

【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23年10月20日 (2011.10.20)

【公表番号】特表2010-509240(P2010-509240A)

【公表日】平成22年3月25日 (2010.3.25)

【年通号数】公開・登録公報2010-012

【出願番号】特願2009-535499(P2009-535499)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/191 (2006.01)

A 6 1 K 31/366 (2006.01)

A 6 1 K 31/22 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 11/02 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/04 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

C 0 7 D 309/30 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/191

A 6 1 K 31/366

A 6 1 K 31/22

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 11/02

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 17/04

A 6 1 P 17/00

C 0 7 D 309/30 D

【手続補正書】

【提出日】平成22年9月22日 (2010.9.22)

【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

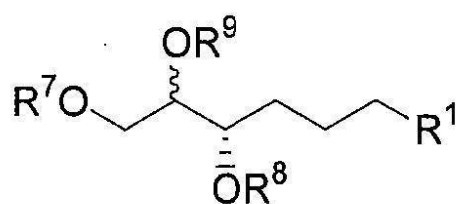
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

哺乳動物の喘息、アレルギー性鼻炎または皮膚障害の治療のための組成物であって、薬学的に受容可能な担体および式 I の化合物の薬学的有効量を含み、

【化 1 3】



I

[ 式中

$R^1$  は、 $C_2H_5$ 、 $CO_2R$ 、 $CONR^2R^3$ 、 $CH_2OR^4$ 、1, 3, 4 - オキサジアゾール - 2 - イルもしくは  $CH_2NR^5R^6$  であり、ここで、

$R$  は、 $H$ 、 $C_{1-6}$  直鎖もしくは分岐鎖アルキル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、もしくはフェニルであり、

または  $R^1$  は、式  $CO_2^-R^+$  のカルボン酸塩であり、ここで、 $R^+$  は、 $Li^+$ 、 $Na^+$ 、 $K^+$  もしくは式  $^+NR^{10}R^{11}R^{12}R^{13}$  のアンモニウム部分であり、

$R^2$ 、 $R^3$  は、 $R^2$ 、 $R^3$  の多くとも 1 つだけが、 $OH$ 、 $OCH_3$  もしくは  $OC_2H_5$  であるという条件で、独立して  $H$ 、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、ベンジル、フェニル、 $OH$ 、 $OCH_3$  もしくは  $OC_2H_5$  であり、

$R^4$  は、 $H$ 、 $C(O)R^{14}$ 、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、ベンジルもしくはフェニルであり、

$R^5$ 、 $R^6$  は、 $R^2$ 、 $R^3$  の多くとも 1 つだけが、 $OH$ 、 $OCH_3$  もしくは  $OC_2H_5$  であるという条件で、独立して  $H$ 、 $C(O)R^{14}$ 、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、ベンジル、フェニル、 $OH$ 、 $OCH_3$  もしくは  $OC_2H_5$  であり、

$R^7$ 、 $R^8$  および  $R^9$  は、独立して  $H$ 、 $CH_3$ 、 $C_2H_5$ 、 $C(O)R^{14}$  もしくは  $CO_2R^{15}$  であり、

または、 $R^7$  および  $R^8$ 、もしくは  $R^8$  および  $R^9$  は、一緒になってカルボニル基 ( $C=O$ ) を構成し、したがって環状カーボネートを形成し、

または、 $OR^8R^1$  は、一緒になって環状エステル (ラクトン) を形成し、

$R^{10} \sim R^{13}$  は、独立して  $H$  もしくは  $C_{1-6}$  アルキルであり、各アルキル基は場合によって置換基  $OH$  もしくは  $OCH_3$  を有し、

$R^{14}$  は、 $H$ 、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、ベンジルもしくはフェニルであり、

