

【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7月20日(2006.7.20)

【公表番号】特表2006-515859(P2006-515859A)

【公表日】平成18年6月8日(2006.6.8)

【年通号数】公開・登録公報2006-022

【出願番号】特願2004-566891(P2004-566891)

【国際特許分類】

C 0 7 J	63/00	(2006.01)
A 6 1 K	31/56	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
A 6 1 P	1/18	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	7/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/00	(2006.01)
A 6 1 P	15/00	(2006.01)
A 6 1 P	13/08	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	37/02	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)

【F I】

C 0 7 J	63/00	C S P
A 6 1 K	31/56	
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	1/18	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	7/00	
A 6 1 P	1/00	
A 6 1 P	19/00	
A 6 1 P	15/00	
A 6 1 P	13/08	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	29/00	1 0 1

A 6 1 P 19/02  
A 6 1 P 1/04  
A 6 1 P 37/02  
A 6 1 P 25/28  
A 6 1 P 25/16  
A 6 1 P 21/00  
A 6 1 P 43/00 1 1 1

## 【手続補正書】

【提出日】平成18年5月11日(2006.5.11)

## 【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

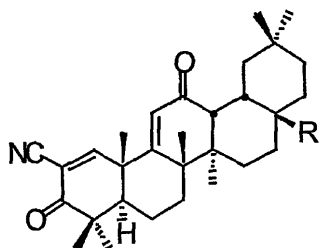
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式を有する物質の組成物：



(式中、Rは、置換または未置換のカルボニルイミダゾール、CN、CO-D-Glu(OAc)<sub>4</sub>、CONH<sub>2</sub>、CONHNH<sub>2</sub>、



【請求項2】

【請求項 3】

**【請求項 4】**

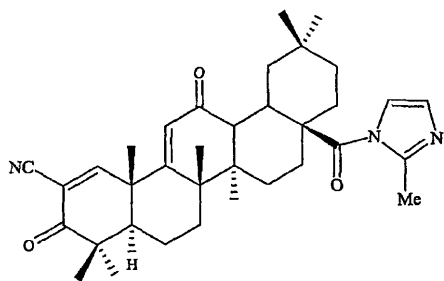
【請求項 5】

【請求項 6】

**【請求項 7】**

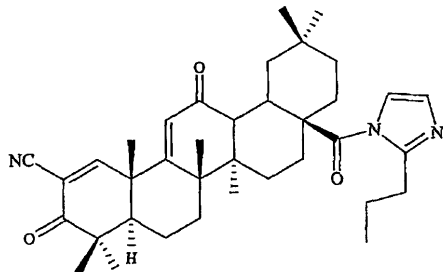
The chemical structure of compound 1 is a complex polycyclic molecule. It features a nitrile group (NC) and a ketone group (C=O) on the left side. The central part of the molecule consists of several fused rings, including a cyclohexene ring with a double bond. The right side of the molecule is a cyclohexane ring substituted with a 4-methyl-1H-imidazole-2-yl group. Stereochemistry is indicated with wedges and dashes at various positions.

