

【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22年5月27日 (2010.5.27)

【公表番号】特表2009-533483(P2009-533483A)

【公表日】平成21年9月17日 (2009.9.17)

【年通号数】公開・登録公報2009-037

【出願番号】特願2009-508549(P2009-508549)

【国際特許分類】

C 07 C 401/00 (2006.01)

A 61 K 31/593 (2006.01)

A 61 P 3/02 (2006.01)

A 61 P 19/08 (2006.01)

A 61 P 17/06 (2006.01)

A 61 P 35/02 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 17/02 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 37/06 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 11/06 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 P 17/16 (2006.01)

A 61 P 17/08 (2006.01)

A 61 P 19/10 (2006.01)

A 61 P 3/04 (2006.01)

A 61 P 3/06 (2006.01)

A 61 P 3/00 (2006.01)

【F I】

C 07 C 401/00 C S P

A 61 K 31/593

A 61 P 3/02 1 0 2

A 61 P 19/08

A 61 P 17/06

A 61 P 35/02

A 61 P 35/00

A 61 P 25/00

A 61 P 17/02

A 61 P 3/10

A 61 P 37/06

A 61 P 19/02

A 61 P 29/00 1 0 1

A 61 P 11/06

A 61 P 1/04

A 61 P 29/00

A 61 P 17/16

A 61 P 17/08

A 61 P 19/10

A 6 1 P 3/04
 A 6 1 P 3/06
 A 6 1 P 3/00 1 7 1

【手続補正書】

【提出日】平成22年4月5日(2010.4.5)

【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

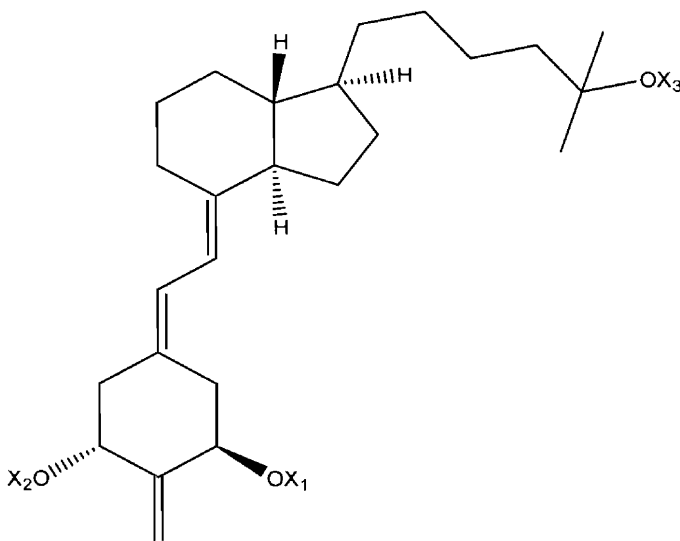
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式Iを有する化合物：



I

式中、 X_1 、 X_2 、および X_3 はHおよびヒドロキシ保護基より独立に選択される。

【請求項 2】

X_1 、 X_2 、および X_3 がヒドロキシ保護基である、請求項1記載の化合物。

【請求項 3】

X_1 、 X_2 、および X_3 がトリエチルシリル基またはt-ブチルジメチルシリル基である、請求項2記載の化合物。

【請求項 4】

X_1 および X_2 がt-ブチルジメチルシリル基であり、 X_3 がトリエチルシリル基である、請求項1記載の化合物。

【請求項 5】

請求項1記載の化合物の有効量と薬学的に許容される担体とを含む、薬学的組成物。

【請求項 6】

有効量が、組成物1グラムあたり約0.01 μg ~ 約1mgの化合物を含む、請求項5記載の薬学的組成物。

【請求項 7】

有効量が、組成物1グラムあたり約0.1 μg ~ 約500 μg の化合物を含む、請求項5記載の薬学的組成物。

【請求項 8】

生物学的状態を患う被験体を治療するための請求項1記載の化合物の有効量と薬学的に許容される担体とを含む薬学的組成物であって、該生物学的状態が、代謝性骨疾患；ビタミンD抵抗性くる病；乾癬；乾癬性関節炎；白血病；大腸癌；乳癌；前立腺癌；皮膚癌；

