

【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27年7月23日(2015.7.23)

【公表番号】特表2014-530191(P2014-530191A)

【公表日】平成26年11月17日(2014.11.17)

【年通号数】公開・登録公報2014-063

【出願番号】特願2014-530804(P2014-530804)

【国際特許分類】

A 6 1 K	31/575	(2006.01)
A 6 1 P	19/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/10	(2006.01)
A 6 1 P	19/08	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 K	38/00	(2006.01)
A 6 1 L	15/44	(2006.01)
A 6 1 L	27/00	(2006.01)
A 6 1 L	17/00	(2006.01)
A 6 1 L	29/00	(2006.01)
A 6 1 K	9/70	(2006.01)
A 6 1 K	9/00	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	31/575	
A 6 1 P	19/00	
A 6 1 P	19/10	
A 6 1 P	19/08	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 K	37/02	
A 6 1 L	15/03	
A 6 1 L	27/00	F
A 6 1 L	17/00	
A 6 1 L	29/00	B
A 6 1 K	9/70	
A 6 1 K	9/70	4 0 1
A 6 1 K	9/00	

【手続補正書】

【提出日】平成27年6月3日(2015.6.3)

【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】

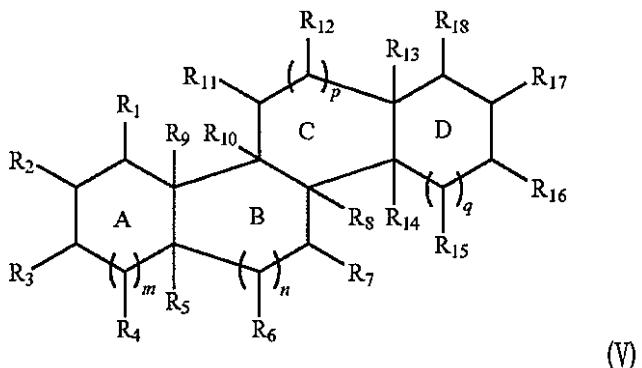
【特許請求の範囲】

【請求項1】

骨疾患の治療または破断骨の治療において使用するための、少なくとも1種の陽イオン性ステロイド性抗微生物薬(CSA)または薬学的に許容されるその塩を含む組成物。

【請求項2】

C S A が、式 (V) の化合物または薬学的に許容されるその塩：  
【化 1】



[ 式中、

環 A、B、C および D は、独立に、飽和または完全もしくは部分的不飽和であり、但し、環 A、B、C および D の少なくとも 2 つは飽和であり、

m、n、p および q は、独立に 0 または 1 であり、

$R_1$  から  $R_4$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$ 、 $R_{15}$ 、 $R_{16}$  および  $R_{18}$  は、水素、ヒドロキシル、置換または非置換アルキル、置換または非置換ヒドロキシアルキル、置換または非置換アルキルオキシアルキル、置換または非置換アルキルカルボキシアルキル、置換または非置換アルキルアミノアルキル、置換または非置換アルキルアミノアルキルアミノアルキルアミノ、置換または非置換アルキルアミノアルキルアミノアルキルアミノ、置換または非置換アミノアルキル、置換または非置換アリール、置換または非置換アリールアミノアルキル、置換または非置換ハロアルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、オキソ、第二のステロイドに結合しているリンカーベース、置換または非置換アミノアルキルオキシ、置換または非置換アミノアルキルオキシアルキル、置換または非置換アミノアルキルカルボキシ、置換または非置換アミノアルキルアミノカルボニル、置換または非置換アミノアルキルカルボキサミド、置換または非置換ジ(アルキル)アミノアルキル、置換または非置換 C - カルボキシアルキル、 $H_2N - HC(Q_5) - C(O) - O -$ 、 $H_2N - HC(Q_5) - C(O) - N(H) -$ 、置換または非置換アジドアルキルオキシ、置換または非置換シアノアルキルオキシ、 $P.G. - HN - HC(Q_5) - C(O) - O -$ 、置換または非置換グアニジノアルキルオキシ、置換または非置換第四級アンモニウムアルキルカルボキシ、および置換または非置換グアニジノアルキルカルボキシからなる群から独立に選択され、 $Q_5$  は、任意のアミノ酸の側鎖(グリシンの側鎖、すなわち H を含む)であり、 $P.G.$  は、アミノ保護基であり、