下記式を有する、請求項1記載の組成物。



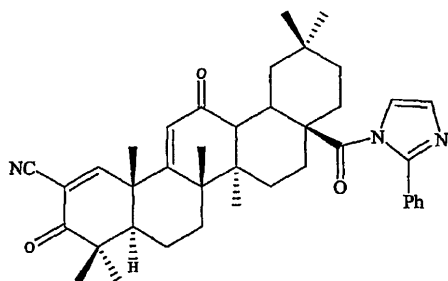
## 【請求項 9】

下記式を有する、請求項1記載の組成物。



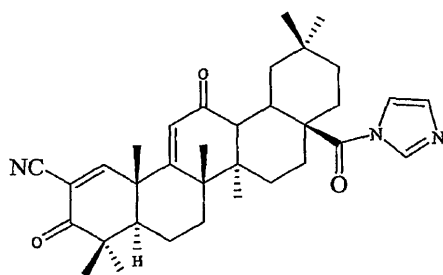
## 【請求項 10】

下記式を有する、請求項1記載の組成物。



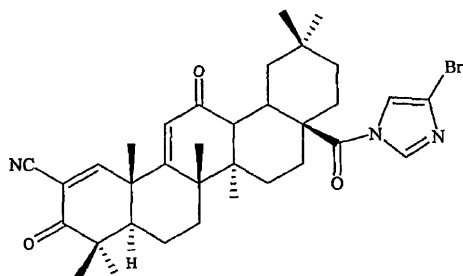
## 【請求項 11】

下記式を有する、請求項1記載の組成物。



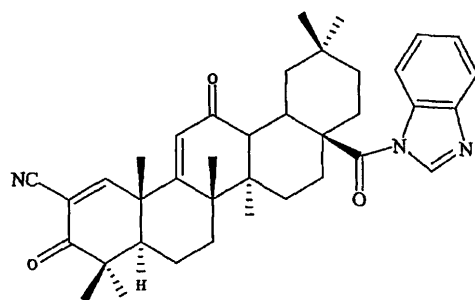
## 【請求項 12】

下記式を有する、請求項1記載の組成物。



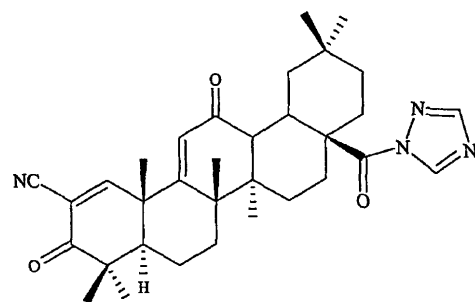
## 【請求項 13】

下記式を有する、請求項1記載の組成物。



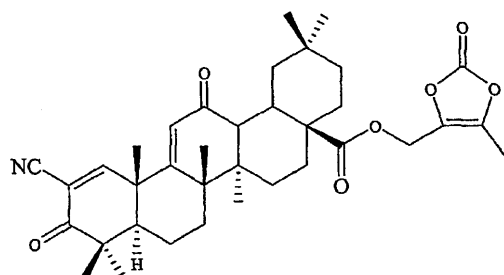
## 【請求項 14】

下記式を有する、請求項1記載の組成物。



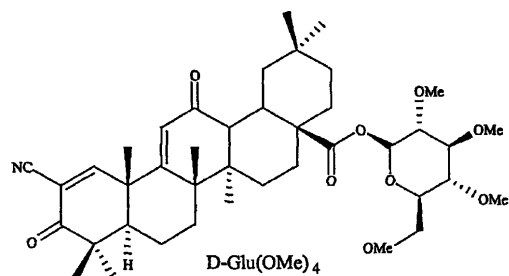
## 【請求項 15】

下記式を有する、請求項1記載の組成物。



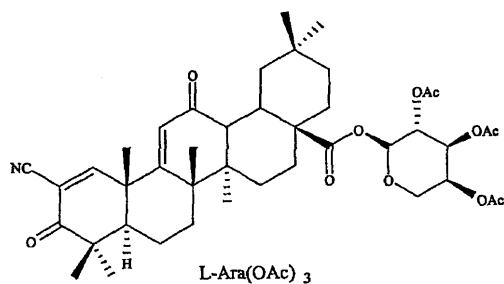
## 【請求項 16】

下記式を有する、請求項1記載の組成物。



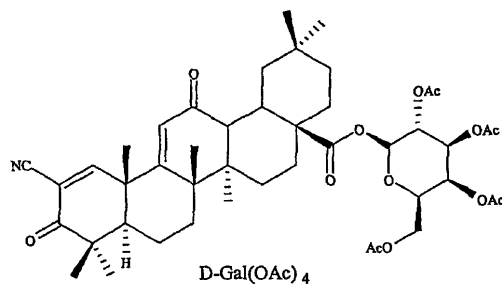
## 【請求項 17】

下記式を有する、請求項1記載の組成物。



## 【請求項 18】

下記式を有する、請求項1記載の組成物。



## 【請求項 19】

マクロファージまたはRAW細胞におけるIFN- $\gamma$ により誘導されるNO生成の阻害に有効なトリテルペノイド誘導体であって、組成物がIC<sub>50</sub>値0.00006nM～0.43nMを有する、トリテルペノイド誘導体。

