

【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11月30日(2006.11.30)

【公表番号】特表2006-501298(P2006-501298A)

【公表日】平成18年1月12日(2006.1.12)

【年通号数】公開・登録公報2006-002

【出願番号】特願2004-541124(P2004-541124)

【国際特許分類】

<i>C 07 C 215/56</i>	(2006.01)
<i>A 61 K 31/137</i>	(2006.01)
<i>A 61 K 31/165</i>	(2006.01)
<i>A 61 K 31/223</i>	(2006.01)
<i>A 61 K 31/4035</i>	(2006.01)
<i>A 61 K 31/4164</i>	(2006.01)
<i>A 61 K 31/77</i>	(2006.01)
<i>A 61 P 1/04</i>	(2006.01)
<i>A 61 P 3/10</i>	(2006.01)
<i>A 61 P 5/16</i>	(2006.01)
<i>A 61 P 11/06</i>	(2006.01)
<i>A 61 P 17/06</i>	(2006.01)
<i>A 61 P 25/28</i>	(2006.01)
<i>A 61 P 29/00</i>	(2006.01)
<i>A 61 P 37/00</i>	(2006.01)
<i>A 61 P 37/06</i>	(2006.01)
<i>A 61 P 37/08</i>	(2006.01)
<i>C 07 C 215/20</i>	(2006.01)
<i>C 07 C 229/36</i>	(2006.01)
<i>C 07 C 233/11</i>	(2006.01)
<i>C 07 C 233/22</i>	(2006.01)
<i>C 07 C 235/34</i>	(2006.01)
<i>C 07 D 209/14</i>	(2006.01)
<i>C 07 D 209/20</i>	(2006.01)
<i>C 07 D 233/64</i>	(2006.01)
<i>C 08 G 65/333</i>	(2006.01)

【F I】

<i>C 07 C 215/56</i>	C S P
<i>A 61 K 31/137</i>	
<i>A 61 K 31/165</i>	
<i>A 61 K 31/223</i>	
<i>A 61 K 31/4035</i>	
<i>A 61 K 31/4164</i>	
<i>A 61 K 31/77</i>	
<i>A 61 P 1/04</i>	
<i>A 61 P 3/10</i>	
<i>A 61 P 5/16</i>	
<i>A 61 P 11/06</i>	
<i>A 61 P 17/06</i>	
<i>A 61 P 25/28</i>	
<i>A 61 P 29/00</i>	1 0 1

A 6 1 P 37/00  
 A 6 1 P 37/06  
 A 6 1 P 37/08  
 C 0 7 C 215/20  
 C 0 7 C 229/36  
 C 0 7 C 233/11  
 C 0 7 C 233/22  
 C 0 7 C 235/34  
 C 0 7 D 209/14  
 C 0 7 D 209/20  
 C 0 7 D 233/64 1 0 5  
 C 0 8 G 65/333

## 【手続補正書】

【提出日】平成18年10月2日(2006.10.2)

