

【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 7 月 26 日 (2007.7.26)

【公表番号】特表 2006-526025 (P2006-526025A)

【公表日】平成 18 年 11 月 16 日 (2006.11.16)

【年通号数】公開・登録公報 2006-045

【出願番号】特願 2006-514998 (P2006-514998)

【国際特許分類】

C 07 J	1/00	(2006.01)
C 07 J	13/00	(2006.01)
C 07 J	3/00	(2006.01)
A 61 P	9/00	(2006.01)
A 61 P	27/02	(2006.01)
A 61 P	37/06	(2006.01)
A 61 P	27/06	(2006.01)
A 61 P	37/08	(2006.01)
A 61 P	31/00	(2006.01)
A 61 P	29/00	(2006.01)
A 61 P	19/02	(2006.01)
A 61 P	1/04	(2006.01)
A 61 P	37/02	(2006.01)
A 61 P	17/00	(2006.01)
A 61 P	31/18	(2006.01)
A 61 P	31/04	(2006.01)
A 61 P	31/10	(2006.01)
A 61 P	31/22	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)
A 61 P	21/00	(2006.01)
A 61 P	25/00	(2006.01)
A 61 P	15/00	(2006.01)
A 61 P	13/08	(2006.01)
A 61 P	13/12	(2006.01)
A 61 P	1/00	(2006.01)
A 61 P	1/16	(2006.01)
A 61 P	11/00	(2006.01)
A 61 P	13/02	(2006.01)
A 61 P	9/10	(2006.01)
A 61 P	7/06	(2006.01)
A 61 P	35/02	(2006.01)
A 61 P	7/02	(2006.01)
A 61 P	17/06	(2006.01)
A 61 K	31/565	(2006.01)
A 61 K	31/567	(2006.01)
A 61 K	31/566	(2006.01)

【 F I 】

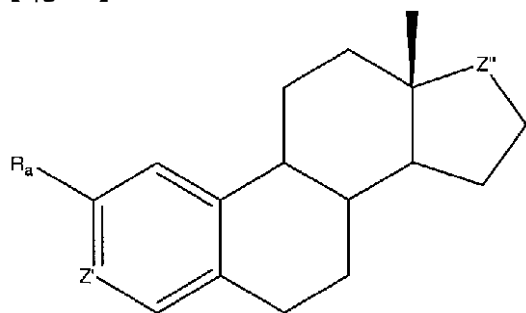
C 07 J	1/00	C S P
C 07 J	13/00	
C 07 J	3/00	
A 61 P	9/00	

A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	27/06	
A 6 1 P	37/08	
A 6 1 P	31/00	
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	17/00	
A 6 1 P	31/18	
A 6 1 P	31/04	
A 6 1 P	31/10	
A 6 1 P	31/22	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	15/00	
A 6 1 P	13/08	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	1/00	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	13/02	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	7/06	
A 6 1 P	35/02	
A 6 1 P	7/02	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 K	31/565	
A 6 1 K	31/567	
A 6 1 K	31/566	

【手続補正書】**【提出日】**平成19年5月28日(2007.5.28)**【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】**

下記的一般式

【化 1】



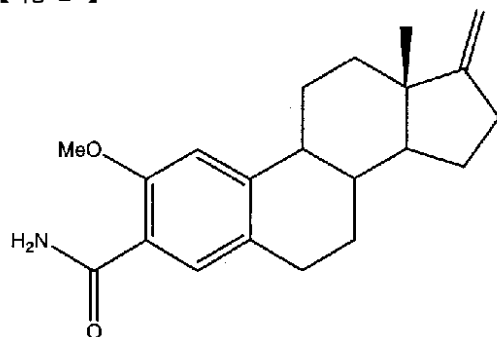
式中、 R_a は、 $-\text{OCH}_3$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$ または $-\text{CCCH}_3$ から選択され、 Z' は、 $>\text{C}-\text{F}$ 、 $>\text{C}-\text{NH}_2$ 、 $>\text{CCONH}_2$ 、 $>\text{C}-\text{NHCOH}$ 、 $>\text{C}-\text{OSO}_2\text{NH}_2$ または $>\text{C}-\text{CHCH}_2$ から選択され、 Z'' は、 $>\text{C}(\text{H}_2)$ 、 $>\text{C}(\text{H})-\text{CH}_3$ 、 $>\text{C}=\text{CH}_2$ 、 $>\text{C}=\text{CHCH}_3$ または $>\text{C}=\text{O}$ から選択されるが、但し、 Z' が $>\text{C}-\text{OSO}_2\text{NH}_2$ であり、かつ Z'' が $>\text{C}(\text{H}_2)$ または $>\text{C}=\text{O}$ である場合、 R_a は、 $-\text{OCH}_3$ でも $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$ でもなく、 Z' が $>\text{C}-\text{NH}_2$ である場合、 Z'' は $>\text{C}=\text{O}$ ではない

で表される化合物。

【請求項 2】

前記化合物が

【化 2】

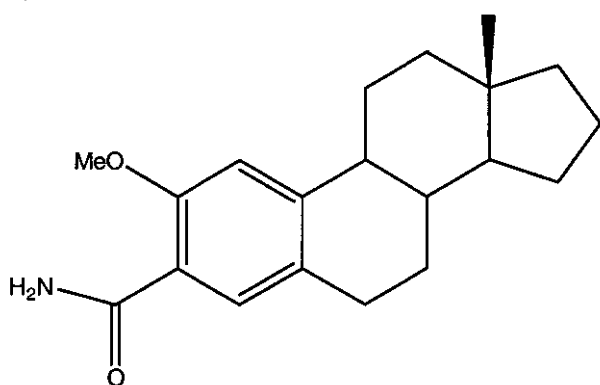


である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

前記化合物が

【化 3】

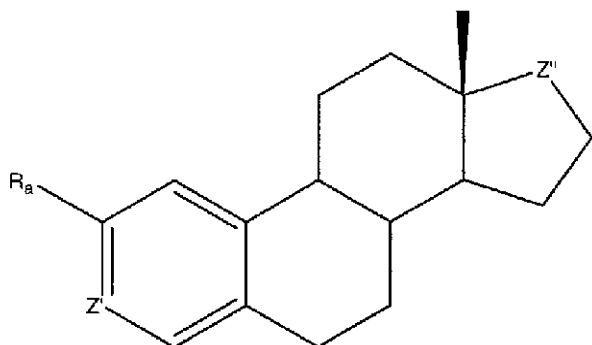


である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

下記の化学式

【化 4】



式中、 R_a は、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ または $-CCCH_3$ から選択され、 Z' は、 $>C-F$ 、 $>C-NH_2$ 、 $>CCONH_2$ 、 $>C-NHCOH$ 、 $>C-OSO_2NH_2$ または $>C-CHCH_2$ から選択され、 Z'' は、 $>C(H_2)$ 、 $>C(H)-CH_3$ 、 $>C=CH_2$ 、 $>C=CHCH_3$ または $>C=O$ から選択されるが、但し、 Z' が $>C-OSO_2NH_2$ であり、かつ Z'' が $>C(H_2)$ または $>C=O$ である場合、 R_a は、 $-OCH_3$ でも $-OCH_2CH_3$ でもなく、 Z' が $>C-NH_2$ である場合、 Z'' は $>C=O$ ではない

で表される化合物を含む、ヒトまたは動物において血管新生を阻害するための医薬品。

【請求項 5】

前記化合物は、1日の単位量、1日の単位量未満の量、又はそれを適当に分割した任意の量で投与されることを特徴とする、請求項 4 に記載の医薬品

【請求項 6】

前記化合物は、およそ $0.1 \sim$ およそ 300 mg/kg/day の量で投与される、請求項 4 又は 5 に記載の医薬品。

【請求項 7】

前記化合物は、およそ $0.5 \sim$ およそ 50 mg/kg/day の量で投与される、請求項 4 から 6 のいずれか一項に記載の医薬品。

【請求項 8】

前記化合物は、およそ $1 \sim$ およそ 10 mg/kg/day の量で投与される、請求項 4 から 7 のいずれか一項に記載の医薬品。

【請求項 9】

前記化合物は、経口、非経口、経皮、局所、静脈内、皮下、筋内、皮内、点眼、硬膜外、気管内、舌下、口腔、直腸、腔内、経鼻または吸入投与されることを特徴とする、請求項 4 から 8 のいずれか一項に記載の医薬品。

【請求項 10】

前記化合物は、酸化防止剤、緩衝剤、静菌薬、液体キャリア、溶質、懸濁剤、増粘剤、着色料、ゼラチン、グリセリン、結合剤、潤滑剤、不活性希釈剤、防腐剤、界面活性剤、分散剤、生分解性ポリマー又はそれらの任意の組合せから選択される添加剤を含む組成物として投与される、請求項 4 から 9 のいずれか一項に記載の医薬品。

【請求項 11】

前記化合物は、錠剤、カプセル、トローチ剤、カシェ剤、溶液、懸濁液、エマルジョン、粉末、エアロゾル、坐剤、スプレー、芳香錠、軟膏、クリーム、ペースト、発泡体、ジェル、タンポン、 pessary、顆粒、ボラス、うがい薬または経皮パッチの形態で投与される、請求項 4 から 10 のいずれか一項に記載の医薬品。

【請求項 12】

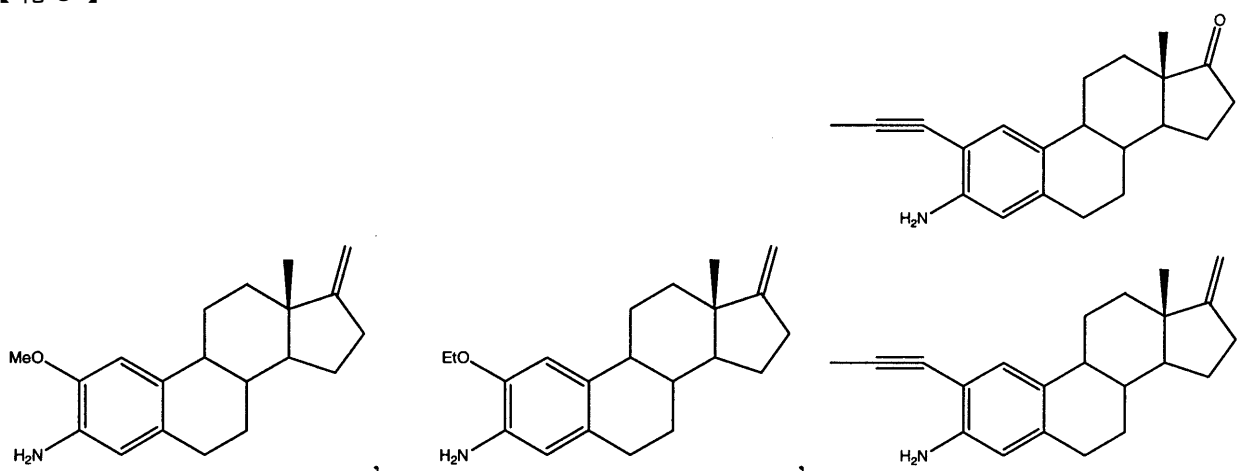
前記血管新生は、糖尿病性網膜症、未熟児網膜症、角膜移植片拒絶、血管新生緑内障、水晶体後線維増殖症、流行性角結膜炎、ビタミン A 欠乏症、コンタクトレンズの過剰装着、アトピー性角膜炎、上輪部角膜炎、翼状片乾性角膜炎、シェーグレン症候群、酒さ性挫瘡、フリクテン症、梅毒、ミコバクテリア感染、脂質変性、化学的熱傷、細菌性潰瘍、真

菌性潰瘍、単純ヘルペス感染、帯状ヘルペス感染、原生動物感染、カポジ肉腫、モーレン潰瘍、テリエン周辺角膜変性、辺縁潰瘍性角膜炎、外傷、関節炎、慢性関節リウマチ、多発性動脈炎、全身性狼瘡、ヴェーゲナー肉芽腫症、強膜炎、スティーヴンス - ジョンソン疾患、放射状角膜切開、黄斑変性、鎌状赤血球貧血、サルコイド、弾性線維性仮性黄色腫、パジェット病、静脈閉塞症、動脈閉塞症、頸動脈閉塞性疾患、慢性ブドウ膜炎、慢性硝子体炎、ライム病、イールズ病、ベーチェット病、近視、視窩、シュタルガルト病、扁平部炎、慢性網膜剥離、過粘稠度症候群、トキシプラズマ症、レーザー照射後の合併症、線維性血管組織または線維組織の異常増殖、血管腫、オースラー - ウェーバー - ランデュ病、固形腫瘍、血液性の腫瘍、後天性免疫不全症候群、眼の血管新生疾患、加齢性黄斑変性、変形性関節症、慢性炎症により引き起こされる疾患、クローン病、潰瘍性大腸炎、横紋筋肉腫、網膜芽細胞腫、ユーイング肉腫、神経芽細胞腫、骨肉腫、白血病、乾癬、アテローム性動脈硬化症、類天疱瘡、網膜炎を引き起こす感染、脈絡膜炎を引き起こす感染、推定眼ヒストプラズマ症、ベスト病、増殖性硝子体網膜症、バルトネラ症、聴神経腫、神経線維腫、トラコーマ、又は化膿性肉芽腫に関連する、請求項 4 から 11 のいずれか一項に記載の医薬品。

