

【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10月21日(2010.10.21)

【公表番号】特表2010-504994(P2010-504994A)

【公表日】平成22年2月18日(2010.2.18)

【年通号数】公開・登録公報2010-007

【出願番号】特願2009-530553(P2009-530553)

【国際特許分類】

C 07 C	401/00	(2006.01)
C 07 F	7/18	(2006.01)
A 61 K	31/695	(2006.01)
A 61 K	31/592	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)
A 61 P	35/02	(2006.01)
A 61 P	17/00	(2006.01)
A 61 P	25/00	(2006.01)
A 61 P	3/10	(2006.01)
A 61 P	37/06	(2006.01)
A 61 P	29/00	(2006.01)
A 61 P	19/02	(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	19/08	(2006.01)
A 61 P	3/04	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
A 61 P	3/06	(2006.01)

【F I】

C 07 C	401/00	C S P
C 07 F	7/18	W
A 61 K	31/695	
A 61 K	31/592	
A 61 P	35/00	
A 61 P	35/02	
A 61 P	17/00	
A 61 P	25/00	
A 61 P	3/10	
A 61 P	37/06	
A 61 P	29/00	1 0 1
A 61 P	19/02	
A 61 P	11/06	
A 61 P	1/04	
A 61 P	17/16	
A 61 P	19/08	
A 61 P	3/04	
A 61 P	43/00	1 0 5
A 61 P	3/06	

【手続補正書】

【提出日】平成22年9月6日(2010.9.6)

【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

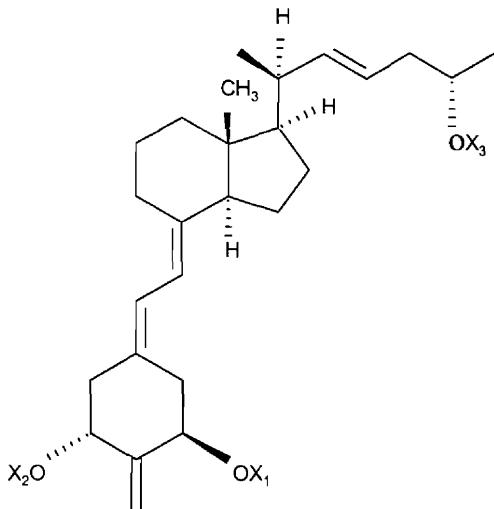
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式を有する化合物：



式中、 $X_1$ 、 $X_2$ 、および $X_3$ は同じでも異なっていてもよく、それぞれが水素またはヒドロキシ保護基より選択される。

【請求項2】

$X_3$ が水素である、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

$X_1$ が水素である、請求項1記載の化合物。

【請求項4】

$X_1$ 、 $X_2$ 、および $X_3$ が全て $t$ -ブチルジメチルシリルである、請求項1記載の化合物。

【請求項5】

薬学的に許容される賦形剤と共に、少なくとも1種類の請求項1記載の化合物の有効量を含む、薬学的組成物。

【請求項6】

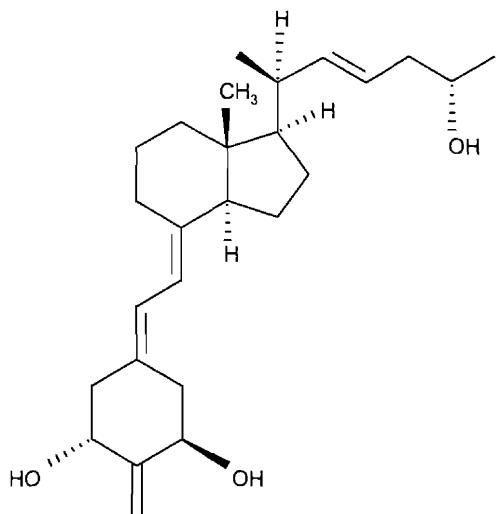
有効量が、組成物1グラムあたり約0.01 $\mu$ g～約1000 $\mu$ gを含む、請求項5記載の薬学的組成物。

【請求項7】

有効量が、組成物1グラムあたり約0.1 $\mu$ g～約500 $\mu$ gを含む、請求項5記載の薬学的組成物。

【請求項8】

下記式



を有する、2-メチレン-(20S,25S)-19,27-ジノル-(22E)-1,25-ジヒドロキシビタミンD<sub>3</sub>。

**【請求項9】**

薬学的に許容される賦形剤と共に、有効量の2-メチレン-(20S,25S)-19,27-ジノル-(22E)-1,25-ジヒドロキシビタミンD<sub>3</sub>を含む、薬学的組成物。

