

【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1月12日(2006.1.12)

【公表番号】特表2005-508368(P2005-508368A)

【公表日】平成17年3月31日(2005.3.31)

【年通号数】公開・登録公報2005-013

【出願番号】特願2003-541772(P2003-541772)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/56	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
C 0 7 J	9/00	(2006.01)
C 0 7 J	41/00	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/56	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	43/00	
C 0 7 J	9/00	
C 0 7 J	41/00	C S P
C 0 7 M	7:00	

【手続補正書】

【提出日】平成17年11月7日(2005.11.7)

【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

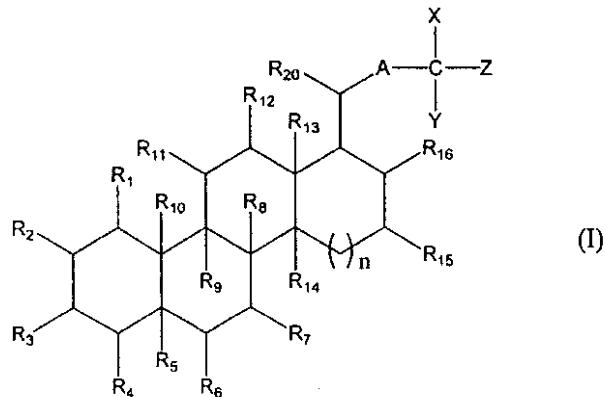
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

## 【化1】



式(I)において、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>11</sub>、R<sub>12</sub>、R<sub>15</sub>、R<sub>16</sub>、およびR<sub>20</sub>は、それぞれ独立に、水素、ハロ、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシル、オキソ、スルホン酸、または-NH-、-N(アルキル)-、-O-、-S-、-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-O-SO<sub>2</sub>-、-SO<sub>2</sub>O-、-SO<sub>3</sub>-O-、-CO-、-CO-O-、-O-CO-、-CO-NR'-、もしくは-NR'-CO-によって1箇所または複数の位置が任意選択で置換されているアルキルであり、

R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub>、R<sub>13</sub>、およびR<sub>14</sub>は、それぞれ独立に、水素、ハロ、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、ヒドロキシ、またはアミノであり

nは、0、1、または2であり、

Aは、アルキレン、アルケニレン、またはアルキニレンであり、

X、Y、およびZは、それぞれ独立に、アルキル、ハロアルキル、-OR'、-SR'、-NR'R''、-N(OR')R''、または-N(SR')R''であり、あるいはXとYが一緒になって、=O、=S、または=NR'であり、

R'およびR''は、それぞれ独立に、水素、アルキル、またはハロアルキルである、式(I)の化合物またはその塩、エステル、アミド、鏡像異性体、異性体、互変異性体、多形、プロドラッグ、もしくは誘導体。

## 【請求項2】

R<sub>5</sub>が水素であり、R<sub>3</sub>およびR<sub>6</sub>がヒドロキシであり、nが0であり、Aがアルキレンである請求項1に記載の化合物。

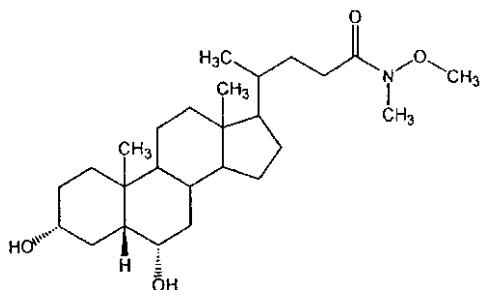
## 【請求項3】

X、Y、およびZが、アルキル、ハロアルキル、-OR'、または-SR'であり、あるいはXとYが一緒になって、=Oまたは=Sであり、Zが、-OR'、-SR'、-NR'R''、-N(OR')R''、または-N(SR')R''である請求項1に記載の化合物。

## 【請求項4】

前記化合物が

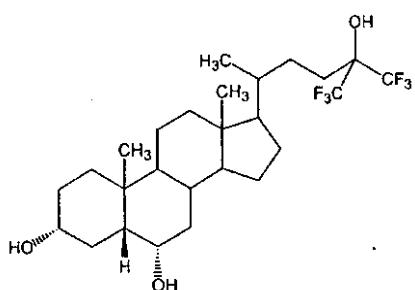
【化2】

である請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

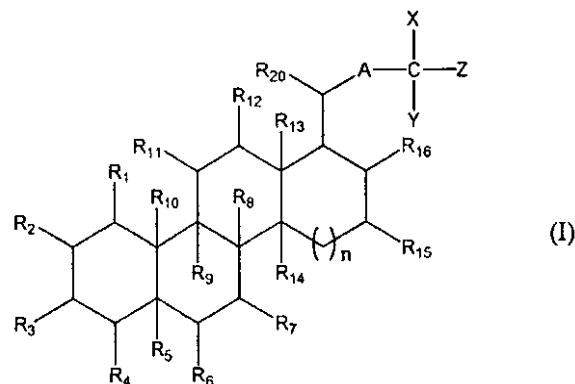
前記化合物が

【化3】

である請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

【化4】



式(I)において、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>11</sub>、R<sub>12</sub>、R<sub>15</sub>、R<sub>16</sub>、およびR<sub>20</sub>は、それぞれ独立に、水素、ハロ、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシ、アミノ、カルボキシル、オキソ、スルホン酸、または-NH-、-N(アルキル)-、-O-、-S-、-SO-、-SO<sub>2</sub>-、-O-SO<sub>2</sub>-、-SO<sub>2</sub>-O-、-SO<sub>3</sub>-O-、-CO-、-CO-O-、-O-CO-、-CO-NR'-、もしくは-NR'-CO-によって1箇所または複数の位置が任意選択で置換されているアルキルであり、