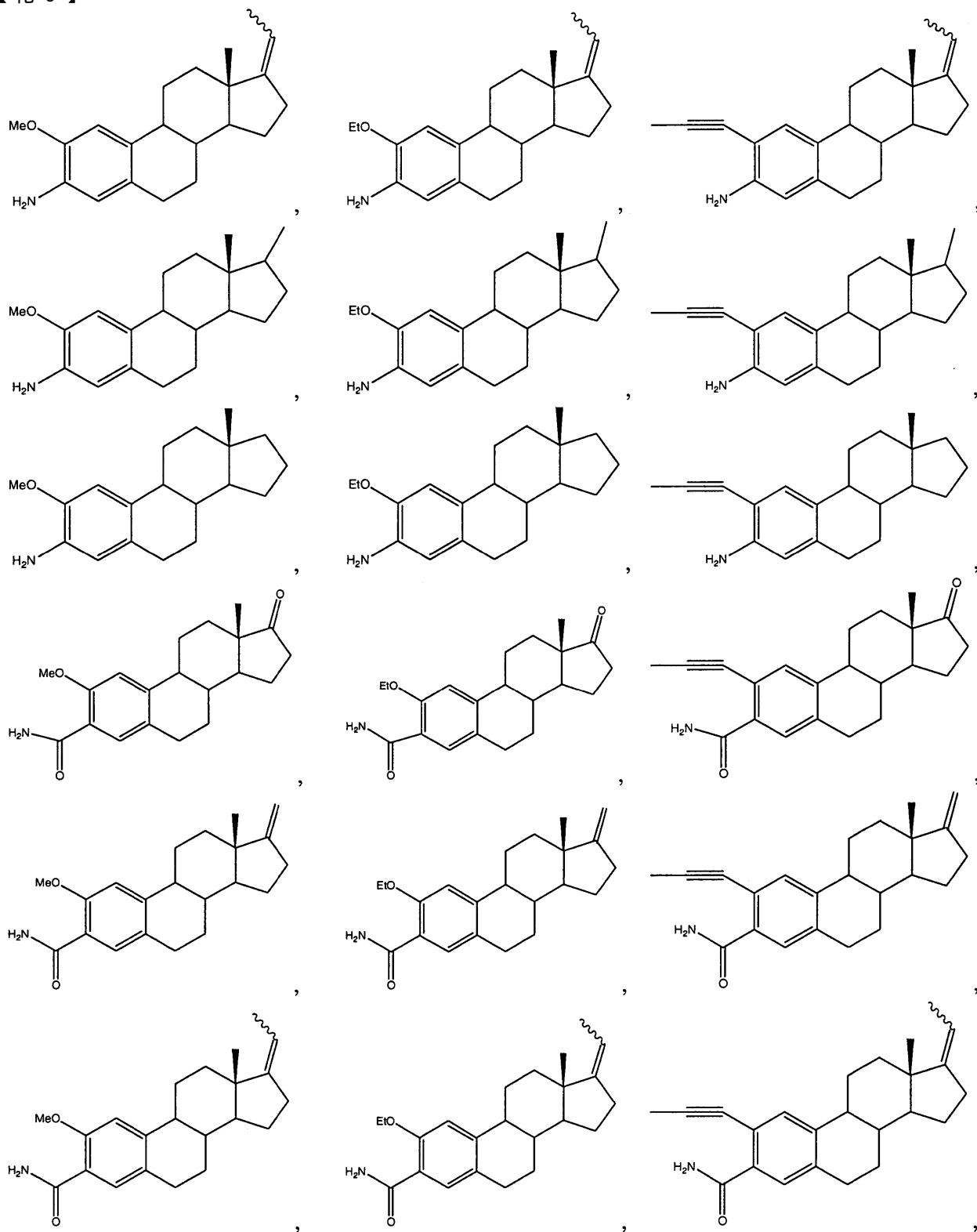
【請求項 13】

下記の化学式

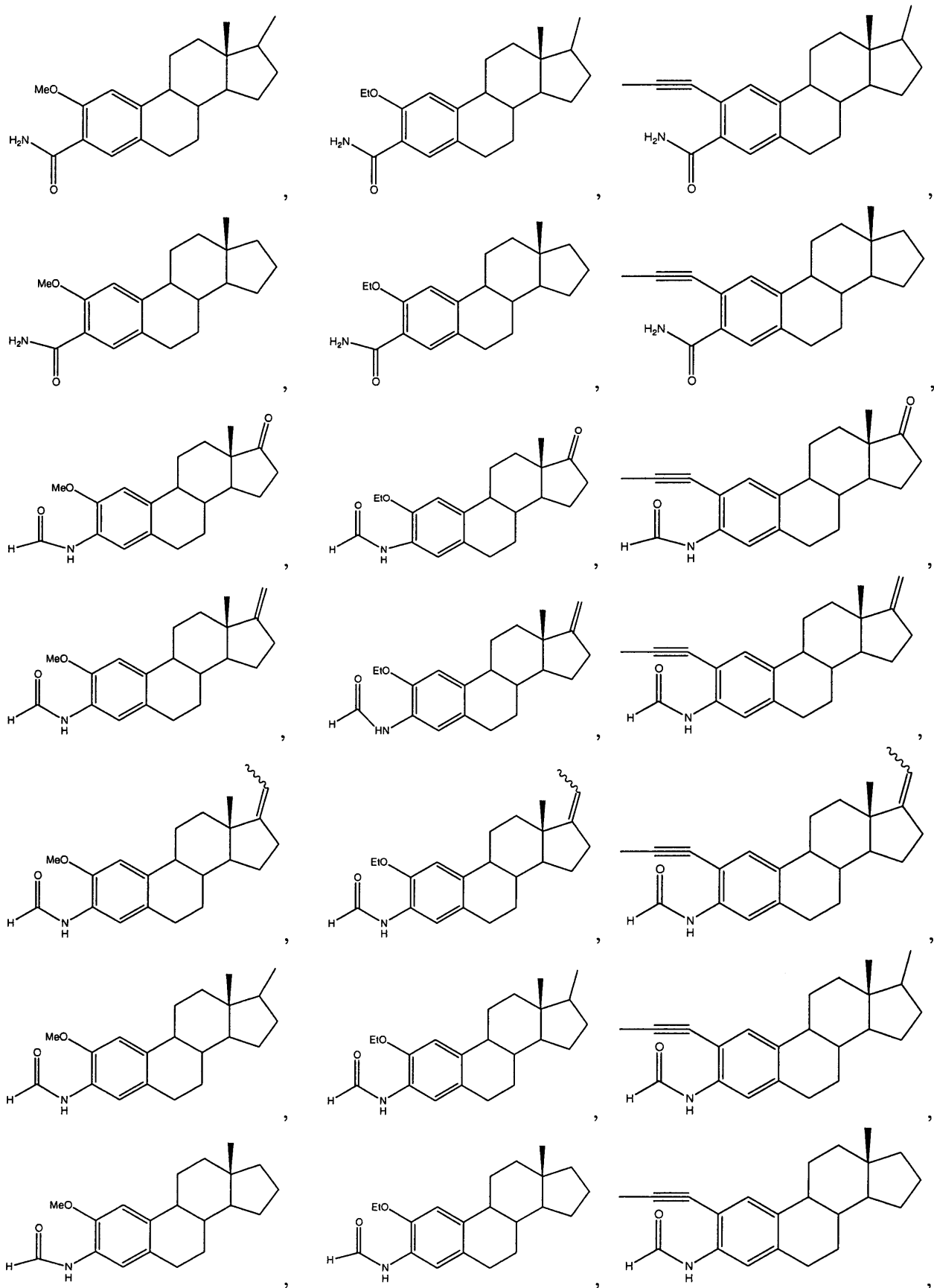
【化 5】



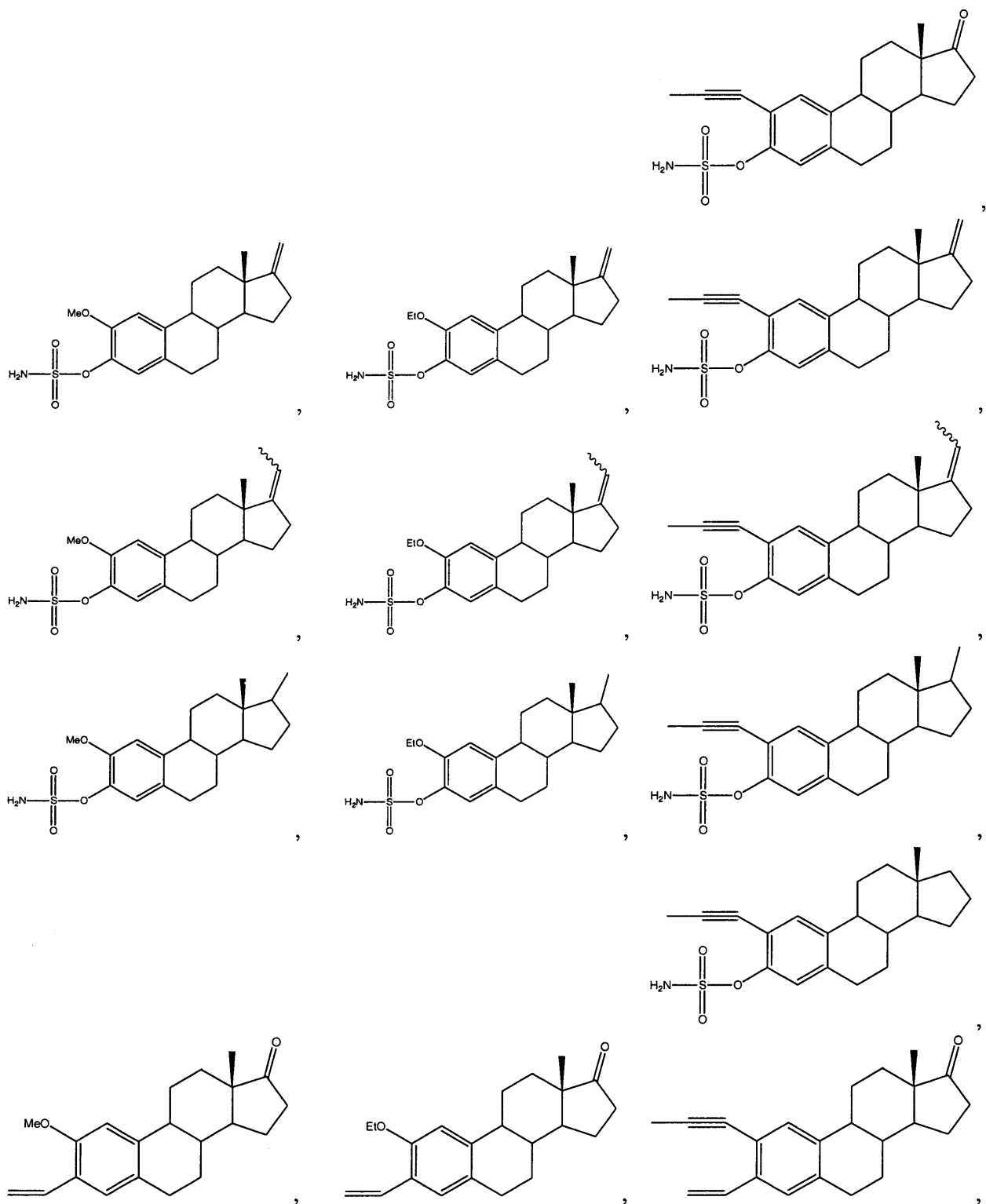
【化 6】



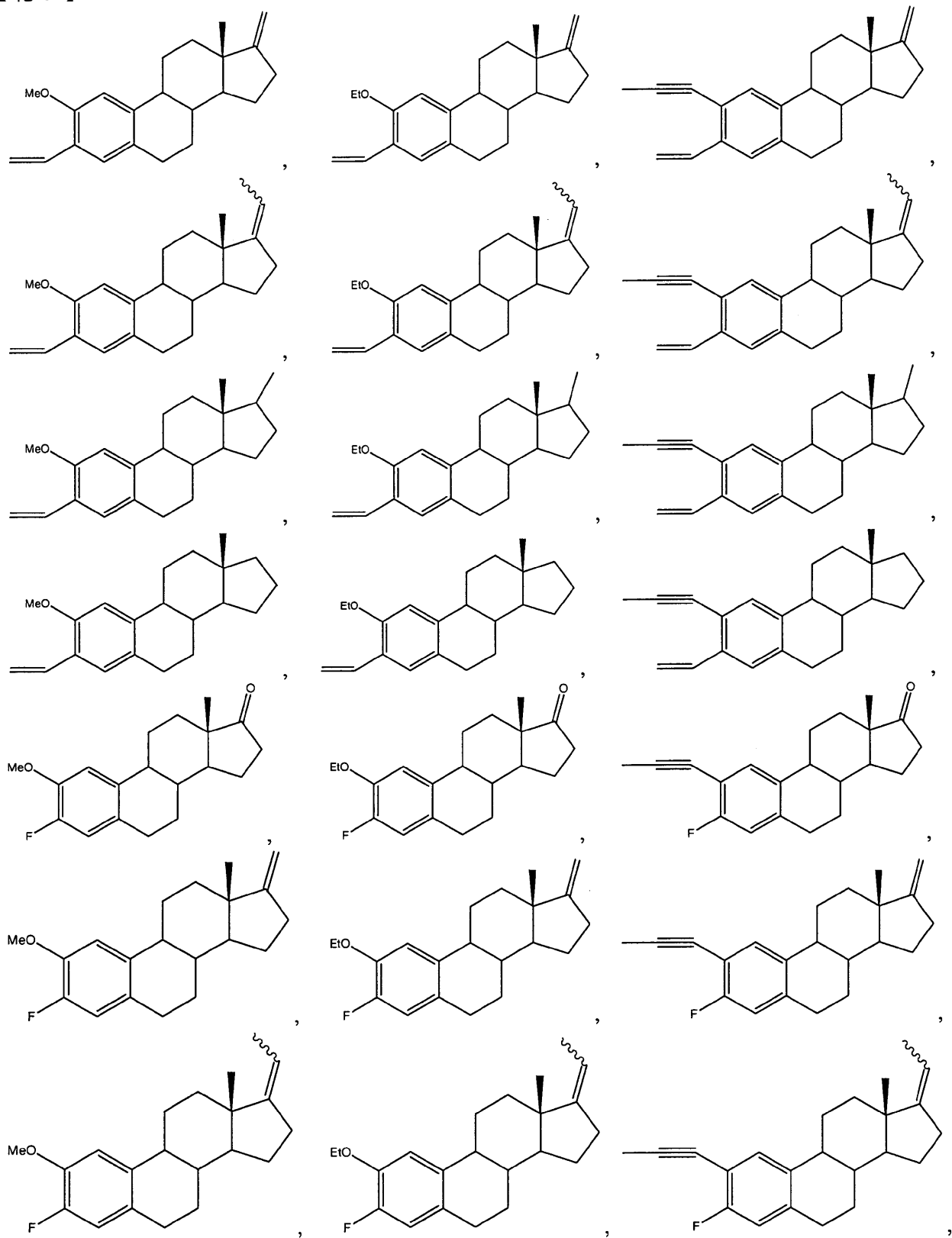
【化 7】



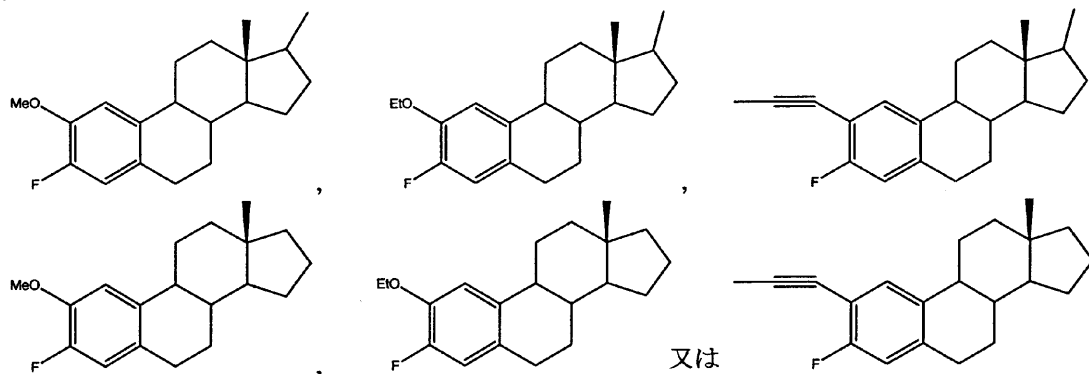
【化 8】



【化 9】



【化 1 0】



で表される化合物を含む、ヒトまたは動物において眼の状態を治療するための医薬品。

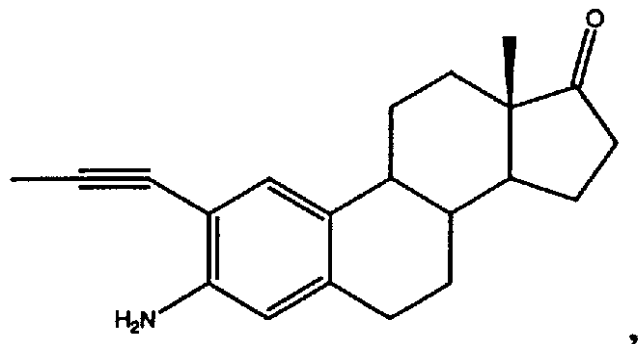
【請求項 1 4】

前記眼の状態は、眼の新生血管疾患、糖尿病性網膜症、未熟児網膜症、黄斑変性、加齢性黄斑変性、角膜移植片拒絶、血管新生緑内障、水晶体後線維増殖症、コンタクトレンズの過剰装着、アトピー性角膜炎、上輪部角膜炎、翼状片乾性角膜炎、近視、慢性網膜剥離、視窩、テリエン周辺角膜変性、過粘稠度症候群、慢性ブドウ膜炎、慢性硝子体炎、推定眼ヒストプラズマ症、網膜炎、脈絡膜炎、増殖性硝子体網膜症、強膜炎、イールズ病、ペスト病、トラコーマ、扁平部炎、慢性炎症に起因するもの、レーザー照射後の合併症、又は放射状角膜切開である、請求項 1 3 に記載の医薬品。

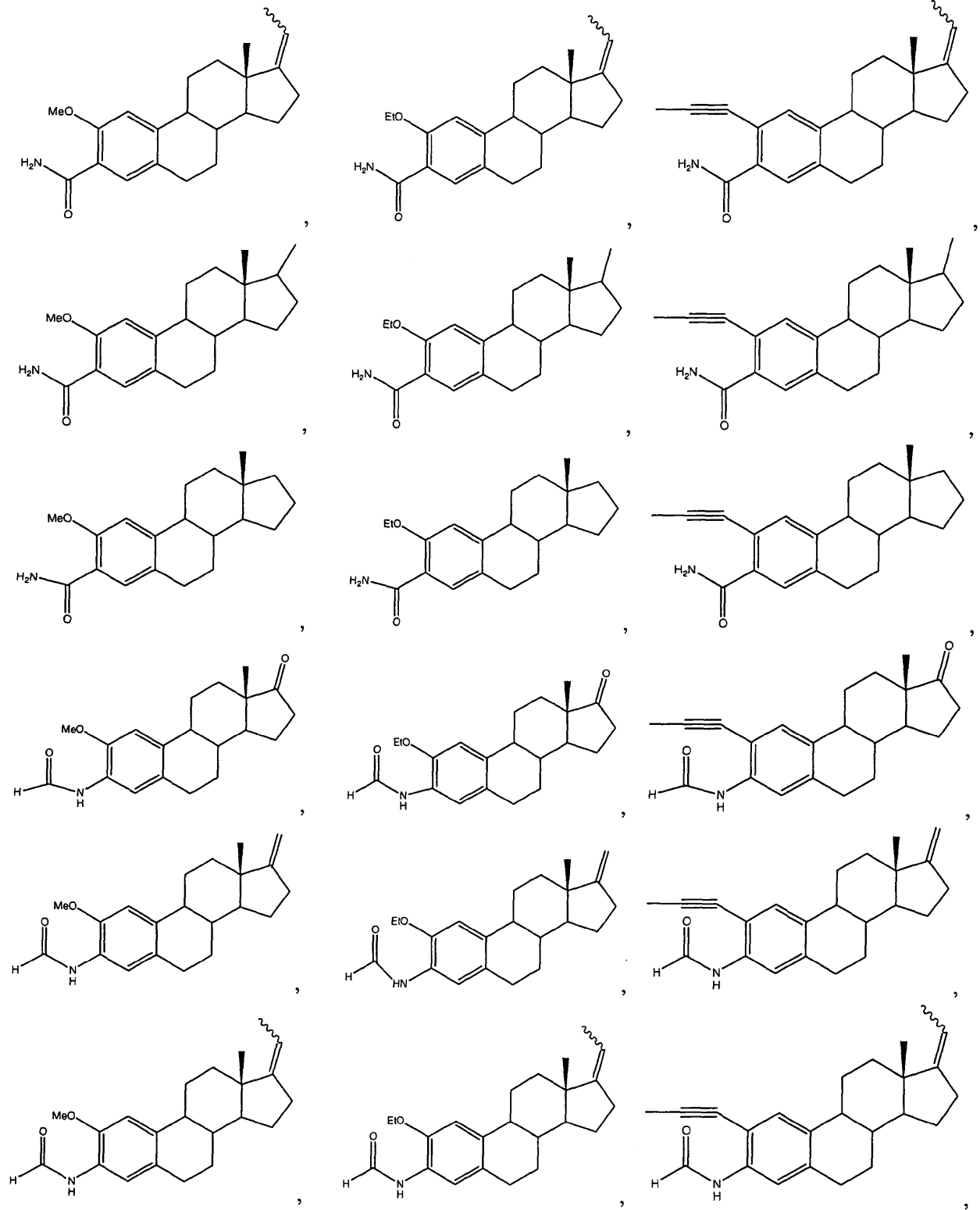
【請求項 1 5】

下記の

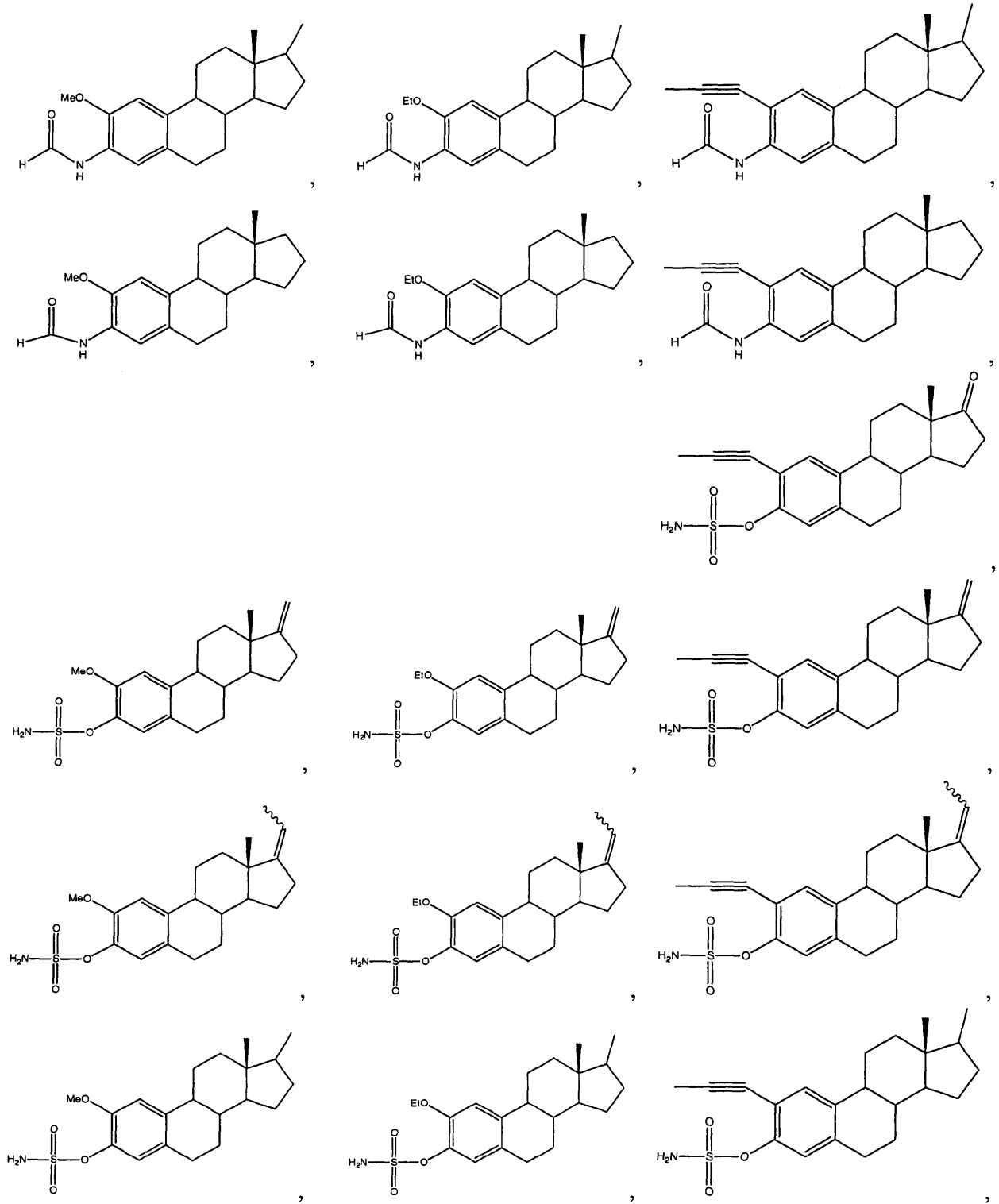
【化 1 1】



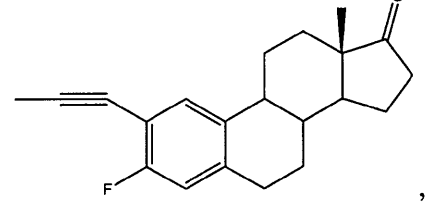
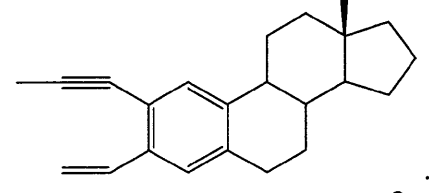
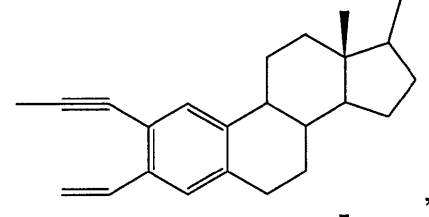
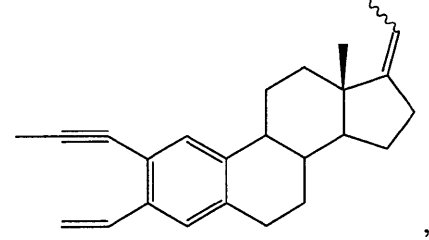
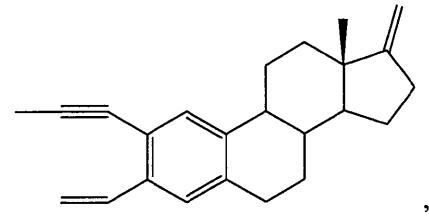
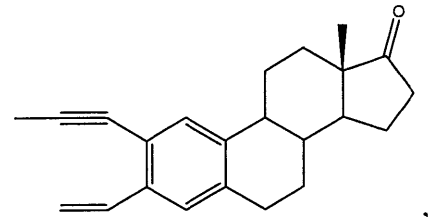
【化 1 3】



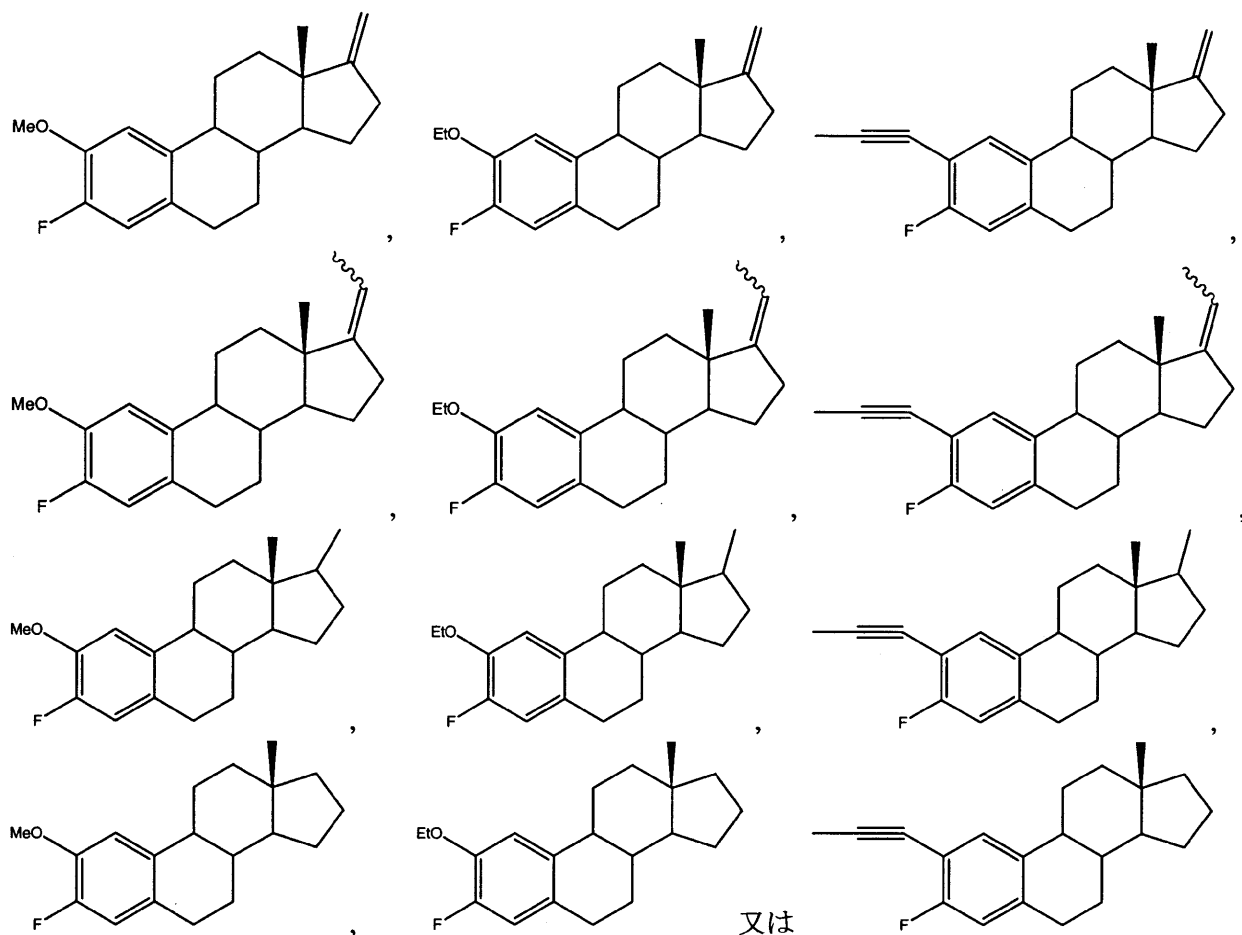
【化 1 4】



The chemical structure of compound 1 is a complex polycyclic molecule. It features a steroid-like core with a sulfonamide group and an ethynyl substituent. The structure is shown in a skeletal format with a sulfonamide group (H₂N-SO₂-O-) attached to a benzene ring, and an ethynyl group (-C≡CH) attached to the same ring. The steroid-like core consists of four fused rings, with a methyl group at the C-13 position and a sulfonamide group at the C-1 position.



