

【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 5 月 10 日 (2007.5.10)

【公表番号】特表 2006-519824 (P2006-519824A)

【公表日】平成 18 年 8 月 31 日 (2006.8.31)

【年通号数】公開・登録公報 2006-034

【出願番号】特願 2006-505924 (P2006-505924)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/7076 (2006.01)

C 0 7 H 19/167 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/08 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 21/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 19/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 39/02 (2006.01)

A 6 1 P 33/06 (2006.01)

A 6 1 P 37/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 7/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 21/04 (2006.01)

A 6 1 P 29/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/02 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

C 0 7 H 19/173 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/7076

C 0 7 H 19/167

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 9/08

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	43/00	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	21/02	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	19/06	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	39/02	
A 6 1 P	33/06	
A 6 1 P	37/04	
A 6 1 P	31/18	
A 6 1 P	7/00	
A 6 1 P	19/00	
A 6 1 P	9/10	1 0 3
A 6 1 P	21/04	
A 6 1 P	29/02	
A 6 1 P	25/02	1 0 1
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	19/10	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
C 0 7 H	19/173	

【手続補正書】

【提出日】平成19年3月5日(2007.3.5)

【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】

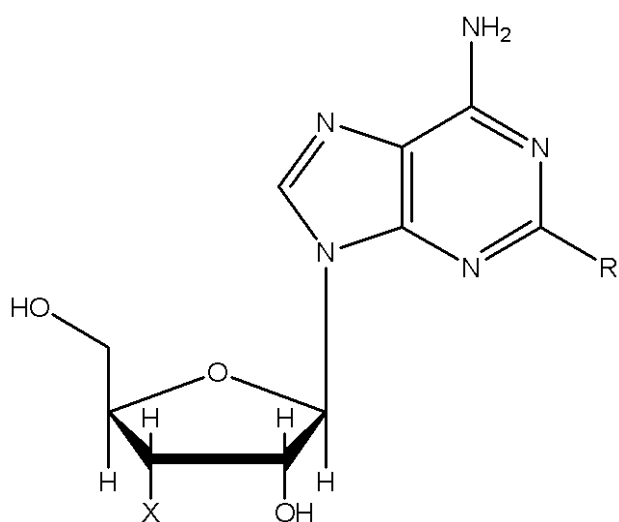
【特許請求の範囲】

【請求項1】

癌、炎症、自己免疫疾患、虚血再灌流損傷、てんかん、敗血症、敗血症ショック、神経変性（アルツハイマー病を含む）、筋肉疲労または筋肉痙攣の予防、治療または改善のための薬剤製造における、式（I）：

【化 1】

(I)



[式中、R は C_{1-4} アルコキシおよび X は OH である]

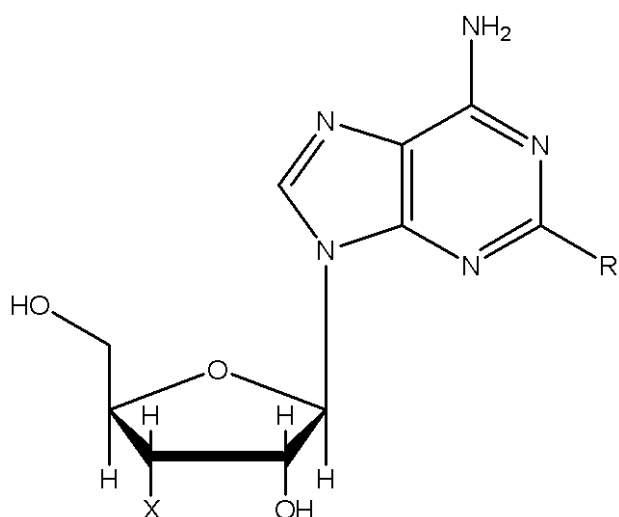
の化合物の使用であって、対象へ投与後に、アデノシン受容体の化合物の pH 7.4 での EC50 値より低いピーク血漿濃度しか生じない量で投与される、化合物の使用。

【請求項 2】

癌、炎症、自己免疫疾患、虚血再灌流損傷、てんかん、敗血症、敗血症ショック、神経変性（アルツハイマー病を含む）、筋肉疲労または筋肉痙攣の予防、治療または改善のための薬剤製造における、式（II）：

【化 2】

(II)



[式中、R は C_{1-4} アルコキシおよび X は H である]

の化合物の使用であって、対象へ投与後に、アデノシン受容体の化合物の pH 7.4 での EC50 値より低いピーク血漿濃度しか生じない量で投与される、化合物の使用。

【請求項 3】

化合物が 2 - メトキシアデノシン、2 - エトキシアデノシン、または 2 - ブチルオキシアデノシンである、請求項 1 に記載の使用。

【請求項 4】

化合物が 3' - デオキシ - 2 - プロポキシアデノシン、3' - デオキシ - 2 - イソプロポキシアデノシン、または 3' - デオキシ - 2 - ブトキシアデノシンである、請求項 2 に記載の使用。

