

【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19年3月15日(2007.3.15)

【公表番号】特表2006-517217(P2006-517217A)

【公表日】平成18年7月20日(2006.7.20)

【年通号数】公開・登録公報2006-028

【出願番号】特願2006-501782(P2006-501782)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/573 (2006.01)

A 6 1 K 31/439 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/407 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

C 0 7 J 7/00 (2006.01)

C 0 7 D 498/18 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/573

A 6 1 K 31/439

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 1/04

A 6 1 K 31/407

A 6 1 K 37/02

C 0 7 J 7/00

C 0 7 D 498/18

【手続補正書】

【提出日】平成19年1月23日(2007.1.23)

【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

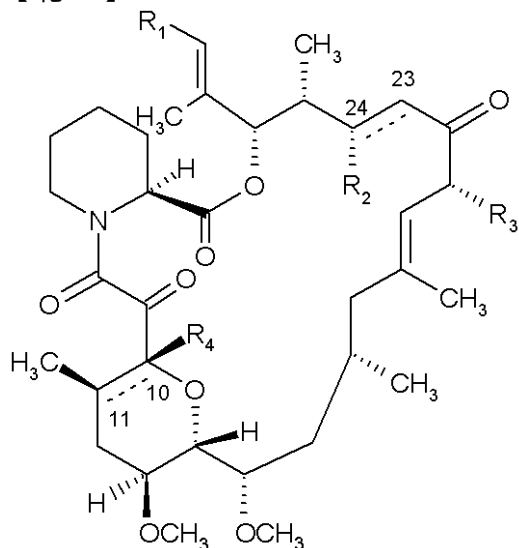
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

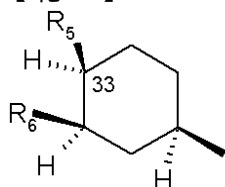
コルチコイドおよび式

【化 1】



[式中、
R₁ は式

【化 2】



(a)

[式中、

R₅ はクロロ、プロモ、ヨードまたはアジドであり、

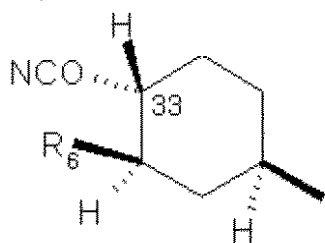
R₆ はヒドロキシまたはメトキシである] の基 (a) であり、そして

R₄ はヒドロキシであり、その場合 10、11 位に単結合が存在するか；または存在せず、その場合 10、11 位に二重結合が存在する か

または

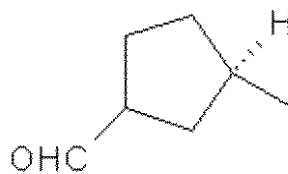
R₁ は式

【化 3】



(b)

および



(c)

[式中

R₆ は上記定義の通りである] の基 (b) または基 (c) であり、そして

R₄ はヒドロキシであり、その場合 10、11 位に単結合が存在し、

R₂ はオキシであり、その場合 23、24 位に単結合が存在するか；ヒドロキシであり、その場合 23、24 位に単結合または二重結合が存在するか；または存在せず、その場合 23、24 位に二重結合が存在し；

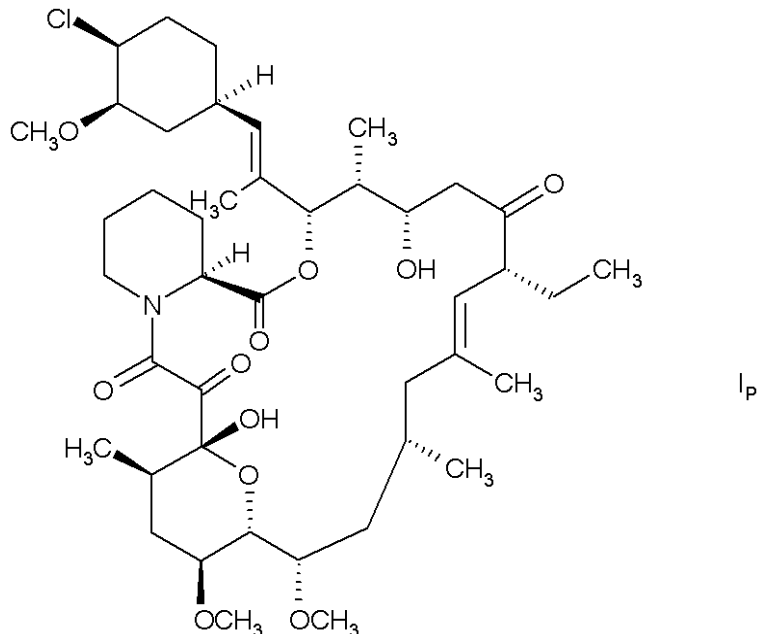
R₃ はメチル、エチル、プロピルまたはアリルである]