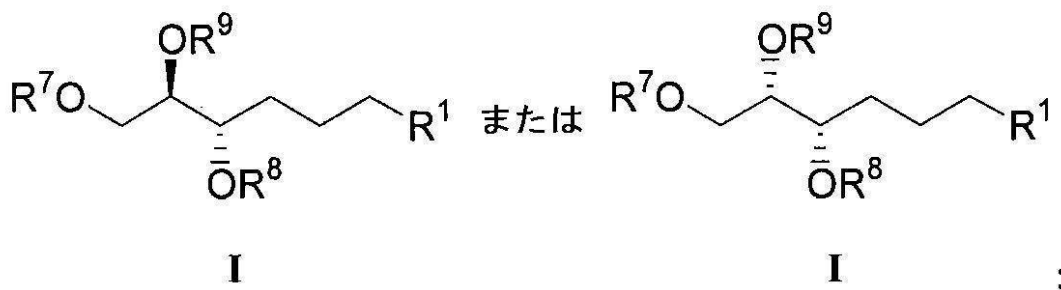
$R^{15}$  は、 $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、ベンジルもしくはフェニルであり、

【化 1 4】



は、 $OR^9$  置換基が、次式の  $R$  もしくは  $S$  の絶対配置

【化 1 5】



を与えるように配置できることを示す]

該皮膚障害が、アレルギー性皮膚炎、接触過敏症、蕁麻疹、酒さおよび乾癬からなる群より選択される、組成物。

【請求項 2】

式 I の化合物について、

$R^1$  が、 $C_2H_5$ 、 $CO_2R$ 、 $CH_2OR^4$ 、1, 3, 4 - オキサジアゾール - 2 - イル、もしくは式  $CO_2^-R^+$  のカルボン酸塩であり、

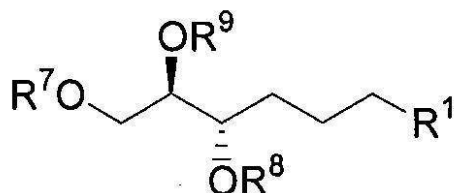
$R^+$  が、 $Li^+$ 、 $Na^+$ 、 $K^+$  もしくは  $NH_4^+$  であり、

R が、H、 $\text{CH}_3$ 、 $\text{C}_2\text{H}_5$ 、 $n\text{-C}_3\text{H}_7$  もしくは  $i\text{-C}_3\text{H}_7$  であり、  
 $\text{R}^4$  が、H、 $\text{COCH}_3$  もしくは  $\text{CH}_3$  であり、  
 $\text{R}^7$ 、 $\text{R}^8$ 、 $\text{R}^9$  が、独立して H、 $\text{CH}_3$  もしくは  $\text{CH}_3\text{CO}$  であり、  
 または、 $\text{R}^7$  および  $\text{R}^8$ 、もしくは  $\text{R}^8$  および  $\text{R}^9$  が、一緒になってカルボニル基 ( $\text{C}=\text{O}$ ) を構成し、したがって環状カーボネートを形成し、  
 または、 $\text{OR}^8\text{R}^1$  が、一緒になって環状エステル (ラクトン) を形成する、  
 請求項 1 に記載の 組成物。