## 【請求項 20】

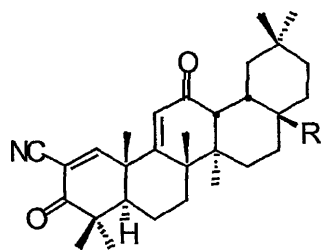
IC<sub>50</sub>値0.0001nM～0.044nMを有する、請求項19記載の組成物。

## 【請求項 21】

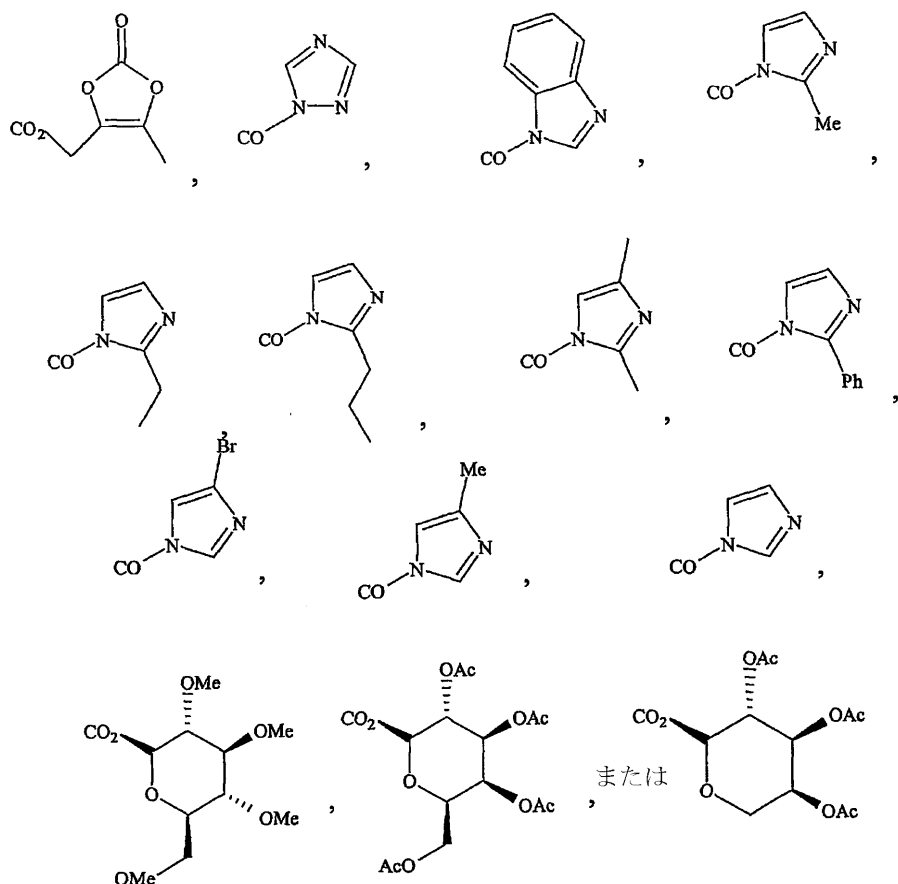
化合物が水溶性である、請求項19記載の組成物。

## 【請求項 22】

対象における障害を予防または治療する方法であって、下記式を有する組成物の薬学的有効量を対象へ投与する工程を含む、方法：



(式中、Rは、置換または未置換のカルボニルイミダゾール、CN、CO-D-Glu(OAc)<sub>4</sub>、CONH<sub>2</sub>、CONHNH<sub>2</sub>、