## 【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

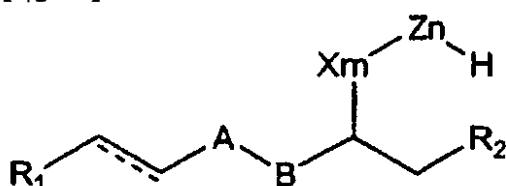
## 【補正の内容】

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

下記の式I、

## 【化1】

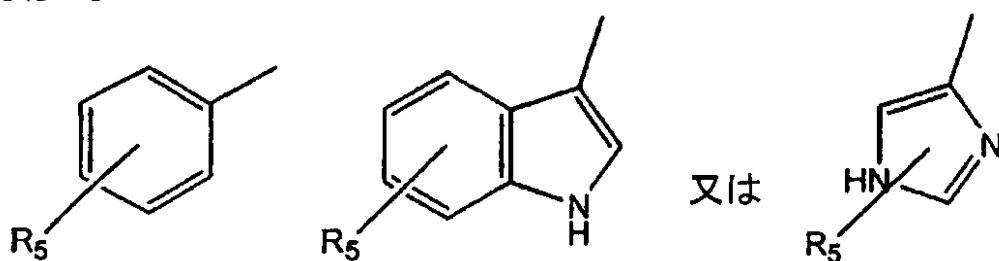


I

(式中、点線は、一重又は二重結合を示し、

R<sub>1</sub>及びR<sub>2</sub>は、同一又は異なるものであって、互いに個々に、下記の式、

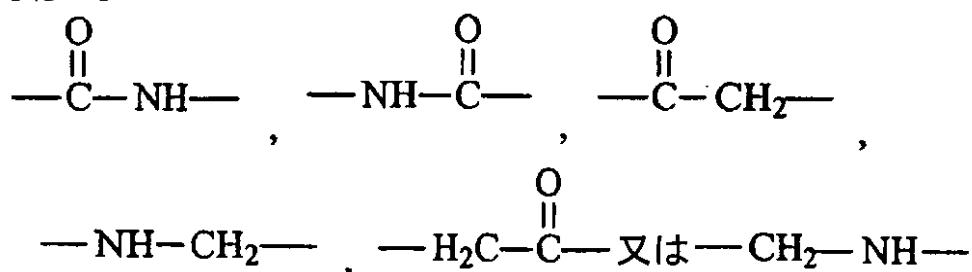
## 【化2】



で示される基を示し、

R<sub>5</sub>は、H、OH又はOR<sub>6</sub>(R<sub>6</sub>は、線状又は枝分れのC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルである)であり、  
A-Bは、下記の式、

【化3】

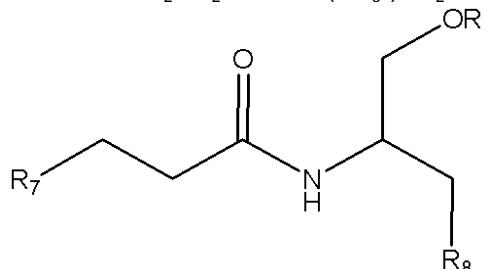


で示される基であり、

(a)  $m$ は、0であり、 $n$ は、0-50の整数であり、かつ $X$ は、0、 $-CH_2O$ 、 $-CH_2CH_2O$ 、 $-CH(CH_3)CH_2O$ 、又は $-CH_2CH(CH_3)O$ であり、又は

(b)  $m$ は、1であり、 $n$ は、1-500の整数であり、かつ $X$ は、 $-CH_2O$ 、 $-CH_2CH_2O$ 、 $-CH(CH_3)CH_2O$ 、又は $-CH_2CH(CH_3)O$ であり、かつ

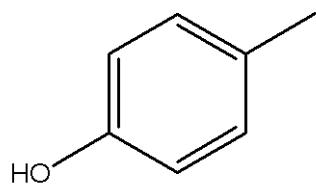
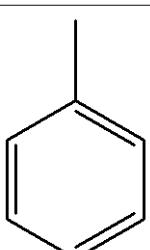
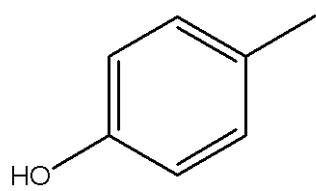
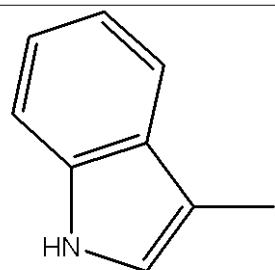
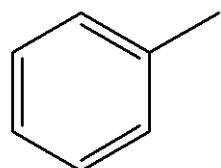
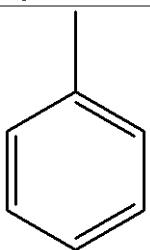
$Z$ は、 $-CH_2CH_2O$ 、 $-CH(CH_3)CH_2O$ 、又は $-CH_2CH(CH_3)O$ である。)又は、