【請求項 5】

関節炎、腸炎、関節リウマチ、骨関節炎、リュウマチ様脊椎炎、痛風性関節炎および他の関節炎状態、乾癬、喘息、慢性閉塞性肺疾患、線維症、多発性硬化症、内毒素ショック、グラム陰性のショック、毒素ショック、出血性ショック、成人呼吸窮迫症候群、脳性マラリア、TNFにより増強したHIV複製、AZTおよびDDI活性のTNF阻害、器官移植の拒絶反応、癌悪液質、HIV、慢性肺性炎症性疾患、ケイ肺症、肺性肉腫、骨吸収の疾患、再灌流損傷（心筋梗塞、脳卒中のような虚血性症状後の再灌流に起因する器官損傷を含む）、自己免疫性損傷（多発性硬化症、ギランバレー症候群、重症筋無力症を含む）、移植片対宿主の拒絶反応、同種移植の拒絶反応、感染症起因の発熱および筋肉痛、感染症または悪性腫瘍に伴う悪液質、後天性免疫不全症候群（AIDS）に伴う悪液質、AIDS関連合併症（ARC）、ケロイド形成、瘢痕組織形成、クローン病、潰瘍性大腸炎およびパイレシス、過敏性腸症候群、骨粗鬆症、脳性マラリア、細菌性髄膜炎、アムホテリシンB治療の副作用、アルツハイマー病を含む神経変性疾患、インターロイキン-2治療の副作用、OKT3治療の副作用、およびGM-CSF治療の副作用の予防、治療または改善のための、前記請求項いずれかに記載の使用。

【請求項6】

アデノシン受容体の化合物のpH7.4でのEC50値の1000分の1ないし5分の1の間に、血漿濃度を1時間以上保つ量で化合物が投与される、前記請求項いずれかに記載の使用。

【請求項7】

投与されるべき対象と同種の動物において、徐脈、低血圧または頻脈の副作用を起こす化合物の最小血漿濃度の1000分の1ないし5分の1の間に、血漿濃度を1時間以上保つ量で化合物が投与される、請求項1ないし5いずれかに記載の使用。

【請求項8】

0.01ないし15mg/kgで投与される、前記請求項いずれかに記載の使用。

【請求項9】

0.1ないし2mg/kgで投与される、前記請求項いずれかに記載の使用。

【請求項10】

0.6ないし1.2mg/kgで投与される、前記請求項いずれかに記載の使用。

【請求項11】

薬剤が1ないし500mgの化合物を含む単位投与の形態である、前記請求項いずれかに記載の使用。

【請求項12】

500mgまでの量の2-メトキシアデノシン、および生理学上許容される担体、賦形剤または希釈剤を含む単位投与形である、医薬組成物。

【請求項13】

癌、炎症、自己免疫疾患、虚血再灌流損傷、てんかん、敗血症、敗血症ショック、神経変性（アルツハイマー病を含む）、筋肉疲労または筋肉痙攣の予防、治療または改善のための医薬組成物であって、請求項1ないし4いずれかで定義される化合物を含み、該化合物が、かかる予防、治療または改善を必要とする対象へ、対象中にアデノシン受容体の化合物のpH7.4でのEC50値より低いピーク血漿濃度しか生じない量で投与される、医薬組成物。

【請求項14】

関節炎、腸炎、関節リウマチ、骨関節炎、リュウマチ様脊椎炎、痛風性関節炎および他の関節炎状態、乾癬、喘息、慢性閉塞性肺疾患、線維症、多発性硬化症、内毒素ショック、グラム陰性のショック、毒素ショック、出血性ショック、成人呼吸窮迫症候群、脳性マラリア、TNFにより増強したHIV複製、AZTおよびDDI活性のTNF阻害、器官移植の拒絶反応、癌悪液質、HIV、慢性肺性炎症性疾患、ケイ肺症、肺性肉腫、骨吸収の疾患、再灌流損傷（心筋梗塞、脳卒中のような虚血性症状後の再灌流に起因する器官損傷を含む）、自己免疫性損傷（多発性硬化症、ギランバレー症候群、重症筋無力症を含む）、移植片対宿主の拒絶反応、同種移植の拒絶反応、感染症起因の発熱および筋肉痛、感

染症または悪性腫瘍に伴う悪液質、後天性免疫不全症候群（AIDS）に伴う悪液質、AIDS 関連合併症（ARC）、ケロイド形成、癬痕組織形成、クローン病、潰瘍性大腸炎およびパイレシス、過敏性腸症候群、骨粗鬆症、脳性マラリア、細菌性髄膜炎、アムホテリシン B 治療の副作用、インターロイキン - 2 治療の副作用、OKT3 治療の副作用、および GM - CSF 治療の副作用の予防、治療または改善のための、請求項 13 に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

アデノシン受容体の化合物の pH 7.4 での EC50 値の 1000 分の 1 ないし 5 分の 1 の間に、対象中に血漿濃度を 1 時間以上保つ量で化合物が投与される、請求項 13 または 14 に記載の医薬組成物。

【請求項 16】

投与されるべき対象と同種の動物において徐脈、低血圧または頻脈の副作用を起こす化合物の最小血漿濃度の 1000 分の 1 ないし 5 分の 1 の間に、対象中に血漿濃度を 1 時間以上保つ量で化合物が投与される、請求項 13 ないし 15 いずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 17】

化合物が 0.01 ないし 15 mg / kg で投与される、請求項 13 ないし 16 いずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 18】

化合物が 0.1 ないし 2 mg / kg で投与される、請求項 13 ないし 17 いずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 19】

化合物が 0.6 ないし 1.2 mg / kg で投与される、請求項 13 ないし 18 いずれかに記載の医薬組成物。

【請求項 20】

癌、炎症、虚血再灌流損傷、てんかん、敗血症、敗血症ショック、神経変性（アルツハイマー病を含む）、筋肉疲労または筋肉痙攣の予防、治療または改善のための薬剤を見出すための、請求項 1 ないし 4 いずれかで定義される化合物の使用。