の化合物の組合せ剤の、コルチコイド耐性疾患および / またはカルシニューリン阻害剤耐性疾患の処置用医薬の製造のための使用。

【請求項 2】

式 I の化合物が式

【化 4】



の化合物である、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 3】

コルチコイドがヒドロコルチゾン、ベタメタゾンおよびデキサメタゾンからなる群から選択される、請求項 1 または 2 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 4】

T 細胞が疾患の病態生理に含まれる、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 5】

該疾患がアトピー性皮膚炎、乾癬、乾癬性関節炎、リウマチ性関節炎、喘息、潰瘍性大腸炎およびクローン病からなる群から選択される、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の使用。

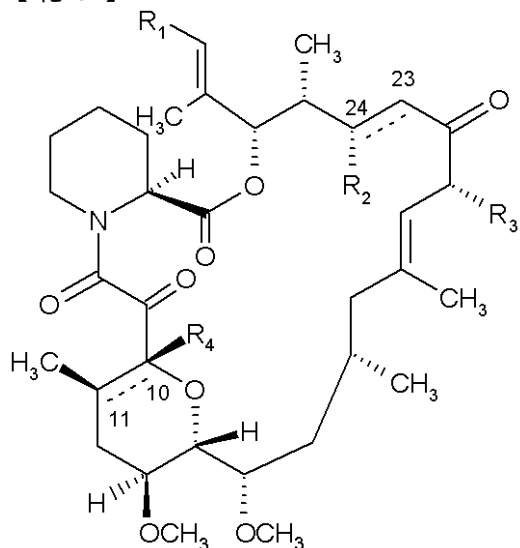
【請求項 6】

T 細胞が疾患の病態生理に含まれるが、ただし T 細胞が病態生理に含まれる巣状分節状系球体硬化症は除く、コルチコイド耐性疾患および / またはカルシニューリン阻害剤耐性疾患の処置用医薬の製造のためのコルチコイドおよびカルシニューリン阻害剤の組合せ剤の使用。