【化 1 6】



から選択される化合物を含む、ヒトまたは動物において炎症性あるいは免疫性疾患を治療するための医薬品。

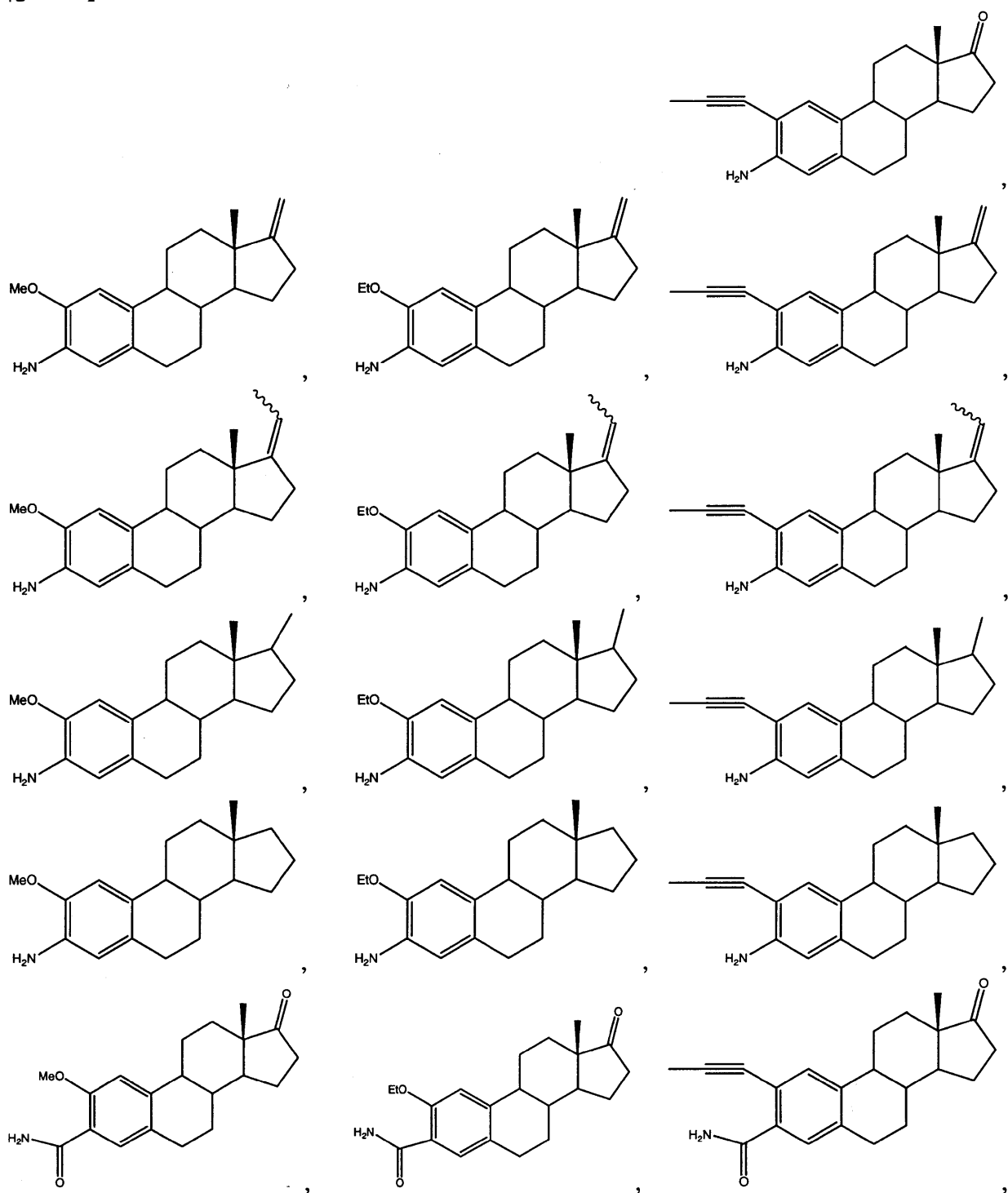
【請求項 1 6】

前記炎症性または免疫性疾患は、慢性関節リウマチ、変形性関節症、潰瘍性大腸炎、クローン病、モーレン潰瘍、関節炎、サルコイドーシス、炎症性腸疾患、免疫性腸疾患、全身性狼瘡、扁平部炎、ヴェーゲナー症候群、スティーヴンズ - ジョンソン疾患、ベーチェット病、類天疱瘡、ライム病、又は後天性免疫不全症候群である、請求項 1 5 に記載の医薬品。