R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub>、R<sub>13</sub>、およびR<sub>14</sub>は、それぞれ独立に、水素、ハロ、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、ヒドロキシ、またはアミノであり

nは、0、1、または2であり、

Aは、アルキレン、アルケニレン、またはアルキニレンであり、

X、Y、およびZは、それぞれ独立に、アルキル、ハロアルキル、-OR'、-SR'

、 - N R ' R " 、 - N ( O R ' ) R " 、 または - N ( S R ' ) R " であり、あるいは X と Y が一緒になって、 = O 、 = S 、 または = N R ' であり、

R ' および R " は、それぞれ独立に、水素、アルキル、またはハロアルキルである、式 (I) の化合物、またはその塩、エステル、アミド、鏡像異性体、異性体、互変異性体、多形、プロドラッグ、もしくは誘導体から選択される治療有効量の化合物を含む薬剤組成物。

**【請求項 7】**

R <sub>5</sub> が 水素であり、R <sub>3</sub> および R <sub>6</sub> が ヒドロキシであり、n が 0 であり、A がアルキレンである請求項 6 に記載の組成物。

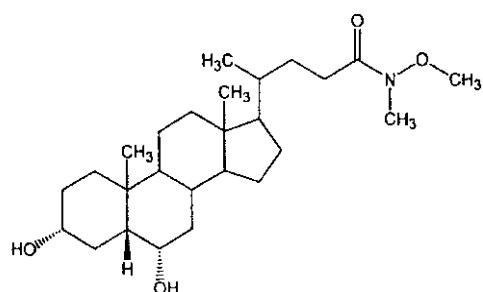
**【請求項 8】**

X 、 Y 、 および Z が、アルキル、ハロアルキル、 - O R ' 、 または - S R ' であり、あるいは X と Y が一緒になって、 = O または = S であり、Z が、 - O R ' 、 - S R ' 、 - N R ' R " 、 - N ( O R ' ) R " 、 または - N ( S R ' ) R " である請求項 6 に記載の組成物。

**【請求項 9】**

前記化合物が

**【化 5】**

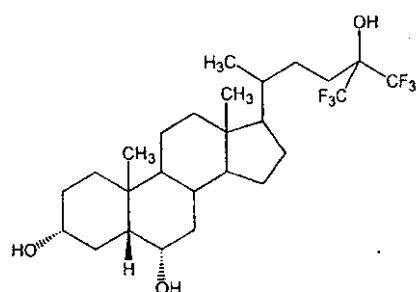


である請求項 6 に記載の組成物。

**【請求項 10】**

前記化合物が

**【化 6】**



である請求項 6 に記載の組成物。

**【請求項 11】**

前記組成物が剤形である請求項 6 に記載の組成物。

**【請求項 12】**

前記剤形が、錠剤、軟ゼラチンカプセル、硬ゼラチンカプセル、懸濁性錠剤、発泡性錠剤、粉末、発泡性粉末、チュアブル錠、溶液、懸濁液、乳濁液、クリーム、ゲル、パッチ、および座剤からなる群から選択される請求項 11 に記載の組成物。

**【請求項 13】**

前記剤形が錠剤である請求項 11 に記載の組成物。

**【請求項 14】**

前記剤形が軟ゼラチンカプセルである請求項 1 1 に記載の組成物。

【請求項 1 5】

前記剤形が硬ゼラチンカプセルである請求項 1 1 に記載の組成物。

【請求項 1 6】

前記剤形が懸濁製錠剤である請求項 1 1 に記載の組成物。

【請求項 1 7】

前記剤形が発泡性錠剤である請求項 1 1 に記載の組成物。

【請求項 1 8】

前記剤形が粉末である請求項 1 1 に記載の組成物。

【請求項 1 9】

前記剤形が発泡性粉末である請求項 1 1 に記載の組成物。

【請求項 2 0】

前記剤形がチュアブル錠である請求項 1 1 に記載の組成物。

【請求項 2 1】

前記剤形が溶液である請求項 1 1 に記載の組成物。

【請求項 2 2】

前記剤形が懸濁液である請求項 1 1 に記載の組成物。

【請求項 2 3】

前記剤形が乳濁液である請求項 1 1 に記載の組成物。

【請求項 2 4】

前記剤形がクリームである請求項 1 1 に記載の組成物。

【請求項 2 5】

前記剤形がゲルである請求項 1 1 に記載の組成物。

【請求項 2 6】

前記剤形がパッチである請求項 1 1 に記載の組成物。

【請求項 2 7】

前記剤形が座剤である請求項 1 1 に記載の組成物。

【請求項 2 8】

製薬的に許容される賦形剤をさらに含む請求項 1 1 に記載の組成物。

【請求項 2 9】

前記製薬的に許容される賦形剤が、結合剤、崩壊剤、充填剤、界面活性剤、可溶化剤、安定剤、滑沢剤、湿潤剤、希釈剤、粘着防止剤、流動促進剤、または、製薬的適合性のある担体を含む請求項 2 8 に記載の組成物。