

【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 5 日 (2006.1.5)

【公表番号】特表 2001-510183 (P2001-510183A)

【公表日】平成 13 年 7 月 31 日 (2001.7.31)

【出願番号】特願 2000-503057 (P2000-503057)

【国際特許分類】

C 07 C 401/00 (2006.01)

A 61 K 31/59 (2006.01)

A 61 P 3/02 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 19/10 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 37/00 (2006.01)

【F I】

C 07 C 401/00

A 61 K 31/59

A 61 P 3/02 1 0 2

A 61 P 3/10

A 61 P 19/10

A 61 P 29/00 1 0 1

A 61 P 35/00

A 61 P 37/00

【手続補正書】

【提出日】平成 17 年 6 月 17 日 (2005.6.17)

【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

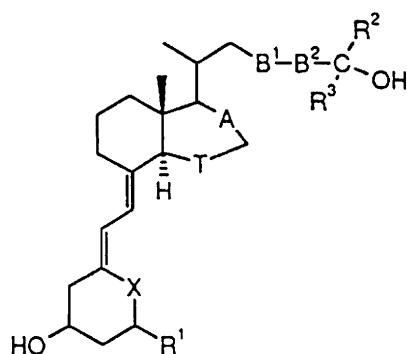
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 式 I :

【化 1】



I

〔式中、

A は、単結合又は二重結合であり、

B^1 は、 $-CH=CH-$ であり、

B^2 は、 $-CH=CH-$ 又は $-C-C-$ であり、

T は、 $-CH_2-$ 又は $-CH_2CH_2-$ であり、

X は、 $-CH_2-$ 又は $>C=CH_2$ であり、

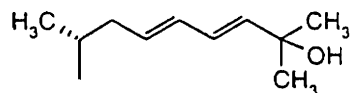
R^1 は、H、F 又は OH であり、

R^2 及び R^3 は、各々独立に、 C_{1-4} -アルキル又は CF_3 であるか、あるいは

C(R^2 , R^3) は、 C_{3-6} -シクロアルキルである〕で示されるポリ不飽和 24a, 24b-ジホモ-9, 10-セココレスタン誘導体。

【請求項 2】 R^1 が、H 又は OH であり、そして特にこの側鎖が、下記式：

【化 2】



である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】 請求項 1 又は 2 記載の化合物、即ち、

(5Z, 7E, 23E, 24aE) - (1R, 3S) - 24a, 24b-ジホモ-9, 10-セコ-コレスタ-5, 7, 10(19), 23, 24a-ペンタエン-1, 3, 25-トリオール。

【請求項 4】 以下の群：

(7E, 23E, 24aE) - (1R, 3R) - 24a, 24b-ジホモ-19-ノル-9, 10-セコ-コレスタ-5, 7, 23, 24a-テトラエン-1, 3, 25-トリオール、

(5Z, 7E, 23E, 24aE) - (1S, 3S) - 24a, 24b-ジホモ-9, 10-セコ-コレスタ-5, 7, 10(19), 23, 24a-ペンタエン-1, 3, 25-トリオール、

(5Z, 7E, 23E, 24aE) - (1S, 3R) - 17a, 24a, 24b-トリホモ-9, 10-セコ-コレスタ-5, 7, 10(19), 23, 24a-ペンタエン-1, 3, 25-トリオール、

(7E, 23E, 24aE) - (1R, 3R) - 17a, 24a, 24b-トリホモ-19-ノル-9, 10-セコ-コレスタ-5, 7, 23, 24a-テトラエン-1, 3, 25-トリオール、

(5Z, 7E, 23E, 24aE) - (3S) - 17a, 24a, 24b-トリホモ-9, 10-セコ-コレスタ-5, 7, 10(19), 23, 24a-ペンタエン-3, 25-ジオール、

(7E, 23E, 24aE) - (1R, 3R) - 17a, 24a, 24b-トリホモ-19-ノル-9, 10-セコ-コレスタ-5, 7, 17, 23, 24a-ペンタエン-1, 3, 25-トリオール、

(5Z, 7E, 23E, 24aE) - (1S, 3R) - 17a, 24a, 24b-トリホモ-9, 10-セコ-コレスタ-5, 7, 10(19), 17, 23, 24a-ヘキサエン-1, 3, 25-トリオール、

(5Z, 7E, 23E, 24aE) - (1S, 3S) - 17a, 24a, 24b-トリホモ-9, 10-セコ-コレスタ-5, 7, 10(19), 17, 23, 24a-ヘキサエン-1, 3, 25-トリオール、