である)。

【請求項 23】

患者が癌を有する、請求項22記載の方法。

【請求項 24】

癌が、脳、肺、肝臓、脾臓、腎臓、リンパ節、小腸、膵臓、血液細胞、骨、結腸、胃、パン様体、子宮内膜、前立腺、精巣、卵巣、中枢神経系、皮膚、頭部および頸部、食道、または骨髄の癌である、請求項23記載の方法。

【請求項 25】

癌が、上皮癌である、請求項23記載の方法。

【請求項 26】

癌が、肺、結腸、乳房、または前立腺の癌である、請求項23記載の方法。

【請求項 27】

癌が、結腸癌である、請求項26記載の方法。

【請求項 28】

患者が、癌の発症について高いリスクを有するとして同定されている、請求項22記載の方法。

【請求項 29】

患者が、炎症疾患を有する、請求項22記載の方法。

【請求項 30】

炎症疾患が、リウマチ様関節炎または炎症性腸疾患である、請求項29記載の方法。

【請求項 31】

炎症性腸疾患が、クローン病および潰瘍性大腸炎からなる群より選択される、請求項30記載の方法。

【請求項 32】

患者が、神経変性疾患を有する、請求項22記載の方法。

【請求項 33】

神経変性疾患が、アルツハイマー病、パーキンソン病、多発性硬化症、または筋萎縮性側索硬化症である、請求項32記載の方法。