**【請求項10】**

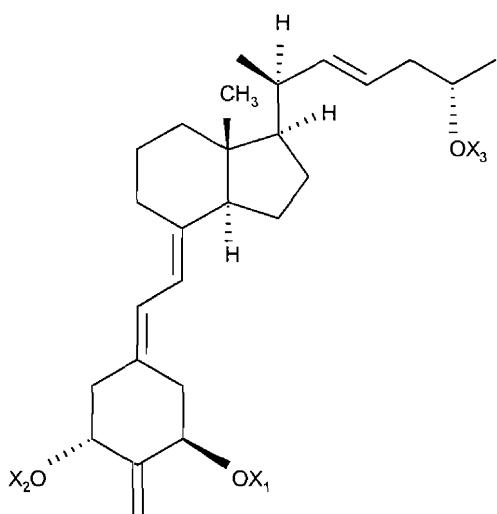
有効量が、組成物1グラムあたり約0.01μg～約1000μgを含む、請求項9記載の薬学的組成物。

**【請求項11】**

有効量が、組成物1グラムあたり約0.1μg～約500μgを含む、請求項9記載の薬学的組成物。

**【請求項12】**

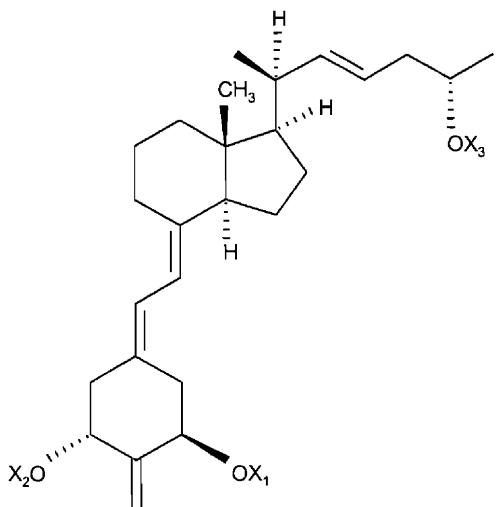
下記式を有する化合物の有効量を含む、乾癬を治療するための薬学的組成物：



式中、X<sub>1</sub>、X<sub>2</sub>、およびX<sub>3</sub>は同じでも異なっていてもよく、それぞれが水素またはヒドロキシ保護基より選択される。

**【請求項13】**

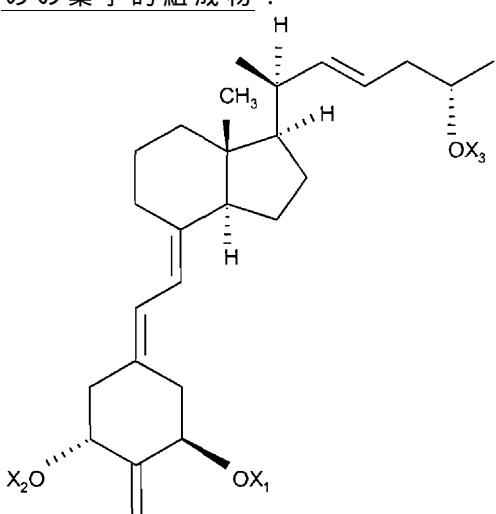
下記式を有する化合物の有効量を含む、白血病、大腸癌、乳癌、皮膚癌、または前立腺癌からなる群より選択される疾患を治療するための薬学的組成物：



式中、 $X_1$ 、 $X_2$ 、および $X_3$ は同じでも異なっていてもよく、それぞれが水素またはヒドロキシ保護基より選択される。

### 【請求項 14】

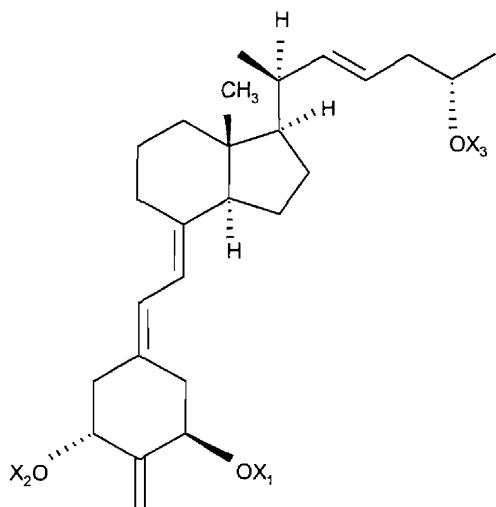
下記式を有する化合物の有効量を含む、多発性硬化症、狼瘡、真性糖尿病、宿主対移植片反応、および臓器移植の拒絶反応からなる群より選択される自己免疫疾患を治療するための薬学的組成物：



