

【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18年1月19日(2006.1.19)

【公表番号】特表2005-519893(P2005-519893A)

【公表日】平成17年7月7日(2005.7.7)

【年通号数】公開・登録公報2005-026

【出願番号】特願2003-559519(P2003-559519)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/573	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 P	3/04	(2006.01)
A 6 1 P	5/28	(2006.01)
A 6 1 P	15/08	(2006.01)
A 6 1 P	15/16	(2006.01)
A 6 1 P	15/18	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/02	(2006.01)
A 6 1 P	25/06	(2006.01)
A 6 1 P	25/08	(2006.01)
A 6 1 P	25/20	(2006.01)
A 6 1 P	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/573	
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	5/28	
A 6 1 P	15/08	
A 6 1 P	15/16	
A 6 1 P	15/18	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	25/02	1 0 1
A 6 1 P	25/06	
A 6 1 P	25/08	
A 6 1 P	25/20	
A 6 1 P	25/24	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	43/00	1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成17年11月21日(2005.11.21)

【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】**

3ベータ, 20ベータ-ジヒドロキシ-5アルファ-プレグナン, 3ベータ, 20アルファ-ジヒドロキシ-5ベータ-プレグナン, 3ベータ-ヒドロキシ-5ベータ-プレグナン20-オン, 3ベータ, 21-ジヒドロキシ-5ベータ-プレグナン-20-オン, 3ベータ-ヒドロキシ-5アルファ-プレグナン-11, 20-ジオン, 及び3ベータ-ヒドロキシ-5アルファ-プレグナン-20-オン-アセテートの少なくとも1種類を含む医薬組成物。

**【請求項 2】**

ヒト患者において3アルファ-ヒドロキシ-5アルファ/ベータ-ステロイド誘導性CNS疾患を治療, 緩和及び/または予防するための医薬組成物であって, 3ベータ, 20ベータ-ジヒドロキシ-5アルファ-プレグナン, 3ベータ, 20アルファ-ジヒドロキシ-5ベータ-プレグナン, 3ベータ-ヒドロキシ-5ベータ-プレグナン20-オン, 3ベータ, 21-ジヒドロキシ-5ベータ-プレグナン-20-オン, 3ベータ-ヒドロキシ-5アルファ-プレグナン-11, 20-ジオン, 3ベータ-ヒドロキシ-5アルファ-プレグナン-20-オン-アセテート及び3ベータ-ヒドロキシ-5アルファ-プレグナン-20-オン-サルフェートから選択される少なくとも1種類の化合物を前記患者に投与するための組成物。

**【請求項 3】**

前記組成物が, 前記少なくとも1つの化合物が薬学的に許容しうる誘導体の形で投与されるよう処方されている, 請求項1または2記載の組成物。

**【請求項 4】**

前記薬学的に許容しうる誘導体が前記化合物のナトリウム塩である, 請求項3記載の組成物。

**【請求項 5】**

前記少なくとも1つの化合物が, 以下の投与経路: 静脈内, 経鼻, 経直腸, 膀胱内, 経皮及び経口の1つにより投与するのに適したように処方されている, 請求項1または2記載の組成物。

**【請求項 6】**

前記投与の経路が静脈内投与である, 請求項5記載の組成物。

**【請求項 7】**

前記投与の経路が鼻腔投与である, 請求項5記載の組成物。

**【請求項 8】**

前記少なくとも1つのステロイドが, 体重1kg当たり約0.2-200mgの範囲の用量で静脈内投与するのに適したように処方されている, 請求項1または2記載の組成物。

**【請求項 9】**

前記少なくとも1つのステロイドが, 体重1kg当たり約20-100mgの範囲の用量で静脈内投与するのに適したように処方されている, 請求項1または2記載の組成物。

**【請求項 10】**

前記ステロイド関連CNS疾患が, ステロイド関連の気分障害である, 請求項1または2記載の組成物。

**【請求項 11】**

前記ステロイド関連CNS疾患が, ヒト患者における閉経後のホルモン療法の副作用である, 請求項1または2記載の組成物。

**【請求項 12】**

前記ステロイド関連CNS疾患が, ヒト患者における経口避妊薬の副作用である, 請求項1または2記載の組成物。

**【請求項 13】**

前記ステロイド関連CNS疾患が, ヒト患者におけるステロイド関連の倦怠感である, 請求項1または2記載の組成物。

**【請求項 1 4】**

前記ステロイド関連 C N S 疾患がヒト患者におけるステロイド関連の記憶障害である，請求項 1 または 2 記載の組成物。

**【請求項 1 5】**

前記ステロイド関連 C N S 疾患が，以下のステロイド関連疾患：てんかん，月経周期依存性のてんかん，鬱，ストレスに関連する鬱，偏頭痛，倦怠感及び特にストレスに関連する倦怠感，月経前症候群，月経前不快気分障害，月経周期に関連した気分の変化，月経周期に関連した記憶の変化，ストレスに関連した記憶の変化，アルツハイマー痴呆，月経周期に関連した集中力欠如，月経周期に関連した睡眠障害及び倦怠感の一つまたはこれらの組み合わせである，請求項 1 または 2 記載の組成物。