(5Z, 7E, 23E, 24aE) - (1S, 3S) - 17a, 24a, 24b-トリホモ-9, 10-セコ-コレスタ-5, 7, 10(19), 23, 24a-ペンタエン-1, 3, 25-トリオール、

(7E, 23E, 24aE) - (1R, 3R) - 24a, 24b-ジホモ-19-ノル-9, 10-セコ-コレスタ-5, 7, 16, 23, 24a-ペンタエン-1, 3, 25

- トリオール、

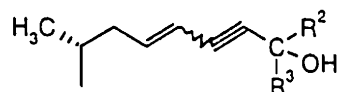
(5 Z, 7 E, 23 E, 24 a E) - (1 S, 3 R) - 24 a, 24 b - ジホモ - 9, 10 - セコ - コレスタ - 5, 7, 10 (19), 16, 23, 24 a - ヘキサエン - 1, 3, 25 - トリオール、又は

(5 Z, 7 E, 23 E, 24 a E) - (3 S) - 24 a, 24 b - ジホモ - 9, 10 - セコ - コレスタ - 5, 7, 10 (19), 16, 23, 24 a - ヘキサエン - 3, 25 - ジオール、

の請求項 1 又は 2 記載の化合物。

【請求項 5】 B^1 が、 $-CH=CH-$ であり、そして B^2 が、 $-C-C-$ であり、そして特に側鎖が、下記式：

【化 3】



であり、そして R^2 及び R^3 が、請求項 1 と同義である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 6】 下記群：

(7 E, 23 E) - (1 R, 3 R) - 17 a, 24 a, 24 b - トリホモ - 19 - ノル - 9, 10 - セコ - コレスタ - 5, 7, 23 - トリエン - 24 a - イン - 1, 3, 25 - トリオール、

(5 Z, 7 E, 23 E) - (1 S, 3 R) - 17 a, 24 a, 24 b - トリホモ - 9, 10 - セコ - コレスタ - 5, 7, 10 (19), 23 - テトラエン - 24 a - イン - 1, 3, 25 - トリオール、

(7 E, 23 E) - 及び (7 E, 23 Z) - (1 R, 3 R) - 24 a, 24 b - ジホモ - 19 - ノル - 9, 10 - セコ - コレスタ - 5, 7, 23 - トリエン - 24 a - イン - 1, 3, 25 - トリオール、

(7 E, 23 E) - 及び (7 E, 23 Z) - (1 R, 3 R) - 24 a, 24 b, 26 a, 26 b - テトラホモ - 19 - ノル - 9, 10 - セコ - コレスタ - 5, 7, 23 - トリエン - 24 a - イン - 1, 3, 25 - トリオール、

(7 E, 23 E) - 及び (7 E, 23 Z) - (1 R, 3 R) - 26, 26, 26, 27, 27, 27 - ヘキサフルオロ - 24 a, 24 b - ジホモ - 19 - ノル - 9, 10 - セコ - コレスタ - 5, 7, 23 - トリエン - 24 a - イン - 1, 3, 25 - トリオール、

(7 E, 23 E, 24 a E) - 及び (7 E, 23 Z, 24 a E) - (1 R, 3 R) - 24 a, 24 b, 26 a, 26 b - テトラホモ - 19 - ノル - 9, 10 - セコ - コレスタ - 5, 7, 23, 24 a - テトラエン - 24 a - イン - 1, 3, 25 - トリオール、又は

(7 E, 23 E, 24 a E) - 及び (7 E, 23 Z, 24 a E) - (1 R, 3 R) - 26, 26, 26, 27, 27, 27 - ヘキサフルオロ - 24 a, 24 b - ジホモ - 19 - ノル - 9, 10 - セコ - コレスタ - 5, 7, 23, 24 a - テトラエン - 24 a - イン - 1, 3, 25 - トリオール、

の請求項 1 及び 5 記載の化合物。

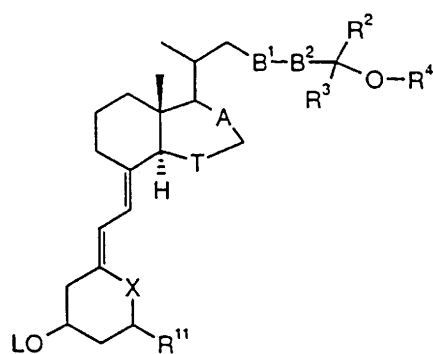
【請求項 7】 B^1 が、 $-CH=CH-$ であり、 B^2 が、 $-C-C-$ であり、そして $C(R^2, R^3)$ が、 C_{3-6} - シクロアルキルである、請求項 1 記載の化合物、特に、