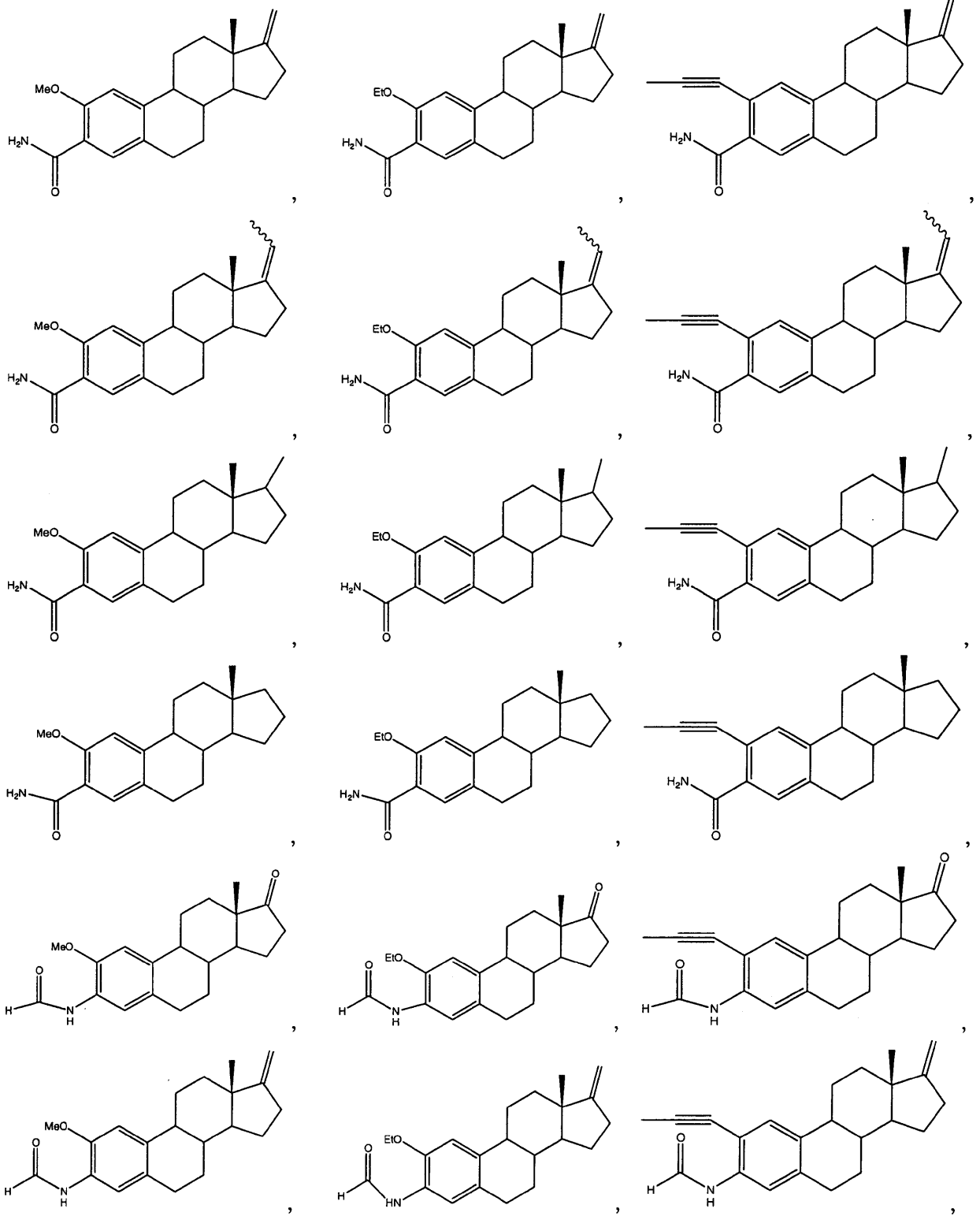
【請求項 1 7】

下記の

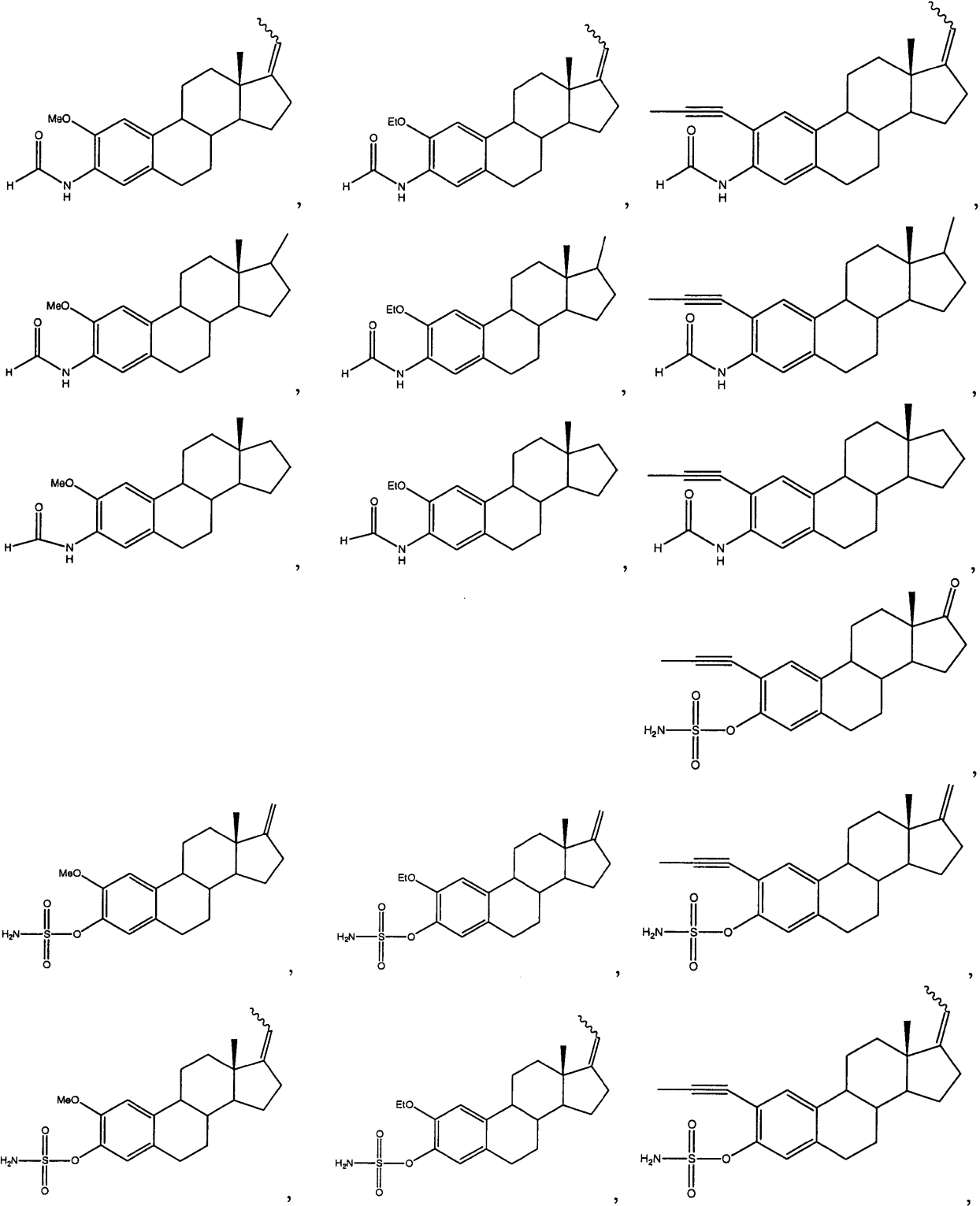
【化 17】



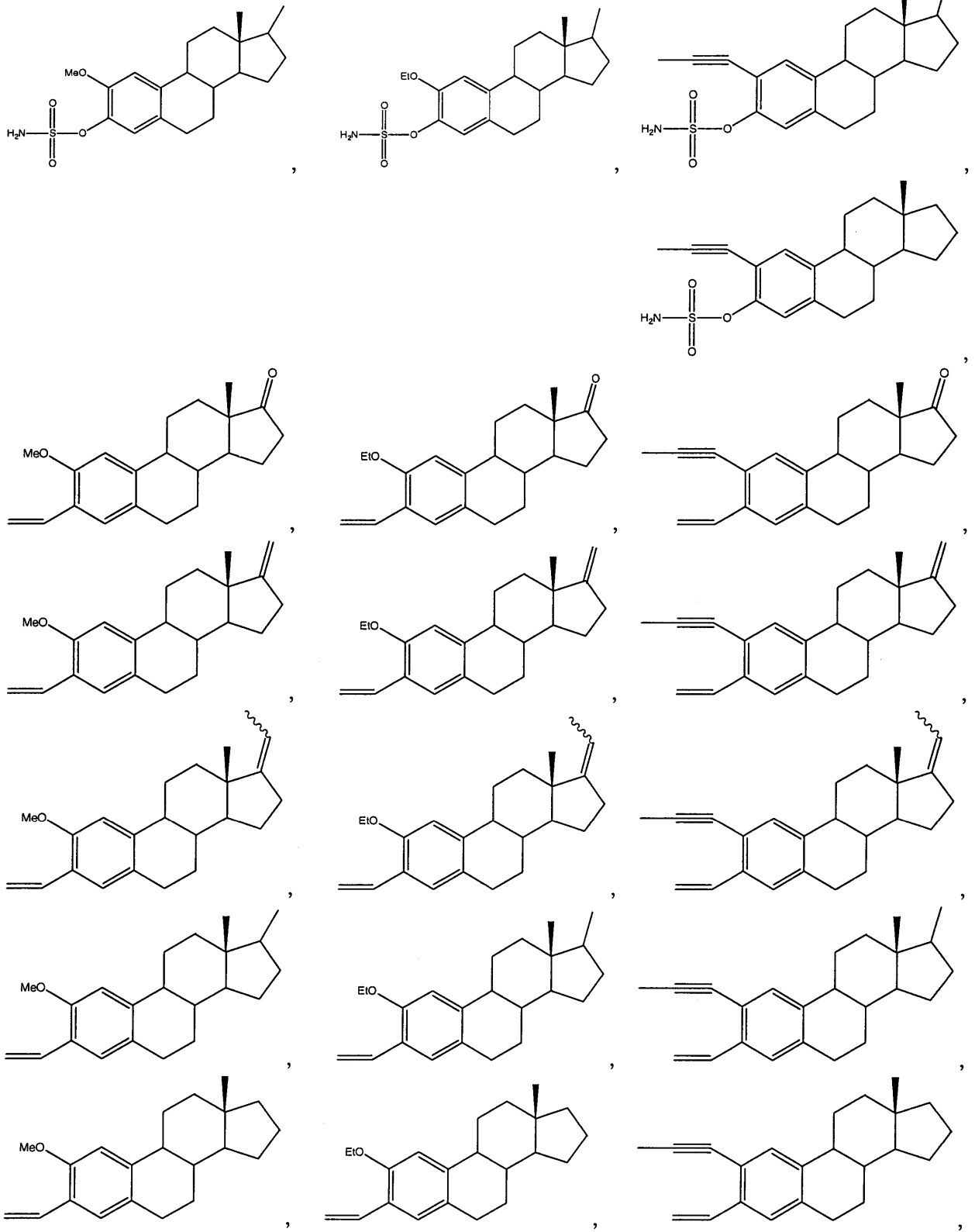
【化 18】



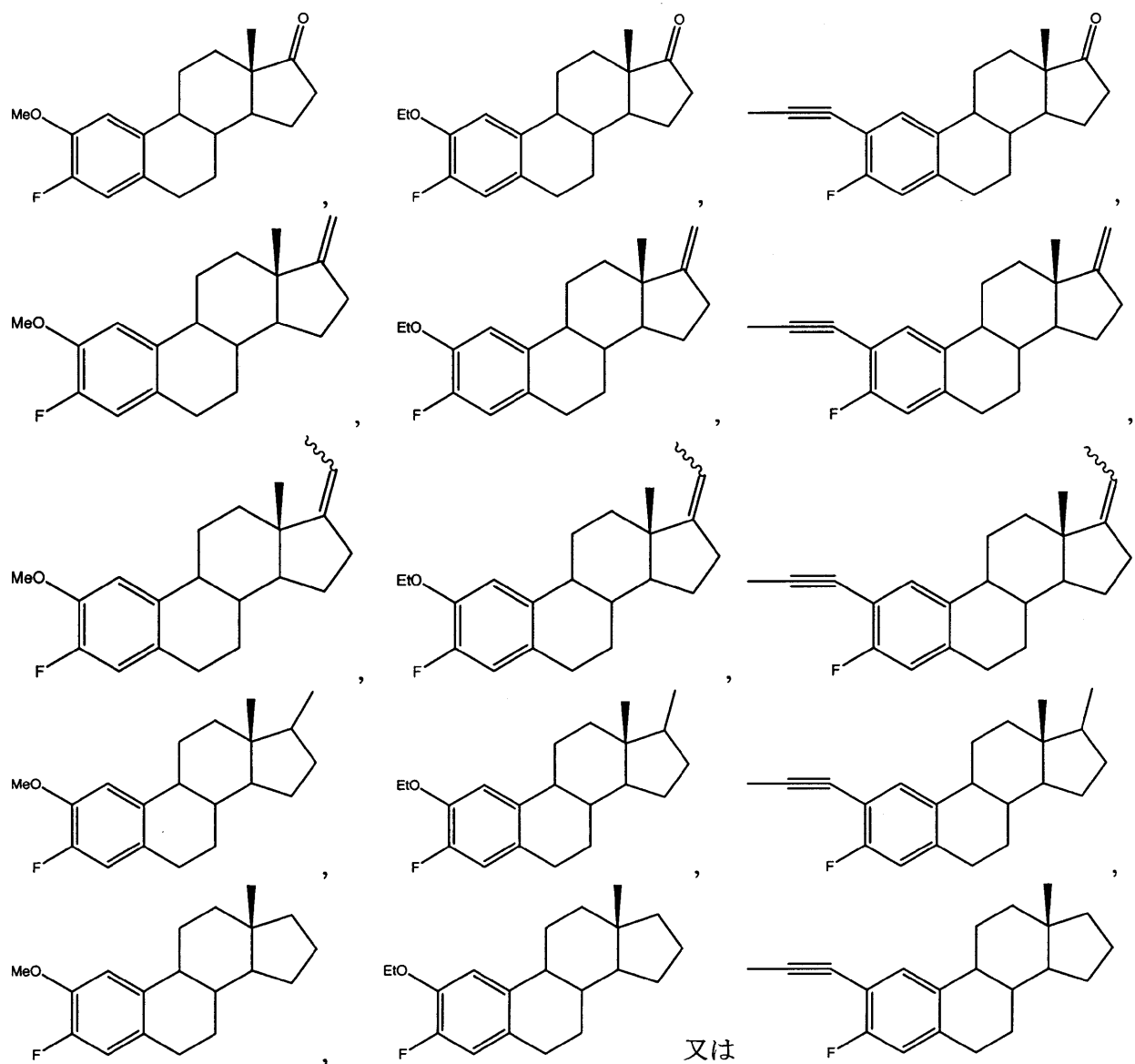
【化 19】



【化 20】



【化 2 1】



から選択される化合物を含む、ヒトまたは動物において感染症を治療するための医薬品。

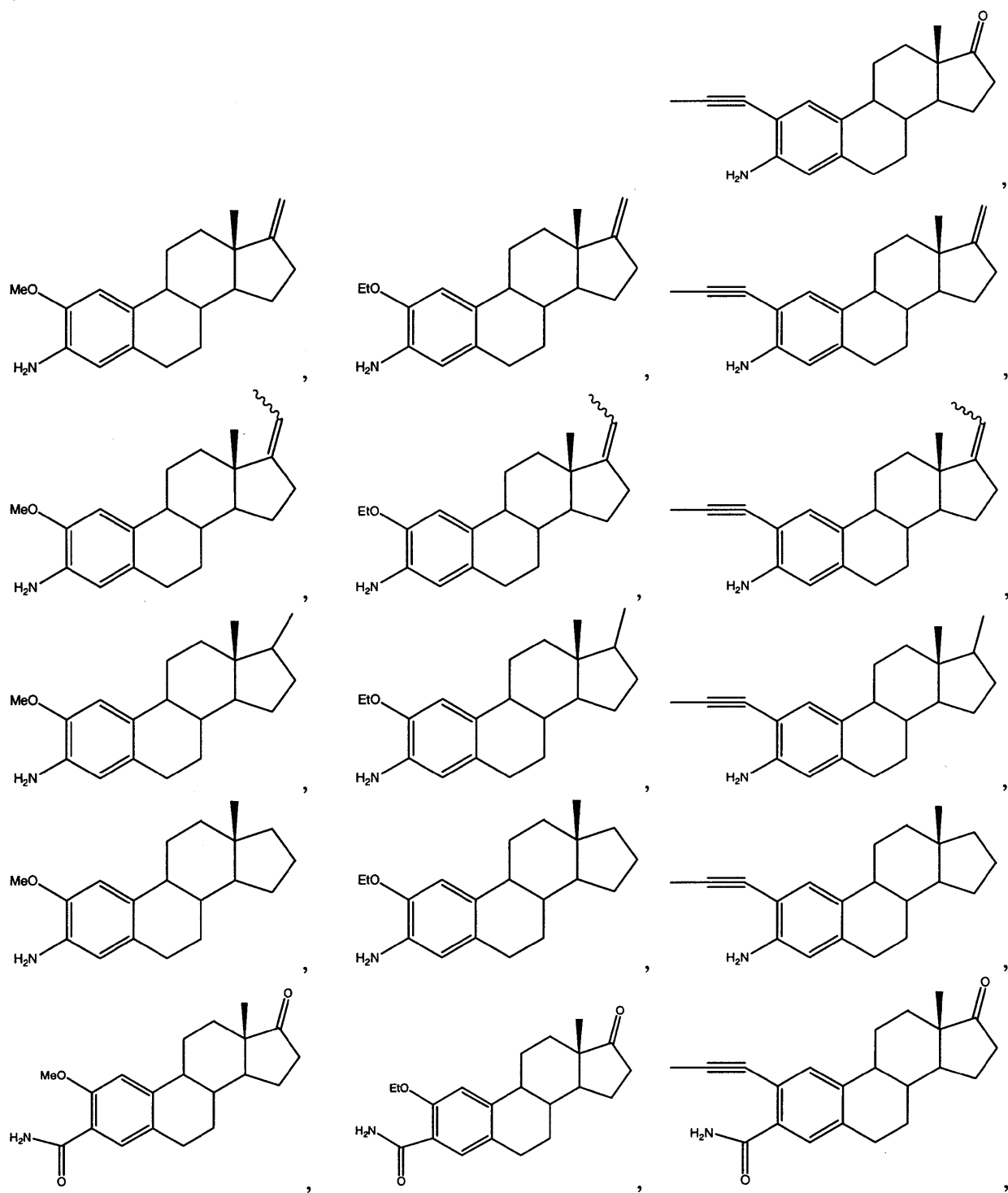
【請求項 18】

前記感染症は、梅毒、細菌性感染、ミコバクテリア感染、細菌性潰瘍、真菌性潰瘍、単純ヘルペス感染、帯状ヘルペス感染、原生動物感染、バルトネラ感染、又はトキソプラズマ症である、請求項 17 に記載の医薬品。

