

【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

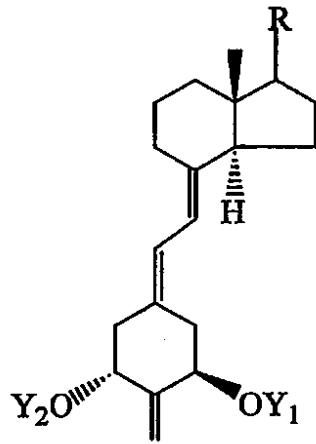
【補正の内容】

【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】



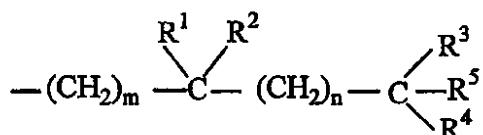
〔式中、Y₁及びY₂は、同じであるか又は異なっていてもよく、各々、水素及び水酸基保護基から成る群から選択され、そして、基Rは、構造:

【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、-OY、-CH₂OY、-CCY及び-CH=CY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、-COR⁵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、一緒にになってオキソ基、又はアルキリデン基=CR²R³、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、一緒にになってオキソ基、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、又はそれ位置20、22、及び23での基-C(H(CH₃))-、-(CH₂)_m-、-C(R¹R²)-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0.01μgから10mg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。

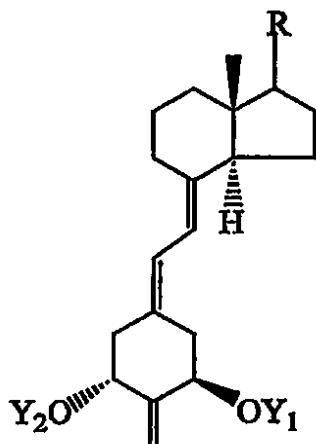
【請求項5】

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】

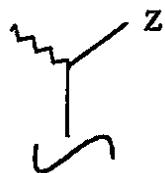
感受性の高い個人における炎症性腸疾患の発症を妨げ、又はその開始を遅延させるための医薬組成物であって、式：

【化4】



[式中、Y₁及びY₂は、同じであるか又は異なっていてもよく、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：

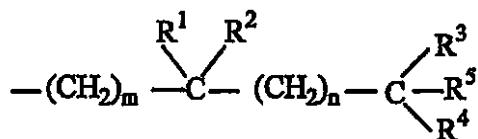
【化5】



[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、-CH₂OY、-C(CY)Y及び-CH=CY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もよく、そして、Yは、水素、メチル、-COR⁵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、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、一緒になってオキソ基、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、一緒になってオキソ基、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-C(H(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 μg 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 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。