

【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19年9月27日(2007.9.27)

【公表番号】特表2003-509369(P2003-509369A)
 【公表日】平成15年3月11日(2003.3.11)
 【出願番号】特願2001-523001(P2001-523001)

【国際特許分類】

C 0 7 D 409/04 (2006.01)
A 6 1 K 9/08 (2006.01)
A 6 1 K 9/10 (2006.01)
A 6 1 K 9/12 (2006.01)
A 6 1 K 31/4535 (2006.01)
A 6 1 K 45/00 (2006.01)
A 6 1 P 1/00 (2006.01)
A 6 1 P 1/04 (2006.01)
A 6 1 P 1/14 (2006.01)
A 6 1 P 11/00 (2006.01)
A 6 1 P 11/06 (2006.01)
A 6 1 P 11/08 (2006.01)
A 6 1 P 17/00 (2006.01)
A 6 1 P 17/04 (2006.01)
A 6 1 P 27/02 (2006.01)
A 6 1 P 27/16 (2006.01)
A 6 1 P 29/00 (2006.01)
A 6 1 P 37/08 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 409/04
 A 6 1 K 9/08
 A 6 1 K 9/10
 A 6 1 K 9/12
 A 6 1 K 31/4535
 A 6 1 K 45/00
 A 6 1 P 1/00
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 1/14
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 11/06
 A 6 1 P 11/08
 A 6 1 P 17/00
 A 6 1 P 17/04
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 27/16
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 37/08
 C 0 7 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成19年8月9日(2007.8.9)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

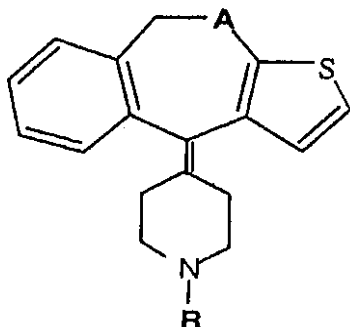
【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 構造：



[式中、Aは -CO- 又は -CHOH- であり、RはCH₃又はHである、但し、RがCH₃であるならば、Aは -CO- ではなく、化合物がラセミ化合物である場合に、RがHであるならば、Aは -CO- ではなく、化合物がラセミ化合物である場合に、RがCH₃であるならば、Aは -CHOH- ではなく、化合物がラセミ化合物である場合に、RがHであるならば、Aは -CHOH- ではない]

の化合物、その立体化学的異性体形及びジアステレオマー、並びにそれらの製薬的に受容される塩及び溶媒和物。

【請求項2】 RがHであり、Aが -CO- であり、化合物がR - 立体配置である、請求項1記載の化合物。

【請求項3】 RがHであり、Aが -CO- であり、化合物がS - 立体配置である、請求項1記載の化合物。

【請求項4】 RがMeであり、Aが -CHOH- であり、前記立体化学的異性体形がR, R -, R, S -, S, R - 及びS, S - 立体配置から成る群から選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項5】 RがHであり、Aが -CHOH- であり、前記立体化学的異性体形がR, R -, R, S -, S, R - 及びS, S - 立体配置から成る群から選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項6】 RがHであり、Aが -CO- であり、化合物がR - 又はS - 立体配置である、請求項1記載の立体化学的活性化合物の合成方法であって、ケトチフェンの対応する立体化学的異性体をそれらの1 - (2, 2, 2 - トリクロロエトキシカルボニル) ノル - 中間体に転化させ、次にCd/Pb - 触媒により生成物へと開裂させることを含む前記方法。

【請求項7】 呼吸障害、アレルギー性障害、皮膚障害、胃腸障害、及び眼障害から成る群から選択される疾患の予防又は治療用薬剤組成物であって、ラセミ・ノルケトチフェンとその立体化学的異性体、ケトチフェンの立体化学的異性体、ラセミ10 - ヒドロキシ - ケトチフェンとそのR, R -, R, S -, S, R - 及びS, S - 異性体、並びにラセミ10 - ヒドロキシ - ノルケトチフェンとそのR, R -, R, S -, S, R - 及びS, S - 異性体、又はそれらの製薬的に受容される塩若しくは溶媒和物から成る群から選択される化合物の治療有効量を含む、前記薬剤組成物。

【請求項8】 前記呼吸障害が慢性閉塞性肺疾患(COPD)、喘息、咳、気管支炎及び気管支過反応から成る群から選択される、請求項7記載の薬剤組成物。

【請求項9】 前記アレルギー性障害がアレルギー性鼻炎、蕁麻疹、アレルギー性結膜炎、及びアレルギー性角膜炎から成る群から選択される、請求項7記載の薬剤組成物。

【請求項10】 前記皮膚障害がアトピー性皮膚炎、蕁麻疹その他のかゆみ、又は炎症性状態及び乾癬から成る群から選択される、請求項7記載の薬剤組成物。

【請求項11】 前記胃腸障害がZollinger-Elison症候群、胃過敏症、腸炎、胃潰瘍、十二指腸潰瘍、胃逆流、胃酸過多、運動障害及び胸焼けを包含する分泌過多症候群から成る群から選択される、請求項7記載の薬剤組成物。

【請求項12】 前記眼障害が結膜炎、角膜炎、眼瞼炎、上強膜炎、強膜炎、ブドウ膜炎、神経炎、動脈炎及び交感性眼炎から成る群から選択される、請求項7記載の薬剤組成物。

【請求項13】 吸入法若しくは経鼻吸入法によって、又は非経口、局所、皮膚、経皮、直腸、舌下、結膜若しくは経口投与によって投与される、請求項7記載の薬剤組成物。

【請求項14】 経口的に投与される、請求項7記載の薬剤組成物。

【請求項15】 持続放出製剤として経口的に投与される、請求項7記載の薬剤組成物。

【請求項16】 局所的に投与される、請求項7記載の薬剤組成物。

【請求項17】 経皮的に投与される、請求項7記載の薬剤組成物。

【請求項18】 治療活性化合物の投与量が1日に1回～4回で投与される約0.5mg～約200mgである、請求項7記載の薬剤組成物。

【請求項19】 治療活性化合物又はその製薬的に受容される塩若しくは溶媒和物の治療有効量を含む固体、半固体、液体、懸濁液、エロゾル又は局所若しくは経皮薬剤組成物の形態にあり、製薬的に受容されるキャリアー又はキャリアー系をさらに含む、請求項7記載の薬剤組成物。

【請求項20】 ラセミ・ノルケトチフェン、ラセミ10-ヒドロキシ-ケトチフェン、ラセミ10-ヒドロキシ-ノルケトチフェン又はケトチフェン若しくは請求項1記載の化合物の光学活性異性体、あるいはそれらの製薬的に受容される塩若しくは溶媒和物の治療有効量を、アドレナリン作動性アンタゴニスト、鎮痛薬、降圧薬、カルシウム・アンタゴニスト、抗ヒスタミン剤、抗コリン作動薬、抗菌剤、抗ウイルス剤、抗炎症薬、気管支拡張薬、うっ血除去薬、ステロイド、ロイコトリエン・アンタゴニスト、リポキシゲナーゼ阻害剤、局所麻酔薬、血管収縮薬、気管支拡張薬、咳抑制薬、及び去痰薬から成るクラスの1種類以上の薬物と共に含む薬剤組成物。