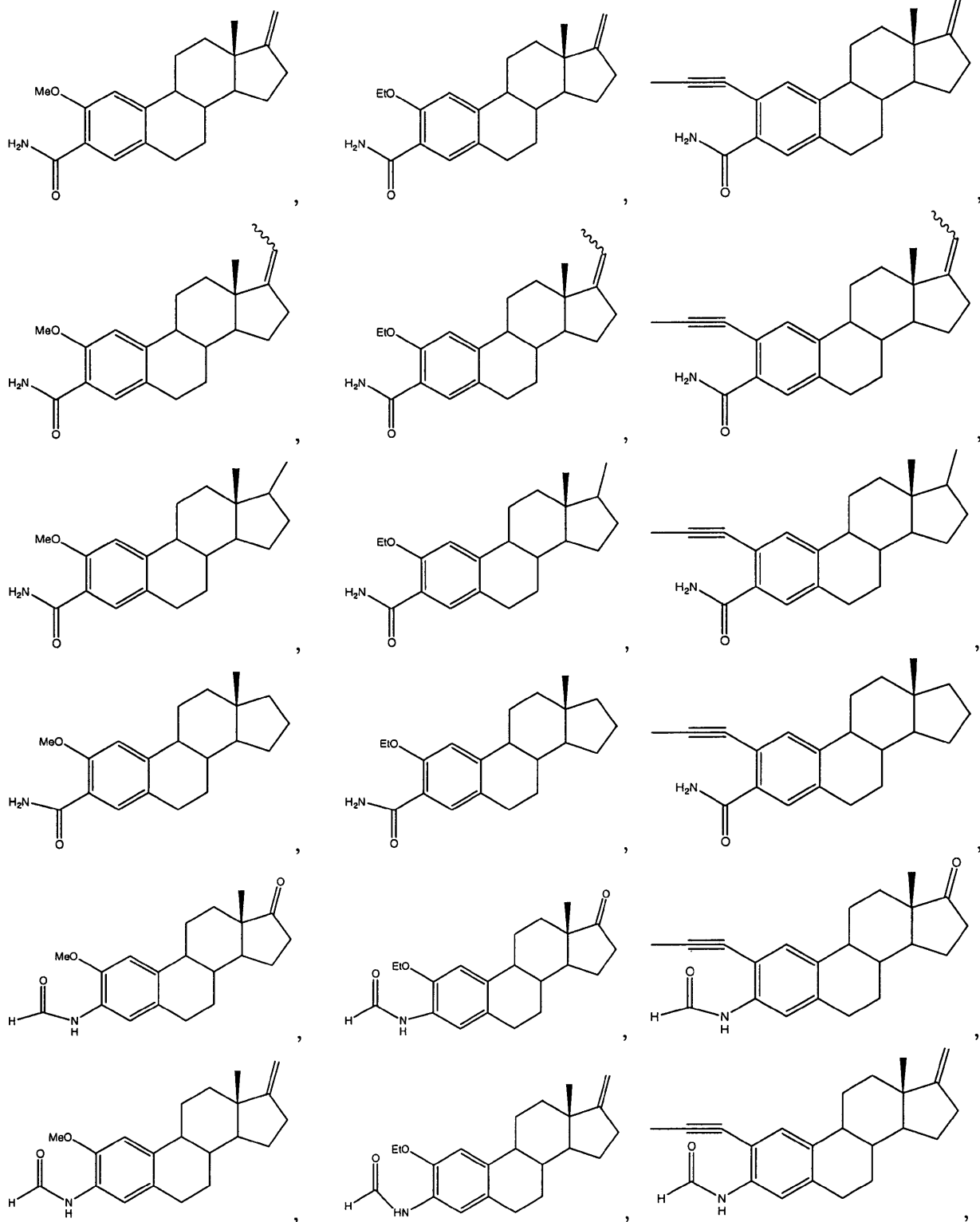
【請求項 19】

下記の

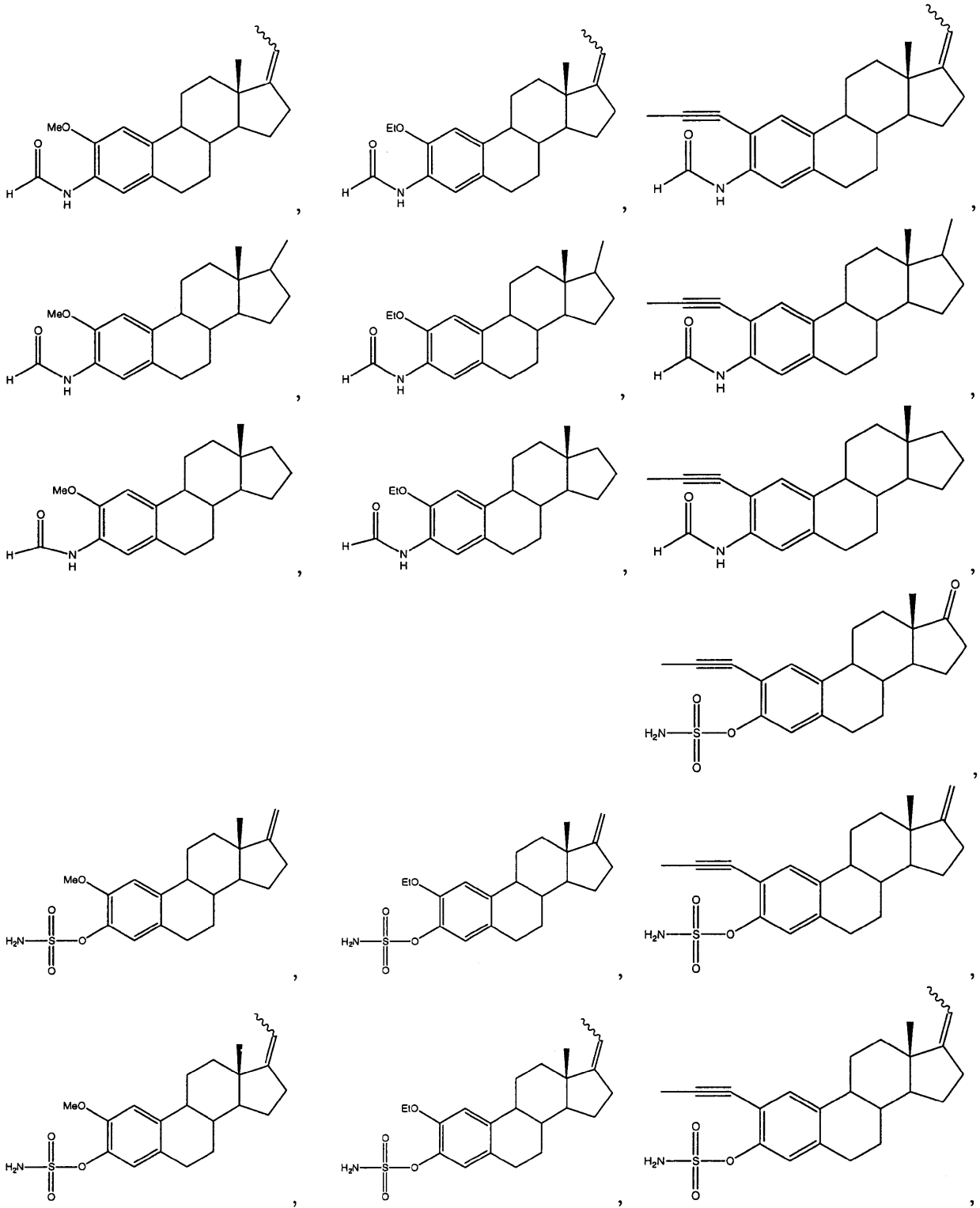
【化 2 2】



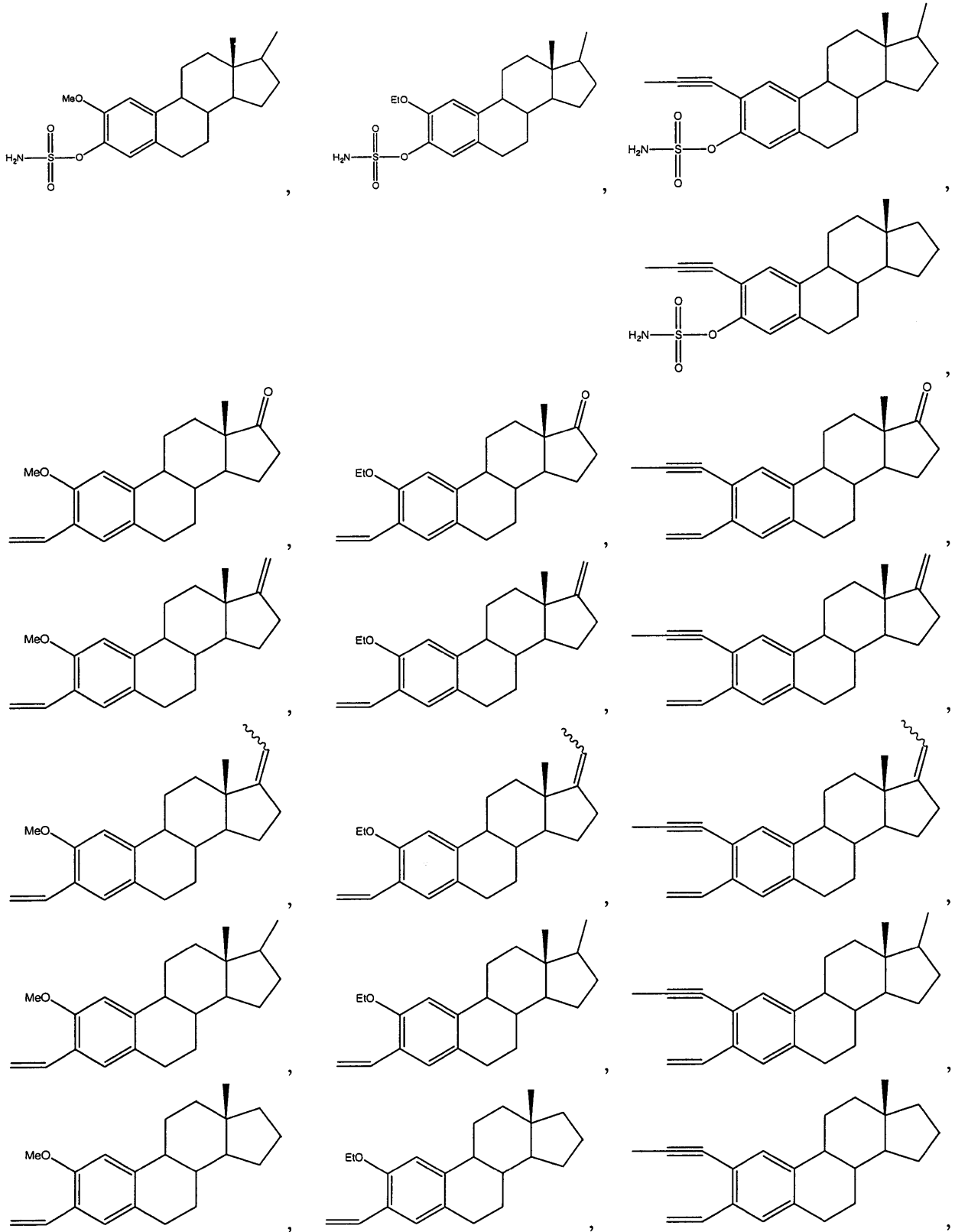
【化 2 3】



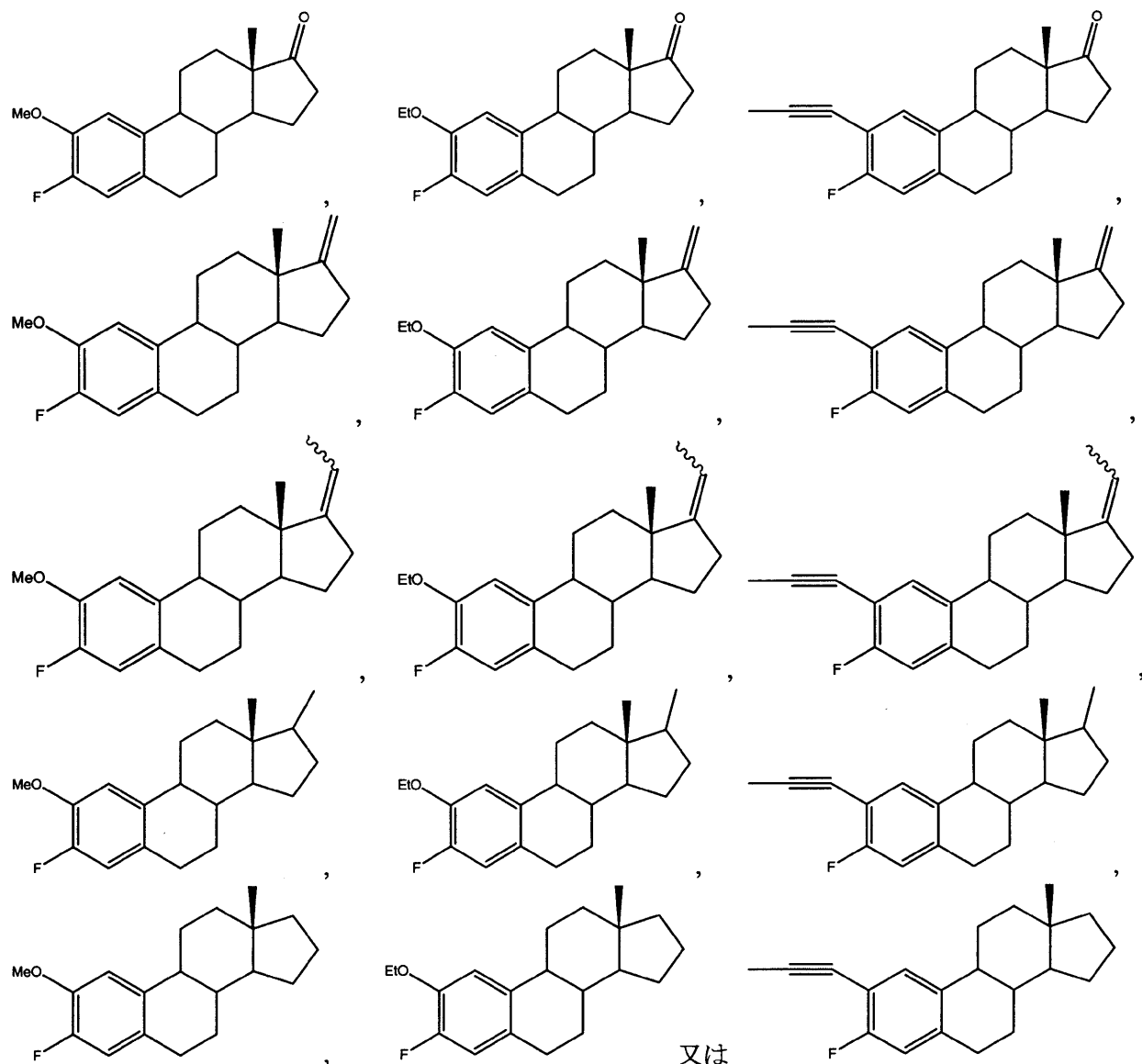
【化 2 4】



【化 2 5】



【化 2 6】



から選択される化合物を含む、ヒトまたは動物において癌性疾患を治療するための医薬品。

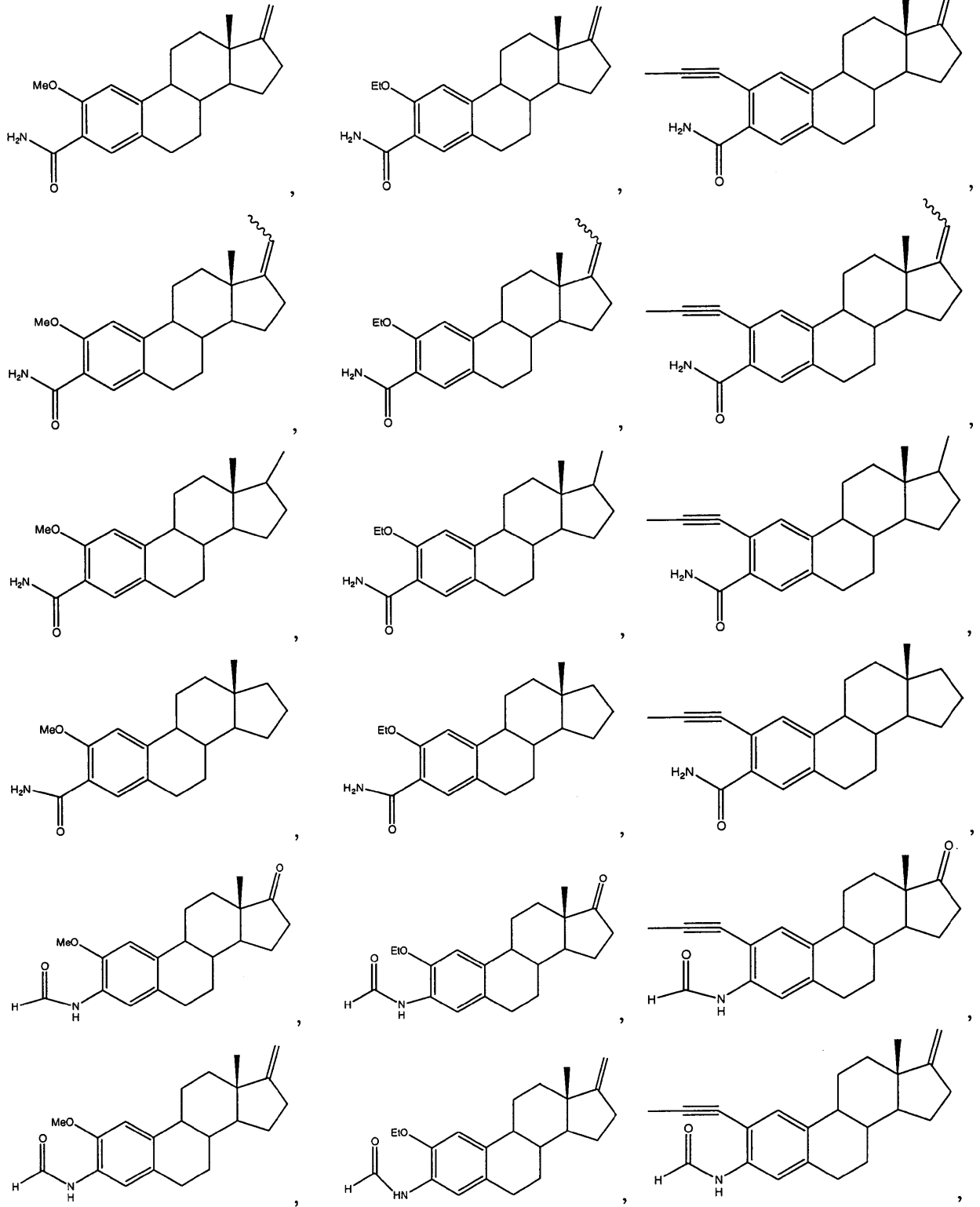
【請求項 2 0】

前記癌性疾患は、横紋筋肉腫、網膜芽細胞腫、ユーイング肉腫、神経芽細胞腫、聴神経腫、骨肉腫、神経線維腫、血管腫、乳癌、前立腺癌、腎細胞癌、脳腫瘍、卵巣癌、結腸癌、肝臓癌、肺癌、膀胱癌、皮膚黒色腫、カポジ肉腫、又は白血病である、請求項 1 9 に記載の医薬品。

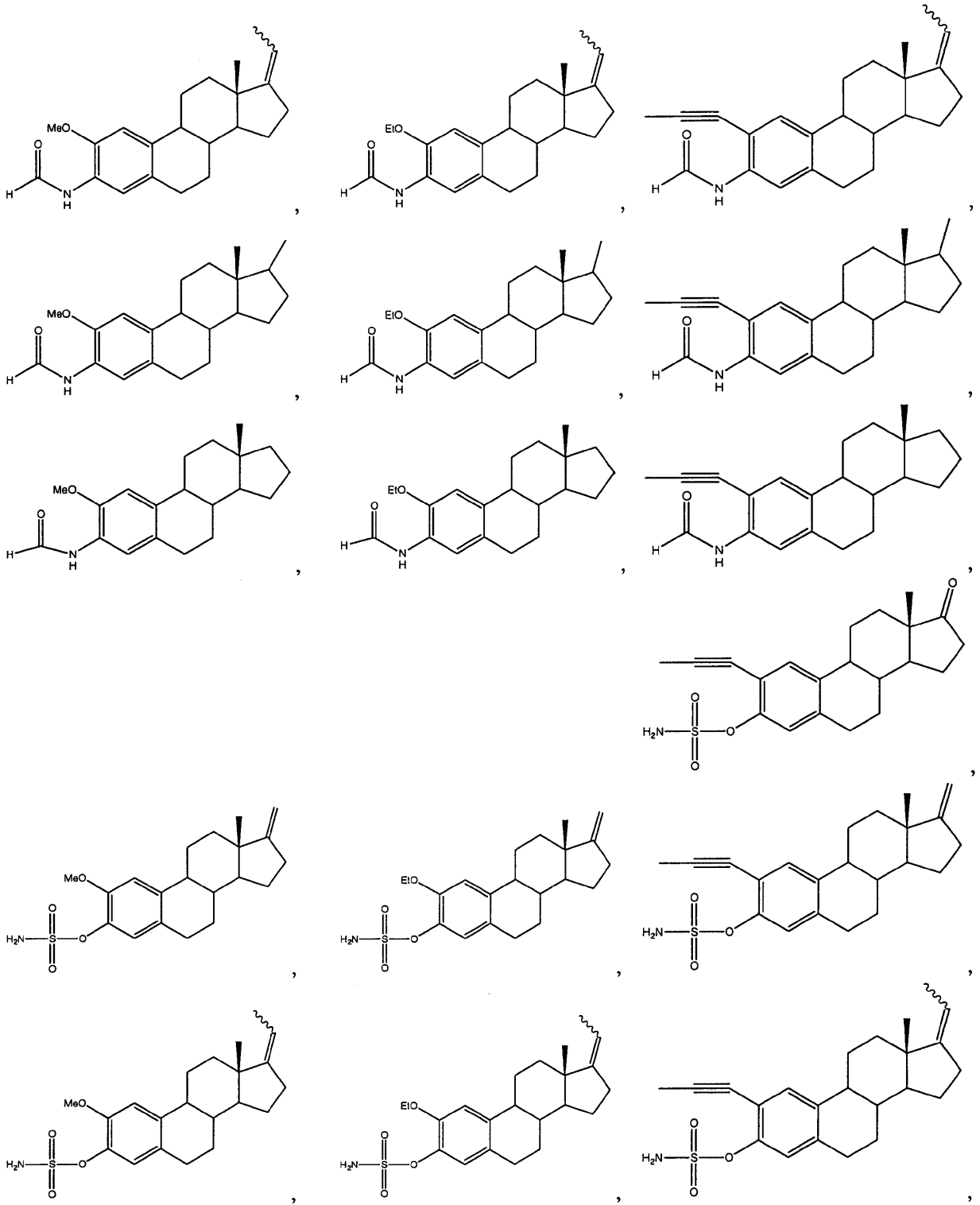
【請求項 2 1】

下記の

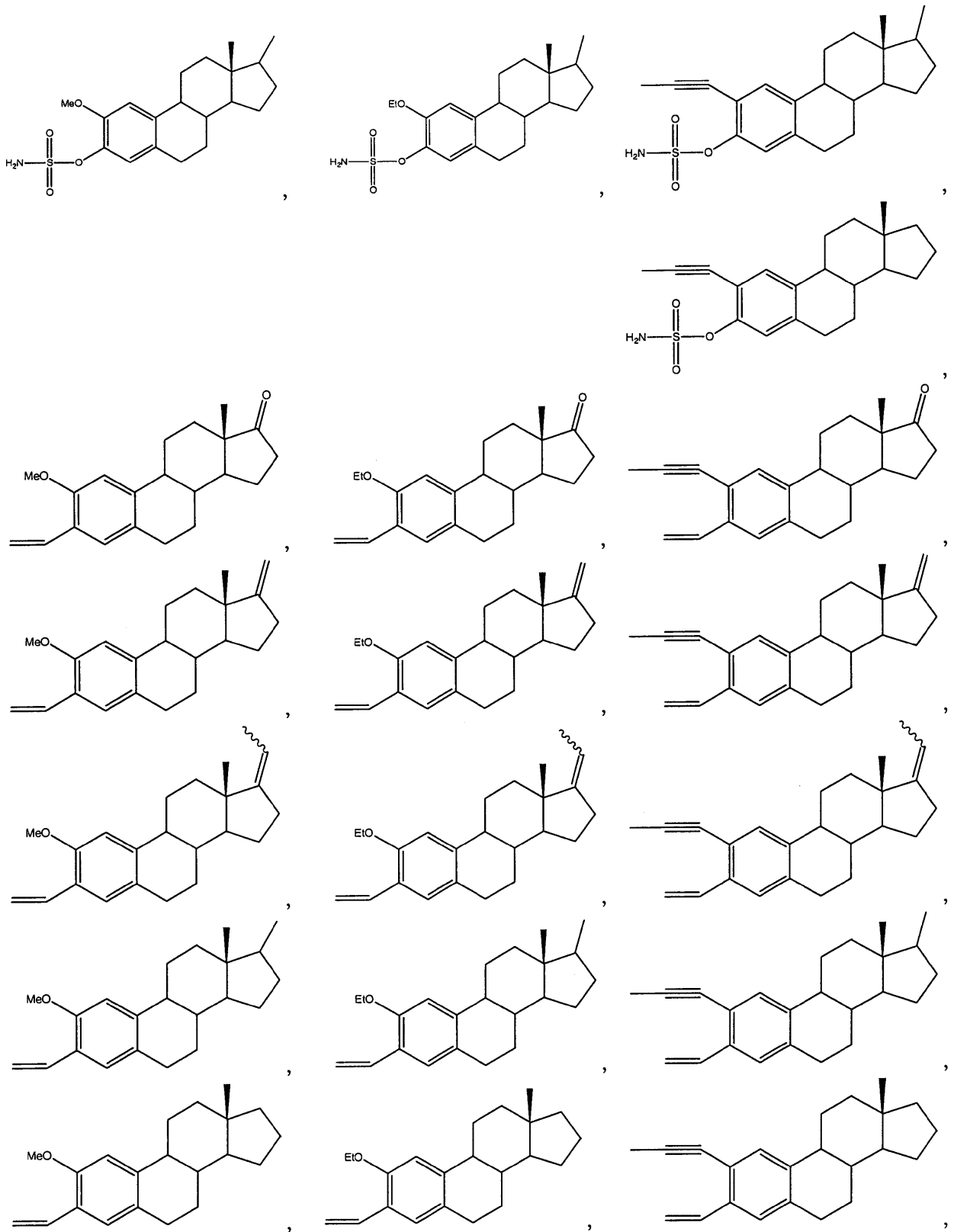
【化 28】



【化 29】



【化 30】



【請求項 22】

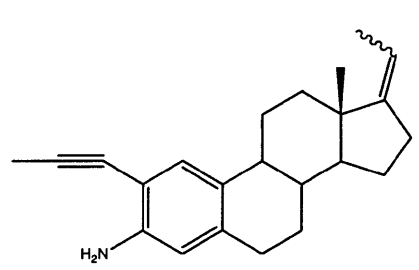
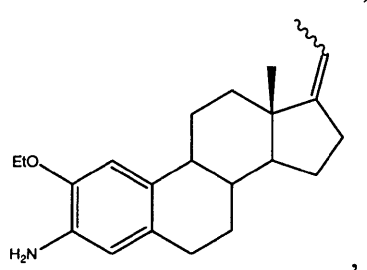
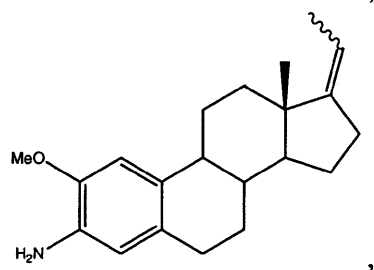
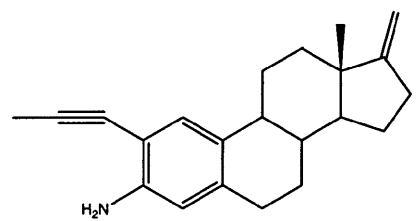
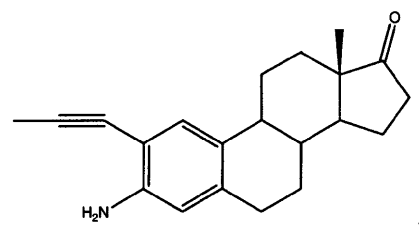
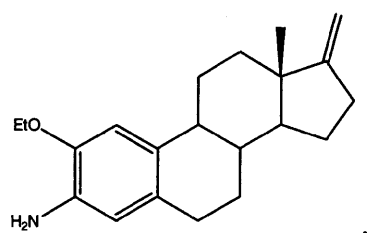
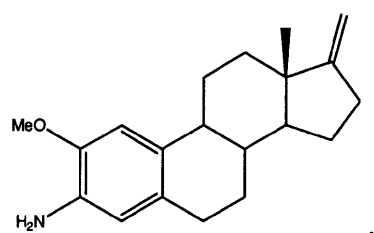
【請求項 23】

