

【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20年9月4日(2008.9.4)

【公表番号】特表2004-504295(P2004-504295A)

【公表日】平成16年2月12日(2004.2.12)

【年通号数】公開・登録公報2004-006

【出願番号】特願2002-512124(P2002-512124)

【国際特許分類】

C 07 C 401/00 (2006.01)

A 61 K 31/59 (2006.01)

A 61 K 31/592 (2006.01)

A 61 K 31/593 (2006.01)

A 61 P 3/02 (2006.01)

【F I】

C 07 C 401/00

A 61 K 31/59

A 61 K 31/592

A 61 K 31/593

A 61 P 3/02 1 0 2

【手続補正書】

【提出日】平成20年7月15日(2008.7.15)

【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】純度が質量ベースのHPLC分析によって98%以上であり、残留溶媒が0.5%以下であり、合計不純物が1.5%以下であり、及び、0.5%より大きい単一の不純物を有しないことを特徴とする、安定化1-ヒドロキシビタミンD(SHVD)。

【請求項2】不純物が、1-ヒドロキシビタミンD<sub>4</sub>である、請求項1に記載の安定化1-ヒドロキシビタミンD。

【請求項3】熱攻撃におけるビタミンD形態からプレビタミン形態への転換率が、同一条件下での非安定化1-ヒドロキシビタミンD(非SHVD<sub>2</sub>)より低い、請求項1に記載の安定化1-ヒドロキシビタミンD。

【請求項4】請求項1に記載のSHVDを含む医薬組成物。

【請求項5】ソフトゼラチンカプセルである請求項4に記載の組成物。

【請求項6】溶液である、請求項4に記載の組成物。

【請求項7】単位投与形態であり、0.5μg～25μgの活性成分を含む、請求項4に記載の組成物。

【請求項8】油中、請求項1に記載のSHVDの効果的量の溶液を含み、該溶液が、ソフトゼラチンカプセルに含まれている組成物。

【請求項9】油が分画されたココナッツ油である、請求項8に記載の組成物。

【請求項10】請求項1に記載のSHVDの効果的な量の固体医薬製剤を含み、該固体医薬製剤が、タブレット、カプセル、粒剤、粉体の形態である組成物。

【請求項11】活性成分としての請求項1に記載のSHVDの効果的量を含む、カルシウム吸収、輸送または代謝、高増殖細胞活性、免疫応答不均衡または炎症応答不均衡の異常性が原因の病気の治療用薬剤。

【請求項 12】病気が乾癬である、請求項11に記載の薬剤。

【請求項 13】活性成分としての請求項1に記載のSHVDの効果的量を、治療が必要なヒト以外の被検者に投与することを含む、カルシウム吸収、輸送または代謝、高増殖細胞活性、免疫応答不均衡または炎症応答不均衡の異常性が原因の病気の治疗方法。

【請求項 14】熱攻撃のときの1'-ヒドロキシプレビタミンDへの転化率が、同一条件下での非SHVDと比較して減少することを特徴とする、安定化1'-ヒドロキシビタミンD(SHVD)。

【請求項 15】熱攻撃が、約60°の一定温度で起こる、請求項14に記載の安定化1'-ヒドロキシビタミンD。

【請求項 16】実質的に純粋で、実質的に溶媒フリーで、かつ貯蔵安定性である、安定化1'-ヒドロキシビタミンD(SHVD)。

【請求項 17】対応するプレビタミン形態と比較して実質的に減少した転換率によって特徴付けられる安定化1'-ヒドロキシビタミンD(SHVD)を含む、医薬化合物。

【請求項 18】(a)ビタミンD化合物である出発物質の3位のヒドロキシル基をトシリ化してヒドロキシを1'位に加える工程；

(b)トシリ化形態をシクロビタミンに転換する工程；

(c)1'位のシクロビタミンをヒドロキシリ化する工程；

(d)シクロビタミンをシス及びトランスビタミン形態に転換する工程；

(e)トランスビタミン形態を照射してシス形態を生成する工程；

(f)シス形態を、有機溶媒中で再結晶化し、再結晶化形態を72～120時間55°で真空オープン乾燥してSHVDを生成する工程、

を含む、安定化1'-ヒドロキシビタミンD(SHVD)の製造方法。

【請求項 19】請求項18に記載の方法によって合成される、安定化1'-ヒドロキシビタミンD(SHVD)。

【請求項 20】少なくとも3回、粗製のヒドロキシビタミンD製品を有機溶媒から連続的に再結晶化することを含む、安定化1'-ヒドロキシビタミンD(SHVD)の製造方法。

【請求項 21】再結晶化方法が、2つの再結晶化を含む、請求項20に記載の方法。

【請求項 22】有機溶媒が、ギ酸メチル、ギ酸エチル、酢酸エチル、アセトン、メチルエチルケトン、ヘキサン、2-プロパノール-ヘキサン、ペンタン、ヘプタン、ジエチルエーテル、ジイソプロピルエーテル、メタノール、エタノールアセトニトリル又はその組み合わせである、請求項21に記載の方法。

【請求項 23】カルシウム吸収、輸送または代謝、高増殖細胞活性、免疫応答不均衡または炎症応答不均衡の異常性が原因の病気の治療用組成物の製造における、活性成分としての請求項1に記載のSHVDの効果的量の使用。