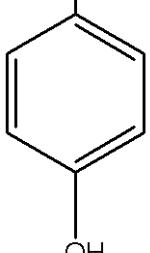
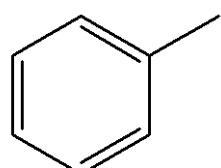
下記の式II

II

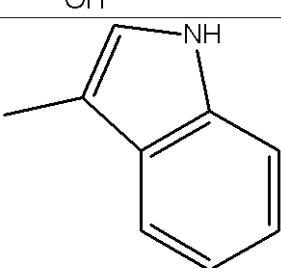
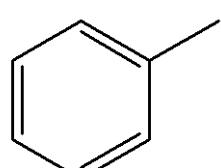
(式中、 $R$ は、 $n$ 単位を有するポリアルキレンジコールポリマーであり、 $n$ は、1-100の整数であり、また $R_7$ 及び $R_8$ は、以下に示される組み合わせの式

R<sub>7</sub>R<sub>8</sub>

OH



OH



で表される基である。 )

の構造で示される化合物又はその塩又は水和物。

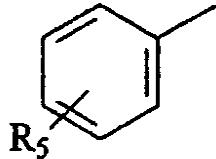
【請求項 2】

前記化合物が、式1で示される、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

$R_1$ が、下記である、請求項2記載の化合物、

【化4】



(式中、 $R_5$ は、H又はOHである)。

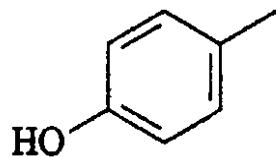
【請求項4】

$R_1$ が、フェニルである、請求項2記載の化合物。

【請求項5】

$R_1$ が、下記である、請求項2記載の化合物。

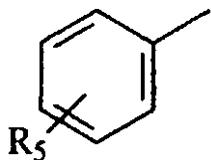
【化5】



【請求項6】

$R_2$ が、下記である、請求項2記載の化合物、

【化6】



(式中、 $R_5$ は、H又はOHである)。

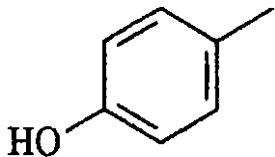
【請求項7】

$R_2$ が、フェニルである、請求項2記載の化合物。

【請求項8】

$R_2$ が、下記である、請求項2記載の化合物、

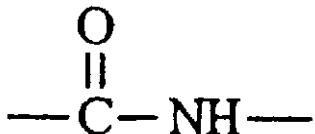
【化7】



【請求項9】

A-Bが、下記である、請求項2記載の化合物、

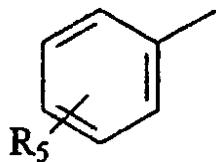
【化8】



【請求項10】

$R_1$ 及び $R_2$ が、ともに下記である、請求項9記載の化合物、

## 【化9】



(式中、R<sub>5</sub>は、H又はOHである)。

## 【請求項11】

mが、0である、請求項2又は10記載の化合物。

## 【請求項12】

mが、1である、請求項2又は10記載の化合物。

## 【請求項13】

Xが、-CH<sub>2</sub>Oである、請求項2又は10記載の化合物。

## 【請求項14】

Zが、-CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>Oである、請求項2又は10記載の化合物。

## 【請求項15】

Xが、-CH<sub>2</sub>O、かつmが、1である請求項10記載の化合物。