【請求項 24】

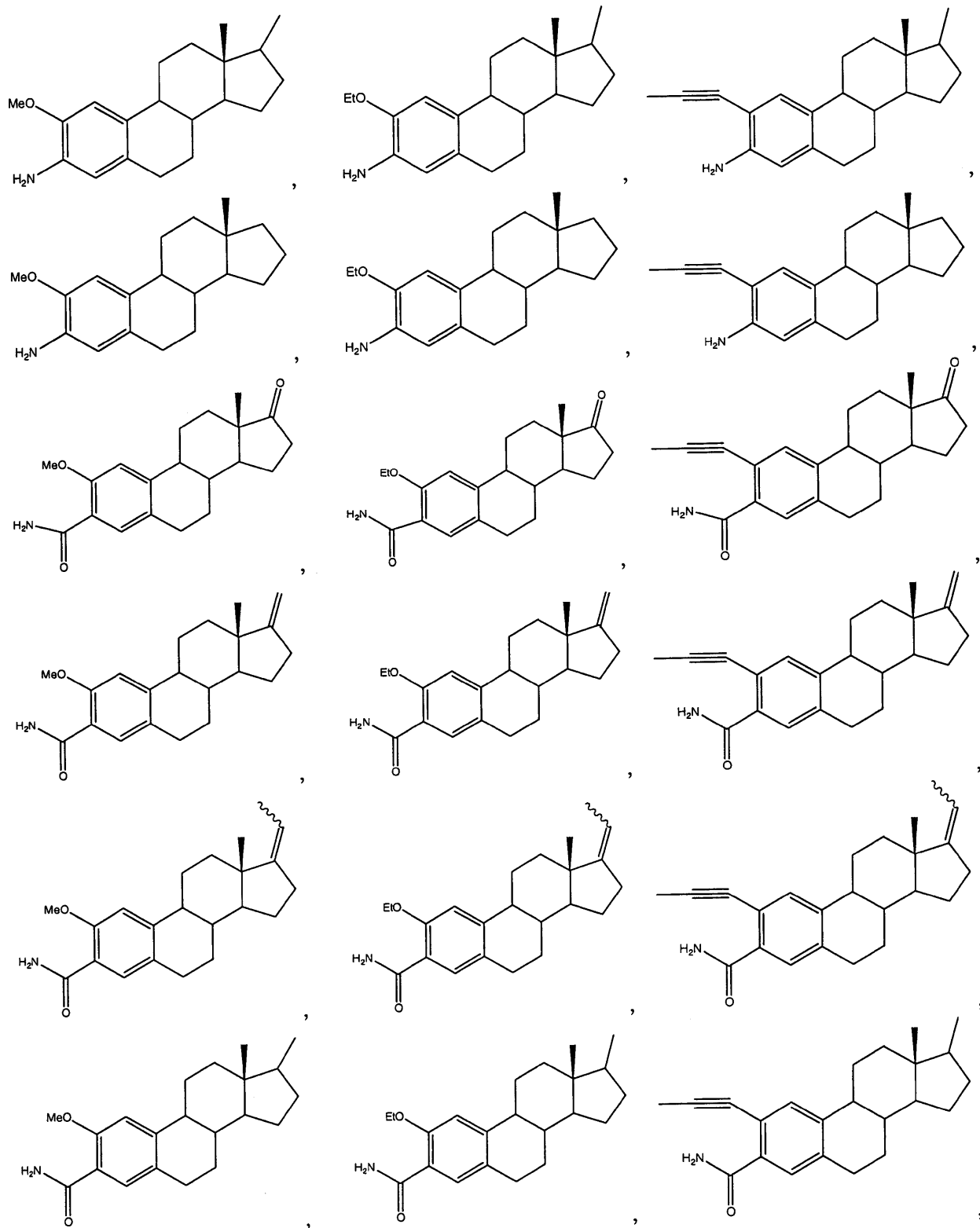
【請求項 25】

下記の

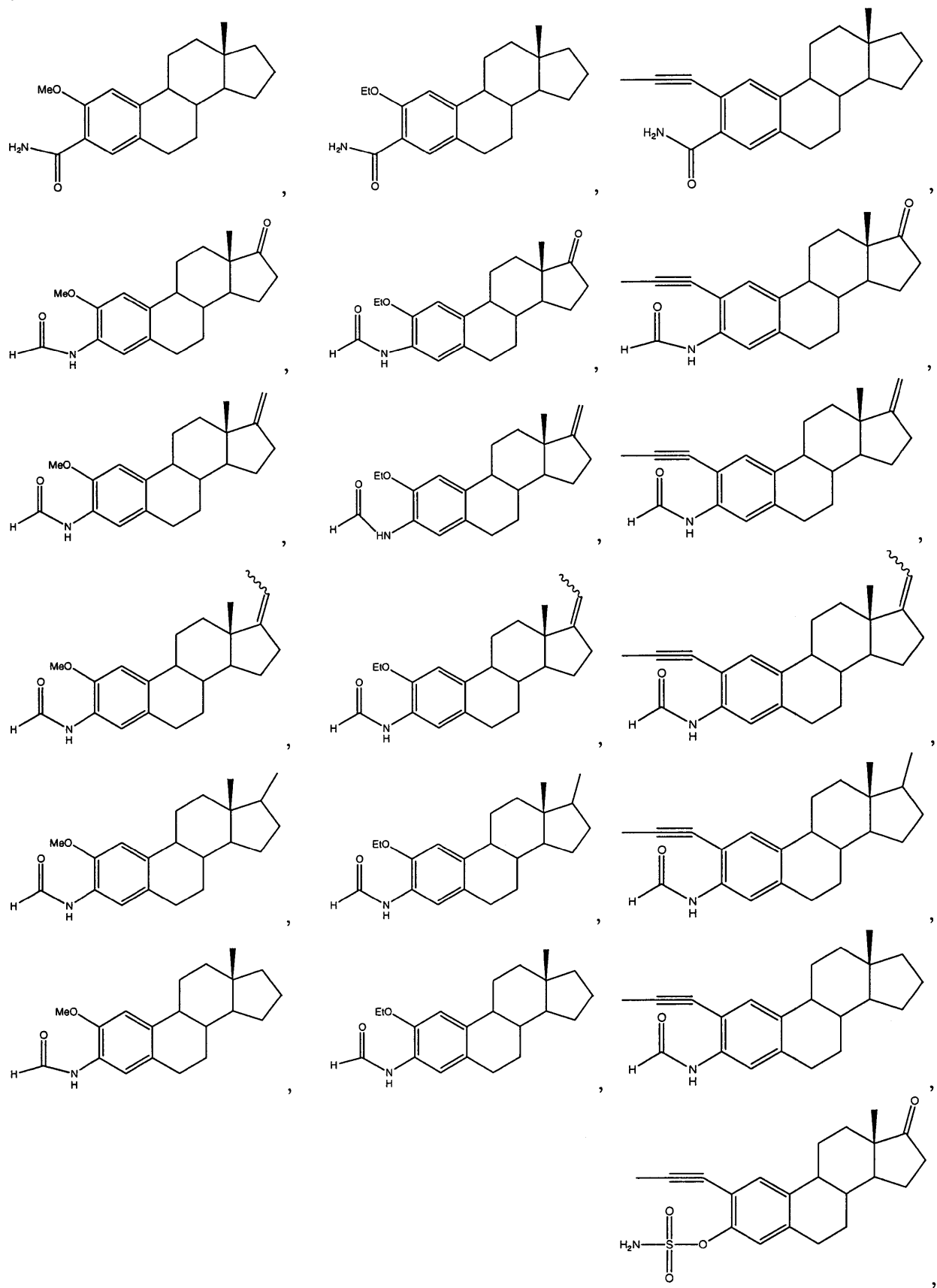
【化 3 2】



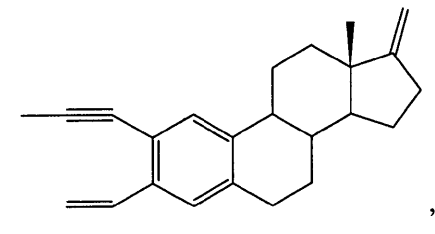
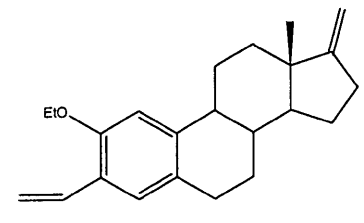
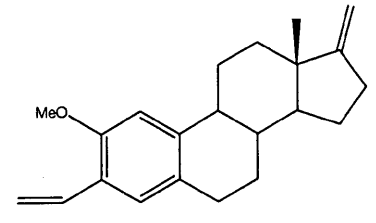
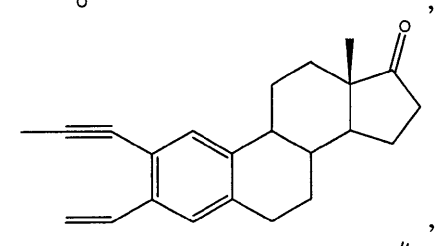
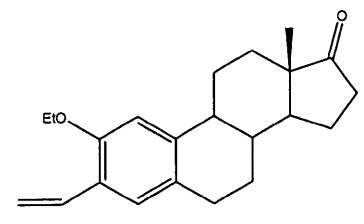
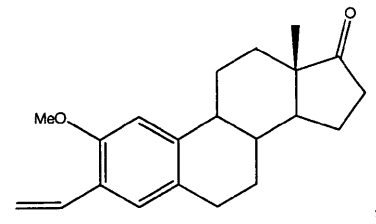
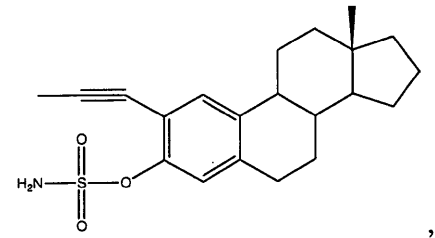
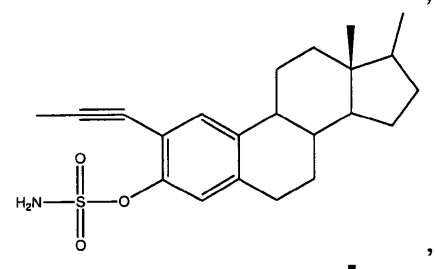
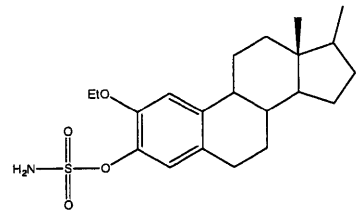
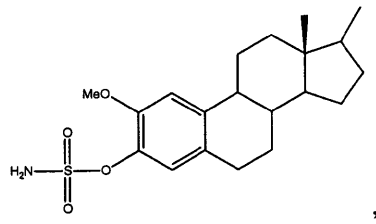
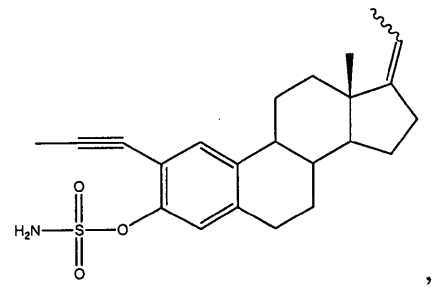
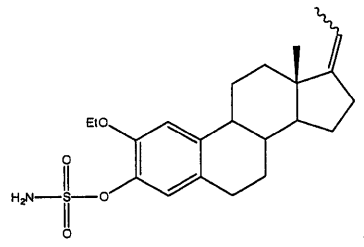
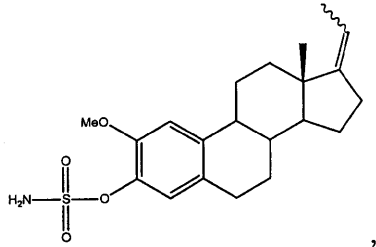
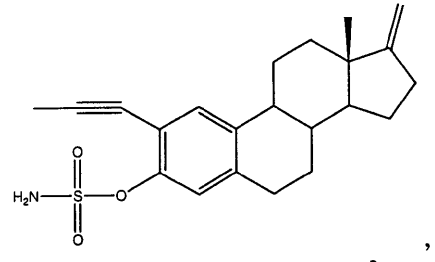
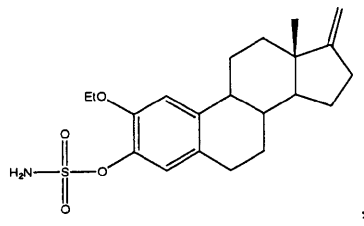
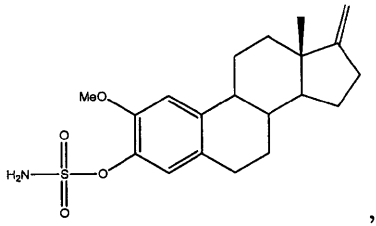
【化 3 3】



