

【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 0 7 C 401/00	(2006.01)
A 6 1 K 31/59	(2006.01)
A 6 1 P 3/02	(2006.01)
A 6 1 P 3/10	(2006.01)
A 6 1 P 19/10	(2006.01)
A 6 1 P 29/00	(2006.01)
A 6 1 P 35/00	(2006.01)
A 6 1 P 37/00	(2006.01)

【F I】

C 0 7 C 401/00	
A 6 1 K 31/59	
A 6 1 P 3/02	1 0 2
A 6 1 P 3/10	
A 6 1 P 19/10	
A 6 1 P 29/00	1 0 1
A 6 1 P 35/00	
A 6 1 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

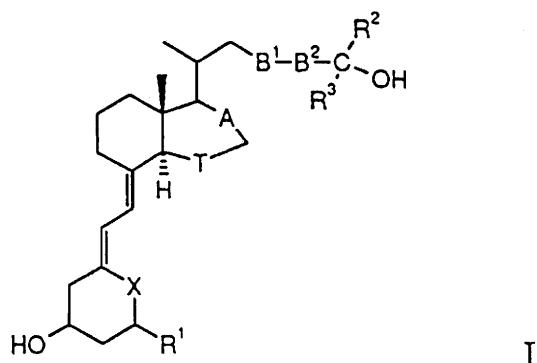
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】式I:

【化1】

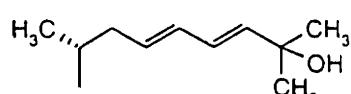


〔式中、

Aは、単結合又は二重結合であり、

B¹は、 - C H = C H - であり、
 B²は、 - C H = C H - 又は - C C - であり、
 Tは、 - C H₂ - 又は - C H₂ C H₂ - であり、
 Xは、 - C H₂ - 又は > C = C H₂ であり、
 R¹は、 H、 F 又は O H であり、
 R²及びR³は、 各々独立に、 C₁₋₄ - アルキル又は C F₃ であるか、 あるいは
 C (R², R³) は、 C₃₋₆ - シクロアルキルである] で示されるポリ不飽和 24a, 2
 4b - ジホモ - 9, 10 - セココレスタン誘導体。

【請求項 2】 R¹が、 H 又は O H 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, 1
 0 - 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, 2
 5 - 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, 2
 5 - 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, 2
 5 - 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 , 2 3 E , 2 4 a E) - (1 S , 3 R) - 2 4 a , 2 4 b - ジホモ - 9 ,
1 0 - セコ - コレスタ - 5 , 7 , 1 0 (1 9) , 1 6 , 2 3 , 2 4 a - ヘキサエン - 1 ,
3 , 2 5 - トリオール、又は

(5 Z , 7 E , 2 3 E , 2 4 a E) - (3 S) - 2 4 a , 2 4 b - ジホモ - 9 , 1 0 -
セコ - コレスタ - 5 , 7 , 1 0 (1 9) , 1 6 , 2 3 , 2 4 a - ヘキサエン - 3 , 2 5 -
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、 - C H = C H - 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 , 2 3 E) - (1 R , 3 R) - 1 7 a , 2 4 a , 2 4 b - トリホモ - 1 9 - ノル
- 9 , 1 0 - セコ - コレスタ - 5 , 7 , 2 3 - トリエン - 2 4 a - イン - 1 , 3 , 2 5 -
トリオール、

(5 Z , 7 E , 2 3 E) - (1 S , 3 R) - 1 7 a , 2 4 a , 2 4 b - トリホモ - 9 ,
1 0 - セコ - コレスタ - 5 , 7 , 1 0 (1 9) , 2 3 - テトラエン - 2 4 a - イン - 1 ,
3 , 2 5 - トリオール、

(7 E , 2 3 E) - 及び (7 E , 2 3 Z) - (1 R , 3 R) - 2 4 a , 2 4 b - ジホモ
- 1 9 - ノル - 9 , 1 0 - セコ - コレスタ - 5 , 7 , 2 3 - トリエン - 2 4 a - イン - 1
, 3 , 2 5 - トリオール、

(7 E , 2 3 E) - 及び (7 E , 2 3 Z) - (1 R , 3 R) - 2 4 a , 2 4 b , 2 6 a
, 2 6 b - テトラホモ - 1 9 - ノル - 9 , 1 0 - セコ - コレスタ - 5 , 7 , 2 3 - トリエ
ン - 2 4 a - イン - 1 , 3 , 2 5 - トリオール、

(7 E , 2 3 E) - 及び (7 E , 2 3 Z) - (1 R , 3 R) - 2 6 , 2 6 , 2 6 , 2 7
, 2 7 , 2 7 - ヘキサフルオロ - 2 4 a , 2 4 b - ジホモ - 1 9 - ノル - 9 , 1 0 - セコ
- コレスタ - 5 , 7 , 2 3 - トリエン - 2 4 a - イン - 1 , 3 , 2 5 - トリオール、

(7 E , 2 3 E , 2 4 a E) - 及び (7 E , 2 3 Z , 2 4 a E) - (1 R , 3 R) - 2
4 a , 2 4 b , 2 6 a , 2 6 b - テトラホモ - 1 9 - ノル - 9 , 1 0 - セコ - コレスタ -
5 , 7 , 2 3 , 2 4 a - テトラエン - 2 4 a - イン - 1 , 3 , 2 5 - トリオール、又は

