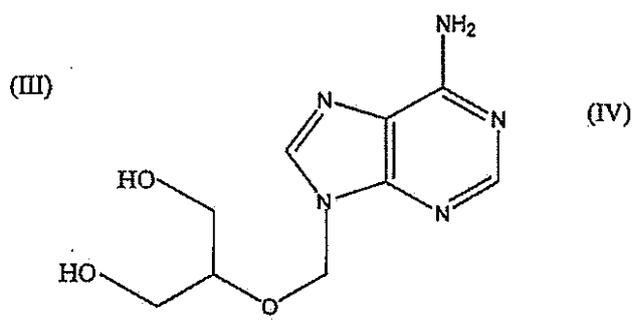
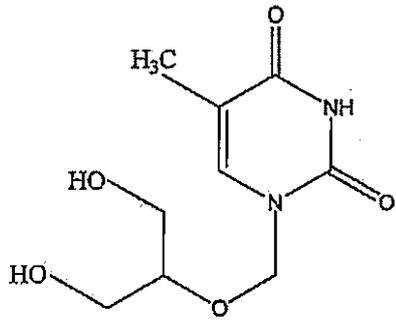
【請求項 7 1】

前記腫瘍が、胃癌、非小細胞肺癌、前立腺癌、膵臓癌、腎臓癌、結腸癌、卵巣癌、白血病、および黒色腫からなる群から選択されるものである、請求項 7 0 に記載の使用。

【請求項 7 2】

腫瘍細胞のアポトーシスを誘導する必要がある哺乳類で該誘導を行うための薬剤の製造のための治療上有効な量の医薬組成物の使用であって、前記医薬組成物が製薬上許容される担体中に任意でAZTおよびジダノシンとともに入れた式(III)、(IV)、(V)もしくは(VI):

【化 1 2】

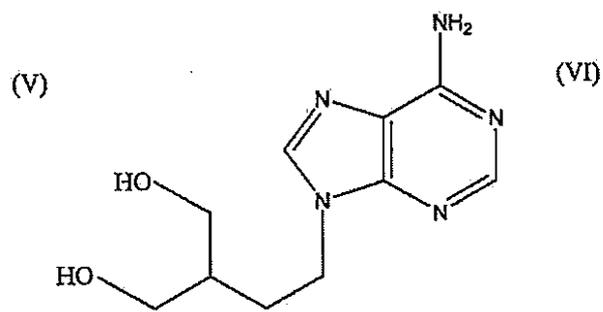
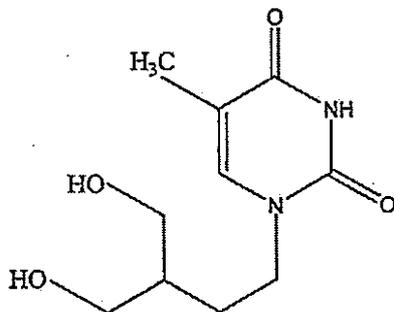
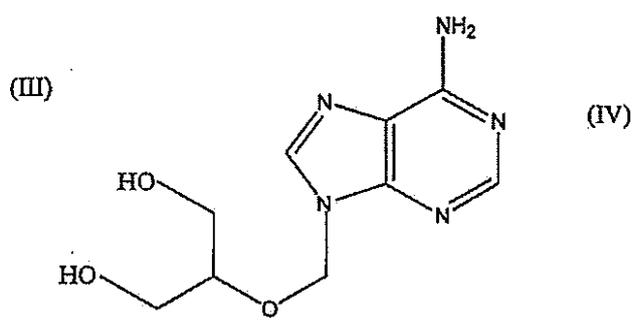
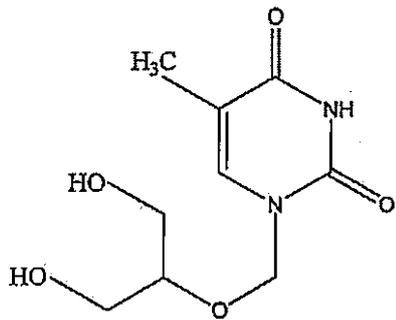


で示される化合物またはその生理学的に許容される塩もしくは光学異性体、ならびに別の抗癌ヌクレオシド類似体、および任意で抗癌剤を含む、前記使用。

【請求項 7 3】

式(III)、(IV)、(V)または(VI):

【化 1 3】

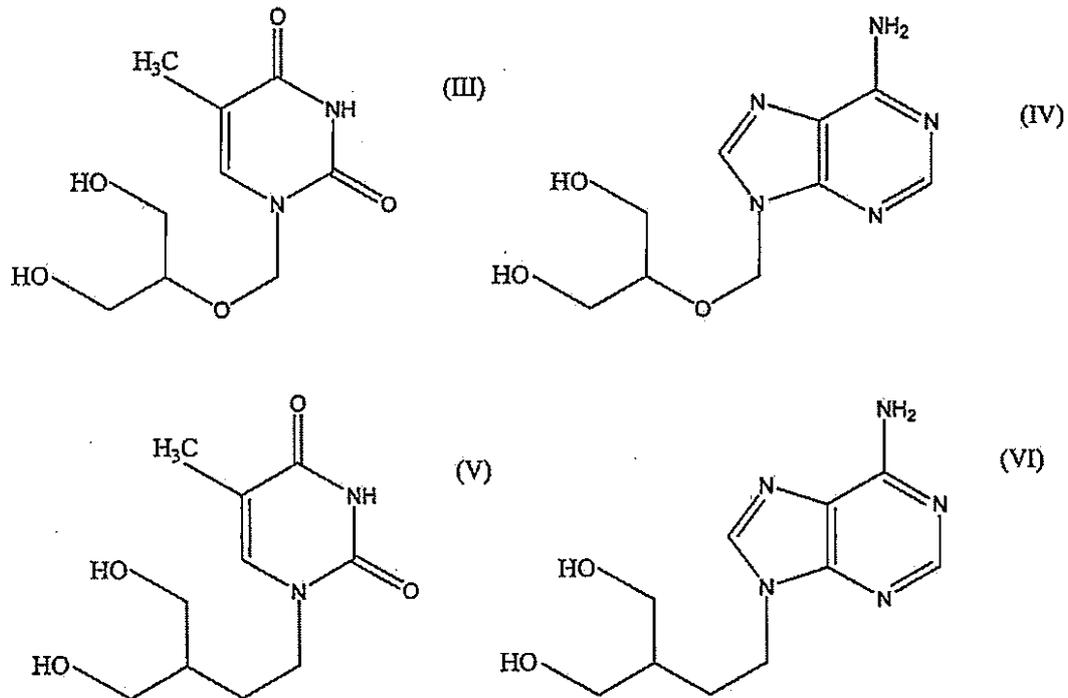


で示される化合物ならびにその他の抗癌ヌクレオシド類似体および抗癌剤をカクテルとして使用する、請求項 7 2 に記載の使用。

【請求項 7 4】

式(III)、(IV)、(V)または(VI):

【化 1 4】



で示される化合物ならびにその他の抗癌ヌクレオシド類似体および抗癌剤を別々の単位剤形で使用する、請求項 7 2 に記載の使用。

【請求項 7 5】

前記抗癌剤が、シクロホスファミド、カペシタピン、タキソール、シスプラチン、カルボプラチン、カンプトテシンおよびドキシソルピシンからなる群から選択されるものである、請求項 7 2 ~ 7 4 のいずれか 1 項に記載の使用。