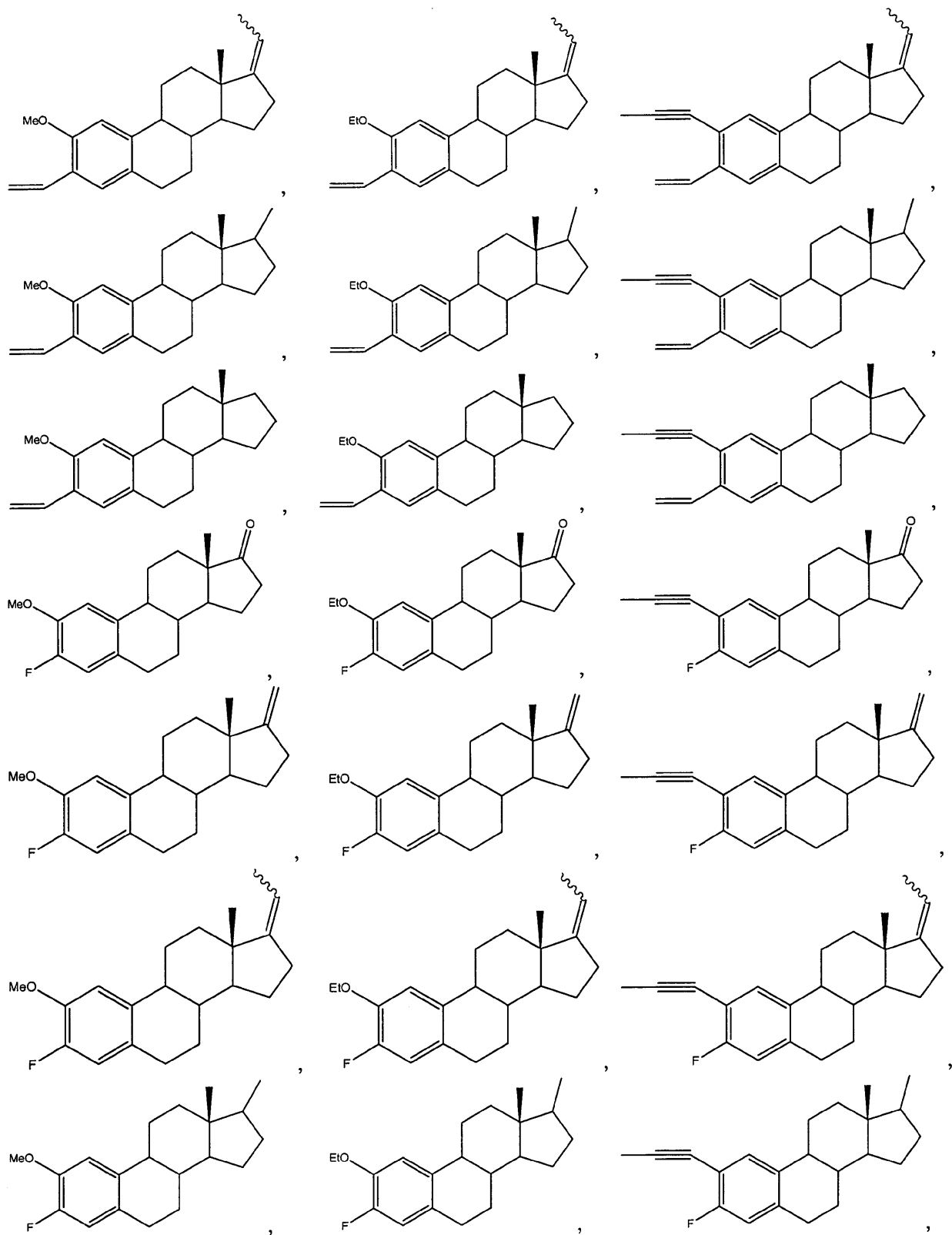
【化 3 4】



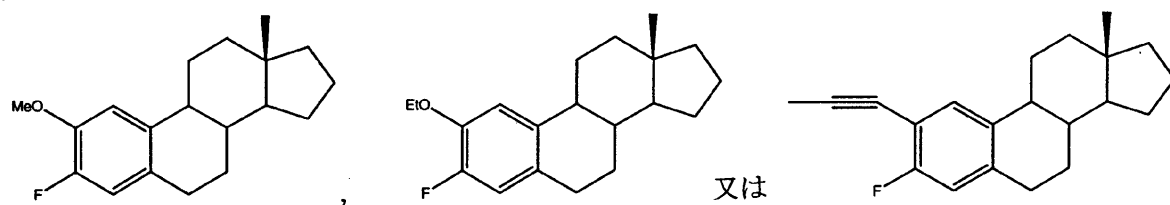
【化 3 5】



【化 3 6】



【化 3 7】



から選択される化合物を含む、ヒトまたは動物において皮膚状態を治療するための医薬品。

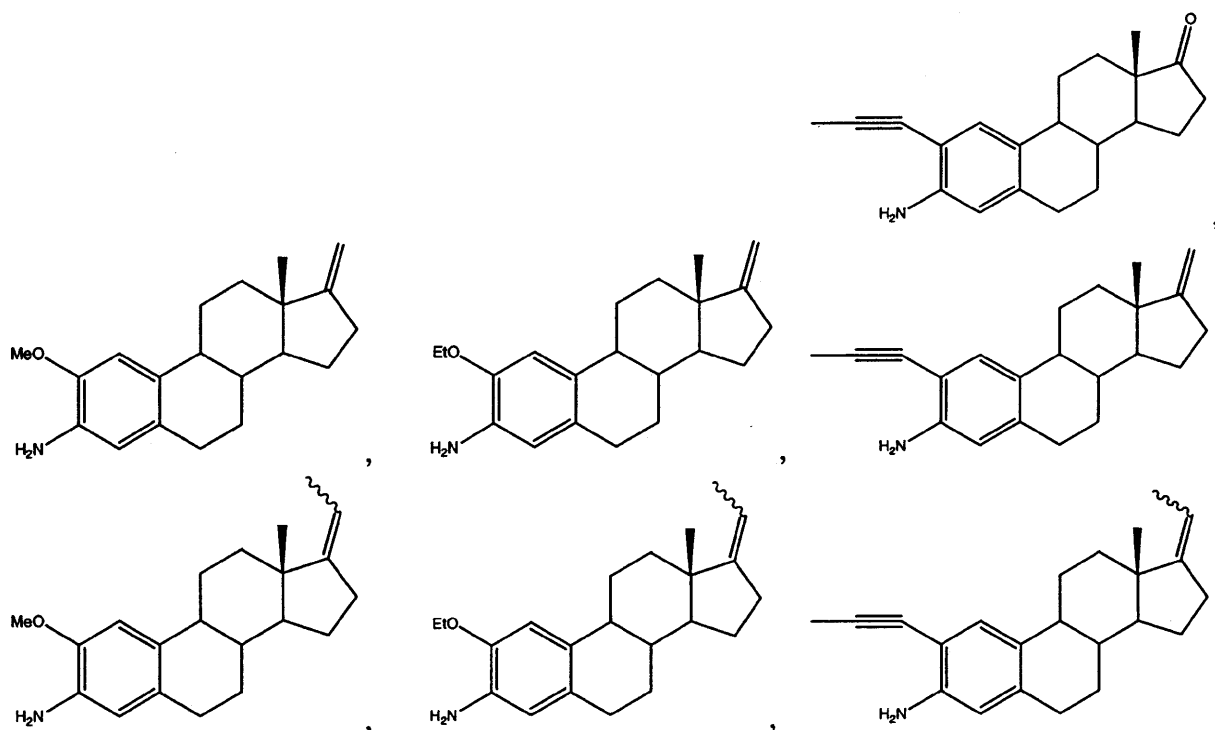
【請求項 26】

前記皮膚状態は、異常な創傷治癒、酒さ性挫瘡、化学的熱傷に起因するもの、又は乾癬である、請求項 25 に記載の医薬品。

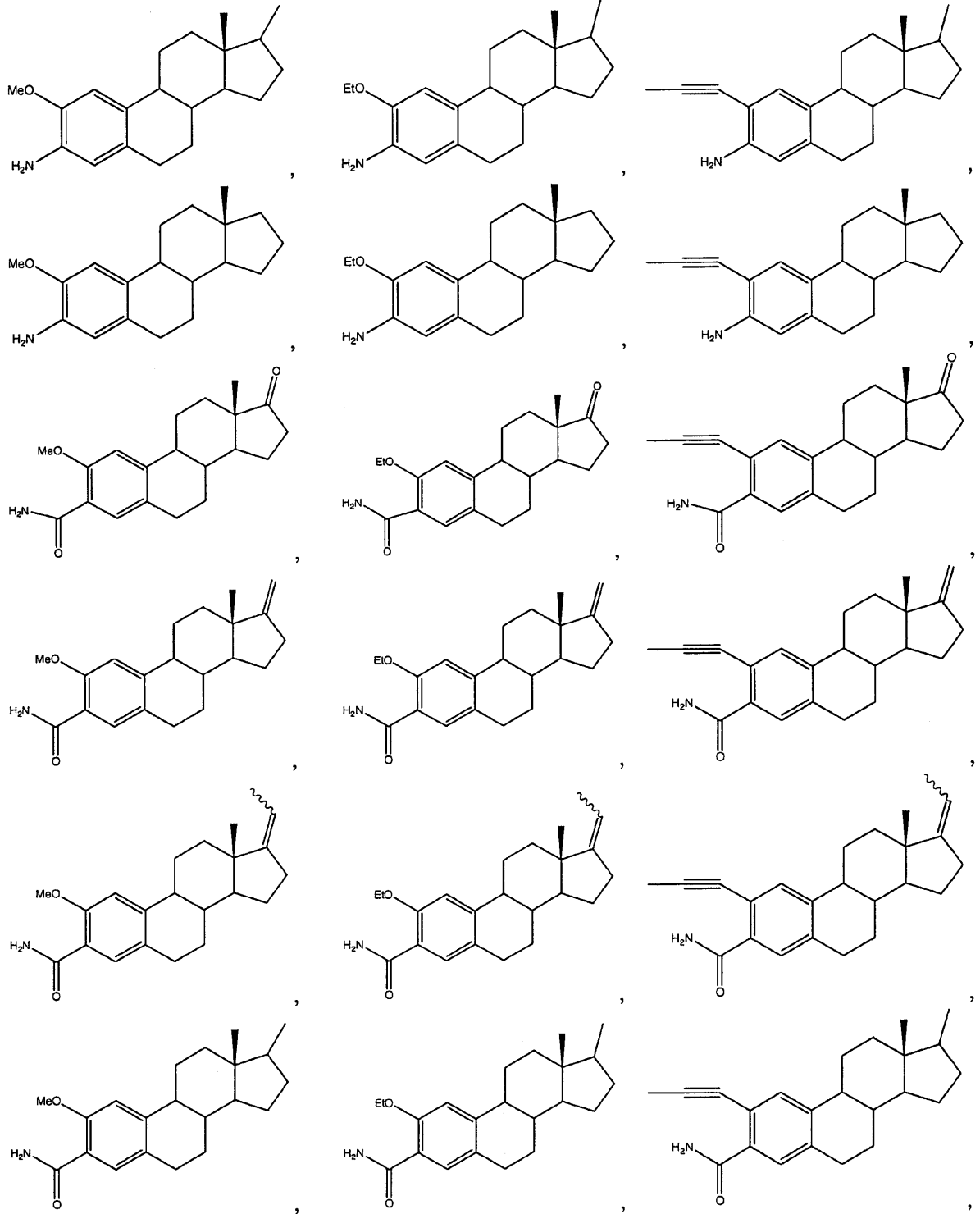
【請求項 27】

下記の化学式

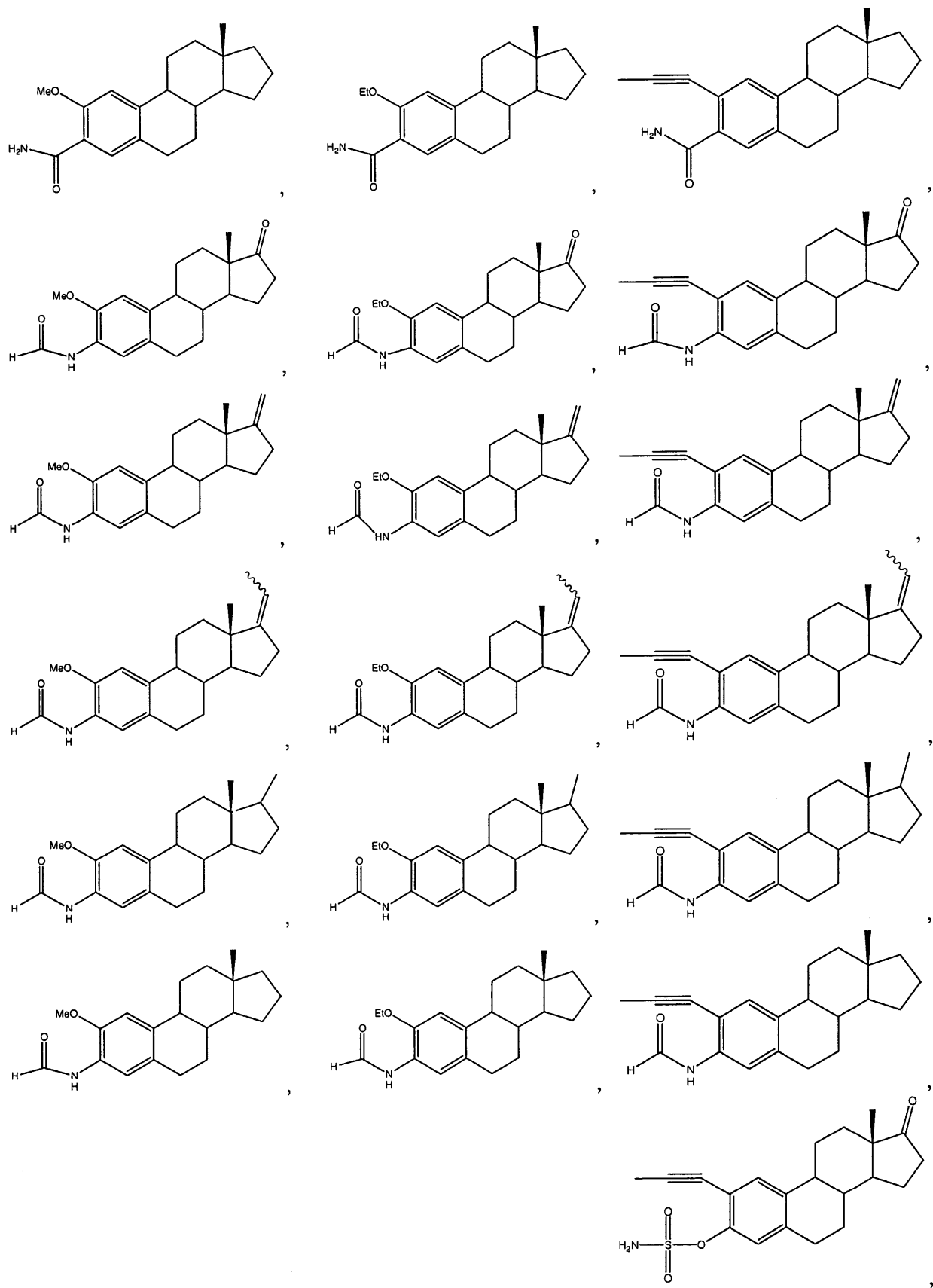
【化 38】



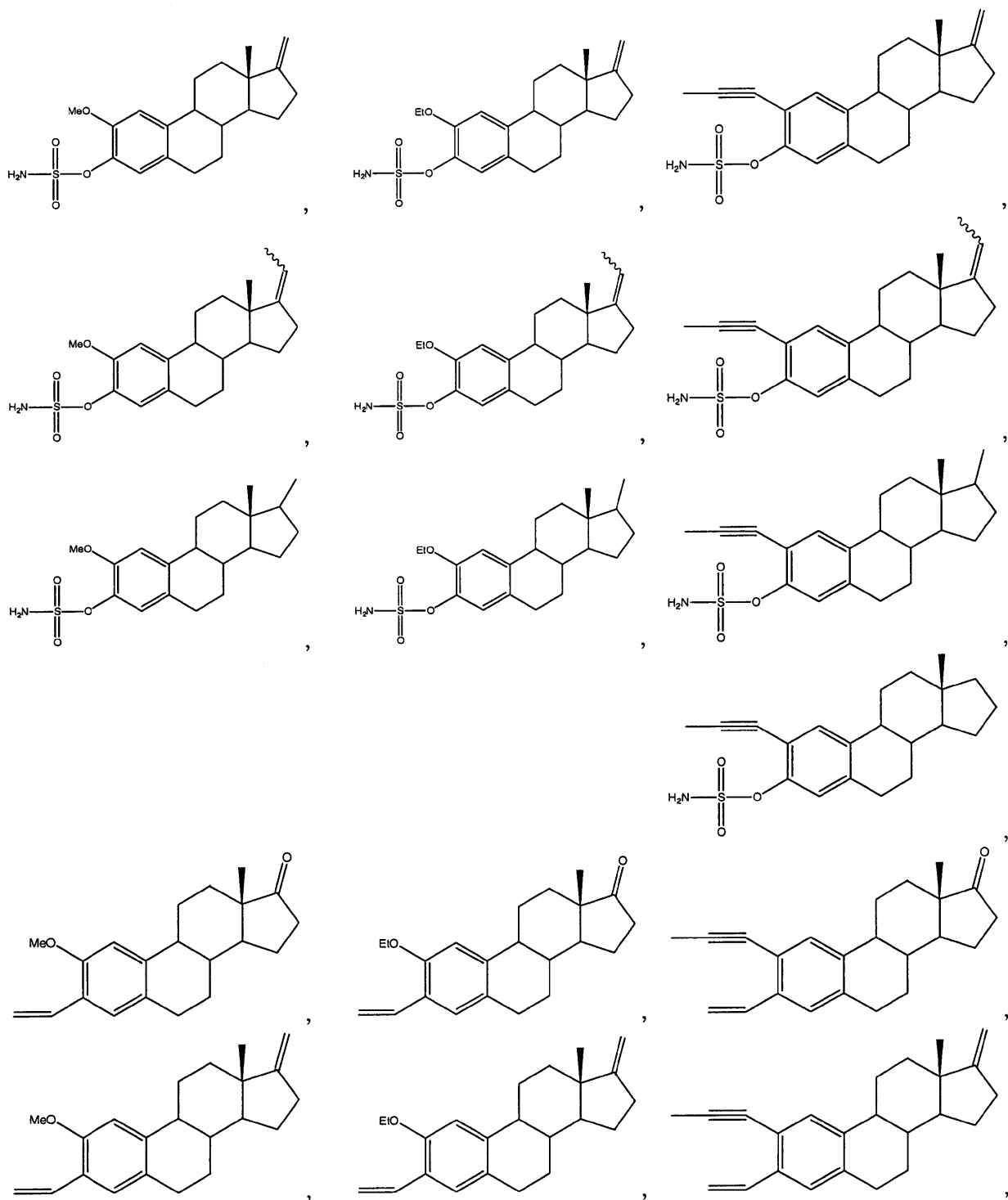
【化 3 9】



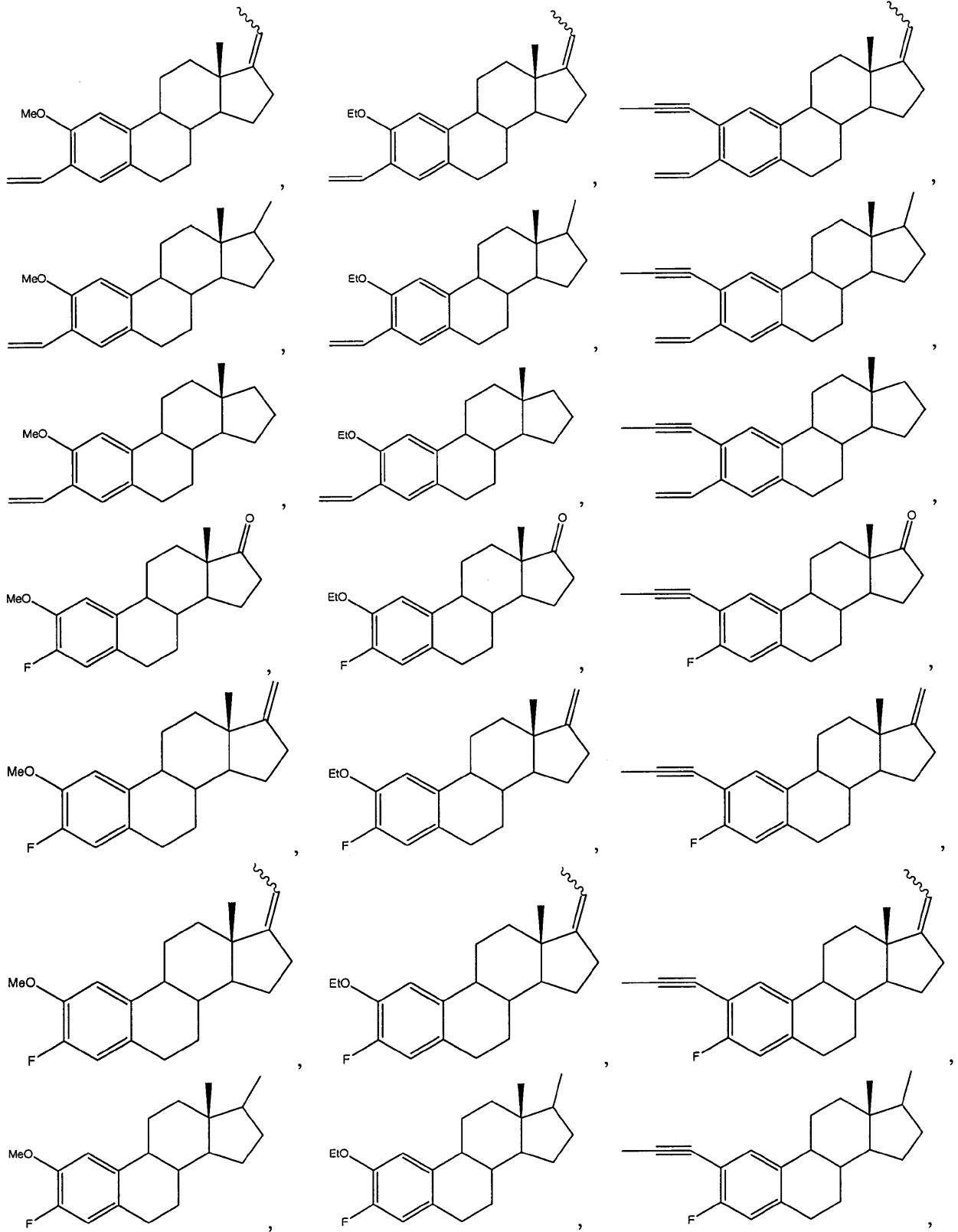
【化 40】



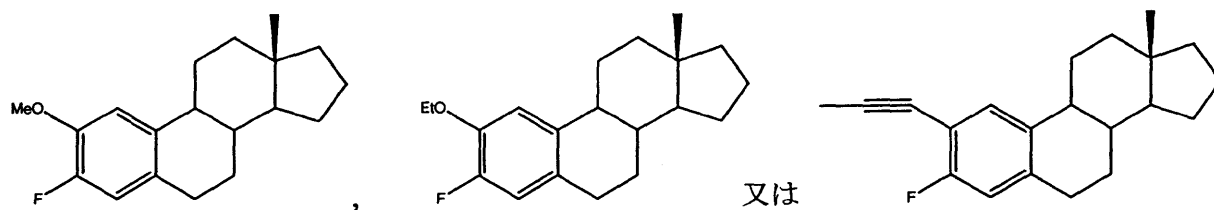
【化 4 1】



【化 4 2】



【化 4 3】



で表される化合物を含む、ヒトまたは動物において腫瘍を治療するための医薬品。

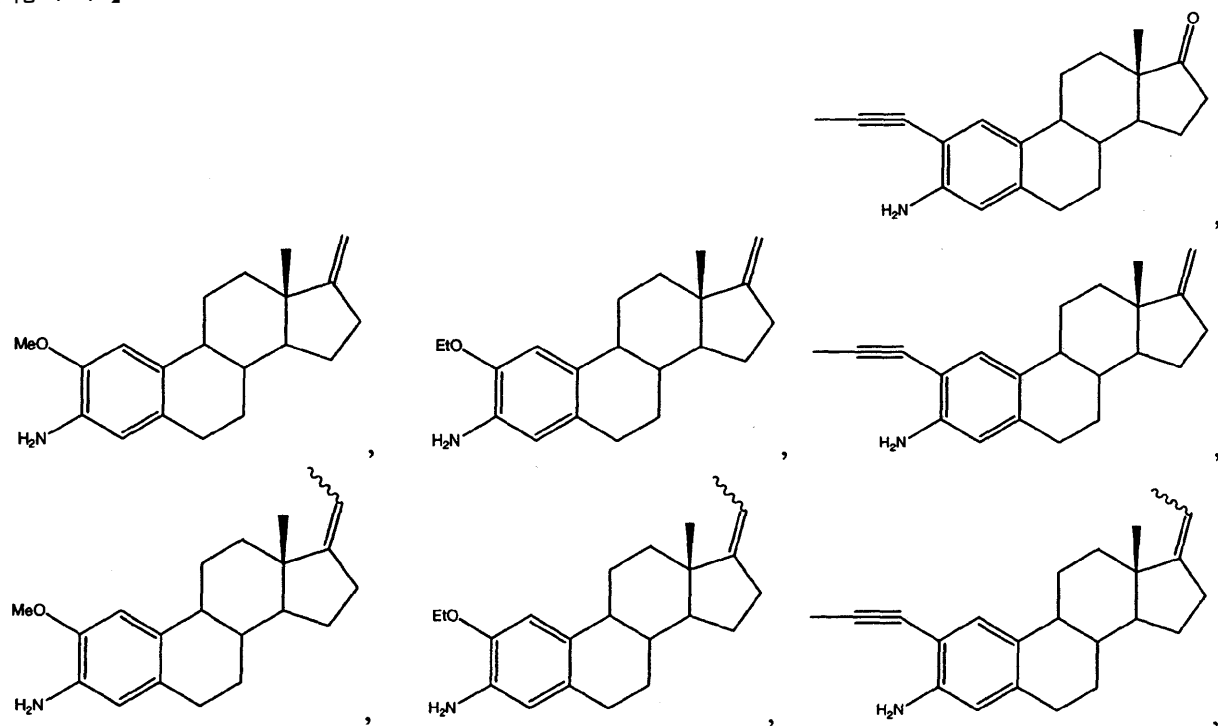
【請求項 2 8】

前記腫瘍は、血液性の腫瘍、癌性の血液性の腫瘍、固形腫瘍、良性腫瘍、又は癌性腫瘍である、請求項 2 7 に記載の医薬品。

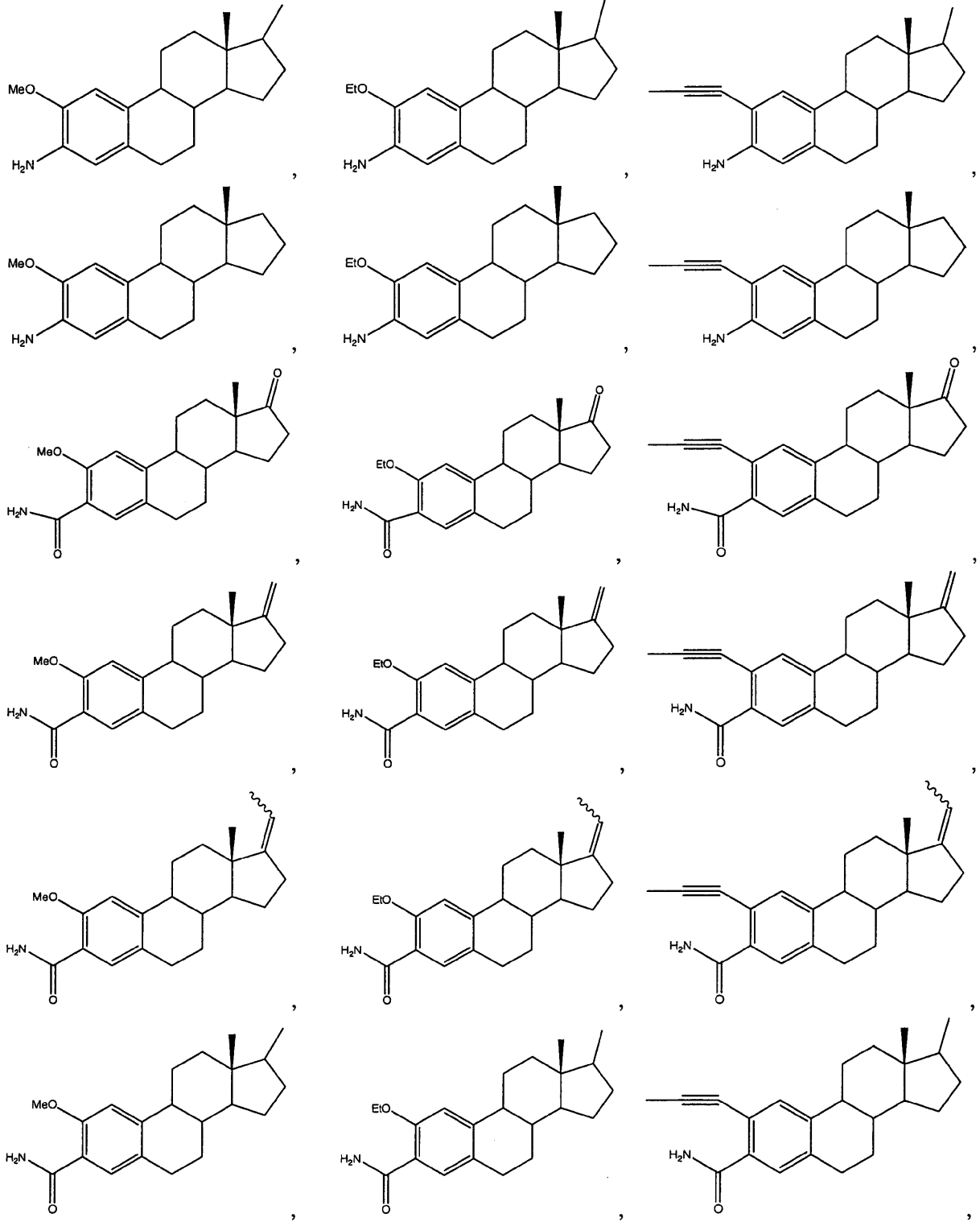
【請求項 2 9】

下記の

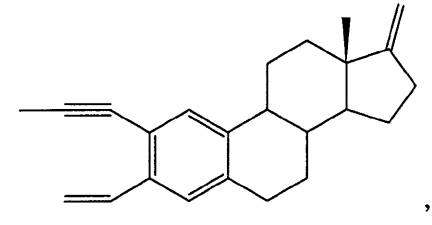
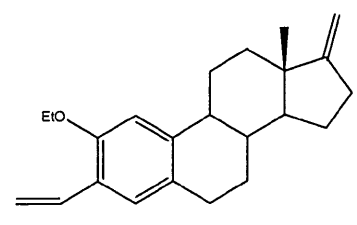
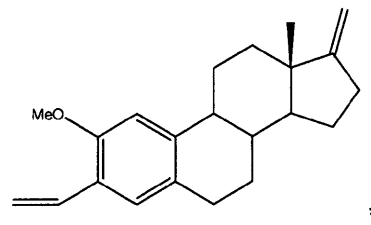
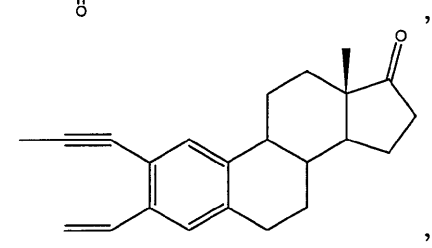
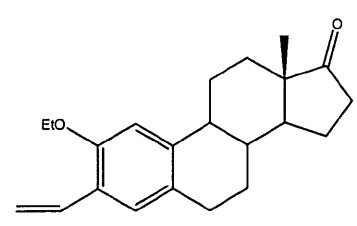
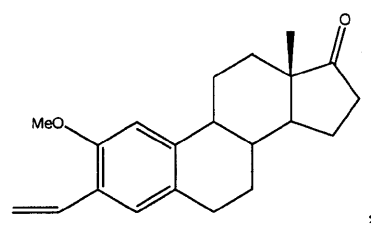
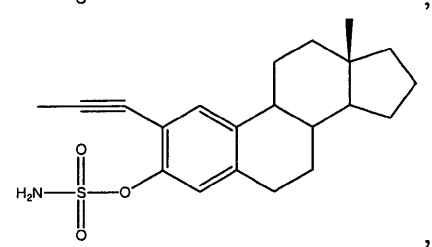
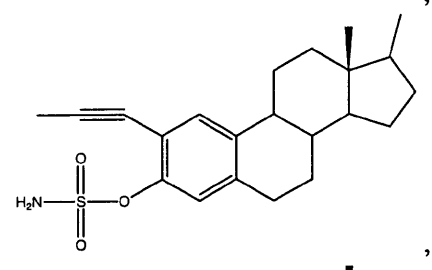
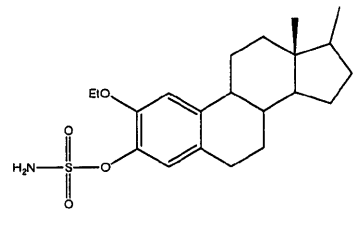
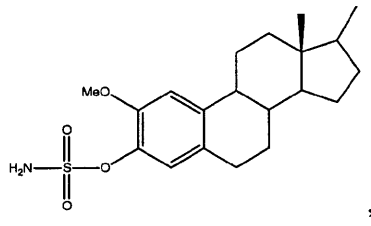
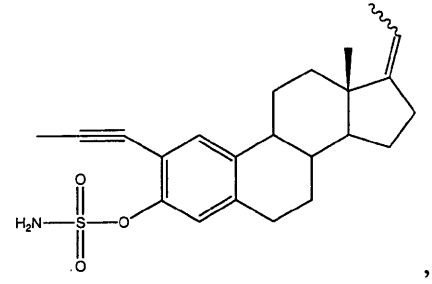
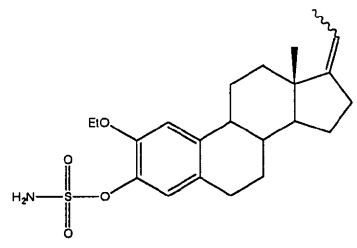
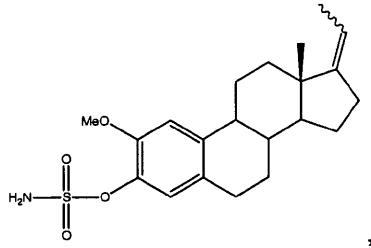
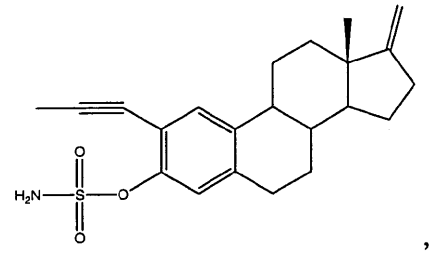
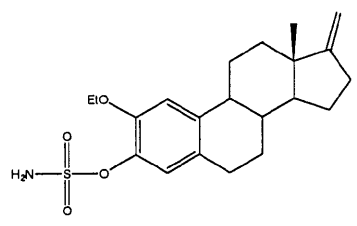
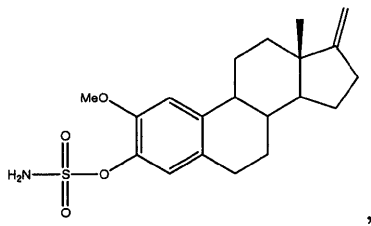
【化 4 4】