式中、 $X_1$ 、 $X_2$ 、および $X_3$ は同じでも異なっていてもよく、それぞれが水素またはヒドロキシ保護基より選択される。

### 【請求項 15】

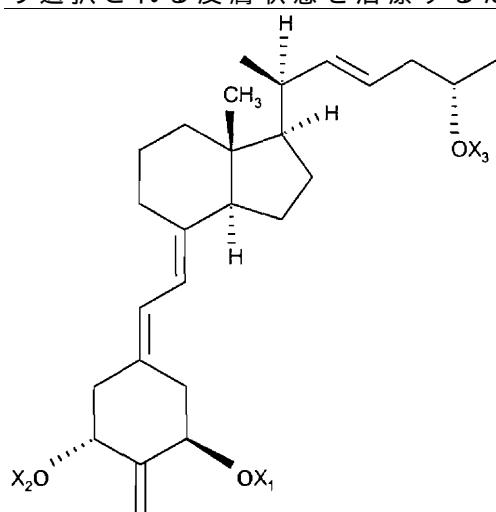
下記式を有する化合物の有効量を該疾患を含む、関節リウマチ、喘息、および炎症性腸疾患からなる群より選択される炎症性疾患を治療するための薬学的組成物：



式中、 $X_1$ 、 $X_2$ 、および $X_3$ は同じでも異なっていてもよく、それぞれが水素またはヒドロキシ保護基より選択される。

**【請求項 1 6】**

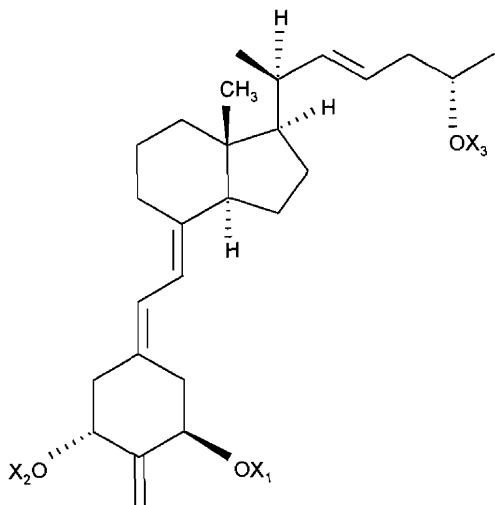
下記式を有する化合物の有効量を含む、しわ、十分な皮膚弾力 (skin firmness) の欠如、十分な皮膚水分 (dermal hydration) の欠如、および不十分な皮脂分泌からなる群より選択される皮膚状態を治療するための薬学的組成物：



式中、 $X_1$ 、 $X_2$ 、および $X_3$ は同じでも異なっていてもよく、それぞれが水素またはヒドロキシ保護基より選択される。

**【請求項 1 7】**

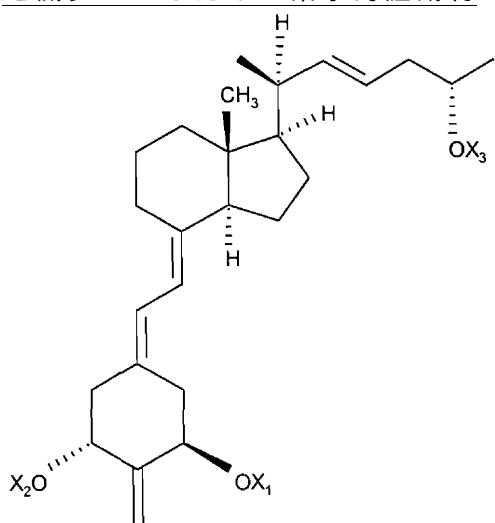
下記式を有する化合物の有効量を含む、腎性骨形成異常を治療するための薬学的組成物：