## 【請求項16】

Zが、-CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>Oである、請求項15記載の化合物。

## 【請求項17】

mが、1かつnが、1-500の整数である請求項2、10、15又は16記載の化合物。

## 【請求項18】

R<sub>5</sub>が、Hである、請求項10、15、16又は17記載の化合物。

## 【請求項19】

R<sub>5</sub>が、OHである、請求項10、15、16又は17記載の化合物。

## 【請求項20】

R<sub>5</sub>'が、Hである、請求項10、15、16又は17記載の化合物。

## 【請求項21】

R<sub>5</sub>'が、OHである、請求項10、15、16又は17記載の化合物。

## 【請求項22】

nが、1-20の整数である、請求項2、10、15又は16記載の化合物。

## 【請求項23】

nが、10-20の整数である、請求項2、10、15又は16記載の化合物。

## 【請求項24】

nが、17である、請求項2、10、15又は16記載の化合物。

## 【請求項25】

nが、1-200の整数である、請求項17記載の化合物。

## 【請求項26】

nが、5-75の整数である、請求項17記載の化合物。

## 【請求項27】

nが、69である、請求項17記載の化合物。

## 【請求項28】

請求項2記載の1種以上の化合物を含む組成物。

## 【請求項29】

活性成分としての請求項2又は17記載の1種以上の化合物を、1種以上の製薬上許容し得る賦形剤又はアジュバントと一緒に含む医薬組成物。

## 【請求項30】

経口又は非経口投与用に調製した、請求項29記載の組成物。

## 【請求項 3 1】

無コーティング錠剤、コーティング錠剤、ピル剤、カプセル剤、粉末剤又は懸濁液として調製した、請求項 2 9 記載の組成物。

## 【請求項 3 2】

静脈内投与用に調製した、請求項 2 9 記載の組成物。

## 【請求項 3 3】

経皮投与用に調製した、請求項 2 9 記載の組成物。

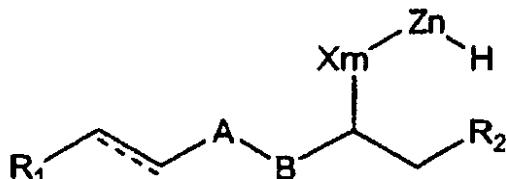
## 【請求項 3 4】

軟膏、クリーム又はゲル形で調製した、請求項 2 9 記載の組成物。

## 【請求項 3 5】

ヒト及び動物用途における免疫・アレルギー疾患又は自己免疫疾患又は臓器又は組織移植拒否反応の治療、予防及び管理に使用する医薬組成物であって、前記組成物が、式 I、

## 【化 1 0】

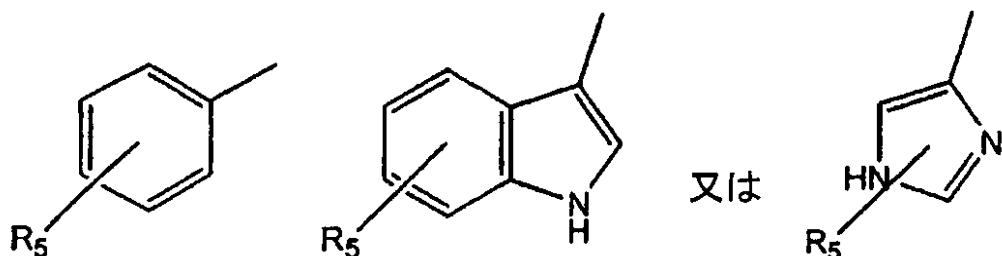


I

(式中、点線は、一重又は二重結合を示し、

R<sub>1</sub>及びR<sub>2</sub>は、同一又は異なるものであって、互いに個々に、下記の式、

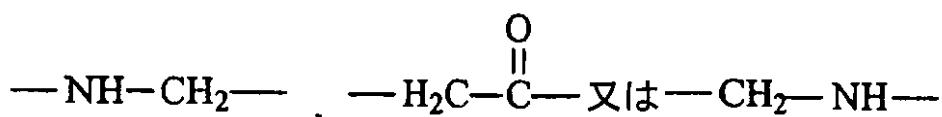
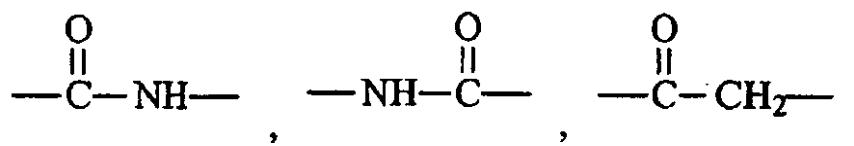
## 【化 1 1】



