

【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25年5月2日 (2013.5.2)

【公表番号】特表2011-530535(P2011-530535A)

【公表日】平成23年12月22日 (2011.12.22)

【年通号数】公開・登録公報2011-051

【出願番号】特願2011-522277(P2011-522277)

【国際特許分類】

C 07 J 19/00 (2006.01)

A 61 K 47/40 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 37/08 (2006.01)

A 61 P 9/14 (2006.01)

A 61 P 11/00 (2006.01)

A 61 P 11/06 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 P 13/08 (2006.01)

A 61 P 37/00 (2006.01)

A 61 P 1/14 (2006.01)

A 61 P 11/04 (2006.01)

A 61 P 11/02 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 21/00 (2006.01)

A 61 P 17/00 (2006.01)

A 61 P 27/16 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 37/06 (2006.01)

A 61 P 7/06 (2006.01)

A 61 P 7/00 (2006.01)

A 61 P 1/18 (2006.01)

A 61 P 13/12 (2006.01)

A 61 P 17/06 (2006.01)

A 61 P 1/02 (2006.01)

A 61 P 1/16 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

A 61 K 31/7048 (2006.01)

【 F I 】

C 07 J 19/00 C S P

A 61 K 47/40

A 61 P 35/00

A 61 P 37/08

A 61 P 9/14

A 61 P 11/00

A 61 P 11/06

A 61 P 1/04

A 61 P 13/08

A 6 1 P 37/00
A 6 1 P 1/14
A 6 1 P 11/04
A 6 1 P 11/02
A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 21/00
A 6 1 P 17/00
A 6 1 P 27/16
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 37/06
A 6 1 P 7/06
A 6 1 P 7/00
A 6 1 P 1/18
A 6 1 P 13/12
A 6 1 P 17/06
A 6 1 P 1/02
A 6 1 P 1/16
A 6 1 P 29/00 1 0 1
A 6 1 P 19/02
A 6 1 P 3/10
A 6 1 P 9/00
A 6 1 K 31/7048

【手続補正書】

【提出日】平成24年3月30日(2012.3.30)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 0 5

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 0 5】

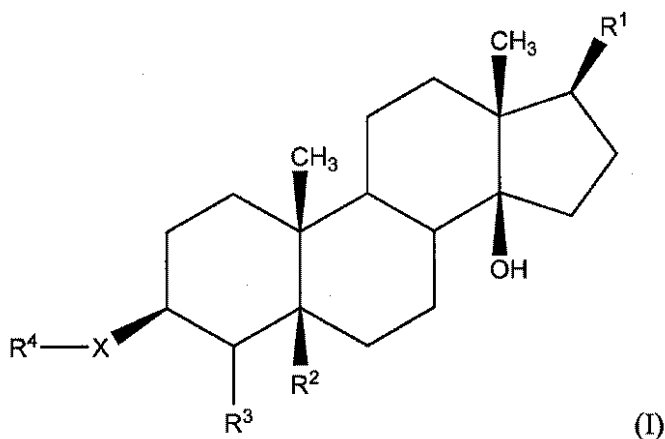
さらなる実施形態において、本発明は、式(I)および式(II)のグリコシドを調製するための方法を提供する。一実施形態において、該グリコシドは、CEN08-177、CEN08-178、CEN08-193、CEN08-243、CEN08-244からなる群から選択される。

本発明は、例えば以下の項目を提供する。

(項目1)

