

【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17年9月29日(2005.9.29)

【公開番号】特開2004-59439(P2004-59439A)

【公開日】平成16年2月26日(2004.2.26)

【年通号数】公開・登録公報2004-008

【出願番号】特願2002-216039(P2002-216039)

【国際特許分類第7版】

C 0 7 C 69/738

A 6 1 K 9/52

A 6 1 K 9/70

A 6 1 K 31/5575

A 6 1 K 47/40

A 6 1 P 19/00

C 0 7 C 69/96

C 0 7 C 235/06

// C 0 7 M 7:00

C 0 7 M 9:00

【F I】

C 0 7 C 69/738 A

A 6 1 K 9/52

A 6 1 K 9/70

A 6 1 K 31/5575

A 6 1 K 47/40

A 6 1 P 19/00

C 0 7 C 69/96 Z

C 0 7 C 235/06

C 0 7 M 7:00

C 0 7 M 9:00

【手続補正書】

【提出日】平成17年5月10日(2005.5.10)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

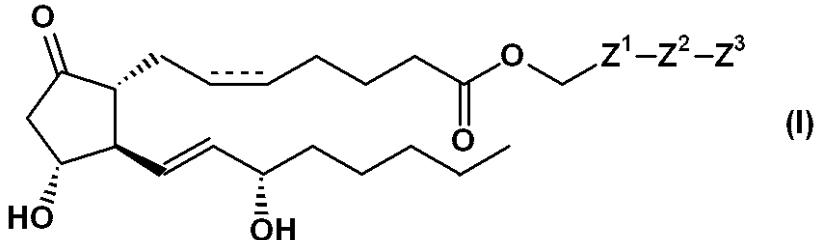
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(I)

【化1】



[式中、Z¹は

(1) 単結合、

(2) C 1 ~ 4 アルキレン基、

(3) C 2 ~ 4 アルケニレン基、または

(4) C 2 ~ 4 アルキニレン基を表し、

Z²は、

(1) - COO - 、

(2) - OCO - 、

(3) - CONR¹ - 、

(4) - N R²CO - 、

(5) - SO₂ - 、

(6) - SO₂NR³ - 、

(7) - NR⁴SO₂ - 、

(8) - NR⁵C(=O)NR⁶ - 、

(9) - NR⁷COO - 、

(10) - OCONR⁸ - 、または

(11) - OC(=O)O - を表し、

R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷およびR⁸は、それぞれ独立して、水素原子またはC 1 ~ 9 アルキル基を表し、

Z³は、

(1) C 1 ~ 9 アルキル基、

(2) C 2 ~ 9 アルケニル基、

(3) C 2 ~ 9 アルキニル基、

(4) Cy c 1、または

(5) OR⁹、SR¹⁰、NR¹¹R¹²、またはCy c 1 によって置換されたC 1 ~ 9 アルキル基を表すか、

R¹とZ³基が結合している窒素原子と一緒にになって、5 ~ 7員の単環飽和ヘテロ環を表してもよく、上記ヘテロ環はさらに酸素原子、窒素原子および硫黄原子から選択される1個のヘテロ原子を含んでもよく、また該ヘテロ環は置換基によって置換されていてもよく、R⁹、R¹⁰、R¹¹およびR¹²は、それぞれ独立して、

(1) 水素原子、

(2) C 1 ~ 9 アルキル基、

(3) Cy c 1、または

(4) Cy c 1 によって置換されたC 1 ~ 4 アルキル基を表し、

Cy c 1は、一部または全部が飽和されていてよいC 3 ~ 15 の単環、二環または三環式炭素環アリールまたは酸素原子、窒素原子または硫黄原子から選択される1 ~ 4 個のヘテロ原子を含む、一部または全部が飽和されていてよい3 ~ 15 員の単環、二環または三環式ヘテロ環アリールを表し、また該炭素環およびヘテロ環は置換基によって置換されていてもよく、

【化2】

は、一重結合または二重結合を表す。

ただし、Z¹が単結合のとき、Z²は-COO-および-OCO-を表さない。】

で示されるプロスタグラジン誘導体、その非毒性塩またはそのシクロデキストリン包接化合物。

【請求項2】

プロスタグラジン誘導体が、

(1) 2 - ヘプタノイルオキシエチル (5Z)-7-[(1R, 2R, 3R)-3-ヒドロキシ-2-[(1E, 3S)-3-ヒドロキシ-1-オクテニル]-5-オキソシクロペンチル]ヘプト-5-エノート、

(2) 2 - ヘキサノイルオキシエチル (5Z) - 7 - [(1R, 2R, 3R) - 3 - ヒドロキシ - 2 - [(1E, 3S) - 3 - ヒドロキシ - 1 - オクテニル] - 5 - オキソシクロペンチル] ヘプト - 5 - エノート、

