

【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9月28日(2006.9.28)

【公表番号】特表2005-536531(P2005-536531A)

【公表日】平成17年12月2日(2005.12.2)

【年通号数】公開・登録公報2005-047

【出願番号】特願2004-527368(P2004-527368)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/706 (2006.01)

A 6 1 K 47/32 (2006.01)

A 6 1 P 27/14 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

C 0 7 H 15/04 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/706

A 6 1 K 47/32

A 6 1 P 27/14

A 6 1 P 37/06

C 0 7 H 15/04 B

【手続補正書】

【提出日】平成18年8月8日(2006.8.8)

【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】

約0.01%～約0.1%のマクロライド化合物を含有する眼アレルギー処置の為の眼科用組成物。

【請求項2】

該眼アレルギーがアレルギー性結膜炎である、請求項1記載の眼科用組成物。

【請求項3】

該マクロライド化合物を約0.03%～約0.06%含有する、請求項1又は2記載の眼科用組成物。

【請求項4】

該マクロライド化合物を約0.03%含有する、請求項3記載の眼科用組成物。

【請求項5】

該マクロライド化合物がFK506である、請求項1記載の眼科用組成物。

【請求項6】

点眼剤である、請求項1記載の眼科用組成物。

【請求項7】

該点眼剤がさらにポリビニルアルコールを含有する、請求項6記載の眼科用組成物。

【請求項8】

該点眼剤が約0.03%の該マクロライド化合物を含有する、請求項7記載の眼科用組成物。

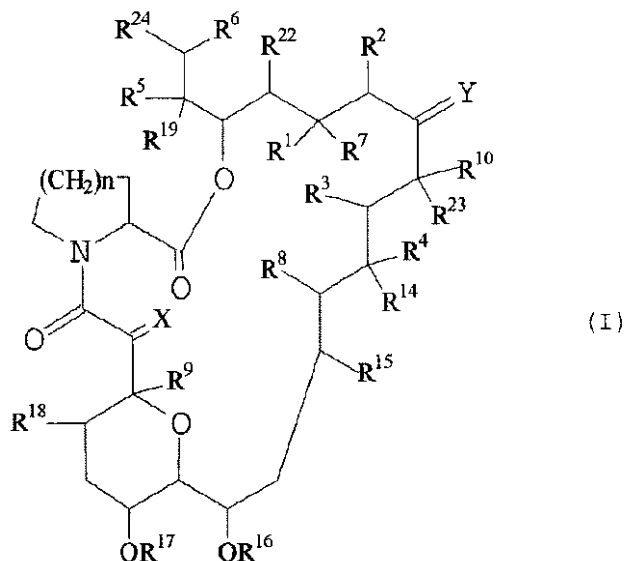
【請求項 9】

該点眼剤が 1 日あたり約 1 回～約 4 回投与される、請求項 8 記載の眼科用組成物。

【請求項 10】

該マクロライド化合物が、下記式 (I) を有する化合物またはその医薬上許容され得る塩である、請求項 1～9 のいずれか 1 項に記載の眼科用組成物：

【化 3】



(式中、 R^1 および R^2 、 R^3 および R^4 、ならびに R^5 および R^6 の隣接する対は、各々独立して、

a) 2 つの隣接する水素原子からなる (R^2 は任意にアルキルである)、または

b) 該対のそれぞれに結合している炭素原子どうしの間でもうひとつの結合を形成してもよく；

R^7 は水素原子、ヒドロキシ、アルキルオキシ、あるいは保護されたヒドロキシであるか、または R^1 と共になってオキソを形成してもよく；

R^8 および R^9 は各々独立して、水素原子またはヒドロキシを表わし；

R^{10} は水素原子、アルキル、1 以上のヒドロキシによって置換されたアルキル、アルケニル、1 以上のヒドロキシによって置換されたアルケニル、またはオキソによって置換されたアルキルであり；

X はオキソ、(水素原子、ヒドロキシ)、(水素原子、水素原子)、または式 $-CH_2O-$ で表わされる基であり；

Y はオキソ、(水素原子、ヒドロキシ)、(水素原子、水素原子)、または式 $N-NR^{11}R^{12}$ もしくは $N-OR^{13}$ で表わされる基であり；

R^{11} および R^{12} は各々独立して水素原子、アルキル、アリールまたはトシルを表わし；

R^{13} 、 R^{14} 、 R^{15} 、 R^{16} 、 R^{17} 、 R^{18} 、 R^{19} 、 R^{22} および R^{23} は各々独立して水素原子またはアルキルを表わし；