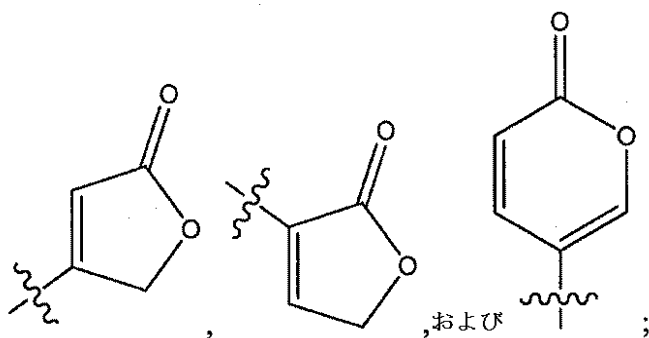
式Iの化合物

【化 5 5】



またはその医薬上許容されるエステル、複合体、水和物、プロドラッグ、溶媒和物、もしくは塩であって、式中、 R^1 は、

【化 5 6】

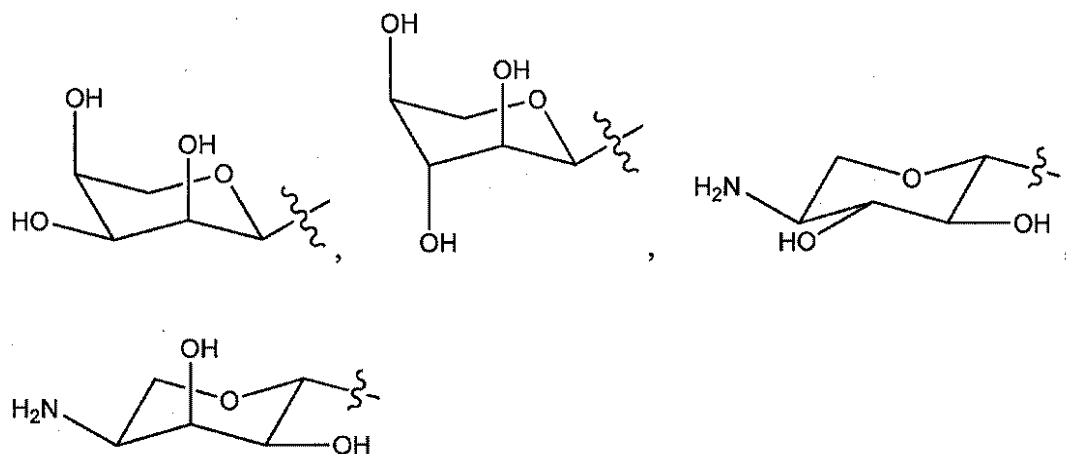


からなる群から選択され、

R^2 および R^3 はそれぞれ、水素であるか、あるいは、 R^2 および R^3 は、その結合した炭素と一緒に、炭素 - 炭素間の二重結合を示し、

R^4 は、

【化 5 7】



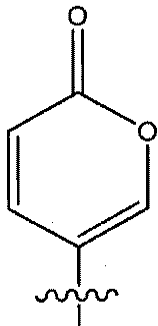
ならびにそれらのエピマーおよび配座異性体からなる群から選択され、

X は、 O または NR^5 であり、式中、 R^5 は、水素、メチル、エチル、またはプロピルである、化合物またはその医薬上許容されるエステル、複合体、水和物、プロドラッグ、溶媒和物、もしくは塩。

(項目 2)

式 I の化合物であって、式中、 $X = \text{NMe}$ である場合、 R^1 は、

【化 5 8】



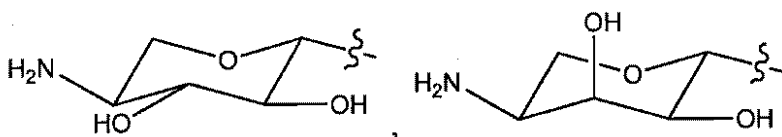
であり、

R^2 および R^3 は、その結合した炭素と一緒にあって、炭素 - 炭素間の二重結合を示し

、

R^4 は、

【化 5 9】

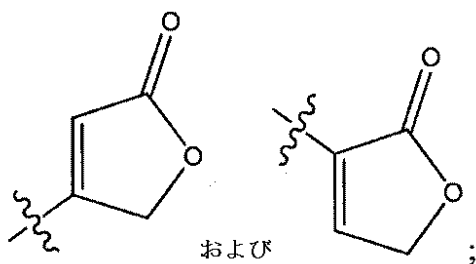


ならびにそれらのエピマーおよび配座異性体からなる群から選択される、化合物。

(項目 3)

