

【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7月31日(2008.7.31)

【公開番号】特開2007-63288(P2007-63288A)

【公開日】平成19年3月15日(2007.3.15)

【年通号数】公開・登録公報2007-010

【出願番号】特願2006-302712(P2006-302712)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/4025 (2006.01)

A 6 1 P 19/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/4025

A 6 1 P 19/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 25/04

【手続補正書】

【提出日】平成20年6月17日(2008.6.17)

【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】

治療有効量のエンドセリンE T - A受容体アンタゴニストを含む、患者における骨量減少を抑制するための医薬組成物。

【請求項2】

患者が癌に罹患していることを特徴とする、請求の範囲第1項に記載の医薬組成物。

【請求項3】

癌が前立腺癌であり、患者が男性であることを特徴とする、請求の範囲第1項に記載の医薬組成物。

【請求項4】

更に、正味の骨量減少の進行を妨げる治療薬の少なくとも1つを含むことを特徴とする、請求の範囲第1項に記載の医薬組成物。

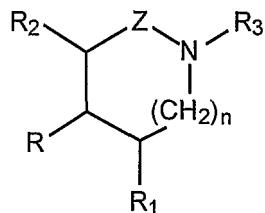
【請求項5】

治療薬がビスホスホネートであることを特徴とする、請求の範囲第4項に記載の医薬組成物。

【請求項6】

治療有効量の式I :

【化1】



I

[式中、

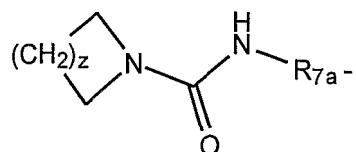
Rは- $(CH_2)_m$ -Wであり；Zは-C(R₁₈)(R₁₉)-及び-C(O)-から選択され；

R₁及びR₂は独立して水素、低級アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシリル、アルコキシカルボニルアルキル、ヒドロキシリル、ハロアルキル、ハロアルコキシリル、アルコキシリアルコキシリル、チオアルコキシリアルコキシリル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アミノカルボニルアルキル、アルキルアミノカルボニルアルキル、ジアルキルアミノカルボニルアルキル、アミノカルボニルアルケニル、アルキルアミノカルボニルアルケニル、ジアルキルアミノカルボニルアルケニル、ヒドロキシリアルケニル、アリール、アリールアルキル、アリールオキシリアルケニル、アリールアルコキシリアルケニル、(N-アルカノイル-N-アルキル)アミノアルキル、アルキルスルホニルアミドアルキル、ヘテロ環、ヘテロ環式アルキル及び(R_aa)(R_bb)N-R_cc-から選択され、ただしR₁及びR₂の一方または両方が水素以外であり；

R₃はR₄-C(O)-R₅-、R₄-R_{5a}-、R₄-C(O)-R₅-N(R₆)-、R₆-S(O)₂-R₇-、R₂₆-S(O)-R₂₇-、R₂₂-O-C(O)-R₂₃-、低級アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アリールアルキル、アリールオキシリアルキル、ヘテロ環、ヘテロ環式アルキル、アルコキシリアルキル、アルコキシリアルコキシリル及びR₁₃-C(O)-CH(R₁₄)-から選択され；

R₄及びR₆は独立して(R₁₁)(R₁₂)N-、低級アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロ環、ヘテロ環式アルキル、アルコキシリアルキル、ヒドロキシリアルキル、ハロアルキル、ハロアルケニル、ハロアルコキシリアルキル、ハロアルコキシ、アルコキシハロアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル、アルコキシ、及び

【化2】



から選択され；

R₅は共有結合、アルキレン、アルケニレン、-N(R₂₀)-R₈-、-R_{8a}-N(R₂₀)-R₈-、-O-R₉-及び-R_{9a}-O-R₉-から選択され；R₆は低級アルキル、ハロアルキル、アルコキシリアルキル、ハロアルコキシリアルキル、アリール及びアリールアルキルから選択され；R₇は共有結合、アルキレン、アルケニレン、-N(R₂₁)-R₁₀-及び-R₁₀_a-N(R₂₁)-R₁₀-から選択され；R₈はアルキレン及びアルケニレンから選択され；R₉はアルキレンであり；

R₁₀ はアルキレン及びアルケニレンから選択され；

R₁₁ 及び R₁₂ は独立して水素、低級アルキル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルコキシアルキルアルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、ヘテロ環、アリールアルキル、ヘテロ環式アルキル、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アミノアルキル、トリアルキルアミノアルキル、アルキルアミノアルキル、ジアルキルアミノアルキル及びカルボキシアルキルから選択され；

R₁₃ はアミノ、アルキルアミノ及びジアルキルアミノから選択され；

R₁₄ はアリール及び R₁₅ - C(○) - から選択され；

R₁₅ はアミノ、アルキルアミノ及びジアルキルアミノから選択され；

R₁₆ は低級アルキル、ハロアルキル、アリール及びジアルキルアミノから選択され；

R₁₇ は低級アルキルであり；

R₁₈ 及び R₁₉ は独立して水素及び低級アルキルから選択され；

R₂₀ は水素、低級アルキル、アルケニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルコキシアルキル、シクロアルキル及びシクロアルキルアルキルから選択され；