【請求項34】

患者が、一酸化窒素またはプロスタグランジンの過剰生成に関連した病理発生を有する、請求項22記載の方法。

【請求項35】

化合物が、水溶液と共に投与される、請求項22記載の方法。

【請求項36】

薬学的有効量が、0.1～1000mg/kgである、請求項22記載の方法。

【請求項37】

追加の治療的物質が、対象へ投与される、請求項22記載の方法。

【請求項38】

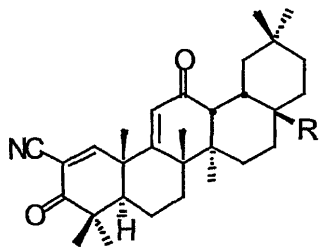
対象が、哺乳類である、請求項22記載の方法。

【請求項39】

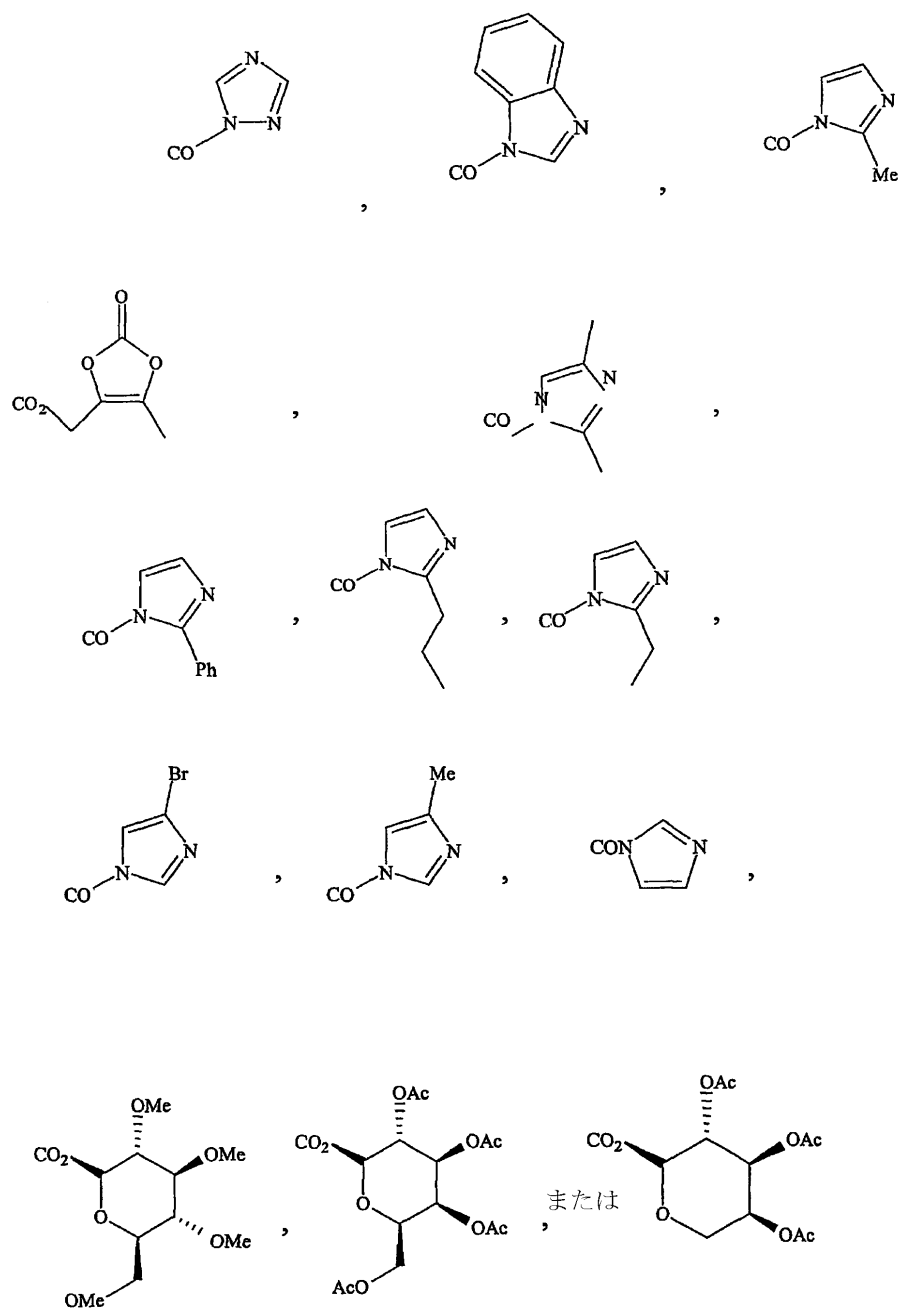
対象が、ヒトである、請求項38記載の方法。

【請求項40】

対象における過剰な一酸化窒素またはプロスタグランジンの生成を調節する方法であって、該対象へ、下記式を有する組成物の薬学的有効量を投与する工程を含む、方法：



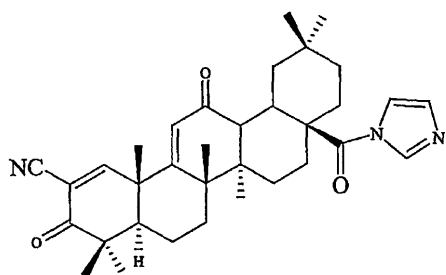
(式中、Rは、置換または未置換のカルボニルイミダゾール、CN、CO-D-Glu(OAc)<sub>4</sub>、CONH<sub>2</sub>、CONHNH<sub>2</sub>、