項目 1 に記載の化合物であって、式中、 $X = \text{O}$ である場合、 R^1 は、

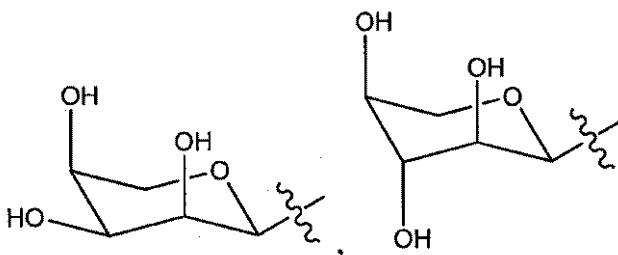
【化 6 0】



からなる群から選択され、

R^2 および R^3 はそれぞれ、水素であり、 R^4 は、

【化 6 1】



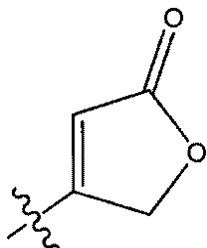
ならびにそれらのエピマーおよび配座異性体からなる群から選択される。

(項目 4)

項目 3 に記載の化合物であって、式中、

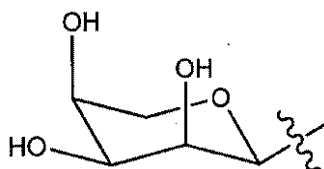
R^1 は、

【化 6 2】



であり、 R^4 は、

【化 6 3】



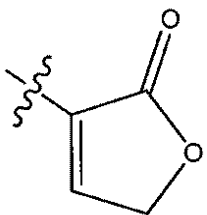
およびそのエピマーおよび配座異性体から選択される。

(項目 5)

項目 3 に記載の化合物であって、式中、

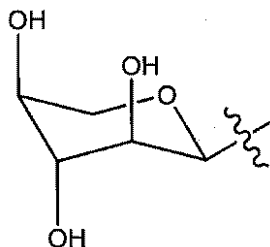
R^1 は、

【化 6 4】



であり、 R^4 は、

【化 6 5】



およびそのエピマーおよび配座異性体から選択される。

(項目 6)

項目 1 ～ 5 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物および少なくとも 1 つの医薬上許容される賦形剤を含む、医薬組成物。

(項目 7)

前記少なくとも 1 つの医薬上許容される賦形剤は、シクロデキストリンである、項目 6 に記載の医薬組成物。

(項目 8)

治療を必要とする被験者における過剰増殖性疾患を治療する方法であって、前記被験者に、項目 1 ～ 5 のうちのいずれか 1 項に記載の治療有効量の化合物を投与することを含む、方法。

(項目 9)

治療を必要とする被験者における過剰増殖性疾患を治療する方法であって、前記被験者に対して、項目 6 に記載の治療有効量の医薬組成物を投与することを含む、方法。

(項目 10)

項目 8 および 9 のいずれか 1 項に記載の方法であって、前記過剰増殖性疾患は、アレルギー性血管炎および肉芽腫症（チャグ・ストラウス病）、石綿肺症、喘息、萎縮性胃炎、良性前立腺肥大症、水疱性類天疱瘡、セリアック病、慢性気管支炎および慢性閉塞性気道疾患、慢性副鼻腔炎、クローン病、脱髄性ニューロパチー、皮膚筋炎、アトピー性皮膚炎を含む湿疹、耳管疾患、巨細胞性動脈炎、移植片拒絶反応、過敏性肺炎、過敏性血管炎（ヘノッホ・シェンライン紫斑病）、刺激性皮膚炎、炎症性溶血性貧血、炎症性好中球減少症、炎症性腸疾患、川崎病、多発性硬化症、心筋炎、筋炎、鼻ポリープ、鼻涙管疾患、腫瘍性脈管炎、膵臓炎、尋常性天疱瘡、原発性糸球体腎炎、乾癬、歯周病、多発性嚢胞腎、結節性多発動脈炎、多発性血管炎オーバーラップ症候群、原発性硬化性胆管炎、リウマチ性関節炎、血清病、外科的癒着、狭窄もしくは再狭窄、強膜炎、強皮症、胆管狭窄、（十二指腸、小腸、および結腸の）狭窄、珪肺症および他の形態の塵肺症、1 型糖尿病、潰瘍性大腸炎、潰瘍性直腸炎、結合組織病に関連する脈管炎、補体系の先天性欠損に関連する脈管炎、中枢神経系の脈管炎、ならびにウェゲナー肉芽腫症からなる群から選択される。