式中、 $X_1$ 、 $X_2$ 、および $X_3$ は同じでも異なっていてもよく、それぞれが水素またはヒドロキシ保護基より選択される。

**【請求項 18】**

下記式を有する化合物の有効量を含む、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：



式中、 $X_1$ 、 $X_2$ 、および $X_3$ は同じでも異なっていてもよく、それぞれが水素またはヒドロキシ保護基より選択される。

**【手続補正 2】**

**【補正対象書類名】**明細書

**【補正対象項目名】**0016

**【補正方法】**変更

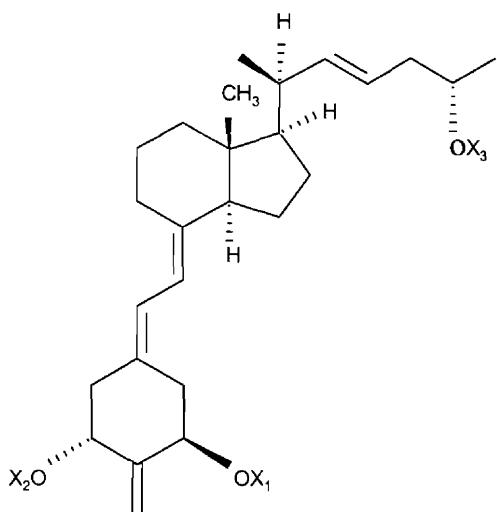
**【補正の内容】**

**【0016】**

一種または複数種の本化合物は、上述の疾患および障害を治療するための組成物中に組成物1gあたり約0.01  $\mu$ g～約1000  $\mu$ g、好ましくは組成物1gあたり約0.1  $\mu$ g～約500  $\mu$ gの量で存在し得、かつ、約0.01  $\mu$ g/日～約1000  $\mu$ g/日、好ましくは約0.1  $\mu$ g/日～約500  $\mu$ g/日の投与量で局所投与、経皮投与、経口投与、直腸投与、経鼻投与、舌下投与、または非経口投与され得る。

**【請求項101】**

下記式を有する化合物：



式中、 $X_1$ 、 $X_2$ 、および $X_3$ は同じでも異なっていてもよく、それぞれが水素またはヒドロキシ保護基より選択される。

## 〔請求項102〕

X<sub>3</sub>が水素である、請求項101記載の化合物。

[請求項103]

X<sub>1</sub>が水素である、請求項101記載の化合物。

[請求項104]

$X_1$ 、 $X_2$ 、および $X_3$ が全てt-ブチルジメチルシリルである、請求項101記載の化合物。

## 〔請求項105〕

薬学的に許容される賦形剤と共に、少なくとも1種類の請求項101記載の化合物の有効量を含む、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0.01μg～約1000μgを含む、請求項105記載の薬学的組成物。

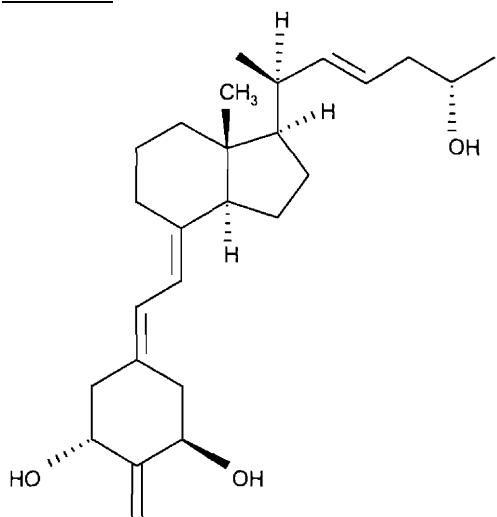
[請求項107]

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

[請求項108]

下記式

10 of 10



を有する、2-メチレン-(20S,25S)-19,27-ジノル-(22E)-1,25-ジヒドロキシビタミンD<sub>3</sub>

一 請求項1001

薬学的に許容される賦形剤と共に、有効量の2-メチレン-(20S,25S)-19,27-ジノル-(22E)-1,25-ジヒドロキシビタミンD<sub>3</sub>を含む、薬学的組成物。

[請求項110]

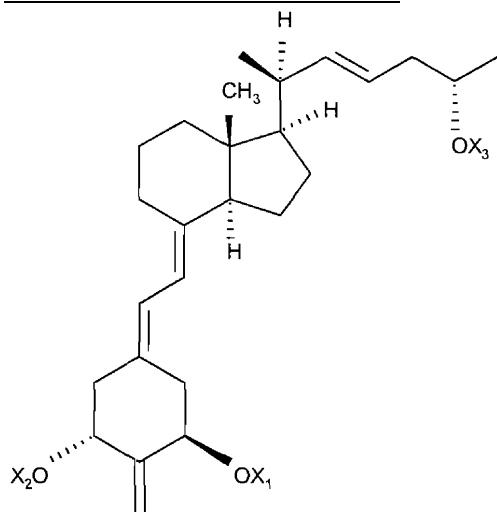
有効量が、組成物1グラムあたり約0.01 μg～約1000 μgを含む、請求項109記載の薬学的組成物。

[請求項111]

有効量が、組成物1グラムあたり約0.1 μg～約500 μgを含む、請求項109記載の薬学的組成物。

[請求項112]

乾癬を治療する方法であって、下記式を有する化合物の有効量を乾癬を有する被験体に投与する工程を含む、方法：



式中、X<sub>1</sub>、X<sub>2</sub>、およびX<sub>3</sub>は同じでも異なっていてもよく、それぞれが水素またはヒドロキシ保護基より選択される。

[請求項113]

化合物が経口投与される、請求項112記載の方法。

[請求項114]

化合物が非経口投与される、請求項112記載の方法。

[請求項115]

化合物が経皮投与される、請求項112記載の方法。

[請求項116]

化合物が局所投与される、請求項112記載の方法。

[請求項117]

化合物が直腸投与される、請求項112記載の方法。

[請求項118]