である)。

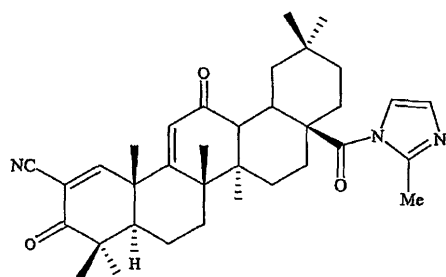
【請求項 4 1】

下記式を有する、請求項40記載の方法。



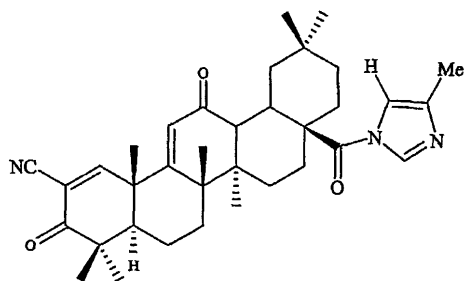
【請求項 4 2】

下記式を有する、請求項40記載の方法。



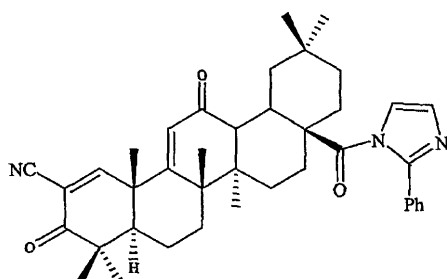
## 【請求項 4 3】

下記式を有する、請求項40記載の方法。



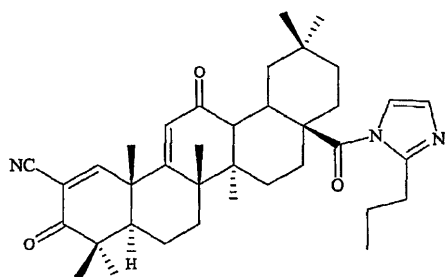
## 【請求項 4 4】

下記式を有する、請求項40記載の方法。



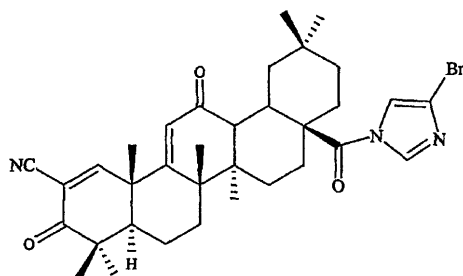
## 【請求項 4 5】

下記式を有する、請求項40記載の方法。



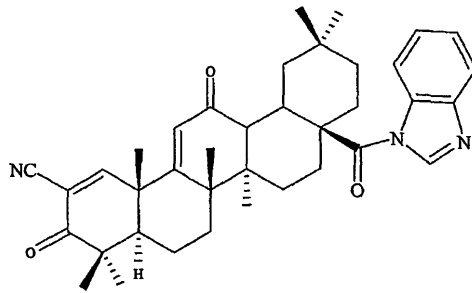
## 【請求項 4 6】

下記式を有する、請求項40記載の方法。



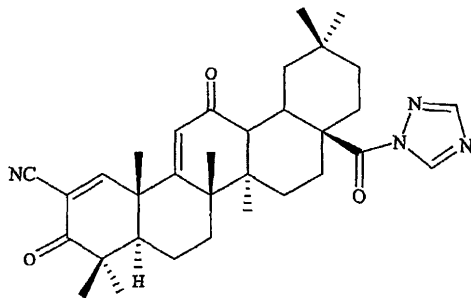
## 【請求項 47】

下記式を有する、請求項40記載の方法。



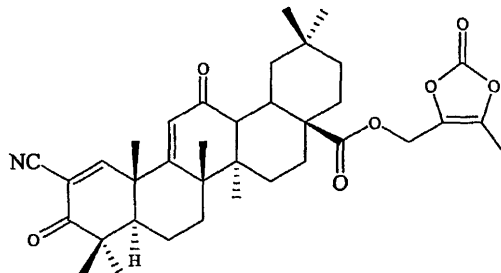
