

【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 5 月 31 日 (2007.5.31)

【公表番号】特表 2007-508298 (P2007-508298A)

【公表日】平成 19 年 4 月 5 日 (2007.4.5)

【年通号数】公開・登録公報 2007-013

【出願番号】特願 2006-533831 (P2006-533831)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/59 (2006.01)

A 6 1 K 31/593 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/59

A 6 1 K 31/593

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 1/04

【手続補正書】

【提出日】平成 19 年 4 月 4 日 (2007.4.4)

【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

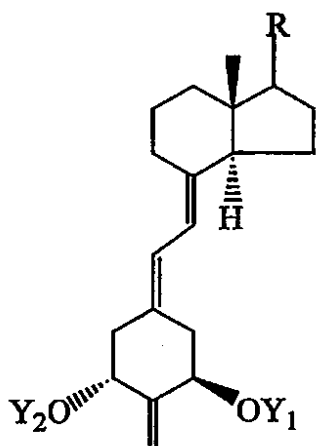
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

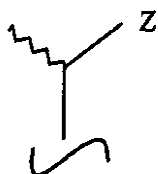
炎症性腸疾患を治療する ための医薬組成物 であって、式：

【化 1】



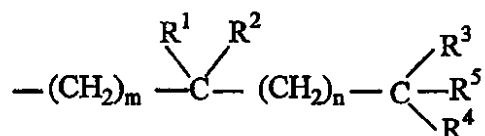
〔式中、 Y_1 及び Y_2 は、同じであるか又は異なってもよく、各々、水素及び水酸基保護基から成る群から選択され、そして、基 R は、構造：

【化 2】



[式中、炭素 20 での立体化学中心が R 又は S 配置を有してもよく、及び Z は、Y、- O Y、- CH₂ O Y、- C C Y 及び - CH = CH Y から選択され、二重結合は、シス又はトランス位置を有していてもよく、そして、Y は、水素、メチル、- C O R⁵ 及び構造：

【化 3】



{ 式中、m 及び n は、独立して、0 ないし 5 の整数を表し、R¹ は、水素、デューテリウム、ヒドロキシ、保護されたヒドロキシ、フルオロ、トリフルオロメチル、及び C₁ - 5 - アルキルから選択され、直鎖又は分岐鎖であってもよく、及び、場合によっては、ヒドロキシ又は保護されたヒドロキシ置換基を有し、そして、R²、R³、及び R⁴ の各々は、独立して、デューテリウム、デューテロアルキル、水素、フルオロ、トリフルオロメチル及び C₁ - 5 - アルキルから選択され、直鎖又は分岐鎖であってもよく、及び、場合によっては、ヒドロキシ又は保護されたヒドロキシ置換基を有し、そして、R¹ 及び R² は、一緒になってオキシ基、又はアルキリデン基 = C R² R³、又は基 - (CH₂)_p - (ここで、p は、2 ないし 5 の整数を表す) を表してもよく、そして、R³ 及び R⁴ は、一緒になってオキシ基、又は基 - (CH₂)_q - (ここで、q は、2 ないし 5 の整数を表す) を表してもよく、そして、R⁵ は、水素、ヒドロキシ、保護されたヒドロキシ、又は C₁ - 5 - アルキルを表し、ここで、側鎖の炭素 20、22、又は 23 でのいずれかの CH 基は、窒素原子で置換されてもよく、又はそれぞれ位置 20、22、及び 23 での基 - CH (CH₃) -、- (CH₂)_m -、- C (R¹ R²) - 若しくは - (CH₂)_n - のいずれかは、酸素又は硫黄原子で置換されてもよい }

の基から選択される]

によって表される]

を有するビタミン D 化合物の有効量を含む、前記 医薬組成物。

【請求項 2】

前記疾患が潰瘍性大腸炎又はクローン病である、請求項 1 記載の 医薬組成物。

【請求項 3】

前記化合物が経口的、非経口的及び皮下的からなる群から選択される少なくとも 1 の方法により投与される、請求項 1 又は 2 記載の 医薬組成物。

【請求項 4】

前記化合物が 160 ポンドのヒト当たり 1 日に 0.01 µg から 10 mg の投与量で投与される、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項記載の 医薬組成物。