**【請求項 1 6】**

ヒト患者においてステロイド感覚麻痺を制御及び／または停止させるための医薬組成物であって，3 ベータ，20 ベータ - ジヒドロキシ - 5 アルファ - プレグナン，3 ベータ，20 アルファ - ジヒドロキシ - 5 ベータ - プレグナン，3 ベータ - ヒドロキシ - 5 ベータ - プレグナン 20 - オン，3 ベータ，21 - ジヒドロキシ - 5 ベータ - プレグナン - 20 - オン，3 ベータ - ヒドロキシ - 5 アルファ - プレグナン - 11，20 - ジオン，3 ベータ - ヒドロキシ - 5 アルファ - プレグナン - 20 - オン - アセテート及び 3 ベータ - ヒドロキシ - 5 アルファ - プレグナン - 20 - オン - サルフェートから選択される少なくとも 1 種類の化合物を含むことを特徴とする組成物。

**【請求項 1 7】**

3 ベータ，20 ベータ - ジヒドロキシ - 5 アルファ - プレグナン，3 ベータ，20 アルファ - ジヒドロキシ - 5 ベータ - プレグナン，3 ベータ - ヒドロキシ - 5 ベータ - プレグナン 20 - オン，3 ベータ，21 - ジヒドロキシ - 5 ベータ - プレグナン - 20 - オン，3 ベータ - ヒドロキシ - 5 アルファ - プレグナン - 11，20 - ジオン，及び 3 ベータ - ヒドロキシ - 5 アルファ - プレグナン - 20 - オン - アセテートから選択されるステロイドを，医薬品を製造するために使用する方法。

**【請求項 1 8】**

3 ベータ，20 ベータ - ジヒドロキシ - 5 アルファ - プレグナン，3 ベータ，20 アルファ - ジヒドロキシ - 5 ベータ - プレグナン，3 ベータ - ヒドロキシ - 5 ベータ - プレグナン 20 - オン，3 ベータ，21 - ジヒドロキシ - 5 ベータ - プレグナン - 20 - オン，3 ベータ - ヒドロキシ - 5 アルファ - プレグナン - 11，20 - ジオン，3 ベータ - ヒドロキシ - 5 アルファ - プレグナン - 20 - オン - アセテート及び 3 ベータ - ヒドロキシ - 5 アルファ - プレグナン - 20 - オン - サルフェートから選択されるステロイドを，3 アルファ - ヒドロキシ - 5 アルファ / ベータ - ステロイド誘導性 C N S 疾患の治療用の医薬品を製造するために使用する方法。

**【請求項 1 9】**

3 ベータ，20 ベータ - ジヒドロキシ - 5 アルファ - プレグナン，3 ベータ，20 アルファ - ジヒドロキシ - 5 ベータ - プレグナン，3 ベータ - ヒドロキシ - 5 ベータ - プレグナン 20 - オン，3 ベータ，21 - ジヒドロキシ - 5 ベータ - プレグナン - 20 - オン，3 ベータ - ヒドロキシ - 5 アルファ - プレグナン - 11，20 - ジオン，3 ベータ - ヒドロキシ - 5 アルファ - プレグナン - 20 - オン - アセテート及び 3 ベータ - ヒドロキシ - 5 アルファ - プレグナン - 20 - オン - サルフェートから選択されるステロイドを，ステロイド関連の気分障害の治療及び／または予防用の医薬品を製造するために使用する方法。

**【請求項 2 0】**

3 ベータ，20 ベータ - ジヒドロキシ - 5 アルファ - プレグナン，3 ベータ，20 アルファ - ジヒドロキシ - 5 ベータ - プレグナン，3 ベータ - ヒドロキシ - 5 ベータ - プレグナン 20 - オン，3 ベータ，21 - ジヒドロキシ - 5 ベータ - プレグナン - 20 - オン，3 ベータ - ヒドロキシ - 5 アルファ - プレグナン - 11，20 - ジオン，3 ベータ - ヒドロキシ - 5 アルファ - プレグナン - 20 - オン - アセテート及び 3 ベータ - ヒドロキシ - 5 アルファ - プレグナン - 20 - オン - サルフェートから選択されるステロイドを，閉経後