R₂₁ は水素、低級アルキル、アルケニル、ハロアルキル、アルコキシアルキル、ハロアルコキシアルキル、アリール及びアリールアルキルから選択され；

R₂₂ はカルボキシ保護基及びヘテロ環から選択され；

R₂₃ は共有結合、アルキレン、アルケニレン及び - N(R₂₄) - R₂₅ - から選択され；

R₂₄ は水素及び低級アルキルから選択され；

R₂₅ はアルキレンであり；

R₂₆ は低級アルキル、ハロアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロ環、ヘテロ環式アルキル、アルコキシアルキル及びアルコキシ置換ハロアルキルから選択され；

R₂₇ はアルキレン及びアルケニレンから選択され；

R₅_a はアルキレン及びアルケニレンから選択され；

R₇_a はアルキレンであり；

R₈_a はアルキレン及びアルケニレンから選択され、

R₉_a はアルキレンであり；

R₁₀_a はアルキレン及びアルケニレンから選択され；

R_a_a はアリール及びアリールアルキルから選択され；

R_b_b は水素及びアルカノイルから選択され；

R_c_c はアルキレンであり；

m は 0 ~ 6 であり；

n は 0 または 1 であり；

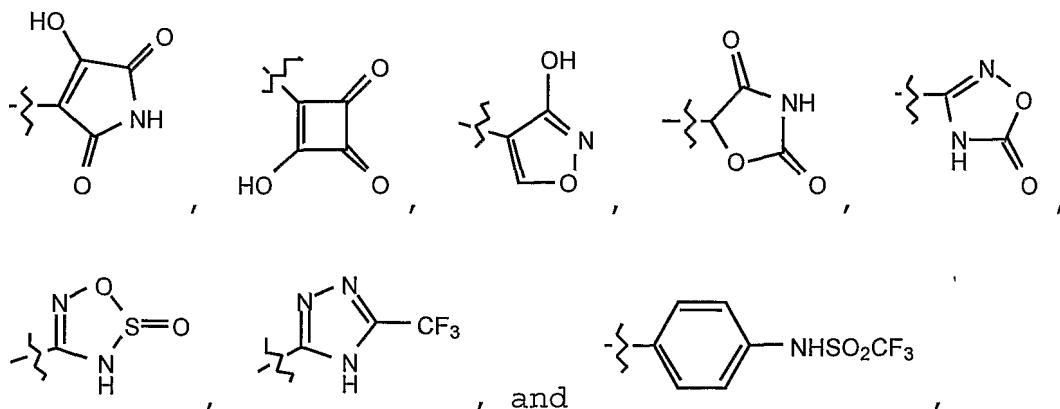
z は 0 ~ 5 であり；

E は水素、低級アルキル及びアリールアルキルから選択され；

G は水素及びカルボキシ保護基から選択され；及び

W は - C(○)₂ - G、- PO₃H₂、- P(○)(OH)(E)、- CN、- C(○)NHR₁₇、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、テトラゾリル、ヒドロキシ、アルコキシ、スルホンアミド、- C(○)NHS(○)₂R₁₆、- S(○)₂NHC(○)R₁₆、

【化 3】



から選択される]

を有する化合物またはその医薬的に許容される塩を含む、癌患者における骨量減少を抑制するための医薬組成物。

【請求項 7】

癌が前立腺癌であり、患者が男性であることを特徴とする、請求の範囲第6項に記載の医薬組成物。

【 請求項 8 】

更に、正味の骨量減少の進行を妨げる治療薬の少なくとも1つを含むことを特徴とする、請求の範囲第6項に記載の医薬組成物。

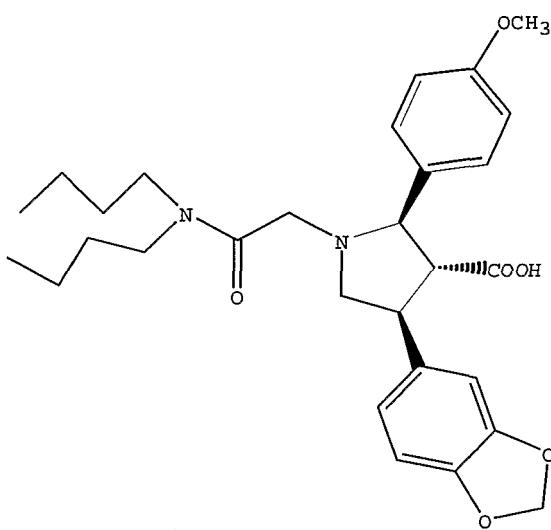
【請求項9】

治療薬がビスホスホネートであることを特徴とする、請求の範囲第8項に記載の医薬組成物。

【請求項 10】

治療有效量の式 III:

【化 4】



III.

を有する化合物を含む、癌患者における骨量減少を抑制するための医薬組成物。

【請求項 11】

癌が前立腺癌であり、患者が男性であることを特徴とする、請求の範囲第10項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 2】

更に、正味の骨量減少の進行を妨げる治療薬の少なくとも1つを含むことを特徴とする、請求の範囲第10項に記載の医薬組成物。

【請求項13】

治療薬がビスホスホネートであることを特徴とする、請求の範囲第12項に記載の医薬組成物。

【請求項14】

治療有効量のエンドセリンE T - A受容体アンタゴニストを含む、患者における骨代謝を抑制するための医薬組成物。