(7 E, 23 E) - 及び (7 E, 23 Z) - (1 R, 3 R) - 25 - (1 - ヒドロキシ - シクロペンチル) - 24 a, 24 b - ジホモ - 19 - ノル - 9, 10 - セコ - コレスタ - 5, 7, 23 - トリエン - 24 a - イン - 1, 3 - ジオール、又は

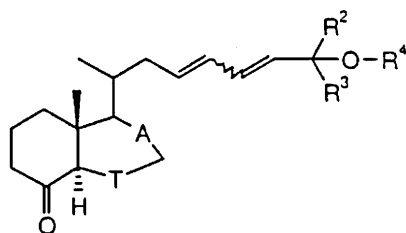
(7 E, 23 E, 24 a E) - 及び (7 E, 23 Z, 24 a E) - (1 R, 3 R) - 25 - (1 - ヒドロキシ - シクロペンチル) - 24 a, 24 b - ジホモ - 19 - ノル - 9, 10 - セコ - コレスタ - 5, 7, 23, 24 a - テトラエン - 24 a - イン - 1, 3 - ジオール。

【請求項 8】 式 II、IV、V 及び VI :

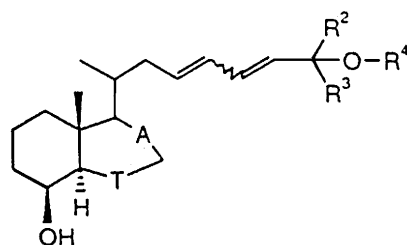
【化 4】



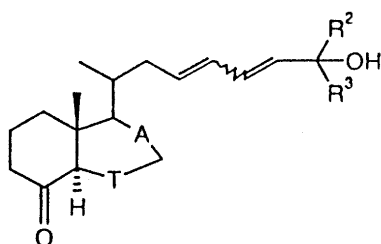
II



IV



V



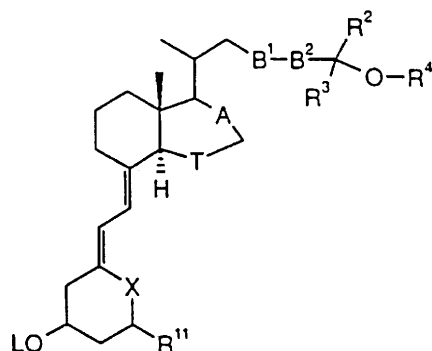
VI

〔式中、 R^{11} は、H、F又はOLであり、 R^4 は、H又はL であり、L及びL は、シリル保護基であり、そしてA、 B^1 、 B^2 、T、R、 R^2 及び R^3 は、請求項1と同義である〕で示される化合物。

【請求項 9】 特にビタミンD依存性障害及びIL-12依存性自己免疫疾患、特に乾癬、基底細胞がん、角化の障害及び角化症、白血病、骨粗鬆症、腎不全を伴う上皮小体機能亢進症、多発性硬化症、移植拒絶、移植片対宿主病、慢性関節リウマチ、インスリン依存性糖尿病、炎症性腸疾患、敗血症性ショック及びアレルギー性脳脊髄炎の治療又は予防用の、活性成分として請求項1～7のいずれか1項記載の式Iの化合物を含む、医薬組成物。

【請求項 10】 請求項1記載の式Iの化合物の製造方法であって、式II:

【化 5】



II

〔式中、 R^{11} は、H、F又はO-Lであり、 R^4 は、H又はLであり、そしてA、 B^1 、 B^2 、T、R、 R^2 及び R^3 は、請求項1と同義である〕で示される化合物に含まれるシリル保護基L及びLを開裂させる方法。

【請求項11】 ビタミンD依存性障害及びIL-12依存性自己免疫疾患、特に乾癬、基底細胞がん、角化の障害及び角化症、白血病、骨粗鬆症、腎不全を伴う上皮小体機能亢進症、多発性硬化症、移植拒絶、移植片対宿主病、慢性関節リウマチ、インスリン依存性糖尿病、炎症性腸疾患、敗血症性ショック及びアレルギー性脳脊髄炎の治療又は予防において使用するための、請求項1～7のいずれか1項記載の化合物。

【請求項12】 ビタミンD依存性障害及びIL-12依存性自己免疫疾患、特に乾癬、基底細胞がん、角化の障害及び角化症、白血病、骨粗鬆症、腎不全を伴う上皮小体機能亢進症、多発性硬化症、移植拒絶、移植片対宿主病、慢性関節リウマチ、インスリン依存性糖尿病、炎症性腸疾患、敗血症性ショック及びアレルギー性脳脊髄炎の治療又は予防の医薬組成物の製造のための、請求項1～7のいずれか1項記載の化合物の使用。