$R_5$ 、 $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{13}$ 、 $R_{14}$  および  $R_{17}$  は、独立に、環 A、B、C もしくは D の 1 つが不飽和であるとき、その部位の炭素原子の原子価が満たされるように欠損しており、または  $R_5$ 、 $R_8$ 、 $R_9$ 、 $R_{10}$ 、 $R_{13}$  および  $R_{14}$  は、水素、ヒドロキシル、置換または非置換アルキル、置換または非置換ヒドロキシアルキル、置換または非置換アルキルオキシアルキル、置換または非置換アミノアルキル、置換または非置換アリール、置換または非置換ハロアルキル、置換または非置換アルケニル、置換または非置換アルキニル、オキソ、第二のステロイドに結合しているリンカーベース、置換または非置換アミノアルキルオキシ、置換または非置換アミノアルキルカルボキシ、置換または非置換アミノアルキルアミノカルボニル、置換または非置換ジ(アルキル)アミノアルキル、置換または非置換 C - カルボキシアルキル、 $H_2N - HC(Q_5) - C(O) - O -$ 、 $H_2N - HC(Q_5) - C(O) - N(H) -$ 、アジドアルキルオキシ、シアノアルキルオキシ、 $P.G. - HN - HC(Q_5) - C(O) - O -$ 、グアニジノアルキルオキシ、およびグアニジノアルキルカルボキシからなる群から独立に選択され、 $Q_5$  は、任意のアミノ酸の側鎖であり、 $P.G.$  は、アミノ保護基であり、

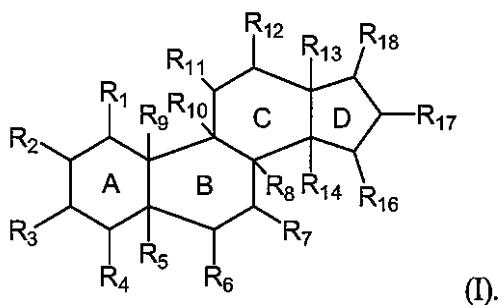
但し、 $R_1 \sim 4$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_{11}$ 、 $R_{12}$ 、 $R_{15}$ 、 $R_{16}$ 、 $R_{17}$  および  $R_{18}$  の少なくとも 2 つまたは 3 つは、置換または非置換アミノアルキル、置換または非置換アミ

ノアルキルオキシ、置換または非置換アルキルカルボキシアルキル、置換または非置換アルキルアミノアルキルアミノ、置換または非置換アルキルアミノアルキルアミノアルキルアミノ、置換または非置換アミノアルキルカルボキシ、置換または非置換アリールアミノアルキル、置換または非置換アミノアルキルオキシアミノアルキルアミノカルボニル、置換または非置換アミノアルキルアミノカルボニル、置換または非置換アミノアルキルカルボキシアミド、第四級アンモニウムアルキルカルボキシ、置換または非置換ジ(アルキル)アミノアルキル、置換または非置換C-カルボキシアルキル、H<sub>2</sub>N-HC(Q<sub>5</sub>)-C(O)-O-、H<sub>2</sub>N-HC(Q<sub>5</sub>)-C(O)-N(H)-、アジドアルキルオキシ、シアノアルキルオキシ、P.G.-HN-HC(Q<sub>5</sub>)-C(O)-O-、置換または非置換グアニジノアルキルオキシ、および置換または非置換グアニジノアルキルカルボキシからなる群から独立に選択される]である、請求項1に記載の組成物。

**【請求項3】**

C S Aまたは薬学的に許容されるその塩が、式(I)の化合物：

**【化2】**



[式中、環A、B、CおよびDが、独立に飽和である]

から選択される、請求項1または2に記載の組成物。

**【請求項4】**

R<sub>3</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>12</sub>およびR<sub>18</sub>が、水素、非置換(C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>)アルキル、非置換(C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>)ヒドロキシアルキル、非置換(C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>)アルキルオキシ-(C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>)アルキル、非置換(C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>)アルキルカルボキシ-(C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>)アルキル、非置換(C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>)アルキルアミノ-(C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>)アルキル、非置換(C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>)アルキルアミノ-(C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>)アルキルアミノ、非置換(C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>)アミノアルキル、非置換アリールアミノ-(C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>)アルキル、非置換(C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>)アミノアルキルオキシ、非置換(C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>)アミノアルキルカルボキシ、非置換(C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>)アミノアルキルアミノカルボニル、非置換(C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>)アミノアルキルカルボキサミド、非置換ジ(C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>アルキル)アミノアルキル、非置換C-カルボキシ(C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>)アルキル、非置換(C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>)グアニジノアルキルオキシ、非置換(C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>)第四級アンモニウムアルキルカルボキシ、および非置換(C<sub>1</sub>~C<sub>18</sub>)グアニジノアルキルカルボキシからなる群から独立に選択され、