【請求項 3】

式 I の化合物が立体配置：

【化 16】

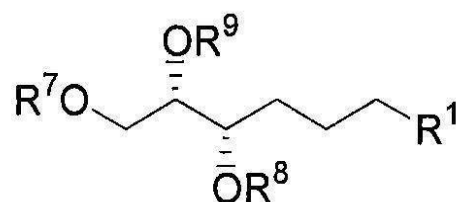


を有する、請求項 2 に記載の 組成物。

【請求項 4】

式 I の化合物が立体配置：

【化 17】



を有する、請求項 2 に記載の 組成物。

【請求項 5】

式 I の化合物が、喘息を治療するために使用される、請求項 3 に記載の 組成物。

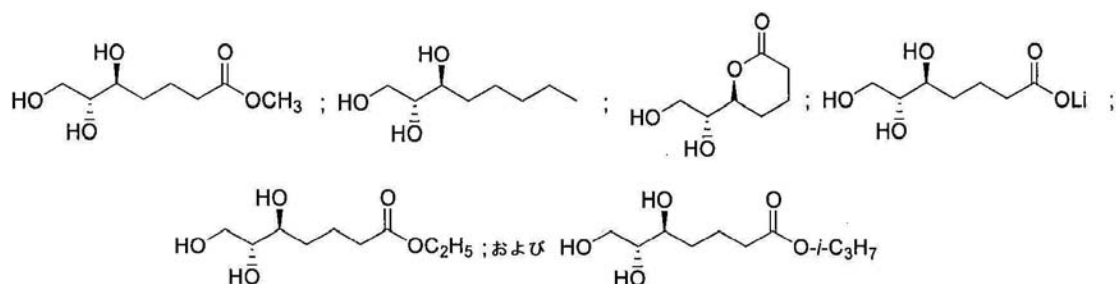
【請求項 6】

式 I の化合物が、アレルギー性鼻炎に使用される、請求項 3 に記載の 組成物。

【請求項 7】

式 I の化合物が、

【化 18】



からなる群より選択される、請求項 3 に記載の 組成物。

【請求項 8】

前記化合物の薬学的有効量が 0.001% から 5% (w/v) である、請求項 7 に記載の 組成物。

【請求項 9】

前記薬学的有効量が、0.1 から 5% (w/v) である、請求項 8 に記載の 組成物。

## 【請求項 10】

前記薬学的に受容可能な担体が、界面活性剤、等張剤、緩衝剤、保存剤、共溶媒および増粘剤からなる群より選択される１種または複数の成分を含む、請求項 1 に記載の組成物。

## 【請求項 11】

喘息を治療するための組成物である、請求項 1 に記載の組成物。

## 【請求項 12】

アレルギー性鼻炎を治療するための組成物である、請求項 1 に記載の組成物。

## 【請求項 13】

アレルギー性皮膚炎、接触過敏症、蕁麻疹、酒さおよび乾癬からなる群より選択される皮膚障害を治療するための組成物である、請求項 1 に記載の組成物。

## 【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0007

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0007】

本発明は、喘息、アレルギー性鼻炎および皮膚障害の治療方法を対象とする。本発明の方法によれば、5, 6, 7 - トリヒドロキシヘプタン酸または類似体は、喘息を治療するために、経口または吸入送達を介し、患者に投与される。本発明のさらなる実施形態では、5, 6, 7 - トリヒドロキシヘプタン酸または類似体は、アレルギー性鼻炎を治療するために、経口または局所鼻腔送達を介し、患者に投与される。さらに、本発明のさらに別の実施形態では、5, 6, 7 - トリヒドロキシヘプタン酸または類似体は、アレルギー性皮膚炎、乾癬および酒さなどの皮膚障害を治療するために、局所送達を介し、患者に投与される。

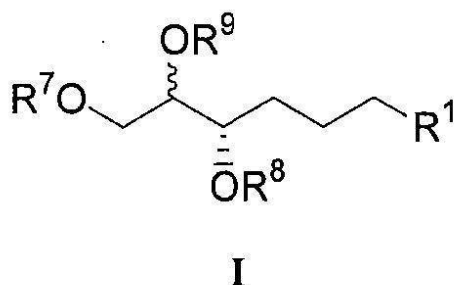
本発明は、例えば以下の項目を提供する。

(項目 1)

哺乳動物の喘息、アレルギー性鼻炎または皮膚障害の治療方法であって、薬学的に受容可能な担体および式 I の化合物の薬学的有効量を含む組成物を該哺乳動物に投与すること

含み、

【化 13】



[ 式中

$R^1$  は、 $C_2H_5$ 、 $CO_2R$ 、 $CONR^2R^3$ 、 $CH_2OR^4$ 、1, 3, 4 - オキサジアゾール - 2 - イルもしくは  $CH_2NR^5R^6$  であり、ここで、

$R$  は、 $H$ 、 $C_1 \sim 6$  直鎖もしくは分岐鎖アルキル、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル、もしくはフェニルであり、

または  $R^1$  は、式  $CO_2^-R^+$  のカルボン酸塩であり、ここで、 $R^+$  は、 $Li^+$ 、 $Na^+$ 、 $K^+$  もしくは式  $^+NR^{10}R^{11}R^{12}R^{13}$  のアンモニウム部分であり、