。

(項目 11)

前記過剰増殖性疾患は、乾癬、多発性硬化症、リウマチ性関節炎、再狭窄、および良性前立腺肥大症から選択される、項目 10 に記載の方法。

(項目 12)

前記過剰増殖性疾患は、癌である、項目 11 に記載の方法。

(項目 13)

前記癌は、結腸直腸癌、非小細胞癌、肺癌、卵巣癌、乳癌、結腸癌、中枢神経系の癌、肝臓癌、および腎臓癌から選択される、項目 12 に記載の方法。

(項目 14)

過剰増殖性疾患の治療のための医薬の製造における、項目 1 ～ 5 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

(項目 15)

前記過剰増殖性疾患は、癌である、項目 14 に記載の使用。

(項目 16)

前記癌は、結腸直腸癌、非小細胞癌、肺癌、卵巣癌、乳癌、結腸癌、中枢神経系の癌、肝臓癌、肺癌、および腎臓癌から選択される、項目 15 に記載の使用。

【 手続補正 2 】

【 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

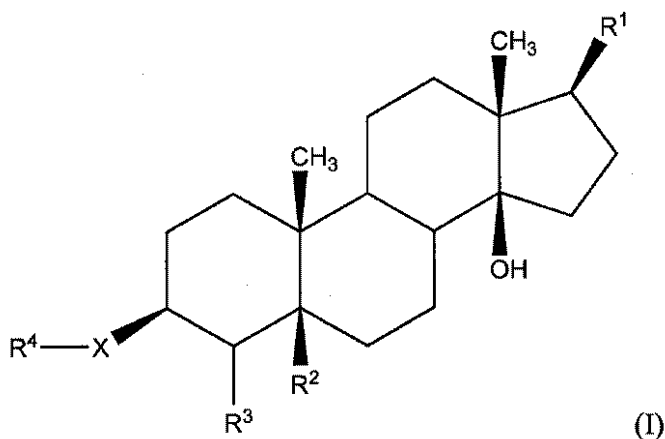
【 補正の内容 】

【 特許請求の範囲 】

【 請求項 1 】

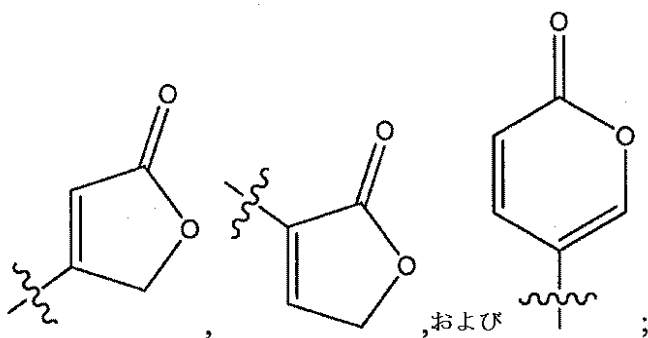
式 I の化合物

【化 5 5】



またはその医薬上許容されるエステル、複合体、水和物、プロドラッグ、溶媒和物、もしくは塩であって、式中、 R^1 は、

【化 5 6】

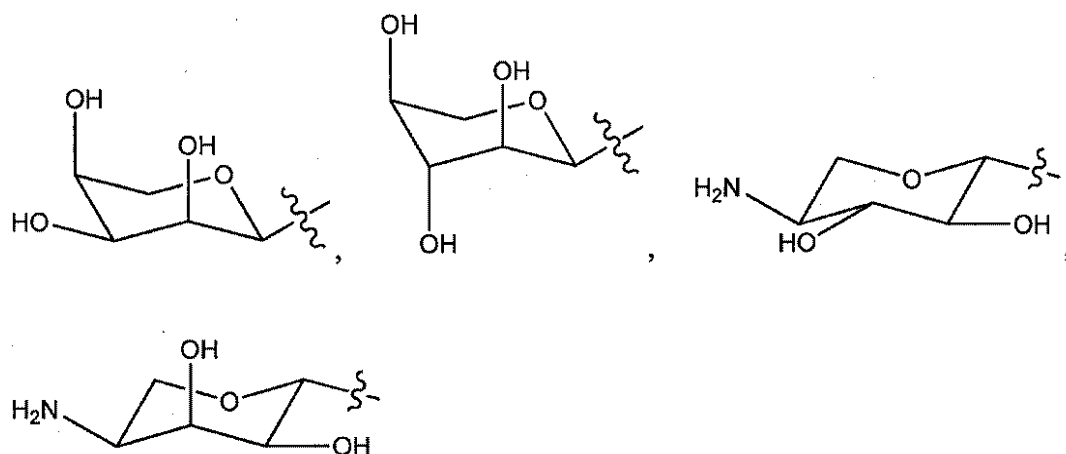


からなる群から選択され、

R^2 および R^3 はそれぞれ、水素であるか、あるいは、 R^2 および R^3 は、その結合した炭素と一緒に、炭素 - 炭素間の二重結合を示し、

R^4 は、

【化 5 7】



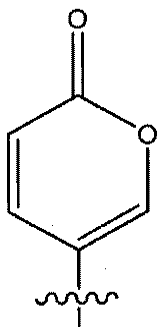
ならびにそれらのエピマーおよび配座異性体からなる群から選択され、

X は、 O または NR^5 であり、式中、 R^5 は、水素、メチル、エチル、またはプロピルである、化合物またはその医薬上許容されるエステル、複合体、水和物、プロドラッグ、溶媒和物、もしくは塩。