(7 E , 2 3 E , 2 4 a E) - 及び (7 E , 2 3 Z , 2 4 a E) - (1 R , 3 R) - 2
6 , 2 6 , 2 6 , 2 7 , 2 7 , 2 7 - ヘキサフルオロ - 2 4 a , 2 4 b - ジホモ - 1 9 -
ノル - 9 , 1 0 - セコ - コレスタ - 5 , 7 , 2 3 , 2 4 a - テトラエン - 2 4 a - イン -
1 , 3 , 2 5 - トリオール、

の請求項 1 及び 5 記載の化合物。

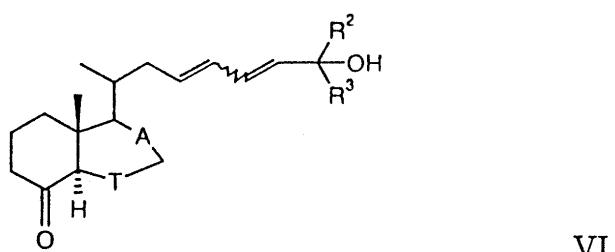
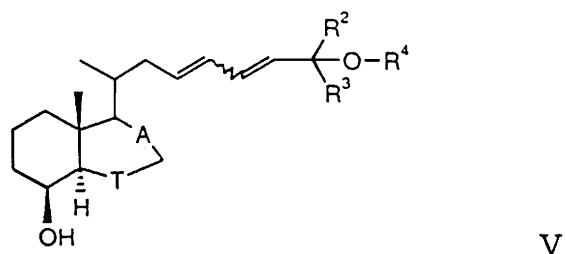
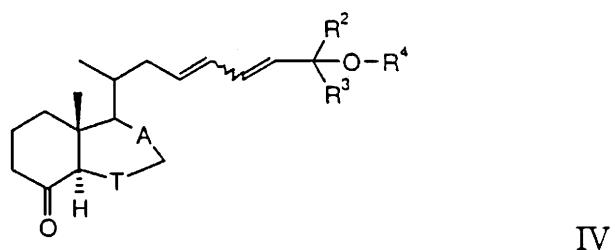
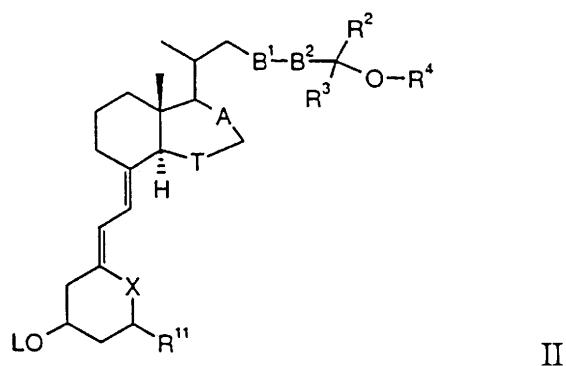
【請求項 7】 B^1 が、 - C H = C H - であり、 B^2 が、 - C C - であり、そして C
(R^2 , R^3) が、 C_{3-6} - シクロアルキルである、請求項 1 記載の化合物、特に、

(7 E , 2 3 E) - 及び (7 E , 2 3 Z) - (1 R , 3 R) - 2 5 - (1 - ヒドロキシ
- シクロペンチル) - 2 4 a , 2 4 b - ジホモ - 1 9 - ノル - 9 , 1 0 - セコ - コレスタ
- 5 , 7 , 2 3 - トリエン - 2 4 a - イン - 1 , 3 - ジオール、又は

(7 E , 2 3 E , 2 4 a E) - 及び (7 E , 2 3 Z , 2 4 a E) - (1 R , 3 R) - 2
5 - (1 - ヒドロキシ - シクロペンチル) - 2 4 a , 2 4 b - ジホモ - 1 9 - ノル - 9 ,
1 0 - セコ - コレスタ - 5 , 7 , 2 3 , 2 4 a - テトラエン - 2 4 a - イン - 1 , 3 - ジ
オール。

【請求項 8】 式II、IV、V 及びVI：

【化4】

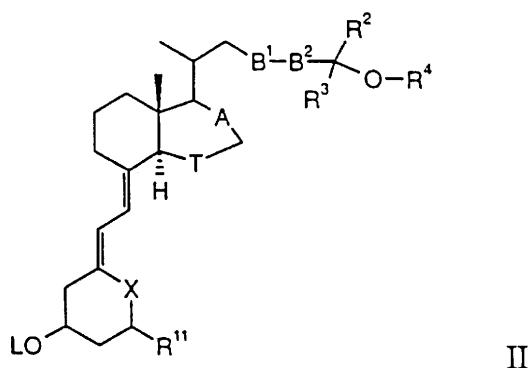


〔式中、R¹¹は、H、F又はOLであり、R⁴は、H又はLであり、L及びL'は、シリル保護基であり、そしてA、B¹、B²、T、R、R²及びR³は、請求項1と同義である〕で示される化合物。

【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】



[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用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。