化合物が経鼻投与される、請求項112記載の方法。

[請求項119]

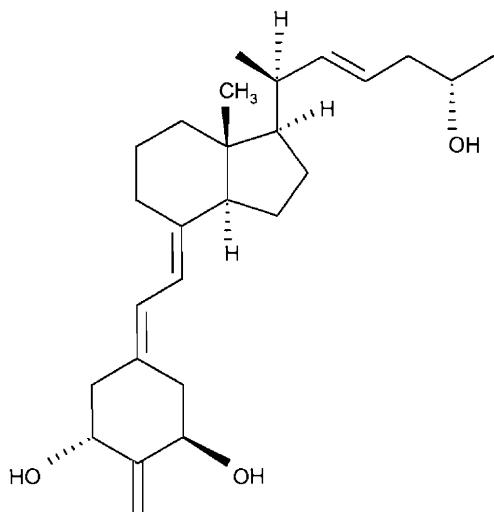
化合物が舌下投与される、請求項112記載の方法。

[請求項120]

化合物が約0.01 μg/日～約1000 μg/日の投与量で投与される、請求項112記載の方法。

[請求項121]

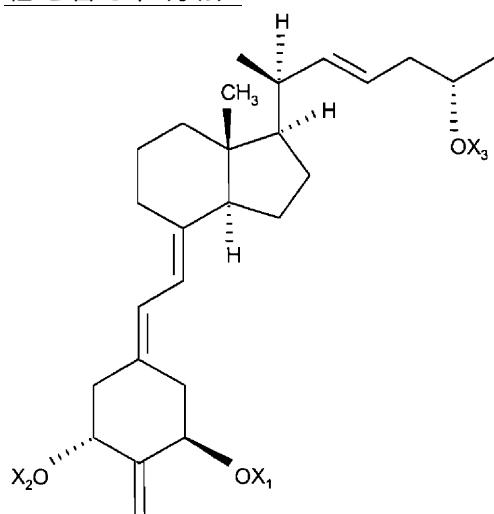
化合物が、下記式



を有する2-メチレン-(20S,25S)-19,27-ジノル-(22E)-1,25-ジヒドロキシビタミンD<sub>3</sub>である、請求項112記載の方法。

[請求項122]

白血病、大腸癌、乳癌、皮膚癌、または前立腺癌からなる群より選択される疾患を治療する方法であって、下記式を有する化合物の有効量を該疾患を有する被験体に投与する工程を含む、方法：



式中、X<sub>1</sub>、X<sub>2</sub>、およびX<sub>3</sub>は同じでも異なっていてもよく、それぞれが水素またはヒドロキシ保護基より選択される。

[請求項123]

化合物が経口投与される、請求項122記載の方法。

[請求項124]

化合物が非経口投与される、請求項122記載の方法。

[請求項125]

化合物が経皮投与される、請求項122記載の方法。

[請求項126]

化合物が直腸投与される、請求項122記載の方法。

[請求項127]

化合物が経鼻投与される、請求項122記載の方法。

[請求項128]

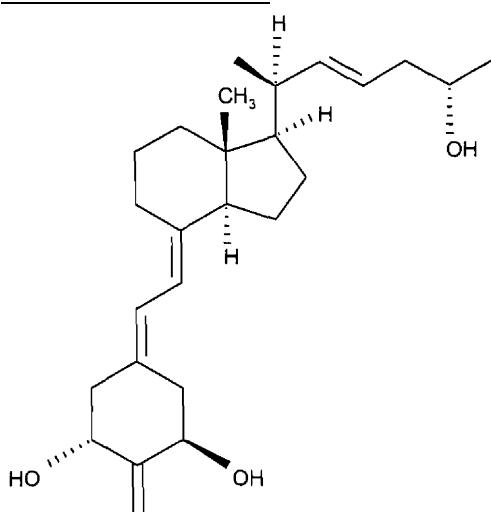
化合物が舌下投与される、請求項122記載の方法。

[請求項129]

化合物が約0.01μg/日～約1000μg/日の投与量で投与される、請求項122記載の方法。

## [請求項130]

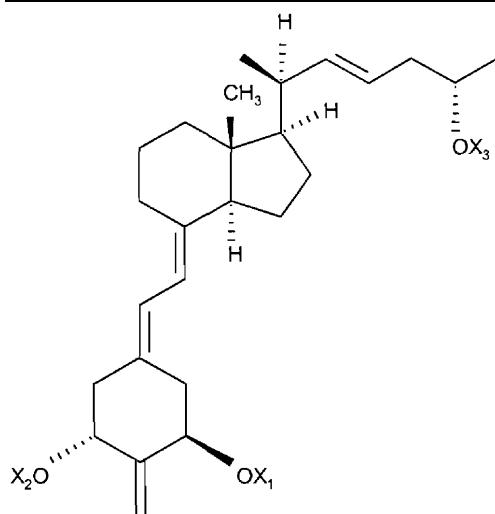
化合物が、下記式



を有する2-メチレン-(20S,25S)-19,27-ジノル-(22E)-1<sub>1</sub>,25-ジヒドロキシビタミンD<sub>3</sub>である、請求項122記載の方法。

