

【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21年5月28日(2009.5.28)

【公表番号】特表2008-535873(P2008-535873A)
 【公表日】平成20年9月4日(2008.9.4)
 【年通号数】公開・登録公報2008-035
 【出願番号】特願2008-505738(P2008-505738)
 【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)
 A 6 1 P 37/02 (2006.01)
 A 6 1 P 17/00 (2006.01)
 A 6 1 K 31/137 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/00
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 P 37/02
 A 6 1 P 17/00
 A 6 1 K 31/137

【手続補正書】

【提出日】平成21年4月8日(2009.4.8)

【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

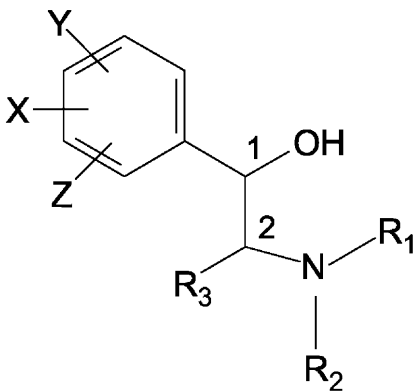
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

亜急性皮膚エリテマトーデス、慢性皮膚エリテマトーデス、円板状エリテマトーデス、ループス脂肪組織炎、および深在性エリテマトーデスより選択される皮膚型エリテマトーデスの局所的治療を受けている個体の皮膚への局所投与用の皮膚科学的薬物の調製のための、 β_2 -アドレナリン受容体作動薬の使用であって、 β_2 -アドレナリン受容体作動薬が、その立体異性体、その生理学的に許容される誘導体、およびその薬学的に許容される塩を含め、構造式Iによって定義される、使用：



式中、Z、X、およびYが、H；置換型のC₁₋₆-アルキル、C₄₋₆-シクロアルキル、C₂₋₆-アル

ケニル、 C_{2-6} -アルキニル、 C_{1-6} -アルコキシル、フェニル、 C_{7-14} アルカリル、および C_{7-14} アルクヘテロシクリル； OR' 、 CN 、 $NH-CO-NH_2$ 、 $NH-CO$ 、トリハロゲンメチル、ハロゲン、 OH 、 OR' 、 NH_2 、 NHR' 、 $NR'R''$ 、 CO 、 $CO-R'$ 、 HSO_2 、 $R'-SO_2$ 、 $NH-SO_2-R'$ からなる群より選択される遊離基を独立に指定し、かつ Z 、 X 、および Y から選択される基のうち2つが一緒になって、五員もしくは六員の炭素環または1つの窒素原子(N)を環内に有する炭素環を形成し；

R_1 および R_2 が、 H 、 C_{1-6} -アルキル、 C_{4-6} -シクロアルキル、 C_{2-6} -アルケニル、 C_{2-6} -アルキニル、 C_{1-6} -アルコキシル、 C_{7-14} アルカリル、 C_{7-14} アルクヘテロシクリルからなる群より選択される遊離基を独立に指定し、かつ R_1 および R_2 が一緒になって、五員もしくは六員の炭素環または1つの窒素原子(N)を環内に有する炭素環を形成し；

R_3 が、 H 、ハロゲン、 C_{1-6} -アルキル、 C_{4-6} -シクロアルキル、 C_{2-6} -アルケニル、および C_{2-6} -アルキニルからなる群より選択される遊離基を指定し；

基 C_{1-6} -アルキル、 C_{4-6} -シクロアルキル、 C_{2-6} -アルケニル、 C_{2-6} -アルキニル、 C_{1-6} -アルコキシル、 C_{7-14} アルカリル、および C_{7-14} アルクヘテロシクリルが、 NH_2 、 NHR' 、 $NR'R''$ 、 OH 、シアノ、ニトロ、およびハロゲンによって一置換または二置換されており；かつ R' および R'' が、 C_{1-6} -アルキル、 C_{4-6} -シクロアルキル、 C_{2-6} -アルケニル、 C_{2-6} -アルキニル、 C_{1-6} -アルコキシル、 C_{7-14} アルカリル、および C_{7-14} アルクヘテロシクリルからなる群より選択される遊離基を独立に指定し、かつ構造式Iの炭素原子 C_1 が、R配置を有する不斉炭素原子を指定する。