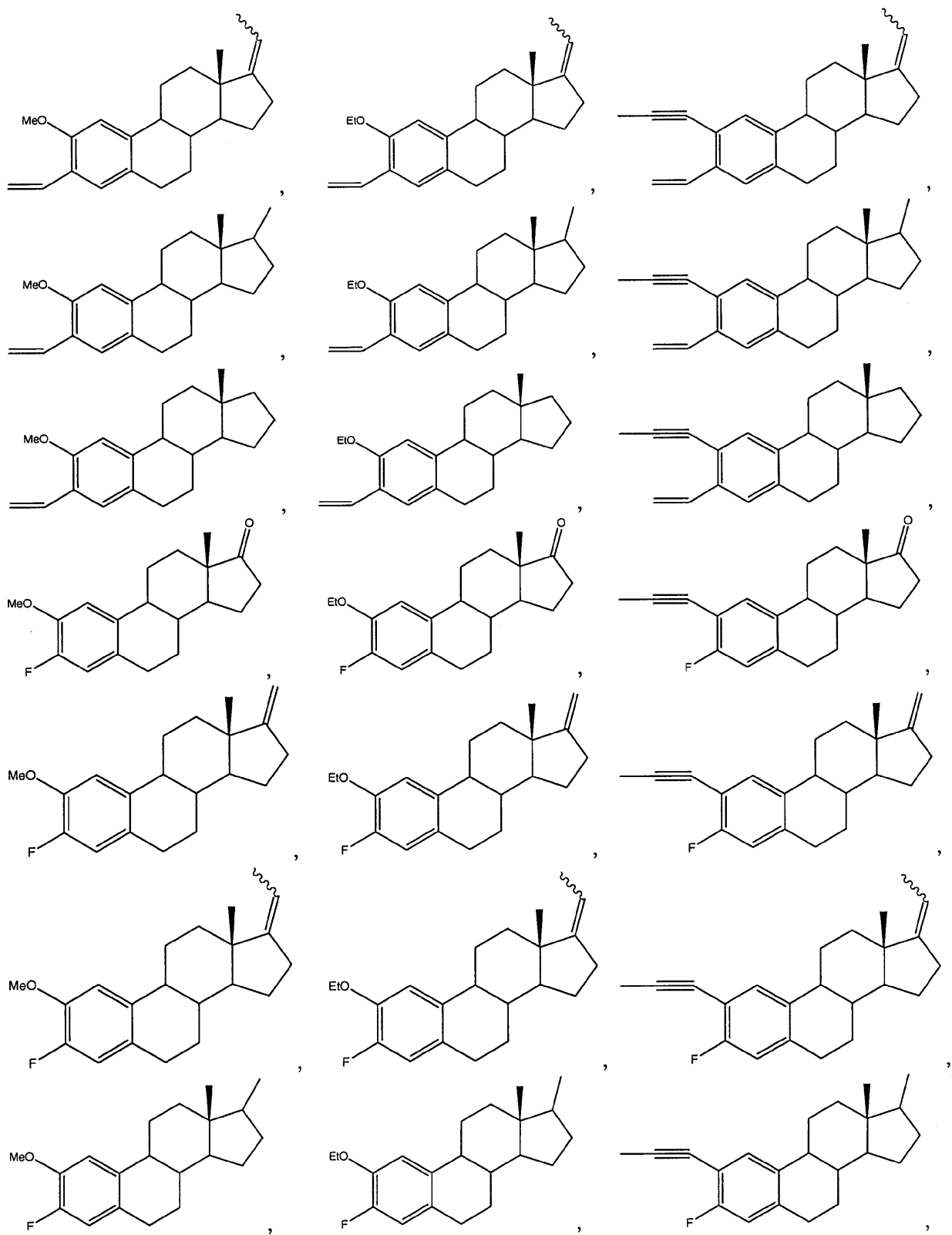
【化 4 5】



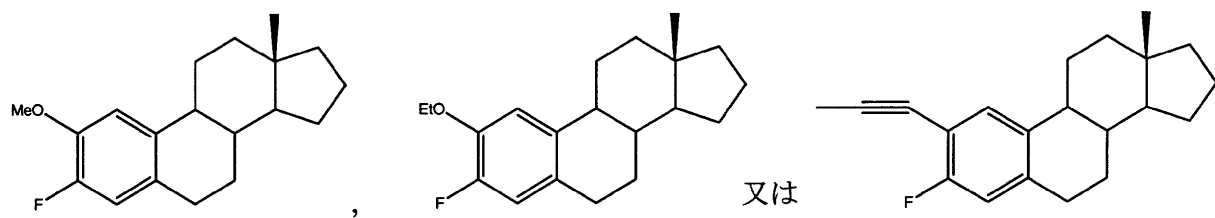
【化 47】



【化 4 8】



【化 4 9】

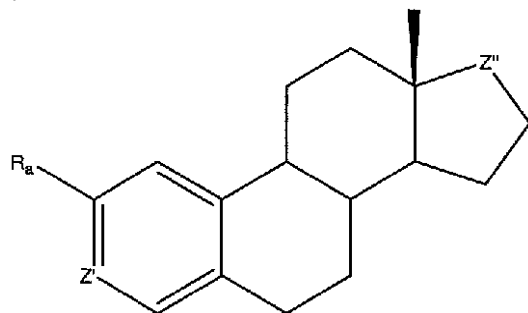


から選択される化合物を含む、ヒトまたは動物において細胞の異常な有糸分裂を抑制するための医薬品。

【請求項 30】

薬学的キャリアまたは賦形剤、および下記の化学式

【化 50】



式中、 R_a は、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ または $-CCCH_3$ から選択され、

Z' は、 $>C-F$ 、 $>C-NH_2$ 、 $>CCONH_2$ 、 $>C-NHCOH$ 、 $>C-OSO_2NH_2$ または $>C-CHCH_2$ から選択され、

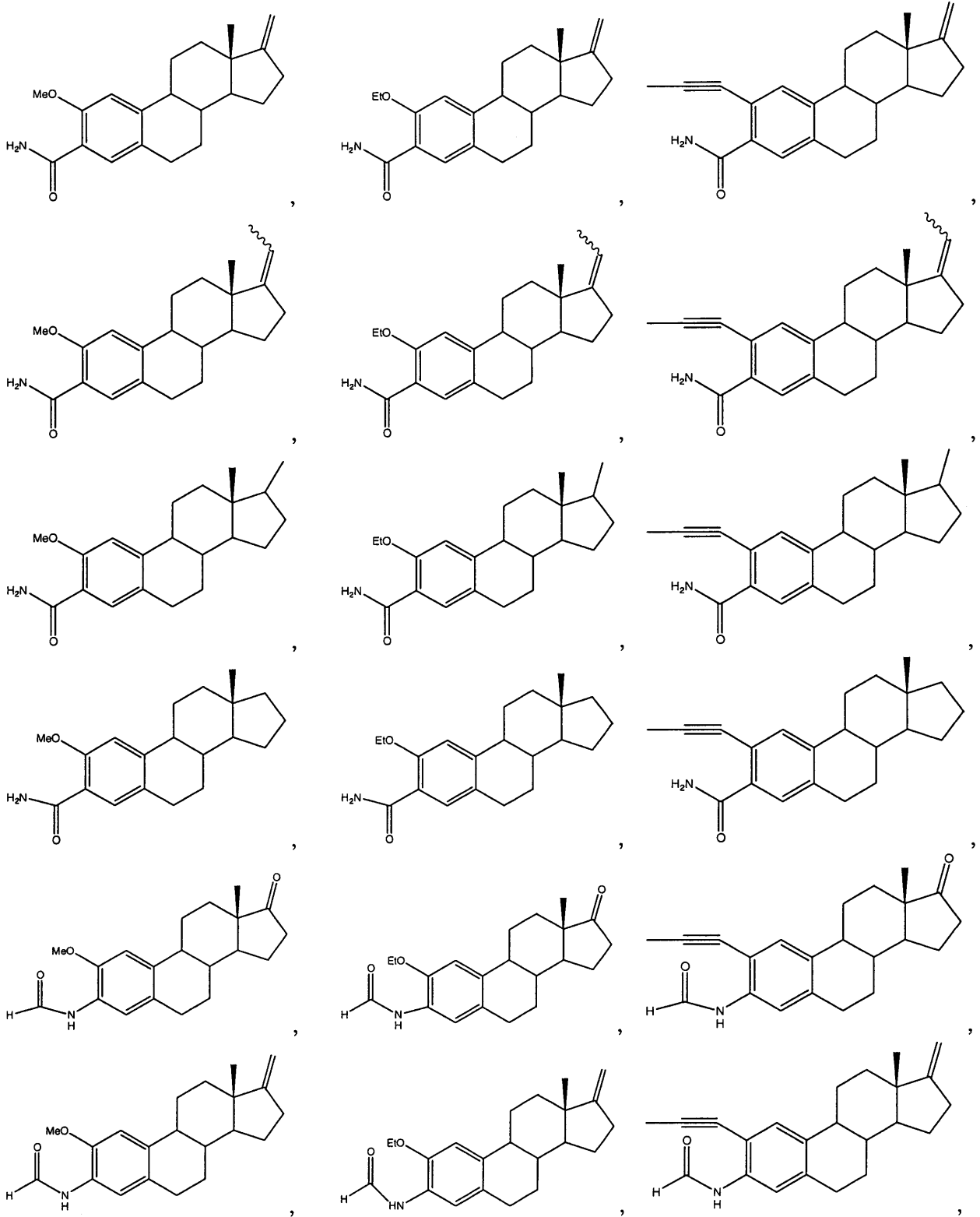
Z'' は、 $>C(H_2)$ 、 $>C(H)-CH_3$ 、 $>C=CH_2$ 、 $>C=CHCH_3$ または $>C=O$ から選択されるが、但し、 Z' が $>C-OSO_2NH_2$ であり、かつ Z'' が $>C(H_2)$ または $>C=O$ である場合、 R_a は、 $-OCH_3$ でも $-OCH_2CH_3$ でもなく、 Z' が $>C-NH_2$ である場合、 Z'' は $>C=O$ ではない

で表される化合物を含む薬学的組成物であって、該化合物の含有量は、ヒトまたは動物に対して、1日の単位量、1日の単位量未満の量、又はそれを適当に分割した量で投与した場合に有効な量であることを特徴とする、薬学的組成物。

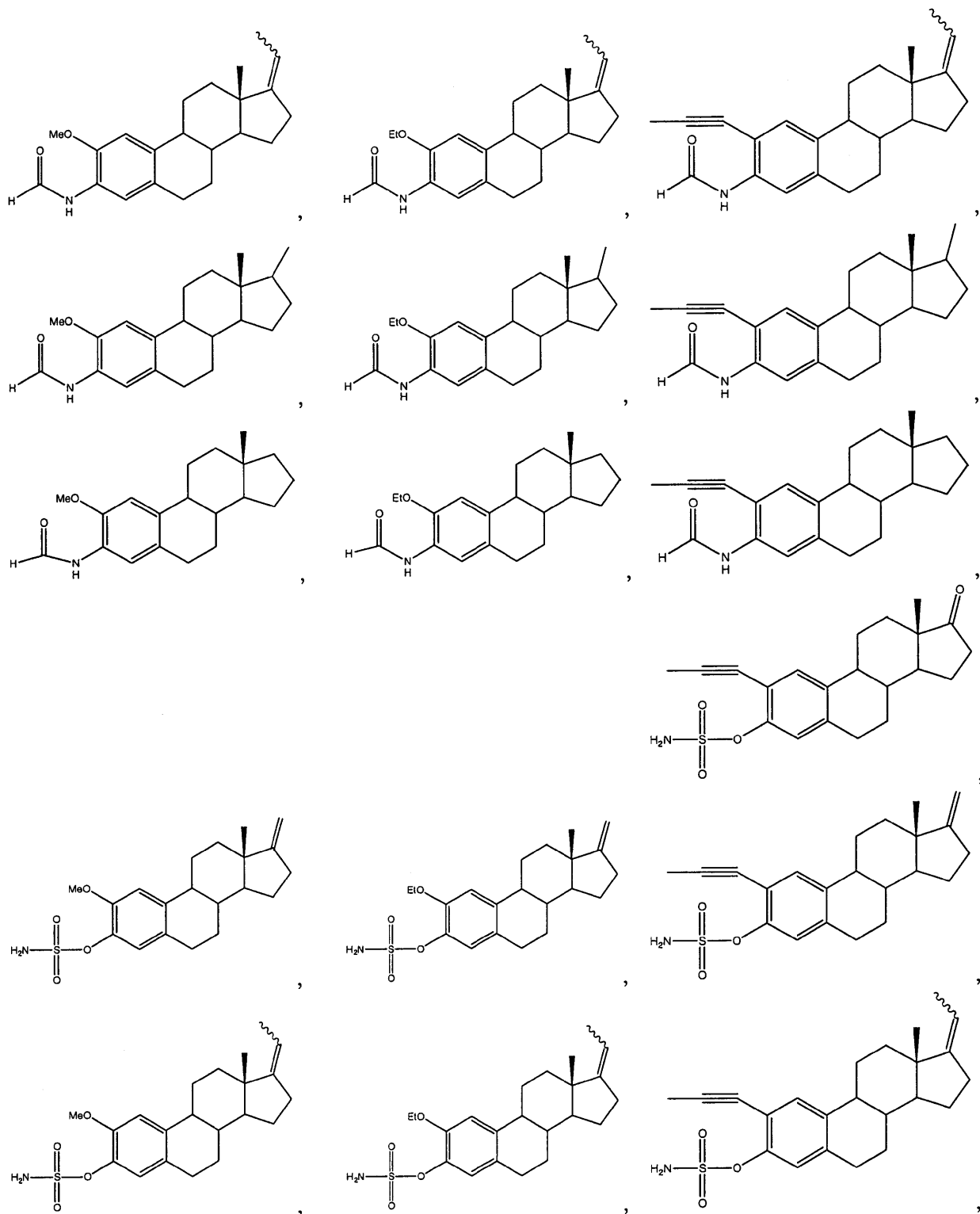
【請求項 31】

薬学的キャリアまたは賦形剤、および下記の

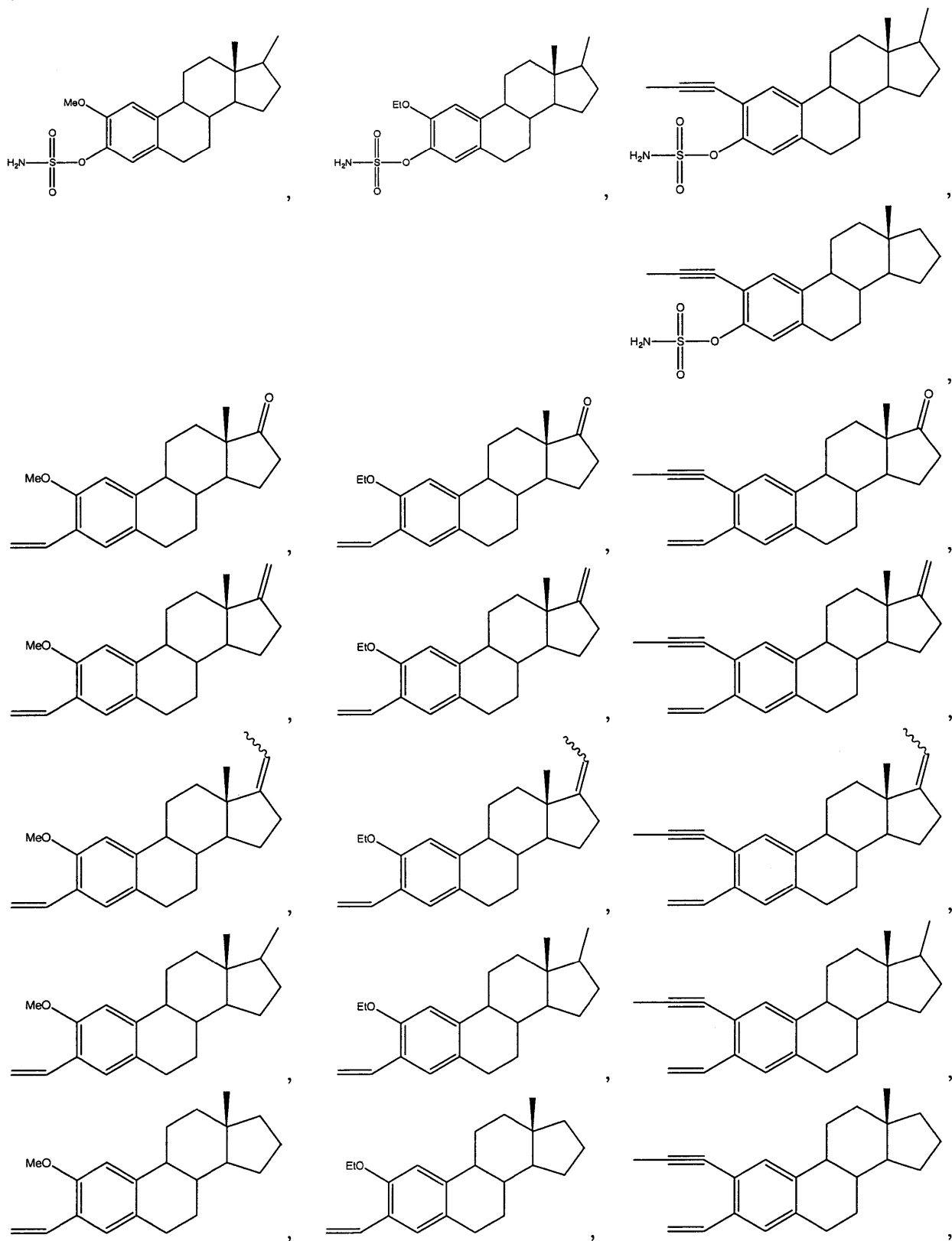
【化 5 2】



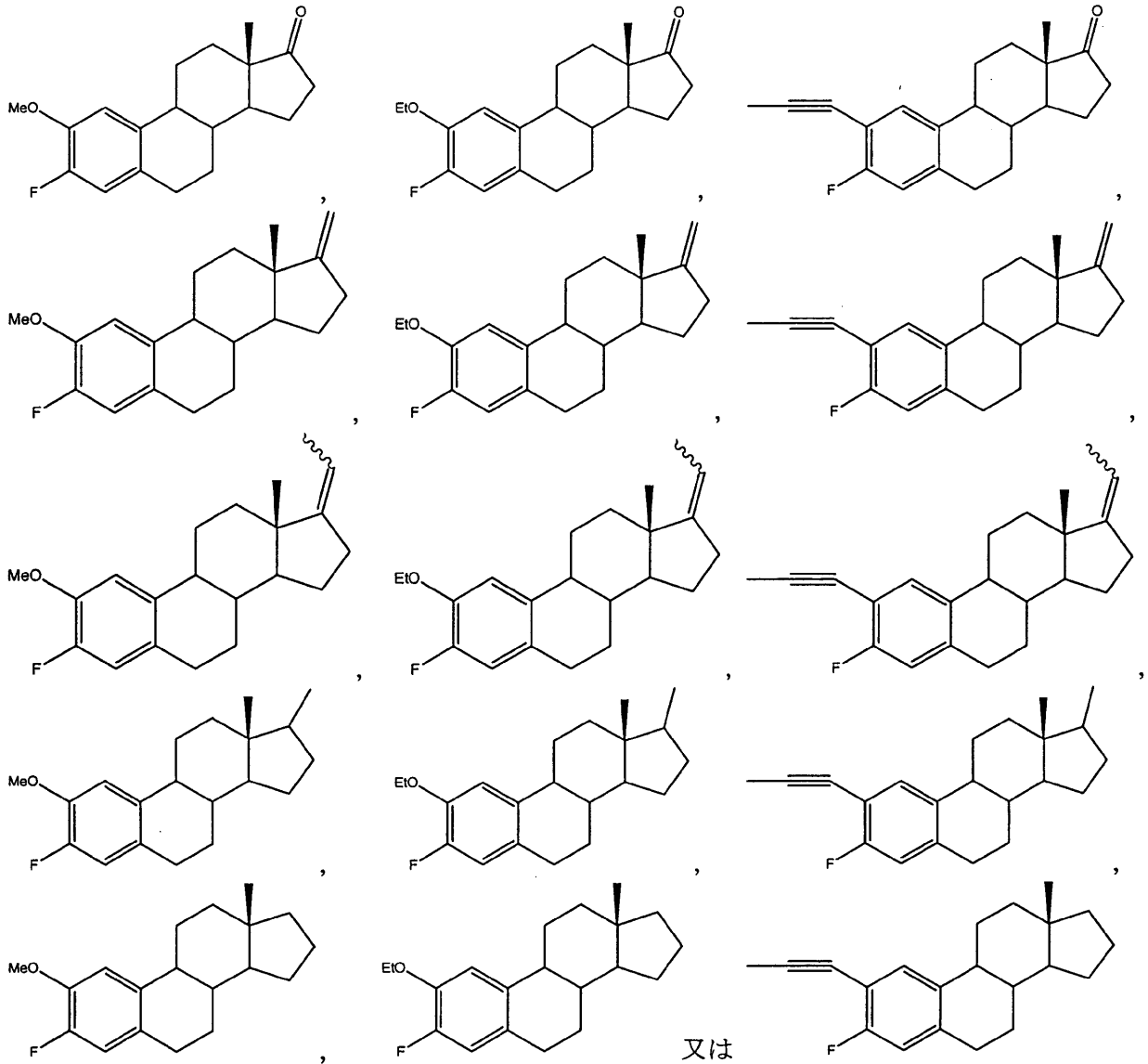
【化 5 3】



【化 5 4】



【化 5 5】



から選択される化合物を含む薬学的組成物であって、該化合物の含有量は、ヒトまたは動物に対して、1日の単位量、1日の単位量未満の量、又はそれを適当に分割した量で投与した場合に有効な量であることを特徴とする、薬学的組成物。