## 【請求項 48】

下記式を有する、請求項40記載の方法。



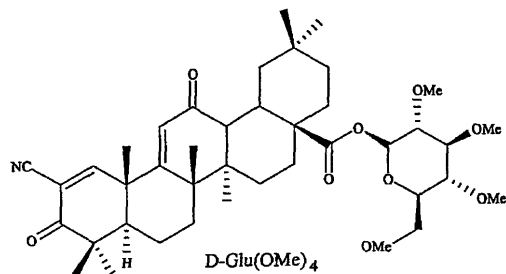
## 【請求項 49】

下記式を有する、請求項40記載の方法。



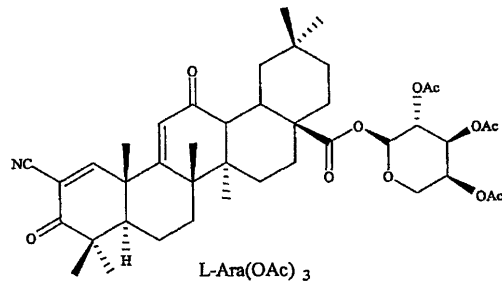
## 【請求項 50】

下記式を有する、請求項40記載の方法。



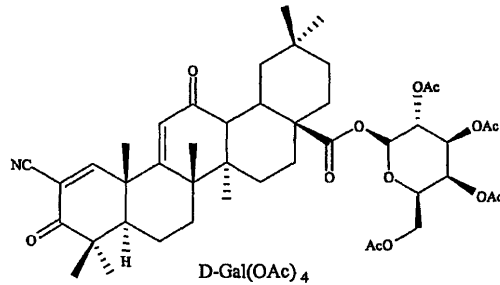
## 【請求項 51】

下記式を有する、請求項40記載の方法。



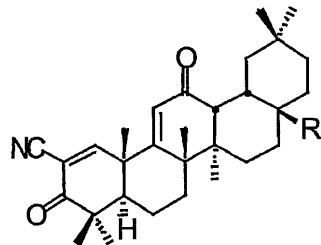
## 【請求項 5 2】

下記式を有する、請求項40記載の方法。



## 【請求項 5 3】

iNOSまたはCOX-2遺伝子の転写または翻訳を調節する方法であって、下記式を有する組成物の薬学的有効量を対象へ投与する工程を含む、方法：

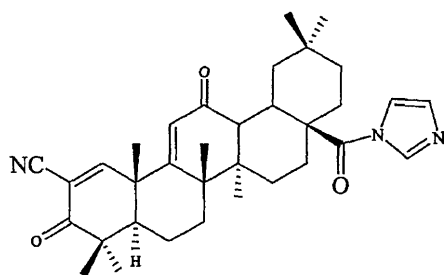


(式中、Rは、置換または未置換のカルボニルイミダゾール、CN、CO-D-Glu(OAc)<sub>4</sub>、CONH<sub>2</sub>、CONHNH<sub>2</sub>、