肺癌；多発性硬化症；狼瘡；真性糖尿病；宿主対移植片反応；臓器移植の拒絶反応；関節リウマチ、喘息、もしくは炎症性腸疾患より選択される炎症性疾患；セリアック病；潰瘍性大腸炎；クローン病；しわ、十分な皮膚弾力（skin firmness）の欠如、十分な皮膚水分（dermal hydration）の欠如、もしくは不十分な皮脂分泌より選択される皮膚状態；骨減少症；腎性骨形成異常；または骨粗しょう症より選択される、薬学的組成物。

【請求項 9】

生物学的状態が、腎性骨形成異常、ビタミンD抵抗性くる病、骨粗しょう症、または乾癬性関節炎である、請求項8記載の薬学的組成物。

【請求項 10】

生物学的状態が、白血病、大腸癌、乳癌、皮膚癌、肺癌、または前立腺癌より選択される、請求項8記載の薬学的組成物。

【請求項 11】

生物学的状態が、多発性硬化症、狼瘡、真性糖尿病、宿主対移植片反応、または臓器移植の拒絶反応より選択される、請求項8記載の薬学的組成物。

【請求項 12】

生物学的状態が、関節リウマチ、喘息、または、セリアック病、潰瘍性大腸炎、およびクローン病より選択される炎症性腸疾患より選択される、請求項8記載の薬学的組成物。

【請求項 13】

生物学的状態が、しわ、十分な皮膚弾力の欠如、十分な皮膚水分の欠如、または不十分な皮脂分泌より選択される、請求項8記載の薬学的組成物。

【請求項 14】

経口的に、非経口的に、経鼻的に、直腸に、舌下に、経皮的に、または局所的に被験体に投与されうる、請求項8記載の薬学的組成物。

【請求項 15】

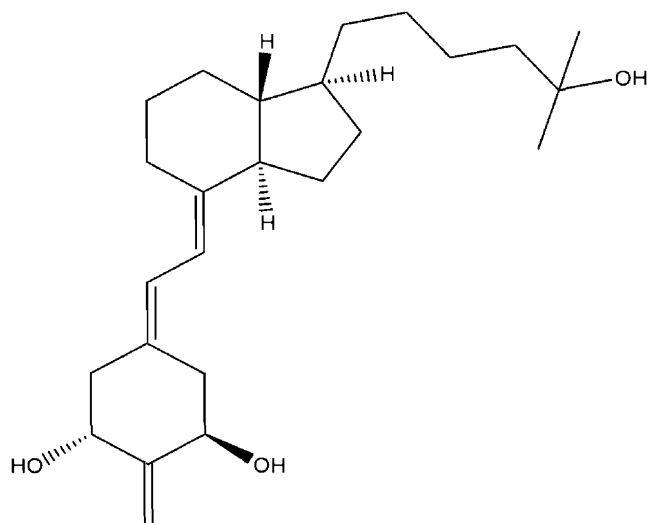
腹腔内投与されうる、請求項8記載の薬学的組成物。

【請求項 16】

化合物が、 $0.01 \mu\text{g}/\text{日} \sim 1\text{mg}/\text{日}$ の投与量で投与されうる、請求項8記載の薬学的組成物を含む薬剤。

【請求項 17】

式II



II

を有する化合物。

【請求項 18】

請求項17記載の化合物の有効量と薬学的に許容される担体とを含む、薬学的組成物。

【請求項 19】

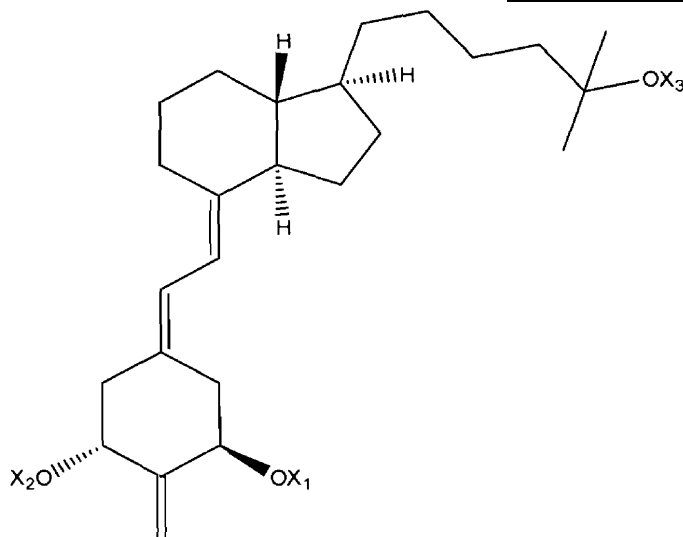
有効量が、組成物1グラムあたり約0.01 μg ~ 約1mgの化合物を含む、請求項18記載の薬学的組成物。