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub>、R<sub>11</sub>、R<sub>13</sub>、R<sub>14</sub>、R<sub>15</sub>、R<sub>16</sub>およびR<sub>17</sub>が、水素および非置換(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキルからなる群から独立に選択される、

請求項1から3のいずれか一項に記載の組成物。

**【請求項5】**

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>8</sub>、R<sub>10</sub>、R<sub>11</sub>、R<sub>14</sub>、R<sub>16</sub>およびR<sub>17</sub>が、それぞれ水素であり、R<sub>9</sub>およびR<sub>13</sub>が、それぞれメチルである、請求項1から4のいずれか一項に記載の組成物。

**【請求項6】**

$R_3$ 、 $R_7$ および $R_{1-2}$ が、アミノアルキルオキシおよびアミノアルキルカルボキシからなる群から独立に選択され、

$R_{1-8}$ が、アルキルアミノアルキル、アルコキシカルボニルアルキル、アルキルカルボニルオキシアルキル、ジ(アルキル)アミノアルキル、C-カルボキシアルキル、アルキルアミノアルキル、アルキオキシカルボニルアルキル、およびアルキルカルボキシアルキルからなる群から選択される。

請求項1から5のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項7】

$R_3$ 、 $R_7$ および $R_{1-2}$ が同じである、請求項1から6のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項8】

$R_{1-8}$ が、アルキルアミノアルキル、アルコキシカルボニルアルキル、ジ(アルキル)アミノアルキル、またはアルキルカルボキシアルキルである、請求項1から7のいずれか一項に記載の組成物。

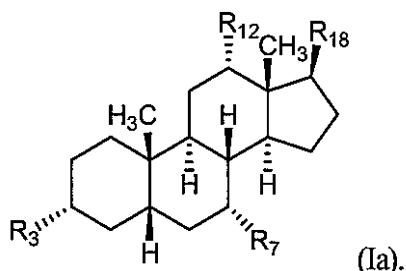
【請求項9】

$R_3$ 、 $R_7$ 、 $R_{1-2}$ および $R_{1-8}$ が、アミノ-C<sub>3</sub>-アルキルオキシ、アミノ-C<sub>3</sub>-アルキル-カルボキシ、C<sub>8</sub>-アルキルアミノ-C<sub>5</sub>-アルキル、C<sub>8</sub>-アルコキシ-カルボニル-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>8</sub>-アルキル-カルボニル-C<sub>4</sub>-アルキル、ジ-(C<sub>5</sub>-アルキル)アミノ-C<sub>5</sub>-アルキル、C-カルボキシ-カルボニル-C<sub>4</sub>-アルキル、C<sub>1-3</sub>-アルキルアミノ-C<sub>5</sub>-アルキル、C<sub>6</sub>-アルコキシ-カルボニル-C<sub>4</sub>-アルキル、およびC<sub>6</sub>-アルキル-カルボキシ-C<sub>4</sub>-アルキルからなる群から独立に選択される、請求項1から8のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項10】