で示される基を示し、

R<sub>5</sub>は、H、OH又はOR<sub>6</sub> (R<sub>6</sub>は、線状又は枝分れのC<sub>1</sub>～C<sub>4</sub>アルキルである)であり、  
A-Bは、下記の式、

## 【化 1 2】



で示される基であり、

(a)mは、0であり、nは、0-50の整数であり、かつXは、0、-CH<sub>2</sub>O、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O、-CH(CH<sub>3</sub>)C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>O、又は-CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)Oであり、又は

(b)mは、1であり、nは、1-500の整数であり、かつXは、-CH<sub>2</sub>O、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O、-CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>O、又は-CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)Oであり、かつ

Zは、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O、-CH(CH<sub>3</sub>)CH<sub>2</sub>O、又は-CH<sub>2</sub>CH(CH<sub>3</sub>)Oである。)

の構造で示される化合物又はその塩又は水和物を含むことを特徴とする組成物。

【請求項 3 6】

前記免疫-アレルギー疾患が、気管支ぜんそく、アレルギー性鼻炎、乾癬又はクローン病である、請求項 3 5 記載の医薬組成物。

【請求項 3 7】

前記自己免疫疾患が、全身性エリテマトーデス、自己免疫性甲状腺炎、関節リウマチ、糖尿病、多発性硬化症又は実験的自己免疫性脳脊髄炎である、請求項 3 5 記載の医薬組成物。

【請求項 3 8】

前記臓器又は組織移植拒絶反応が、腎拒絶反応、骨髄拒絶反応、皮膚移植片拒絶反応、心臓移植片拒絶反応又は慢性移植片対宿主疾病である、請求項 3 5 記載の医薬組成物。

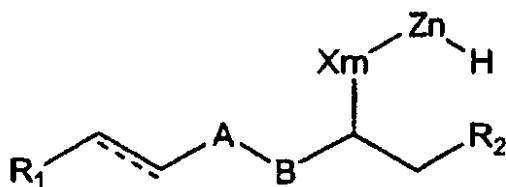
【請求項 3 9】

1種以上の製薬上許容し得る賦形剤又はアジュバントをさらに含む請求項 3 5 記載の医薬組成物。

【請求項 4 0】

下記の式1、

【化 1 3】

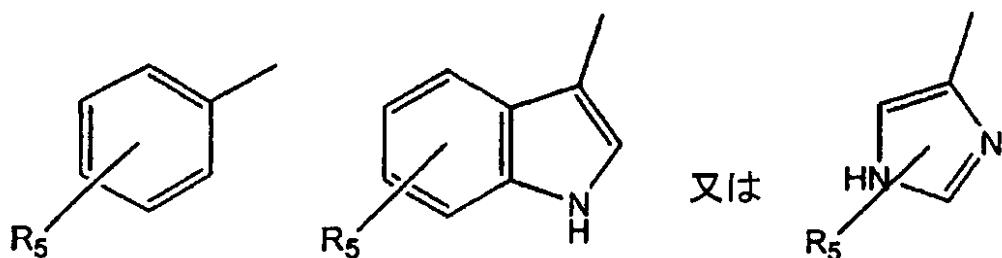


|

(式中、点線は、一重又は二重結合を示し、

R<sub>1</sub>及びR<sub>2</sub>は、同一又は異なるものであって、互いに個々に、下記の式、

【化 1 4】

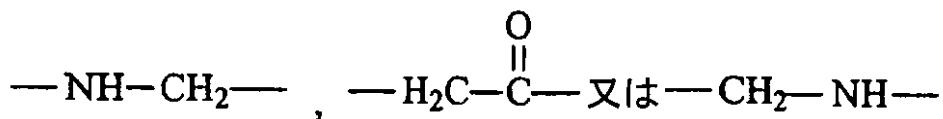
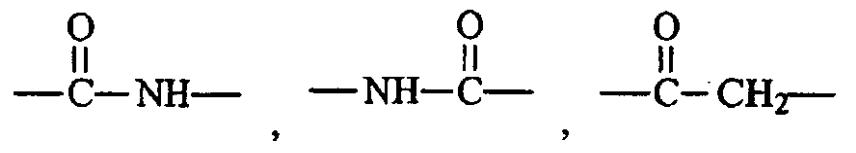