療法のステロイド関連の副作用の治療及び／または予防用の医薬品を製造するために使用する方法。

【請求項 2 1】

3ベータ，20ベータ-ジヒドロキシ-5アルファ-プレグナン，3ベータ，20アルファ-ジヒドロキシ-5ベータ-プレグナン，3ベータ-ヒドロキシ-5ベータ-プレグナン20-オン，3ベータ，21-ジヒドロキシ-5ベータ-プレグナン-20-オン，3ベータ-ヒドロキシ-5アルファ-プレグナン-11，20-ジオン，3ベータ-ヒドロキシ-5アルファ-プレグナン-20-オン-アセテート及び3ベータ-ヒドロキシ-5アルファ-プレグナン-20-オン-サルフェートから選択されるステロイドを，経口避妊薬の副作用の治療及び／または予防用の医薬品を製造するために使用する方法。

【請求項 2 2】

3ベータ，20ベータ-ジヒドロキシ-5アルファ-プレグナン，3ベータ，20アルファ-ジヒドロキシ-5ベータ-プレグナン，3ベータ-ヒドロキシ-5ベータ-プレグナン20-オン，3ベータ，21-ジヒドロキシ-5ベータ-プレグナン-20-オン，3ベータ-ヒドロキシ-5アルファ-プレグナン-11，20-ジオン，3ベータ-ヒドロキシ-5アルファ-プレグナン-20-オン-アセテート及び3ベータ-ヒドロキシ-5アルファ-プレグナン-20-オン-サルフェートから選択されるステロイドを，以下の3アルファ-ヒドロキシ-5アルファ/ベータ-ステロイド誘導性疾患：てんかん，偏頭痛，鬱，摂食障害，認識障害，運動障害，睡眠障害，ストレスに関連する疾患，月経周期に関連する疾患，月経前症候群，月経前不快気分障害，月経周期に関連する疾患：鎮静，倦怠感，記憶障害，学習障害，集中力欠如，運動機能障害，不器用，食欲増進及び食物渴求，緊張としての負の気分，神経過敏及び鬱，月経前症候群，小発作の月経前悪化，ストレス過敏症，集中力欠如，並びにインパルス制御の欠乏及び鬱；物質依存症，月経周期に関連するてんかん；ストレスに関連する疾患，たとえばストレスに関連する気分の変化，鬱，偏頭痛，倦怠感，特にストレスに関連する倦怠感，ストレスに関連する記憶の変化，鎮静，記憶障害，学習障害，集中力欠如，運動機能障害，不器用，食欲増進及び食物渴求，緊張としての負の気分，神経過敏及び鬱，小発作の月経前悪化，ストレス過敏症，集中力欠如，インパルス制御の欠乏，物質依存症，ストレスに関連するてんかん，アルツハイマー痴呆のストレスに関連する悪化，産後の気分変化のいずれか一つ，またはこれらの組み合わせの治療及び／または予防用の医薬品を製造するために使用する方法。

【請求項 2 3】

3ベータ，20ベータ-ジヒドロキシ-5アルファ-プレグナン，3ベータ，20アルファ-ジヒドロキシ-5ベータ-プレグナン，3ベータ-ヒドロキシ-5ベータ-プレグナン20-オン，3ベータ，21-ジヒドロキシ-5ベータ-プレグナン-20-オン，3ベータ-ヒドロキシ-5アルファ-プレグナン-11，20-ジオン，3ベータ-ヒドロキシ-5アルファ-プレグナン-20-オン-アセテート及び3ベータ-ヒドロキシ-5アルファ-プレグナン-20-オン-サルフェートから選択されるステロイドを，経口避妊薬としてのステロイドホルモンによる治療，閉経後ホルモン補充療法，炎症性疾患のステロイド治療，及びタンパク質同化／男性ホルモンステロイド摂取の間の副作用の予防用の医薬品を製造するために使用する方法。

【請求項 2 4】

薬剤候補をスクリーニング及び同定する方法であって，候補物質を，3アルファ-ヒドロキシ-5アルファ/ベータ-ステロイドのGABA-Aレセプターに対する作用を遮断し，このことにより3アルファ-ヒドロキシ-5アルファ/ベータ-ステロイドの負の作用の発現を遮断するその能力に関してスクリーニングする工程を含むことを特徴とする方法。

【請求項 2 5】

薬剤候補をスクリーニング及び同定する方法であって，3アルファ-ヒドロキシ-5アルファ/ベータ-ステロイドのGABA-Aレセプターに対する作用を遮断し，このことにより3アルファ-ヒドロキシ-5アルファ/ベータ-ステロイドの負の作用の発現を遮断

することができる物質との構造的または機能的類似性を選択基準として使用する工程を含むことを特徴とする方法。

【請求項 2 6】

薬剤が 3 アルファ - ヒドロキシ - 5 アルファ / ベータ - ステロイドの GABA - A レセプターに対する作用を遮断する能力を合成の最終生成物を評価するための基準として用いることを特徴とする、薬剤候補を合成するための方法。

【請求項 2 7】

請求項 2 4 - 2 6 のいずれか 1 項に記載の方法によって得られる、3 アルファ - ヒドロキシ - 5 アルファ / ベータ - ステロイドの GABA - A レセプターに対する作用を遮断しうる化合物。