## [請求項131]

多発性硬化症、狼瘡、真性糖尿病、宿主対移植片反応、および臓器移植の拒絶反応からなる群より選択される自己免疫疾患を治療する方法であって、下記式を有する化合物の有効量を該疾患を有する被験体に投与する工程を含む、方法：



式中、X<sub>1</sub>、X<sub>2</sub>、およびX<sub>3</sub>は同じでも異なっていてもよく、それぞれが水素またはヒドロキシ保護基より選択される。

## [請求項132]

化合物が経口投与される、請求項131記載の方法。

## [請求項133]

化合物が非経口投与される、請求項131記載の方法。

## [請求項134]

化合物が経皮投与される、請求項131記載の方法。

## [請求項135]

化合物が直腸投与される、請求項131記載の方法。

## [請求項136]

化合物が経鼻投与される、請求項131記載の方法。

## [請求項137]

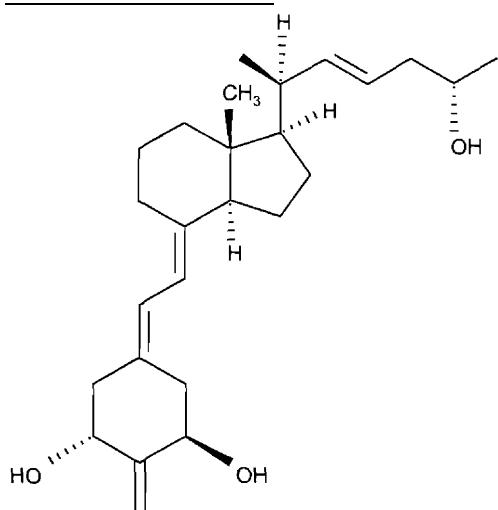
化合物が舌下投与される、請求項131記載の方法。

## [請求項138]

化合物が約0.01 μg/日～約1000 μg/日の投与量で投与される、請求項131記載の方法。

## [請求項139]

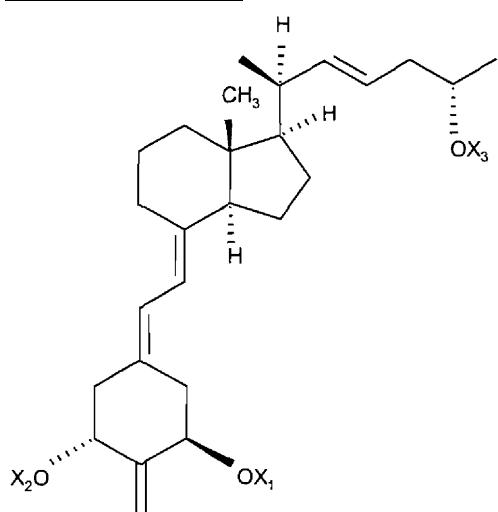
化合物が、下記式



を有する2-メチレン-(20S,25S)-19,27-ジノル-(22E)-1,25-ジヒドロキシビタミンD<sub>3</sub>である、請求項131記載の方法。

## [請求項140]

関節リウマチ、喘息、および炎症性腸疾患からなる群より選択される炎症性疾患を治療する方法であって、下記式を有する化合物の有効量を該疾患を有する被験体に投与する工程を含む、方法：



式中、X<sub>1</sub>、X<sub>2</sub>、およびX<sub>3</sub>は同じでも異なっていてもよく、それぞれが水素またはヒドロキシ保護基より選択される。