【請求項2】

構造式Iのフェニル環が非置換型、一置換型、または二置換型のフェニル環を定義し、 Z および Y が同じであっても異なってもよく、 X がヒドリドであり、かつ Z および X が請求項1に定義された通りである、請求項1記載の使用。

【請求項3】

R' および R'' が、 C_{1-6} -アルキル、 C_{4-6} -シクロアルキル、 C_{2-6} -アルケニル、 C_{2-6} -アルキニル、および C_{1-6} -アルコキシルからなる群より選択される遊離基を指定する、請求項1記載の使用。

【請求項4】

2 -アドレナリン受容体作動薬が、アミテロール；バメタン；ビトルテロール；ブタキシミン；カルブテロール；シマテロール；コルテロール；クレンプテロール；クロルプレナリン；コルテロール；デテレノール；ジオキセテドリン；エタフェドリン；エチルノルエピネフリン；フェノテロール；インダカテロール；イソプロテレノール；マブテロール；メルアドリン；ナルデテロール；ノルブドリン；ノルエピネフリン；オルシプレナリン；ピクメテロール；ピルブテロール；キンプレナリン；レプロテロール；サルブタモール；サルメテロール；ソテレノール；スルホンテロール；テルブタリン；ツロブテロール；ジントロール；およびそれらの薬学的に許容される塩からなる群より選択される、請求項1記載の使用。

【請求項5】

2 -アドレナリン受容体作動薬が、フレロブテロール、フォルモテロール、ヘキサプレナリン、イソエタリン、プロカテロール、プロトキロール、リミテロール、サルメフェモール、およびジルパテロール、ならびにそれらの薬学的に許容される塩からなる群より選択される 2 -アドレナリン受容体作動薬の、ジアステレオマー的に純粋なまたはジアステレオマー的に富化されたRS異性体またはRR異性体として提供される、請求項1記載の使用。

【請求項6】

2 -アドレナリン受容体作動薬が、サルブタモール、テルブタリン、およびそれらの薬学的に許容される塩からなる群より選択される、請求項1記載の使用。

【請求項7】

2 -アドレナリン受容体作動薬が、R-サルブタモールまたはその薬学的に許容される塩である、請求項1記載の使用。

【請求項 8】

β_2 -アドレナリン受容体作動薬が、薬物の調製に用いるための単独の治療的有効薬剤である、前記請求項のいずれか一項記載の使用。

【請求項 9】

薬物がステロイドをさらに含まないことを条件とする、請求項1~8のいずれか一項記載の使用。

【請求項 10】

薬物がアミノ糖をさらに含まないことを条件とする、請求項1~8のいずれか一項記載の使用。

【請求項 11】

皮膚型エリテマトーデスが亜急性皮膚エリテマトーデスである、請求項1記載の使用。

【請求項 12】

皮膚型エリテマトーデスが円板状エリテマトーデスである、請求項1記載の使用。

【請求項 13】

皮膚に対する局所投与用の薬物が、 β_2 -アドレナリン受容体作動薬を、重量比で0.01~10%の範囲にある量で含む、請求項1記載の使用。

【請求項 14】

皮膚に対する局所投与用の薬物が、 β_2 -アドレナリン受容体作動薬を、重量比で0.05~5%の範囲にある量で含む、請求項1記載の使用。

【請求項 15】

皮膚に対する局所投与用の薬物が、 β_2 -アドレナリン受容体作動薬を、重量比で0.2~5%の範囲にある量で含む、請求項1記載の使用。

【請求項 16】

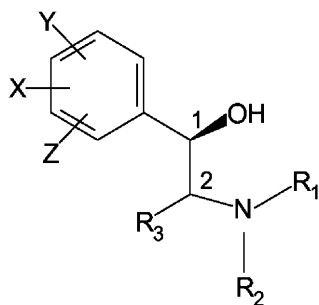
皮膚に対する局所投与用の薬物が、 β_2 -アドレナリン受容体作動薬を、重量比で0.2~2.5%の範囲にある量で含む、請求項1記載の使用。