C S Aまたは薬学的に許容されるその塩が、式(Ia)の化合物：

【化3】

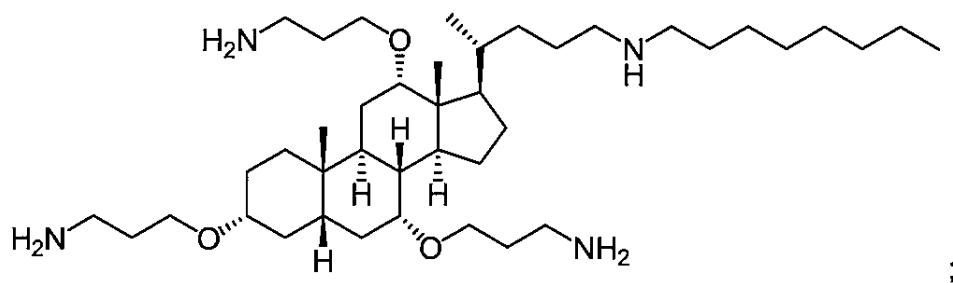


から選択される、請求項1から9のいずれか一項に記載の組成物。

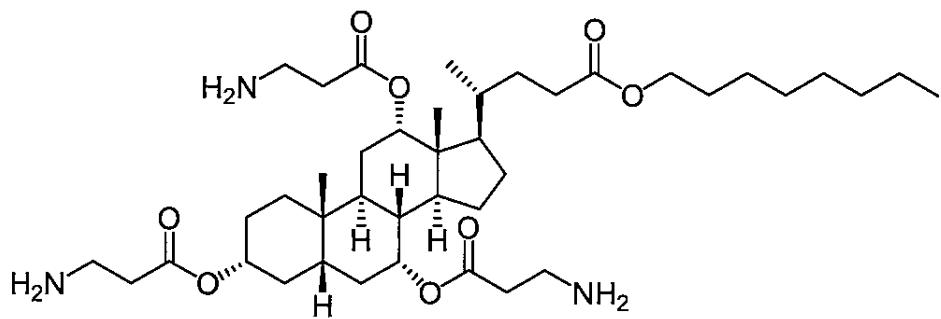
【請求項11】

C S Aまたは薬学的に許容されるその塩が、

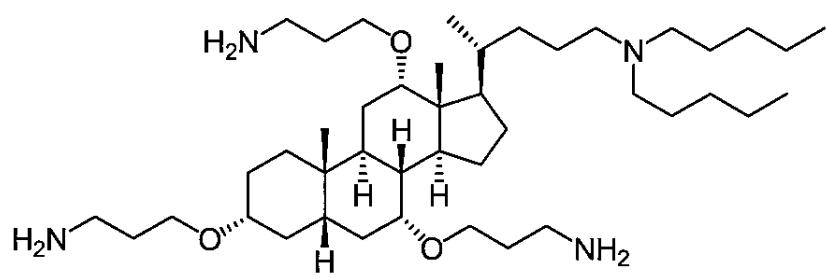
【化4】



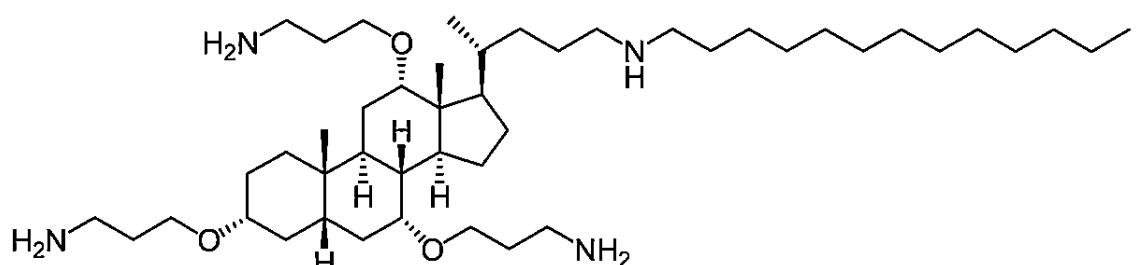
;



;

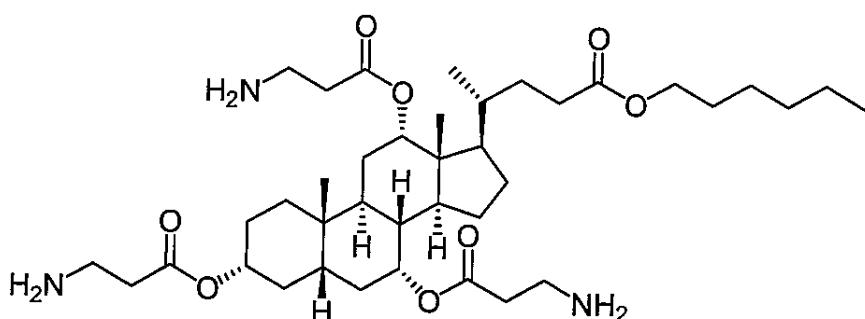


;



;

および



からなる群から選択される、請求項1から10のいずれか一項に記載の組成物。

**【請求項 1 2】**

薬学的に許容される塩が塩酸塩または三塩酸塩である、請求項1から1\_1のいずれか一項に記載の組成物。

**【請求項 1 3】**

請求項1から1\_2のいずれか一項に記載の組成物；及び

B M P - 2 または r h B M P - 2 のような少なくとも 1 種の成長因子から選択される少なくとも 1 種の他の成分、薬学的に許容されるデバイス、またはインプラントを含むキット。

**【請求項 1 4】**

薬学的に許容されるデバイスが、包帯、縫合剤、ガーゼ、粘着性ストリップ、外科用ステープラー、クリップ、止血鉗子、子宮内デバイス、縫合糸、トロカール、カテーテル、管、およびインプラントからなる群から選択される、請求項1\_3に記載のキット。

**【請求項 1 5】**

インプラントが、ピル、ペレット、ロッド、スクリュー、ウェーハ、ディスク、スポンジ、およびタブレットからなる群から選択される、請求項1\_3または1\_4に記載のキット。