R^{24} は、任意に置換されていてもよい、1 以上の複素原子を含み得る環であり；および

n は 1 または 2 を表わす。

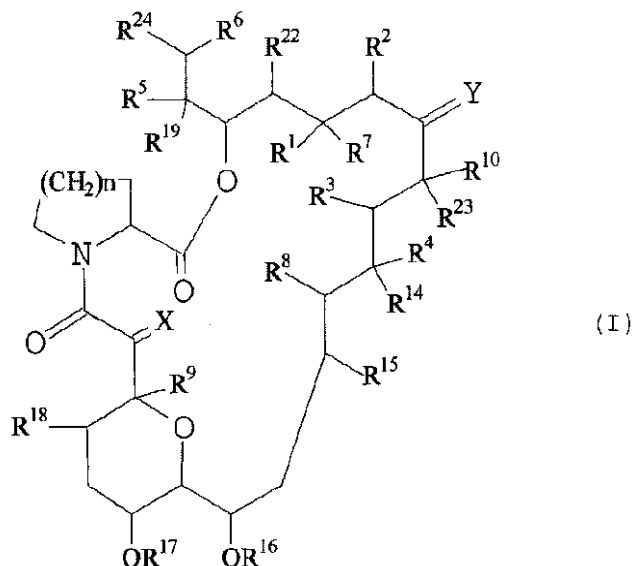
【請求項 11】

該マクロライド化合物が下記構造を有する、請求項 10 記載の眼科用組成物：

[illegible]

該マクロライド化合物が、下記式（Ⅰ）を有する化合物またはその医薬上許容され得る塩である、請求項 12 ~ 20 のいずれか 1 項に記載の使用：

【化 5】



(式中、R¹ および R²、R³ および R⁴、ならびに R⁵ および R⁶ の隣接する対は、各々独立して、

a) 2つの隣接する水素原子からなる (R² は任意にアルキルである)、または

b) 該対のそれぞれに結合している炭素原子どうしの間でもうひとつの結合を形成してもよく;

R⁷ は水素原子、ヒドロキシ、アルキルオキシ、あるいは保護されたヒドロキシであるか、または R¹ と共になってオキソを形成してもよく;

R⁸ および R⁹ は各々独立して、水素原子またはヒドロキシを表わし;

R¹⁰ は水素原子、アルキル、1以上のヒドロキシによって置換されたアルキル、アルケニル、1以上のヒドロキシによって置換されたアルケニル、またはオキソによって置換されたアルキルであり;

Xはオキソ、(水素原子、ヒドロキシ)、(水素原子、水素原子)、または式 -CH₂O- で表わされる基であり;

Yはオキソ、(水素原子、ヒドロキシ)、(水素原子、水素原子)、または式 N-NR¹¹R¹² もしくは N-OR¹³ で表わされる基であり;

R¹¹ および R¹² は各々独立して水素原子、アルキル、アリールまたはトシルを表わし;

R¹³、R¹⁴、R¹⁵、R¹⁶、R¹⁷、R¹⁸、R¹⁹、R²² および R²³ は各々独立して水素原子またはアルキルを表わし;

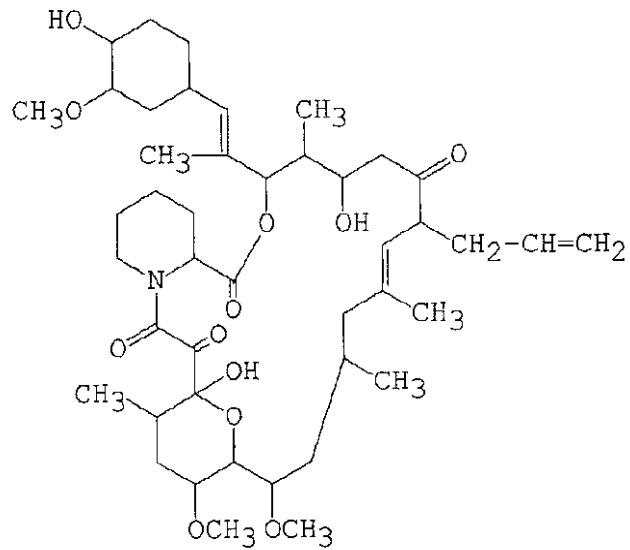
R²⁴ は、任意に置換されていてもよい、1以上の複素原子を含み得る環であり; および

n は 1 または 2 を表わす。

【請求項 22】

該マクロライド化合物が下記構造を有する化合物である、請求項 21 記載の使用:

【化 6】



【請求項 2 3】

請求項 1 ~ 1 1 のいずれか 1 項に記載の眼科用組成物及びそれとともに記載物（該記載物は該組成物をアレルギー性結膜炎に使用し得るか使用すべきであることを記載している）を含む商業的パッケージ。