(3) 2 - バレリルオキシエチル (5Z) - 7 - [(1R, 2R, 3R) - 3 - ヒドロキシ - 2 - [(1E, 3S) - 3 - ヒドロキシ - 1 - オクテニル] - 5 - オキソシクロペンチル] ヘプト - 5 - エノート、

(4) 2 - (2 - エチル - 2 - メチルブチリルオキシ)エチル (5Z) - 7 - [(1R, 2R, 3R) - 3 - ヒドロキシ - 2 - [(1E, 3S) - 3 - ヒドロキシ - 1 - オクテニル] - 5 - オキソシクロペンチル] ヘプト - 5 - エノート、

(5) (N, N - ジブチルカルバモイル)メチル (5Z) - 7 - [(1R, 2R, 3R) - 3 - ヒドロキシ - 2 - [(1E, 3S) - 3 - ヒドロキシ - 1 - オクテニル] - 5 - オキソシクロペンチル] ヘプト - 5 - エノート、

(6) 2 - ヘプタノイルオキシエチル 7 - [(1R, 2R, 3R) - 3 - ヒドロキシ - 2 - [(1E, 3S) - 3 - ヒドロキシ - 1 - オクテニル] - 5 - オキソシクロペンチル] ヘプタノエノート、

(7) 3 - ヘキサノイルオキシプロピル 7 - [(1R, 2R, 3R) - 3 - ヒドロキシ - 2 - [(1E, 3S) - 3 - ヒドロキシ - 1 - オクテニル] - 5 - オキソシクロペンチル] ヘプタノエノート、

(8) 3 - オクタノイルオキシプロピル 7 - [(1R, 2R, 3R) - 3 - ヒドロキシ - 2 - [(1E, 3S) - 3 - ヒドロキシ - 1 - オクテニル] - 5 - オキソシクロペンチル] ヘプタノエノート、

(9) 2 - ヘキサノイルオキシエチル 7 - [(1R, 2R, 3R) - 3 - ヒドロキシ - 2 - [(1E, 3S) - 3 - ヒドロキシ - 1 - オクテニル] - 5 - オキソシクロペンチル] ヘプタノエノート、

(10) 2 - オクタノイルオキシエチル 7 - [(1R, 2R, 3R) - 3 - ヒドロキシ - 2 - [(1E, 3S) - 3 - ヒドロキシ - 1 - オクテニル] - 5 - オキソシクロペンチル] ヘプタノエノート、

(11) 2 - (4 - フェニルブタノイルオキシ)エチル 7 - [(1R, 2R, 3R) - 3 - ヒドロキシ - 2 - [(1E, 3S) - 3 - ヒドロキシ - 1 - オクテニル] - 5 - オキソシクロペンチル] ヘプタノエノート、

(12) 3 - プロピオニルオキシプロピル 7 - [(1R, 2R, 3R) - 3 - ヒドロキシ - 2 - [(1E, 3S) - 3 - ヒドロキシ - 1 - オクテニル] - 5 - オキソシクロペンチル] ヘプタノエノート、

(13) 2 - デカノイルオキシエチル 7 - [(1R, 2R, 3R) - 3 - ヒドロキシ - 2 - [(1E, 3S) - 3 - ヒドロキシ - 1 - オクテニル] - 5 - オキソシクロペンチル] ヘプタノエノート、または

(14) (ヘキシルオキシカルボニルオキシ)メチル 7 - [(1R, 2R, 3R) - 3 - ヒドロキシ - 2 - [(1E, 3S) - 3 - ヒドロキシ - 1 - オクテニル] - 5 - オキソシクロペンチル] ヘプタノエノート、

である請求項1に記載のプロスタグラジン誘導体、その非毒性塩またはそのシクロデキストリン包接化合物。

【請求項3】

請求項1に記載の一般式(I)で示されるプロスタグラジン誘導体、その非毒性塩またはそのシクロデキストリン包接化合物を有効成分として含有する医薬組成物。

【請求項4】

請求項1に記載の一般式(I)で示されるプロスタグラジン誘導体、その非毒性塩またはそのシクロデキストリン包接化合物を有効成分として含有する持続性製剤。

【請求項5】

マイクロスフェア製剤またはフィルム製剤である請求項4記載の持続性製剤。

【請求項6】

請求項 1 に記載の一般式 (I) で示されるプロスタグランジン誘導体、その非毒性塩またはそのシクロデキストリン包接化合物を有効成分として含有する骨量低下疾患の予防および / または治療剤。

【請求項 7】

局所投与用骨量低下疾患の予防および / または治療剤である請求項 4 または 5 に記載の持続性製剤。

【請求項 8】

骨量低下疾患が原発性骨粗鬆症、二次性骨粗鬆症、癌骨転移、高カルシウム血症、ページェット病、骨欠損、骨壊死の骨疾患、骨の手術後の骨形成、または骨移植代替療法である請求項 6 または 7 記載の予防および / または治療剤。