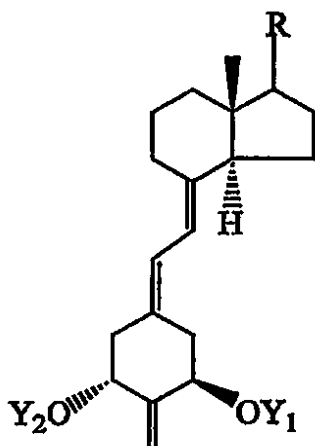
【請求項 5】

前記化合物が 2 - メチレン - 19 - ノル - 1 - ヒドロキシ - ホモプレグナカルシフェロール又は 2 - メチレン - 19 - ノル - 20 (S) - 1 , 25 - ジヒドロキシビタミン D₃ である、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項記載の 医薬組成物。

【請求項 6】

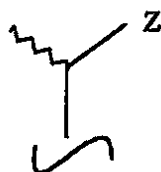
感受性の高い個人における炎症性腸疾患の発症を妨げ、又はその開始を遅延させるための 医薬組成物であって、式：

【化 4】



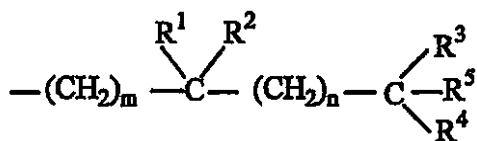
〔式中、 Y_1 及び Y_2 は、同じであるか又は異なってもよく、各々、水素及び水酸基保護基から成る群から選択され、そして、基 R は、構造：

【化 5】



〔式中、炭素 20 での立体化学中心が R 又は S 配置を有してもよく、及び Z は、 Y 、 $-OY$ 、 $-CH_2OY$ 、 $-CCY$ 及び $-CH=CHY$ から選択され、二重結合は、シス又はトランス位置を有していてもよく、そして、 Y は、水素、メチル、 $-COR^5$ 及び構造：

【化 6】



〔式中、 m 及び n は、独立して、0 ないし 5 の整数を表し、 R^1 は、水素、デューテリウム、ヒドロキシ、保護されたヒドロキシ、フルオロ、トリフルオロメチル、及び C_{1-5} -アルキルから選択され、直鎖又は分岐鎖であってもよく、及び、場合によっては、ヒドロキシ又は保護されたヒドロキシ置換基を有し、そして、 R^2 、 R^3 、及び R^4 の各々は、独立して、デューテリウム、デューテロアルキル、水素、フルオロ、トリフルオロメチル及び C_{1-5} -アルキルから選択され、直鎖又は分岐鎖であってもよく、及び、場合によっては、ヒドロキシ又は保護されたヒドロキシ置換基を有し、そして、 R^1 及び R^2 は、一緒になってオキソ基、又はアルキリデン基 $=CR^2R^3$ 、又は基 $-(CH_2)_p-$ (ここで、 p は、2 ないし 5 の整数を表す) を表してもよく、そして、 R^3 及び R^4 は、一緒になってオキソ基、又は基 $-(CH_2)_q-$ (ここで、 q は、2 ないし 5 の整数を表す) を表してもよく、そして、 R^5 は、水素、ヒドロキシ、保護されたヒドロキシ、又は C_{1-5} -アルキルを表し、ここで、側鎖の炭素 20、22、又は 23 でのいずれかの CH 基は、窒素原子で置換されてもよく、又はそれぞれ位置 20、22、及び 23 での基 $-CH(CH_3)-$ 、 $-(CH_2)_m-$ 、 $-C(R^1R^2)-$ 若しくは $-(CH_2)_n-$ のいずれかは、酸素又は硫黄原子で置換されてもよい〕

の基から選択される〕
によって表される〕

を有するビタミン D 化合物を含む、前記医薬組成物。

【請求項 7】

前記化合物が 2 - メチレン - 19 - ノル - 1 - ヒドロキシ - ホモプレグナカルシフェロール又は 2 - メチレン - 19 - ノル - 20 (S) - 1 , 25 - ジヒドロキシビタミン D₃ である、請求項 6 記載の医薬組成物。

【請求項 8】

前記化合物が 160 ポンドのヒト当たり 1 日に 0 . 01 μ g から 10 mg の投与量で投与される、請求項 6 又は 7 記載の医薬組成物。

【請求項 9】

前記化合物が経口的、非経口的及び皮下のからなる群から選択される少なくとも 1 の方法により投与される、請求項 6 ~ 8 のいずれか 1 項記載の医薬組成物。

【請求項 10】

前記疾患が潰瘍性大腸炎又はクローン病である、請求項 6 ~ 9 のいずれか 1 項記載の医薬組成物。