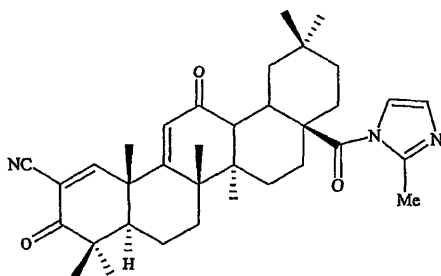
【請求項 5 4】

下記式を有する、請求項53記載の方法。



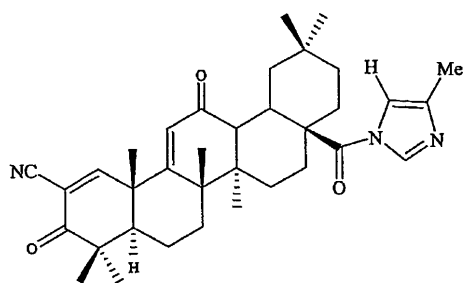
【請求項 5 5】

下記式を有する、請求項53記載の方法。



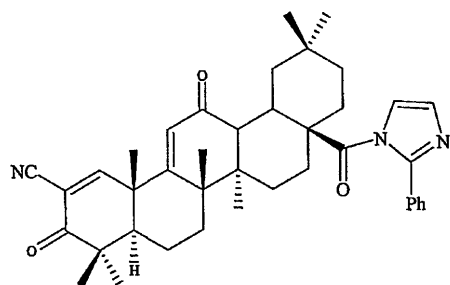
【請求項 56】

下記式を有する、請求項53記載の方法。



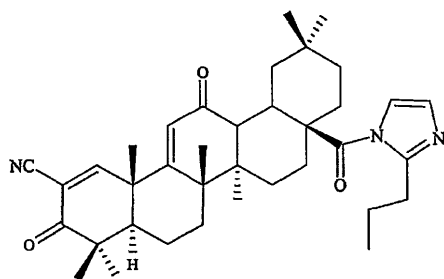
## 【請求項 57】

下記式を有する、請求項53記載の方法。



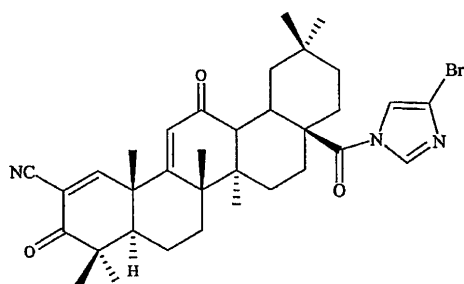
## 【請求項 58】

下記式を有する、請求項53記載の方法。



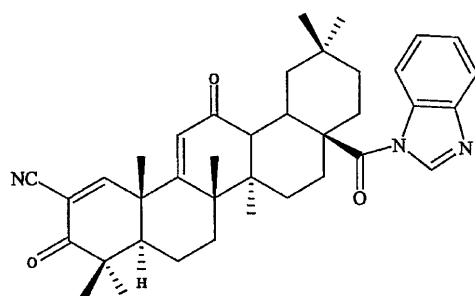
## 【請求項 59】

下記式を有する、請求項53記載の方法。



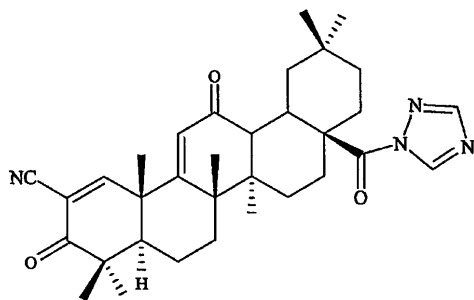
## 【請求項 60】

下記式を有する、請求項53記載の方法。



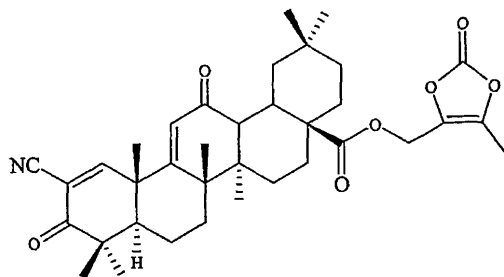
## 【請求項 6 1】

下記式を有する、請求項53記載の方法。



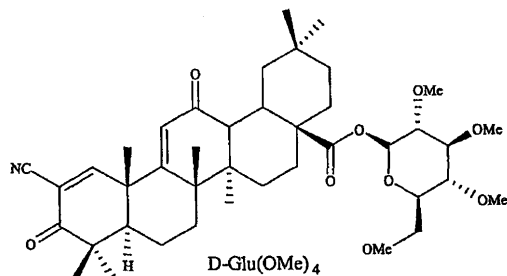
## 【請求項 6 2】

下記式を有する、請求項53記載の方法。



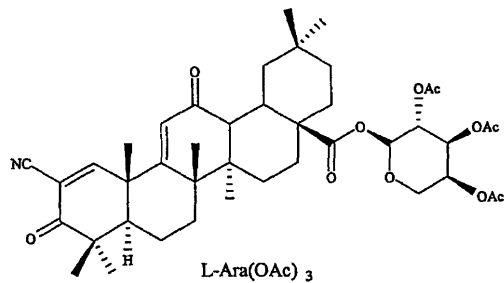
## 【請求項 6 3】

下記式を有する、請求項53記載の方法。



## 【請求項 6 4】

下記式を有する、請求項53記載の方法。



## 【請求項 6 5】

下記式を有する、請求項53記載の方法。

