

【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20年3月6日(2008.3.6)

【公表番号】特表2007-523209(P2007-523209A)

【公表日】平成19年8月16日(2007.8.16)

【年通号数】公開・登録公報2007-031

【出願番号】特願2007-500232(P2007-500232)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/085 (2006.01)

A 6 1 P 3/14 (2006.01)

A 6 1 P 15/12 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

G 0 1 N 33/68 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/085

A 6 1 P 3/14

A 6 1 P 15/12

A 6 1 P 19/10

G 0 1 N 33/68

【手続補正書】

【提出日】平成20年1月16日(2008.1.16)

【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

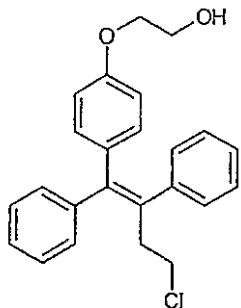
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

骨代謝回転が増加した個体において骨粗鬆症を治療または予防する方法であって、下記の構造式(I)の化合物、あるいはその幾何異性体、立体異性体、薬剤的に許容される塩、エステルまたは代謝産物である治療的活性化合物を有効量、前記個体に投与する工程を含み、前記骨代謝回転の増加が、骨吸収および骨形成が正常値よりも少なくとも5%、好ましくは少なくとも10%高いことであることを特徴とする方法。

## 【化1】



(I)

## 【請求項1】

前記化合物(1)がオスペミフェンであることを特徴とする請求項1記載の方法。

## 【請求項2】

前記個体が閉経後の女性であることを特徴とする請求項1記載の方法。

## 【請求項3】

前記個体が閉経後の女性であることを特徴とする請求項1記載の方法。

## 【請求項4】

前記個体が、

a)マーカーとして尿中で測定したタイプIコラーゲンのアミノ末端テロペプチドを使用して(U-NTX)、少なくとも65nmol/mmol Creaの骨吸収、および/またはマーカーとして尿中で測定したタイプIコラーゲンのカルボキシ末端テロペプチドを使用して(U-CTX)、少なくとも680マイクログラム/mmol Creaの骨吸収、および

b)マーカーとして血清中で測定したタイプIプロコラーゲンのカルボキシ末端プロペプチドを使用して(S-PICP)、少なくとも170マイクログラム/lの骨形成、および/またはマーカーとして血清中で測定したタイプIプロコラーゲンのアミノ末端プロペプチドを使用して(S-PINP)、少なくとも84マイクログラム/lの骨形成、

を有することを特徴とする請求項1記載の方法。

## 【請求項5】

前記骨吸収が、U-NTXとして測定して、少なくとも70nmol/mmol Creaであり、前記骨形成が、S-PICPとして測定して、少なくとも180マイクログラム/lであることを特徴とする請求項4記載の方法。

## 【請求項6】

前記骨吸収が、U-NTXとして測定して、少なくとも80nmol/mmol Creaであることを特徴とする請求項5記載の方法。

## 【請求項7】

前記骨吸収が、血清から測定したクロスラップ(Crosslaps)をマーカーとして使用して測定されることを特徴とする請求項1記載の方法。

## 【請求項8】

前記骨吸収が、血清から測定したTRAP5bをマーカーとして使用して測定されることを特徴とする請求項1記載の方法。

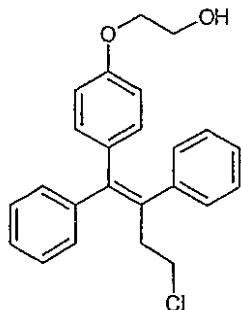
## 【請求項9】

前記骨吸収が、いずれも血清から測定したクロスラップおよびTRAP5bの組合せをマーカーとして使用して測定されることを特徴とする請求項1記載の方法。

## 【請求項 10】

下記の構造式(I)の化合物、あるいはその幾何異性体、立体異性体、薬剤的に許容される塩、エステルまたは代謝産物である治療的活性化合物を、骨代謝回転が増加した個体における骨粗鬆症の治療または予防に有用な薬剤を製造するために使用する方法であって、前記骨代謝回転の増加が、骨吸収および骨形成が正常値よりも少なくとも5%、好ましくは少なくとも10%高いことであることを特徴とする方法。

## 【化2】



(I)

## 【請求項 11】

前記化合物(I)がオスペミフェンであることを特徴とする請求項10記載の方法。

## 【請求項 12】

前記個体が閉経後の女性であることを特徴とする請求項10記載の方法。

## 【請求項 13】

前記個体が、

a)マーカーとして尿中で測定したタイプIコラーゲンのアミノ末端テロペプチドを使用して(U-NTX)、少なくとも65nmol/mmol Creaの骨吸収、および/またはマーカーとして尿中で測定したタイプIコラーゲンのカルボキシ末端テロペプチドを使用して(U-CTX)、少なくとも680マイクログラム/mmol Creaの骨吸収、および

b)マーカーとして血清中で測定したタイプIプロコラーゲンのカルボキシ末端プロペプチドを使用して(S-PICP)、少なくとも170マイクログラム/lの骨形成、および/またはマーカーとして血清中で測定したタイプIプロコラーゲンのアミノ末端プロペプチドを使用して(S-PINP)、少なくとも84マイクログラム/lの骨形成、

を有することを特徴とする請求項10記載の方法。

## 【請求項 14】

前記骨吸収が、U-NTXとして測定して、少なくとも70nmol/mmol Creaであり、前記骨形成が、S-PICPとして測定して、少なくとも180マイクログラム/lであることを特徴とする請求項13記載の方法。

## 【請求項 15】

前記骨吸収が、U-NTXとして測定して、少なくとも80nmol/mmol Creaであることを特徴とする請求項14記載の方法。

## 【請求項 16】

前記骨吸収が、血清から測定したクロスラップをマーカーとして使用して測定されることを特徴とする請求項10記載の方法。

## 【請求項 17】

前記骨吸収が、血清から測定したTRAP5bをマーカーとして使用して測定されることを特徴とする請求項10記載の方法。

## 【請求項 18】

前記骨吸収が、いずれも血清から測定したクロスラップおよびTRAP5bの組合せをマーカ

－として使用して測定されることを特徴とする請求項10記載の方法。