## [請求項141]

化合物が経口投与される、請求項140記載の方法。

## [請求項142]

化合物が非経口投与される、請求項140記載の方法。

## [請求項143]

化合物が経皮投与される、請求項140記載の方法。

## [請求項144]

化合物が直腸投与される、請求項140記載の方法。

## [請求項145]

化合物が経鼻投与される、請求項140記載の方法。

## [請求項146]

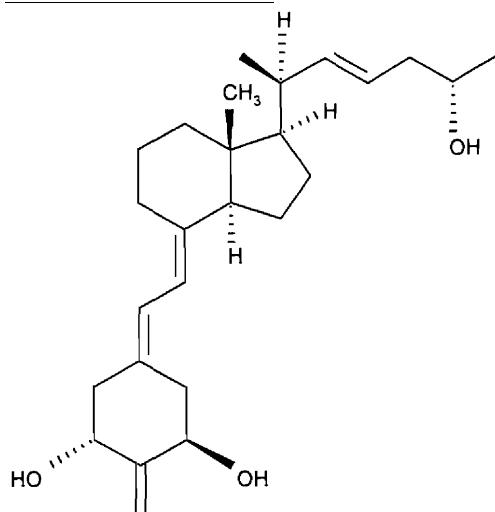
化合物が舌下投与される、請求項140記載の方法。

## [請求項147]

化合物が約0.01 μg/日～約1000 μg/日の投与量で投与される、請求項140記載の方法。

## [請求項148]

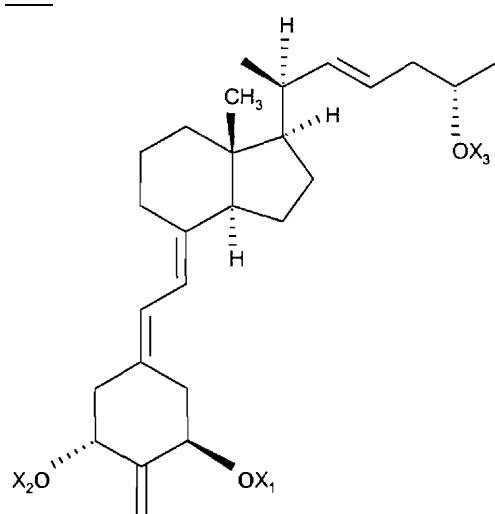
化合物が、下記式



を有する2-メチレン-(20S,25S)-19,27-ジノル-(22E)-1,25-ジヒドロキシビタミンD<sub>3</sub>である、請求項140記載の方法。

## [請求項149]

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、および不十分な皮脂分泌からなる群より選択される皮膚状態を治療する方法であって、下記式を有する化合物の有効量を該皮膚状態を有する被験体に投与する工程を含む、方法：



式中、X<sub>1</sub>、X<sub>2</sub>、およびX<sub>3</sub>は同じでも異なっていてもよく、それぞれが水素またはヒドロキシ保護基より選択される。

## [請求項150]

化合物が経口投与される、請求項149記載の方法。

## [請求項151]

化合物が非経口投与される、請求項149記載の方法。

## [請求項152]

化合物が経皮投与される、請求項149記載の方法。

## [請求項153]

化合物が局所投与される、請求項149記載の方法。

[請求項154]

化合物が直腸投与される、請求項149記載の方法。

[請求項155]

化合物が経鼻投与される、請求項149記載の方法。

[請求項156]

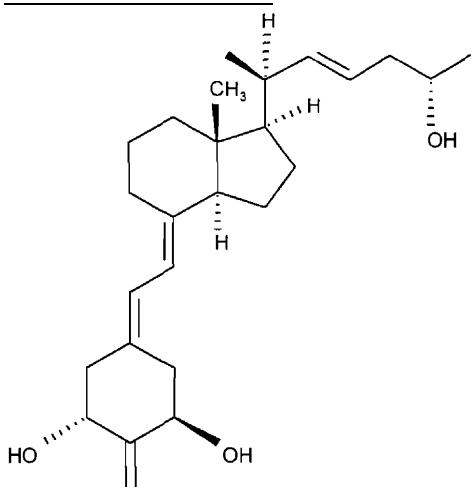
化合物が舌下投与される、請求項149記載の方法。

[請求項157]

化合物が約0.01 μg/日～約1000 μg/日の投与量で投与される、請求項149記載の方法。

[請求項158]

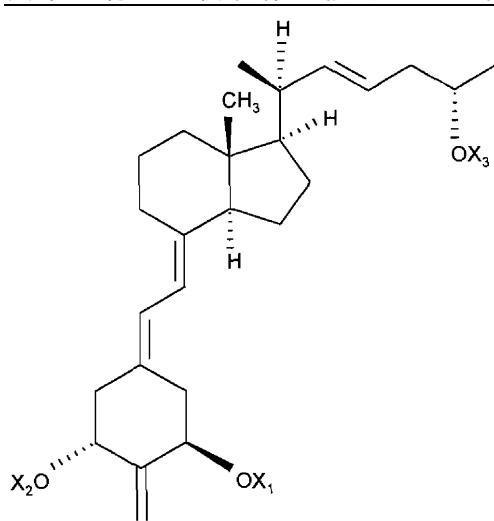
化合物が、下記式



を有する2-メチレン-(20S,25S)-19,27-ジノル-(22E)-1,25-ジヒドロキシビタミンD<sub>3</sub>である、請求項149記載の方法。

[請求項159]

腎性骨形成異常を治療する方法であって、下記式を有する化合物の有効量を腎性骨形成異常を有する被験体に投与する工程を含む、方法：



式中、X<sub>1</sub>、X<sub>2</sub>、およびX<sub>3</sub>は同じでも異なっていてもよく、それぞれが水素またはヒドロキシ保護基より選択される。