【請求項 2 0】

有効量が、組成物1グラムあたり約0.1 μg ~ 約500 μg の化合物を含む、請求項18記載の薬学的組成物。

【請求項 2 1】

下記式を有する化合物の有効量と薬学的に許容される担体とを含む、動物の肥満を治療もしくは予防する、脂肪細胞分化を阻害する、SCD-1遺伝子転写を阻害する、および/または動物における体脂肪を減少させるための、薬学的組成物：



I

式中、 X_1 、 X_2 、および X_3 はHおよびヒドロキシ保護基より独立に選択される。

【請求項 2 2】

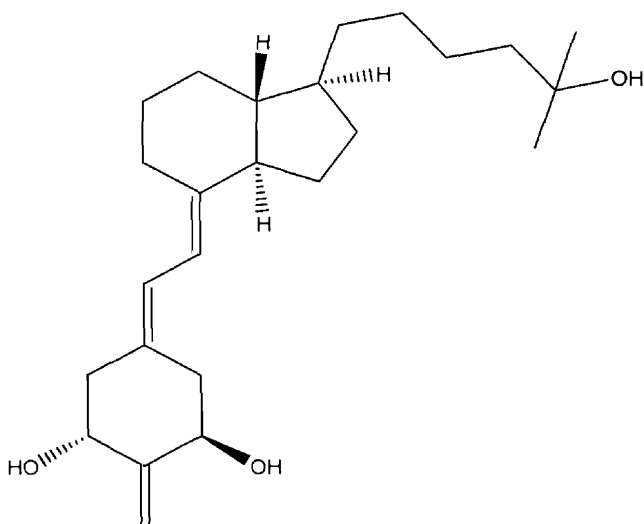
経口的に、非経口的に、経鼻的に、直腸に、舌下に、経皮的に、または局所的に動物に投与されうる、請求項21記載の薬学的組成物。

【請求項 2 3】

化合物が、0.01 $\mu\text{g}/\text{日}$ ~ 1mg/日の投与量で投与されうる、請求項21記載の薬学的組成物を含む薬剤。

【請求項 2 4】

化合物が、下記式



II

を有する2-メチレン-1 β ,25-ジヒドロキシ-18,19,21-トリノルビタミンD₃である、請求項

21記載の薬学的組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0028

【補正方法】変更

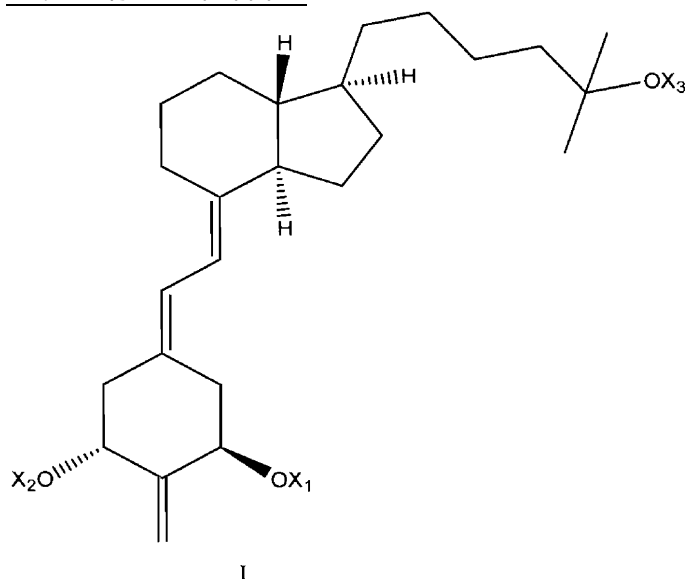
【補正の内容】

【0028】

本発明のさらなる目的、特徴、および利点は以下の詳細な説明、添付の図面、および添付の特許請求の範囲から明らかになるであろう。

[請求項101]

式Iを有する化合物：



式中、 X_1 、 X_2 、および X_3 はHおよびヒドロキシ保護基より独立に選択される。

[請求項102]