で示される基を示し、

R<sub>5</sub>は、H、OH又はOR<sub>6</sub> (R<sub>6</sub>は、線状又は枝分れのC<sub>1</sub>~C<sub>4</sub>アルキルである)であり、

A-Bは、下記の式、

【化 1 5】



で示される基であり、

(a)mは、0であり、nは、0-50の整数であり、かつXは、0、-CH<sub>2</sub>O、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O、-CH(CH<sub>3</sub>)C

$\text{H}_2\text{O}$ 、又は $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{O}$ であり、又は

(b)  $m$ は、1であり、 $n$ は、1-500の整数であり、かつ $X$ は、 $-\text{CH}_2\text{O}$ 、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 、 $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{O}$ 、又は $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{O}$ であり、かつ

$Z$ は、 $-\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ 、 $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{O}$ 又は $-\text{CH}_2\text{CH}(\text{CH}_3)\text{O}$ である。)の構造で示される化合物及びヒト及び動物用途における免疫-アレルギー疾患又は自己免疫疾患又は臓器又は組織移植拒否反応の治療、予防及び管理に使用する医薬組成物の製造において製薬上許容し得る1種以上の賦形剤又はアジュバントを含む医薬組成物の使用。

【請求項41】

前記免疫-アレルギー疾患が、気管支ぜんそく、アレルギー性鼻炎、乾癬又はクローン病である、請求項40記載の使用。

【請求項42】

前記自己免疫疾患が、全身性エリテマトーデス、自己免疫性甲状腺炎、関節リウマチ、糖尿病、多発性硬化症又は実験的自己免疫性脳脊髄炎である、請求項40記載の使用。

【請求項43】

前記臓器又は組織移植拒絶反応が、腎拒絶反応、骨髄拒絶反応、皮膚移植片拒絶反応、心臓移植片拒絶反応又は慢性移植片対宿主疾病である、請求項40記載の使用。

【請求項44】

前記化合物が、式IIで示される請求項1記載の化合物。

【請求項45】

前記ポリアルキレングリコールポリマーが、ポリイソプロピレングリコールである、請求項44記載の化合物。

【請求項46】

$n$ が、5-75の整数である、請求項45記載の化合物。

【請求項47】

$n$ が、7、12、17、34及び69からなる群から選ばれる、請求項45記載の化合物。

【請求項48】

請求項44～47のいずれか1項記載の化合物を1種以上含む組成物。

【請求項49】

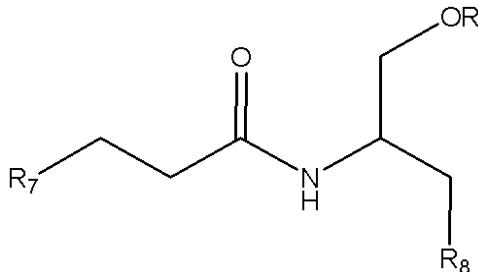
活性成分としての請求項44～47のいずれか1項記載の1種以上の化合物を、1種以上の製薬上許容し得る賦形剤又はアジュバントと一緒に含む医薬組成物。