【請求項 17】

皮膚に対する局所投与用の薬物が、 β_2 -アドレナリン受容体作動薬を、重量比で0.5%または1%の量で含む、請求項1記載の使用。

【請求項 18】

治療的有効成分として、式IIによる β_2 -アドレナリン受容体作動薬またはその薬学的に許容される塩を含む、皮膚の局所的治療のための、罹患した皮膚領域に対する投与用に製剤化された、皮膚科学的に投与可能な薬学的組成物であって、



II

式中、 C_1 の炭素原子がR配置を有する不斉炭素を指定し；Z、Y、X、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R' 、 R'' が請求項1に定義された通りであり；かつ、1つまたは複数の皮膚科学的に許容される賦形剤または担体をさらに含み、 β_2 -アドレナリン受容体作動薬が、重量比で0.05~5%の範囲にある量である、

薬学的組成物。

【請求項 19】

β_2 -アドレナリン受容体作動薬が、アミテロール、バメタン、ビトルテロール、ブタキシミン、カルブテロール、シマテロール、コルテロール、クレンブテロール、クロルプレ

ナリン、コルテロール、デテレノール、ジオキセテドリン、エタフェドリン、エチルノルエピネフリン、フェノテロール、インダカテロール、イソプロテレノール、マブテロール、メルアドリン、ナルデテロール、ノルブドリン、ノルエピネフリン、オルシブレナリン、ピクメテロール、ピルブテロール、キンブレナリン、レプロテロール、サルブタモール、サルメテロール、ソテレノール、スルホンテロール、テルブタリン、ツロブテロール、ジントロール、およびそれらの薬学的に許容される塩の、鏡像異性的に純粋なまたは鏡像異性的に富化されたR鏡像異性体から選択される、請求項18記載の組成物。

【請求項20】

β_2 -アドレナリン受容体作動薬が、フレロブテロール、フォルモテロール、ヘキソブレナリン、イソエタリン、プロカテロール、プロトキロール、リミテロール、サルメフェロール、ジルパテロール、およびそれらの薬学的に許容される塩から選択される β_2 -アドレナリン受容体作動薬の、ジアステレオマー的に純粋なまたはジアステレオマー的に富化されたRR異性体またはRS異性体から選択される、請求項18記載の組成物。

【請求項21】

β_2 -アドレナリン受容体作動薬が、R-サルブタモールまたはその薬学的に許容される塩である、請求項18記載の組成物。

【請求項22】

β_2 -アドレナリン受容体作動薬が、重量比で0.2~5%の範囲にある量にある、請求項18記載の組成物。

【請求項23】

β_2 -アドレナリン受容体作動薬が、重量比で0.5%、1.0%、1.5%、2.0%、または2.5%の量にある、請求項18記載の組成物。

【請求項24】

組成物が、エマルション、クレーム、ゲル、リニメント、軟膏、泥膏、または泡状体の形態である、請求項18記載の組成物。

【請求項25】

組成物が、エマルションの形態である、請求項18記載の組成物。

【請求項26】

組成物が、水中油型エマルションまたは油中水型エマルションの形態である、請求項18記載の組成物。

【請求項27】

組成物が、親水性相を30%よりも多く含む水中油型エマルションである、請求項25記載の組成物。

【請求項28】

組成物が、ゲルの形態である、請求項18記載の組成物。

【請求項29】

組成物が、泡状体の形態である、請求項18記載の組成物。

【請求項30】

組成物が、皮膚用の局所噴霧剤の形態である、請求項18記載の組成物。

【請求項31】

実質的な量の副腎皮質ステロイドをさらに含まないことを条件とする、請求項18~30のいずれか一項記載の組成物。

【請求項32】

β_2 -アドレナリン受容体作動薬が組成物中の単独の治療的有效成分である、請求項18~30のいずれか一項記載の組成物。