[請求項160]

化合物が経口投与される、請求項159記載の方法。

[請求項161]

化合物が非経口投与される、請求項159記載の方法。

[請求項162]

化合物が経皮投与される、請求項159記載の方法。

[請求項163]

化合物が直腸投与される、請求項159記載の方法。

[請求項164]

化合物が経鼻投与される、請求項159記載の方法。

[請求項165]

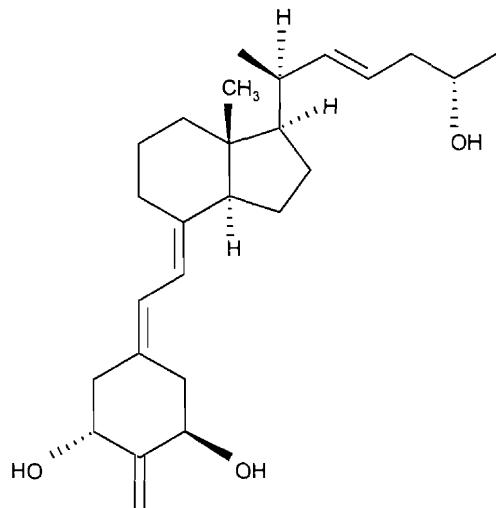
化合物が舌下投与される、請求項159記載の方法。

[請求項166]

化合物が約0.01 μg/日～約1000 μg/日の投与量で投与される、請求項159記載の方法。

[請求項167]

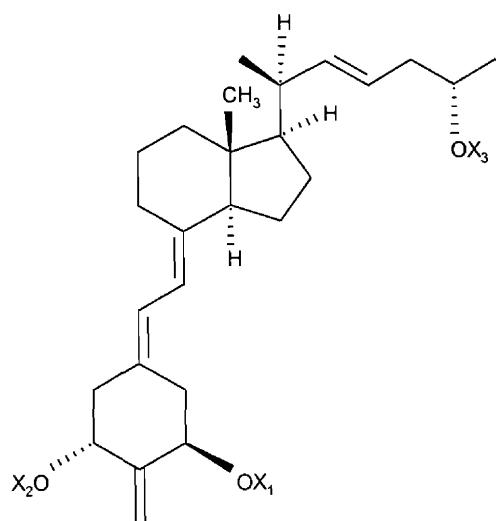
化合物が、下記式



を有する2-メチレン-(20S,25S)-19,27-ジノル-(22E)-1,25-ジヒドロキシビタミンD<sub>3</sub>である、請求項159記載の方法。

[請求項168]

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であって、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工程を含む、方法：



式中、X<sub>1</sub>、X<sub>2</sub>、およびX<sub>3</sub>は同じでも異なっていてもよく、それぞれが水素またはヒドロキシ保護基より選択される。

[請求項169]

化合物が経口投与される、請求項168記載の方法。

[請求項170]

化合物が非経口投与される、請求項168記載の方法。

[請求項171]

化合物が経皮投与される、請求項168記載の方法。

[請求項172]

化合物が直腸投与される、請求項168記載の方法。

[請求項173]

化合物が経鼻投与される、請求項168記載の方法。

[請求項174]

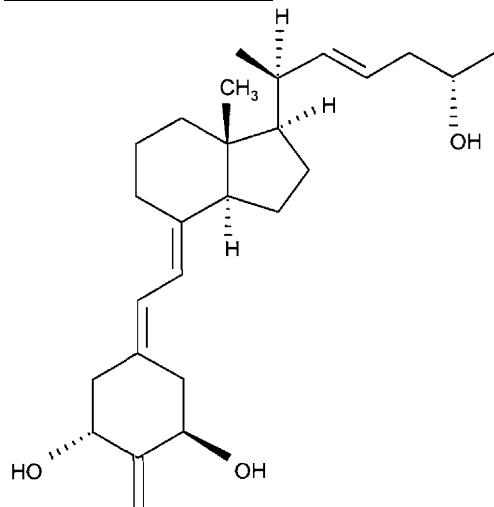
化合物が舌下投与される、請求項168記載の方法。

[請求項175]

化合物が、約0.01 μg/日～約1000 μg/日の投与量で投与される、請求項168記載の方法。

[請求項176]

化合物が、下記式



を有する2-メチレン-(20S,25S)-19,27-ジノル-(22E)-1,25-ジヒドロキシビタミンD<sub>3</sub>である、請求項168記載の方法。

[請求項177]

動物がヒトである、請求項168記載の方法。

[請求項178]

動物がペットである、請求項168記載の方法。

[請求項179]

動物が家畜である、請求項168記載の方法。