【請求項 2】

式 I の化合物であって、式中、 $X = NMe$ である場合、 R^1 は、

【化 5 8】

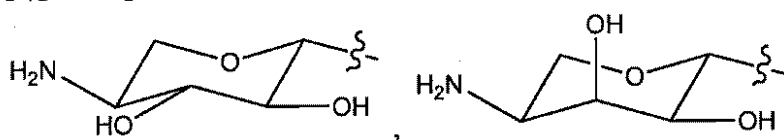


であり、

R^2 および R^3 は、その結合した炭素と一緒にあって、炭素 - 炭素間の二重結合を示し

R^4 は、

【化 5 9】

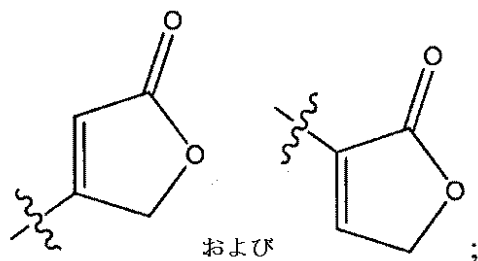


ならびにそれらのエピマーおよび配座異性体からなる群から選択される、化合物。

【請求項 3】

請求項 1 に記載の化合物であって、式中、 $X = O$ である場合、 R^1 は、

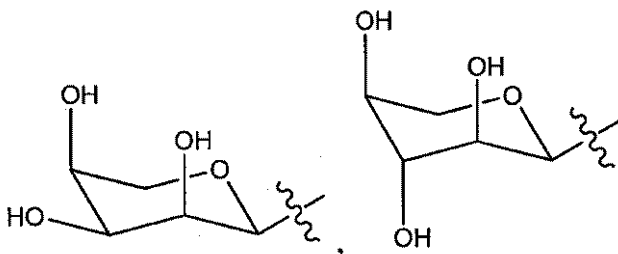
【化 6 0】



からなる群から選択され、

R^2 および R^3 はそれぞれ、水素であり、 R^4 は、

【化 6 1】



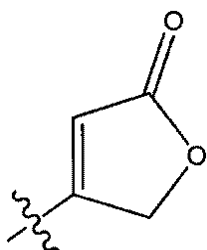
ならびにそれらのエピマーおよび配座異性体からなる群から選択される、化合物。

【請求項 4】

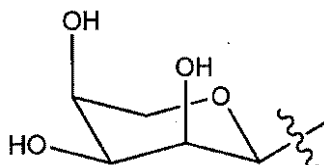
請求項 3 に記載の化合物であって、式中、

R^1 は、

【化 6 2】

であり、 R^4 は、

【化 6 3】

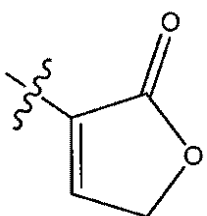
およびそのエピマーおよび配座異性体から選択される、化合物。

【請求項 5】

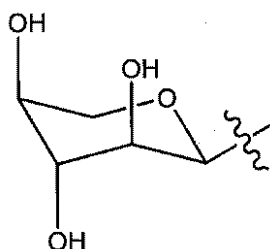
請求項 3 に記載の化合物であって、式中、

 R^1 は、

【化 6 4】

であり、 R^4 は、

【化 6 5】

およびそのエピマーおよび配座異性体から選択される、化合物。

【請求項 6】

請求項 1 ～ 5 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物および少なくとも 1 つの医薬上許容される賦形剤を含む、医薬組成物。

【請求項 7】

前記少なくとも 1 つの医薬上許容される賦形剤は、シクロデキストリンである、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

治療を必要とする被験者における過剰増殖性疾患を治療するための組成物であって、請求項 1 ～ 5 のうちのいずれか 1 項に記載の治療有効量の化合物を含む、組成物。