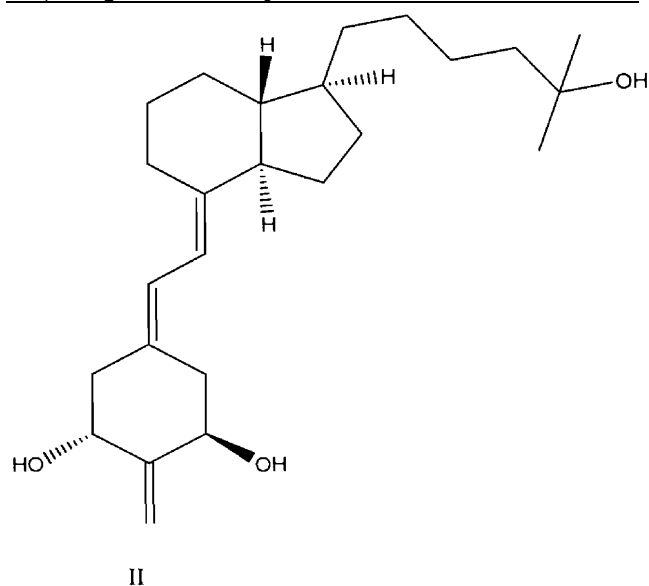
X_1 、 X_2 、および X_3 がヒドロキシ保護基である、請求項101記載の化合物。

[請求項103]

X_1 、 X_2 、および X_3 がトリエチルシリル基またはt-ブチルジメチルシリル基である、請求項102記載の化合物。

[請求項104]

X_1 、 X_2 、および X_3 がHであり、化合物が式II



を有する、請求項101記載の化合物。

[請求項105]

請求項101記載の化合物の有効量と薬学的に許容される担体とを含む、薬学的組成物。

[請求項106]

有効量が、組成物1グラムあたり約0.01 μ g ~ 約1mgの化合物を含む、請求項105記載の薬学的組成物。

[請求項107]

有効量が、組成物1グラムあたり約0.1 μ g ~ 約500 μ gの化合物を含む、請求項105記載の薬学的組成物。

[請求項108]

生物学的状態を患う被験体に請求項101記載の化合物の有効量を投与する段階を含む、該被験体を治療する方法であって、該生物学的状態が、代謝性骨疾患；乾癬；白血病；大腸癌；乳癌；前立腺癌；皮膚癌；肺癌；多発性硬化症；狼瘡；真性糖尿病；宿主対移植片反応；臓器移植の拒絶反応；関節リウマチ、喘息、もしくは炎症性腸疾患より選択される炎症性疾患；しわ、十分な皮膚弾力(skin firmness)の欠如、十分な皮膚水分(dermal hydration)の欠如、もしくは不十分な皮脂分泌より選択される皮膚状態；骨減少症；腎性骨形成異常；または骨粗しょう症より選択される、方法。

[請求項109]

生物学的状態が、腎性骨形成異常、ビタミンD抵抗性くる病、骨粗しょう症、または乾癬性関節炎である、請求項108記載の方法。

[請求項110]

生物学的状態が、白血病、大腸癌、乳癌、皮膚癌、肺癌、または前立腺癌より選択される、請求項108記載の方法。

[請求項111]

生物学的状態が、多発性硬化症、狼瘡、真性糖尿病、宿主対移植片反応、または臓器移植の拒絶反応より選択される、請求項108記載の方法。

[請求項112]

生物学的状態が、関節リウマチ、喘息、または、セリアック病、潰瘍性大腸炎、およびクローン病より選択される炎症性腸疾患より選択される、請求項108記載の方法。

[請求項113]

生物学的状態が、しわ、十分な皮膚弾力の欠如、十分な皮膚水分の欠如、または不十分な皮脂分泌より選択される、請求項108記載の方法。

[請求項114]

化合物が、経口的に、非経口的に、経鼻的に、直腸に、舌下に、経皮的に、または局所的に被験体に投与される、請求項108記載の方法。

[請求項115]

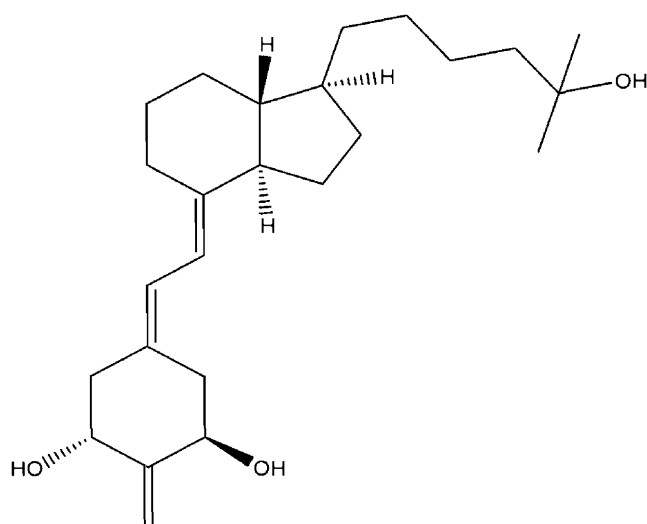
化合物が腹腔内投与される、請求項108記載の方法。

[請求項116]