【請求項 7】

カルシニューリン阻害剤が式

【化5】

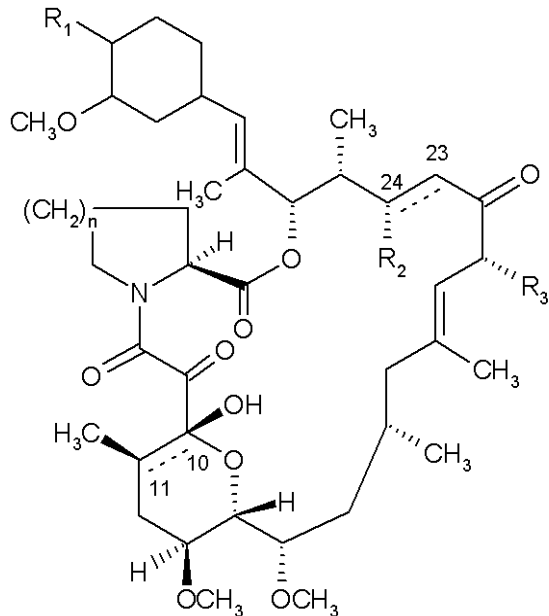


[式中、置換基は請求項 1 に定義の通りである]
 の化合物である、請求項 6 に記載の使用。

【請求項 8】

カルシニューリン阻害剤が式

【化6】

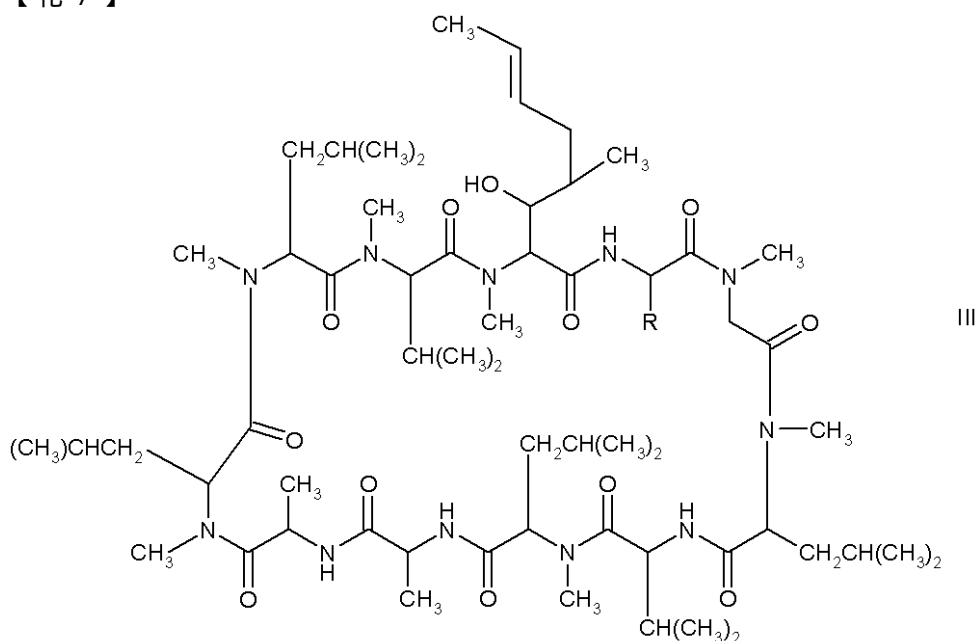


[式中、
 R_1 はヒドロキシまたは保護されたヒドロキシであり、
 R_2 は水素、ヒドロキシルまたは保護されたヒドロキシルであり、
 R_3 はメチル、エチル、プロピルまたはアリルであり、
 n は 1 または 2 の整数であり、そして
 線および点線の記号は単結合である]
 の化合物である、請求項 6 に記載の使用。

【請求項 9】

カルシニューリン阻害剤が式

【化 7】



[式中、R はメチル、エチル、プロピル、イソプロピルまたは $-CH(OH)CH_3$ である]

の化合物である、請求項 6 に記載の使用。

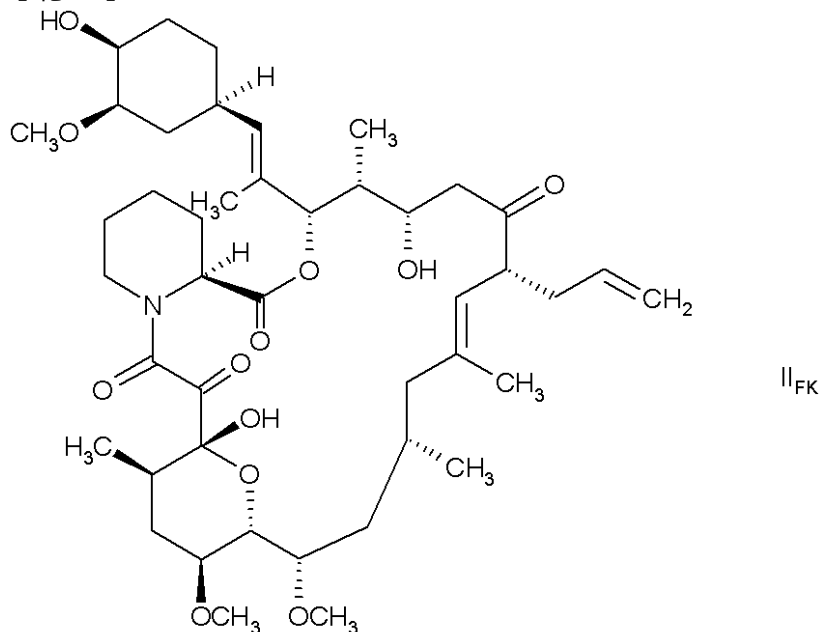
【請求項 10】

カルシニューリン阻害剤が請求項 2 に記載の式 I_p の化合物である、請求項 6 または 7 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 11】

カルシニューリン阻害剤が式

【化 8】



の化合物である、請求項 6 または 8 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 12】

カルシニューリン阻害剤が式 III の化合物 (R がエチル) である、請求項 6 または 9 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 13】