【請求項50】

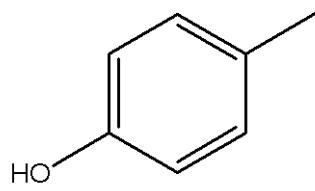
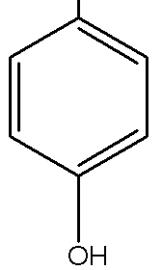
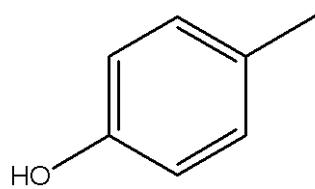
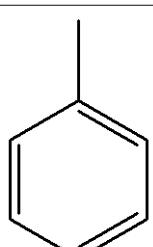
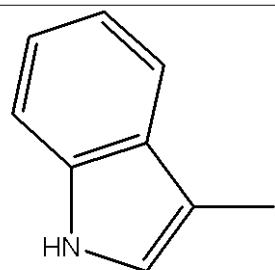
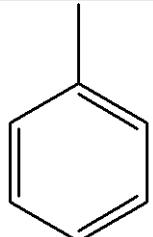
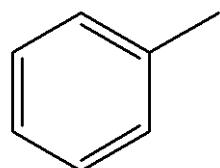
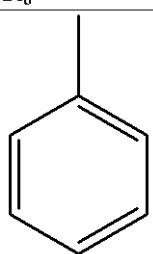
経口又は非経口投与用に調製した、請求項49記載の医薬組成物。

【請求項51】

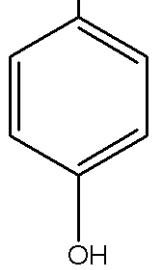
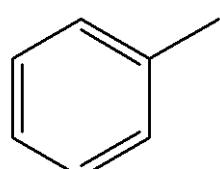
ヒト及び動物用途における免疫-アレルギー疾患又は自己免疫疾患の治療又は臓器又は組織移植拒絶反応の治療、予防及び管理に使用する医薬組成物であって、前記組成物が、式II、



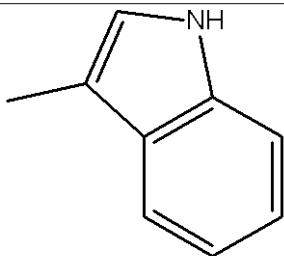
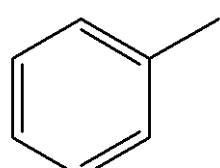
(式中、Rは、n単位を有するポリアルキレングリコールポリマーであり、nは、1-100の整数であり、またR<sub>7</sub>及びR<sub>8</sub>は、以下に示される組み合わせの式

R<sub>7</sub>R<sub>8</sub>

OH



OH



で表される基である。 )

の構造で示される化合物又はその塩又は水和物を含むことを特徴とする組成物。

【請求項 5 2】

前記免疫-アレルギー疾患が、気管支ぜんそく、アレルギー性鼻炎、乾癬又はクローン病である、請求項51記載の医薬組成物。

【請求項53】

前記自己免疫疾患が、全身性エリテマトーデス、自己免疫性甲状腺炎、関節リウマチ、糖尿病、多発性硬化症又は実験的自己免疫性脳脊髄炎である、請求項51記載の医薬組成物。

【請求項54】

前記臓器又は組織移植拒絶反応が、腎拒絶反応、骨髄拒絶反応、皮膚移植片拒絶反応、心臓移植片拒絶反応又は慢性移植片対宿主疾病である、請求項51記載の医薬組成物。

【請求項55】

ヒト及び動物用途における免疫-アレルギー疾患又は自己免疫疾患又は臓器又は組織移植拒否反応の治療、予防及び管理に使用する医薬組成物の製造における請求項51記載の医薬組成物の使用。

【請求項56】

前記免疫-アレルギー疾患が、気管支ぜんそく、アレルギー性鼻炎、乾癬又はクローン病である、請求項55記載の使用。

【請求項57】

前記自己免疫疾患が、全身性エリテマトーデス、自己免疫性甲状腺炎、関節リウマチ、糖尿病、多発性硬化症又は実験的自己免疫性脳脊髄炎である、請求項55記載の使用。

【請求項58】

前記臓器又は組織移植拒絶反応が、腎拒絶反応、骨髄拒絶反応、皮膚移植片拒絶反応、心臓移植片拒絶反応又は慢性移植片対宿主疾病である、請求項55記載の使用。