

【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18年5月11日(2006.5.11)

【公表番号】特表2002-505336(P2002-505336A)

【公表日】平成14年2月19日(2002.2.19)

【出願番号】特願2000-534566(P2000-534566)

【国際特許分類】

C 0 7 J 41/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/575 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 5/18 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/08 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

C 0 7 J 43/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 J 41/00

A 6 1 K 31/575

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 5/18

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 19/08

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 31/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 37/06

C 0 7 J 43/00

【手続補正書】

【提出日】平成18年3月8日(2006.3.8)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

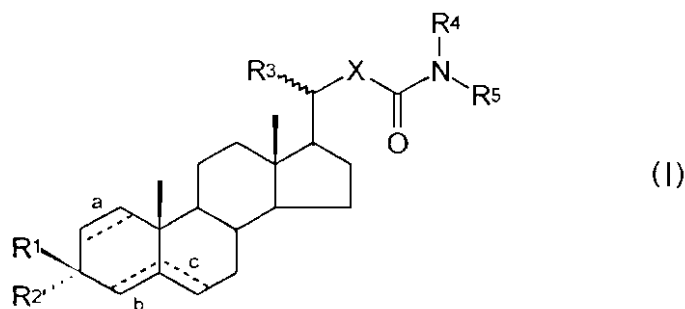
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 式 (I) の化合物：

【化 1】



式中、

R^1 はヒドロキシル基または保護されたヒドロキシル基を表し、 R^2 は水素原子を表し、そして二重結合は c 位置に存在するか、または R^1 および R^2 はともにオキソ基を表しそして二重結合は b 位置に存在するかまたは二重結合は a 位置および b 位置に存在し；

R^3 は - または - 配置を有するメチル基を表し；

R^4 および R^5 は、同一であっても異なってもよく、水素原子および脂肪族、シクロ脂肪族、芳香脂肪族およびアリール基から選択されるか、またはそれらが結合した窒素原子と一緒になって複素環式基を形成し；そして

X は、2 ~ 5 個の炭素原子を含有するポリメチレン基、それらのオキサ基含有類縁体（ここで -CO-N R^4 R^5 部分に結合したメチレン基以外のメチレン基は酸素原子によって置換されている）、または 2 つまでの二重結合を含有するそれらの不飽和類縁体を表すが、但し：

- i) R^3 が -CH₃ であり且つ X が (CH₂)₂ である場合は、 R^4 R^5 N - はアミノ、ジメチルアミノ、ジエチルアミノ、イミダゾリルまたはトリアゾリル基を表さず；
- ii) R^3 が -CH₃ であり且つ X が (CH₂)₃ である場合は、 R^4 R^5 N - はモルホリノでなく；そして
- iii) R^3 が -CH₃ であり且つ X が O(CH₂)₂ である場合は、 R^4 R^5 N - はジメチルアミノではない。

【請求項 2】 R^1 がヒドロキシル基または代謝的に不安定な O - 保護基で置換されたヒドロキシル基を表す、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 3】 R^4 および R^5 が、水素原子、C₁₋₆ アルキル基、C₃₋₈ シクロアルキル基、C₆₋₁₂ アリール - C₁₋₄ アルキル基および任意で置換された C₆₋₁₂ 炭素環式アリール基から選択される、請求項 1 または 2 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 4】 R^4 R^5 N - が、一つまたはそれ以上の 5 - および / または 6 - 員環を含み且つ O、N および S から選択される少なくとも一つのヘテロ原子を含有する複素環式基を表す、請求項 1 または 2 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 5】 R^4 R^5 N - が、ピペリジノ、モルホリノまたはチアモルホリノ基を表す、請求項 4 に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 6】 X が式 -CH₂ - (CH=CH)_m - (CH₂)_n - （ここで m は 0、1 または 2 であり、そして n は 0 または 2m + n = 1、2、3 または 4 となるような整数である）の基を表す、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 7】 X が式 - (CH₂)_p - O - (CH₂)_q - （ここで p は 0、1、2 または 3 であり、q は 1、2、3 または 4 であり、そして p + q は 4 を超えない）の基を表す、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の式 (I) の化合物。

【請求項 8】 下記の化合物：

- 3 - ヒドロキシ - 20 - エピ - コラ - 5 (6) - エン酸、ピペリジンアミド；
- 3 - オキソ - 20 - エピ - コラ - 4 - エン酸、ピペリジンアミド；
- 3 - ヒドロキシコラ - 5 (6) - エン酸、ピペリジンアミド；および

3 - オキシコラ - 4 - エン酸、ピペリジンアミド。

【請求項 9】 下記の化合物：

3 - ヒドロキシコラ - 5 (6) - エン酸、モルホリンアミド；

3 - オキシコラ - 4 - エン酸、モルホリンアミド；

3 - ヒドロキシコラ - 5 (6) - エン酸、チアモルホリンアミド；

3 - オキシコラ - 4 - エン酸、チアモルホリンアミド；

3 - ヒドロキシコラ - 5 (6) - エン酸、ジイソプロピルアミド；

3 - オキシコラ - 4 - エン酸、ジイソプロピルアミド；

3 - ヒドロキシ - 2 4 , 2 4 a - ビスホモ - コラ - 5 (6) - エン酸、ピペリジンアミド；

3 - オキシ - 2 4 , 2 4 a - ビスホモ - コラ - 4 - エン酸、ピペリジンアミド；

3 - ヒドロキシ - 2 0 - エピ - 2 4 - ホモ - 2 2 - オキサコラ - 5 (6) - エン酸、ピペリジンアミド；

3 - ヒドロキシ - 2 0 - エピ - 2 2 - オキサコラ - 5 (6) - エン酸、ピペリジンアミド；

3 - オキシ - 2 0 - エピ - 2 2 - オキサコラ - 4 - エン酸、ピペリジンアミド；

3 - ヒドロキシコラ - 5 (6) , 2 2 - ジエン酸、ピペリジンアミド；

3 - オキシ - 2 0 - エピ - コラ - 1 , 4 - ジエン酸、ピペリジンアミド；

3 - オキシコラ - 1 , 4 - ジエン酸、ピペリジンアミド；

3 - ヒドロキシ - 2 0 - エピ - 2 4 - ホモ - 2 3 - オキサコラ - 5 (6) - エン酸、ピペリジンアミド；および

3 - オキシ - 2 0 - エピ - 2 4 - ホモ - 2 3 - オキサコラ - 4 - エン酸、ピペリジンアミド。

【請求項 10】 ヒトまたは動物における傷の治癒、上皮小体ホルモンの抑制、受精の制御、または腫瘍性疾患、感染、骨疾患、自己免疫疾患、宿主移植片反応、移植拒絶反応、炎症性疾患、腫瘍形成、過剰増殖、筋障害、腸疾病、脊椎炎心臓疾患、皮膚疾患、高血圧、慢性関節リウマチ、乾癬性関節炎、二次上皮小体機能亢進症、喘息、認知障害若しくは老人性痴呆の治療若しくは予防に使用する医薬の製造のための請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載されているが請求項 1 の但し書きに従わない式 (I) の活性化合物の使用。

【請求項 11】 請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載されているが請求項 1 の但し書きに従わない式 (I) の活性化合物を、一つまたはそれ以上の生理学的許容担体または賦形剤との混合物として含む、医薬組成物。