化合物が、0.01 μ g/日 ~ 1mg/日の投与量で投与される、請求項108記載の方法。

[請求項117]

式II



II

を有する化合物。

[請求項118]

請求項117記載の化合物の有効量と薬学的に許容される担体とを含む、薬学的組成物。

[請求項119]

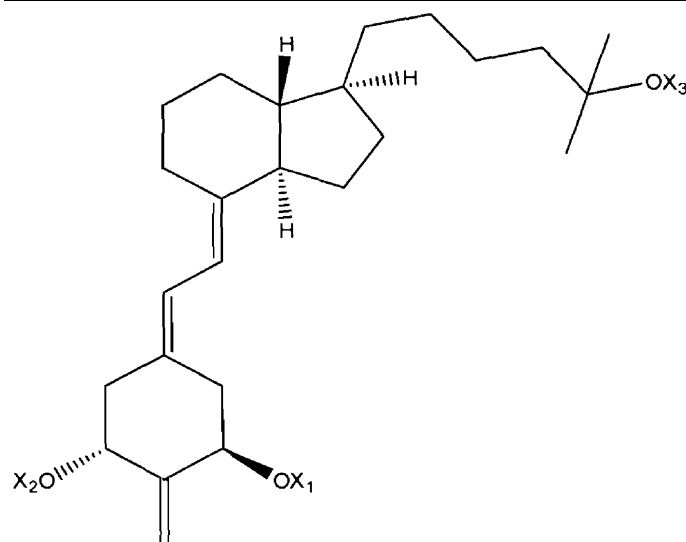
有効量が、組成物1グラムあたり約0.01 μg ~ 約1mgの化合物を含む、請求項118記載の薬学的組成物。

[請求項120]

有効量が、組成物1グラムあたり約0.1 μg ~ 約500 μg の化合物を含む、請求項118記載の薬学的組成物。

[請求項121]

それを必要とする動物に下記式を有する化合物の有効量を投与する段階を含む、動物の肥満を治療もしくは予防する、脂肪細胞分化を阻害する、SCD-1遺伝子転写を阻害する、および/または動物における体脂肪を減少させる、方法：



I

式中、 X_1 、 X_2 、および X_3 はHおよびヒドロキシ保護基より独立に選択される。

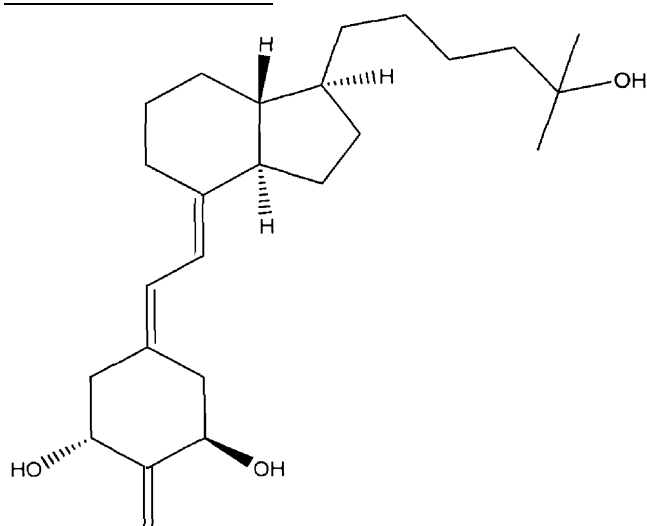
[請求項122]

化合物が、経口的に、非経口的に、経鼻的に、直腸に、舌下に、経皮的に、または局所的に動物に投与される、請求項121記載の方法。

[請求項123]

化合物が、0.01 μg /日 ~ 1mg/日の投与量で投与される、請求項121記載の方法。

化合物が、下記式



を有する2-メチレン-1,25-ジヒドロキシ-18,19,21-トリノルビタミンD₃である、請求項121記載の方法。

動物がヒトである、請求項121記載の方法。

動物が家畜である、請求項121記載の方法。

動物が農業動物である、請求項121記載の方法。