コルチコイドがヒドロコルチゾン、ベタメタゾンおよびデキサメタゾンからなる群から

選択される、請求項 6 ~ 12 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 14】

カルシニューリン阻害剤、コルチコイド、またはその両方が塩形である、請求項 6 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の使用。

【請求項 15】

式 I_p の化合物およびヒドロコルチゾンの組合せ、その上薬学的に許容される賦形剤を含んでなる医薬組成物。

【請求項 16】

式 I_p の化合物およびベタメタゾンの組合せ、その上薬学的に許容される賦形剤を含んでなる医薬組成物。

【請求項 17】

式 I_p の化合物およびデキサメタゾンの組合せ、その上薬学的に許容される賦形剤を含んでなる医薬組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0003

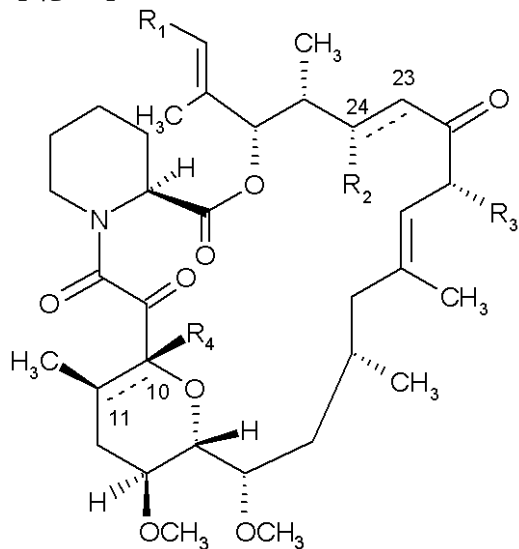
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0003】

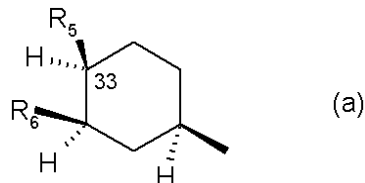
ある態様において、本発明はコルチコイドおよび式

【化 1】



【式中、
R₁ は式

【化 2】



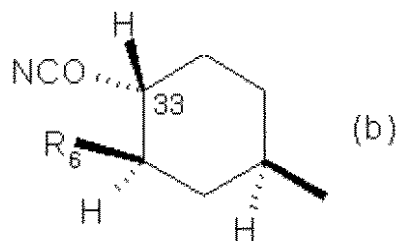
【式中、

R₅ はクロロ、プロモ、ヨードまたはアジドであり、

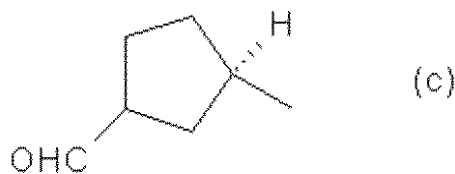
R₆ はヒドロキシまたはメトキシである] の基 (a) であり、そして

R₄ はヒドロキシであり、その場合 10、11 位に単結合が存在するか；または存在せず、その場合 10、11 位に二重結合が存在するか

または
 R_1 は式
 【化3】



および



[式中

R_6 は上記定義の通りである] の基 (b) または基 (c) であり、そして

R_4 はヒドロキシであり、その場合 10、11 位に単結合が存在し、

R_2 はオキソであり、その場合 23、24 位に単結合が存在するか；ヒドロキシであり、その場合 23、24 位に単結合または二重結合が存在するか；または存在せず、その場合 23、24 位に二重結合が存在し；

R_3 はメチル、エチル、プロピルまたはアリルである]

の化合物の組合せ剤の、コルチコイド耐性疾患および / またはカルシニューリン阻害剤耐性疾患の処置用、例えば式 I の化合物単独でまたはコルチコイド単独で効果がないかまたは不十分な疾患の処置用医薬の製造のための使用を提供する。

【手続補正3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0007

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0007】

本発明の組合せ剤において、コルチコイドは薬学的に活性なコルチコイドおよびその誘導体を含み、例えば薬学的な活性を示すグルココルチコイド（すなわちグルココルチコイド様活性を有する）のようなコルチコステロイド、並びにグルココルチコイドレセプターの非ステロイド性リガンドを含み、

例えば遊離形の、および

- 例えばナトリウム塩のような例えば塩形のモノおよびジエステルを、例えば含むエステル形の、

- アセトニドのようなアセタール形およびケタール形の、

例えば適用可能なときには塩形および溶媒和物形の、コルチコイドを含む。