【請求項 9】

治療を必要とする被験者における過剰増殖性疾患を治療するための組成物であって、請求項 6 に記載の治療有効量の医薬組成物を含む、組成物。

【請求項 10】

請求項 8 および 9 のいずれか 1 項に記載の組成物であって、前記過剰増殖性疾患は、アレルギー性血管炎および肉芽腫症（チャージ・ストラウス病）、石綿肺症、喘息、萎縮性胃炎、良性前立腺肥大症、水疱性類天疱瘡、セリアック病、慢性気管支炎および慢性閉塞性気道疾患、慢性副鼻腔炎、クローン病、脱髄性ニューロパチー、皮膚筋炎、アトピー性皮膚炎を含む湿疹、耳管疾患、巨細胞性動脈炎、移植片拒絶反応、過敏性肺炎、過敏性血管炎（ヘノッホ・シェーンライン紫斑病）、刺激性皮膚炎、炎症性溶血性貧血、炎症性好中球減少症、炎症性腸疾患、川崎病、多発性硬化症、心筋炎、筋炎、鼻ポリープ、鼻涙管疾患、腫瘍性脈管炎、脾臓炎、尋常性天疱瘡、原発性糸球体腎炎、乾癬、歯周病、多発性嚢胞腎、結節性多発動脈炎、多発性血管炎オーバーラップ症候群、原発性硬化性胆管炎、リウマチ性関節炎、血清病、外科的癒着、狭窄もしくは再狭窄、強膜炎、強皮症、胆管狭窄、（十二指腸、小腸、および結腸の）狭窄、珪肺症および他の形態の塵肺症、1 型糖尿病、潰瘍性大腸炎、潰瘍性直腸炎、結合組織病に関連する脈管炎、補体系の先天性欠損に関連する脈管炎、中枢神経系の脈管炎、ならびにウェゲナー肉芽腫症からなる群から選択される、組成物。

【請求項 11】

前記過剰増殖性疾患は、乾癬、多発性硬化症、リウマチ性関節炎、再狭窄、および良性前立腺肥大症から選択される、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 12】

前記過剰増殖性疾患は、癌である、請求項 11 に記載の組成物。

【請求項 13】

前記癌は、結腸直腸癌、非小細胞癌、肺癌、卵巣癌、乳癌、結腸癌、中枢神経系の癌、肝臓癌、および腎臓癌から選択される、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 14】

過剰増殖性疾患の治療のための医薬の製造における、請求項 1～5 のうちのいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 15】

前記過剰増殖性疾患は、癌である、請求項 14 に記載の使用。

【請求項 16】

前記癌は、結腸直腸癌、非小細胞癌、肺癌、卵巣癌、乳癌、結腸癌、中枢神経系の癌、肝臓癌、肺癌、および腎臓癌から選択される、請求項 15 に記載の使用。