$R^2$ 、 $R^3$  は、 $R^2$ 、 $R^3$  の多くとも 1 つだけが、 $OH$ 、 $OCH_3$  もしくは  $OC_2H_5$

であるという条件で、独立してH、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル、ベンジル、フェニル、OH、 $OCH_3$  もしくは  $OC_2H_5$  であり、

$R^4$  は、H、 $C(O)R^{14}$ 、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル、ベンジルもしくはフェニルであり、

$R^5$ 、 $R^6$  は、 $R^2$ 、 $R^3$  の多くとも1つだけが、OH、 $OCH_3$  もしくは  $OC_2H_5$  であるという条件で、独立してH、 $C(O)R^{14}$ 、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル、ベンジル、フェニル、OH、 $OCH_3$  もしくは  $OC_2H_5$  であり、

$R^7$ 、 $R^8$  および  $R^9$  は、独立してH、 $CH_3$ 、 $C_2H_5$ 、 $C(O)R^{14}$  もしくは  $CO_2R^{15}$  であり、

または、 $R^7$  および  $R^8$ 、もしくは  $R^8$  および  $R^9$  は、一緒になってカルボニル基 ( $C=O$ ) を構成し、したがって環状カーボネートを形成し、

または、 $OR^8R^1$  は、一緒になって環状エステル(ラクトン)を形成し、

$R^{10} \sim R^{13}$  は、独立してHもしくは  $C_1 \sim 6$  アルキルであり、各アルキル基は場合によって置換基OHもしくは  $OCH_3$  を有し、

$R^{14}$  は、H、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル、ベンジルもしくはフェニルであり、

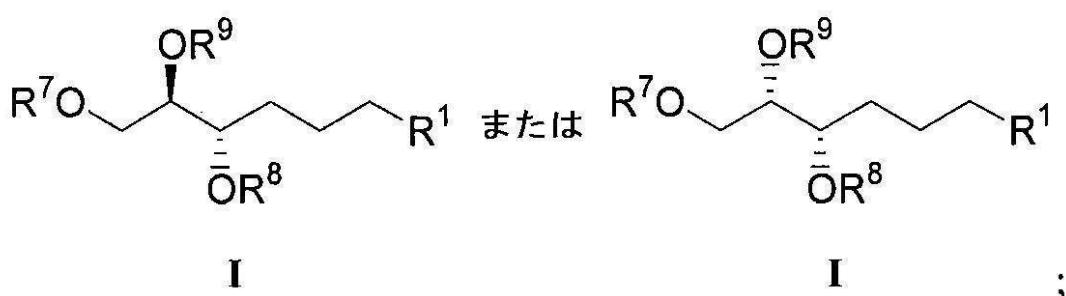
$R^{15}$  は、 $C_1 \sim 6$  アルキル、 $C_3 \sim 6$  シクロアルキル、ベンジルもしくはフェニルであり、

【化14】



は、 $OR^9$  置換基が、次式のRもしくはSの絶対配置

【化15】



を与えるように配置できることを示す]

該皮膚障害が、アレルギー性皮膚炎、接触過敏症、蕁麻疹、酒さおよび乾癬からなる群より選択される方法。

(項目2)

式Iの化合物について、

$R^1$  が、 $C_2H_5$ 、 $CO_2R$ 、 $CH_2OR^4$ 、1,3,4-オキサジアゾール-2-イル、もしくは式  $CO_2 \cdot R^+$  のカルボン酸塩であり、

$R^+$  が、 $Li^+$ 、 $Na^+$ 、 $K^+$  もしくは  $NH_4^+$  であり、

R が、H、 $CH_3$ 、 $C_2H_5$ 、 $n-C_3H_7$  もしくは  $i-C_3H_7$  であり、

$R^4$  が、H、 $COCH_3$  もしくは  $CH_3$  であり、

$R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$  が、独立してH、 $CH_3$  もしくは  $CH_3CO$  であり、

または、 $R^7$  および  $R^8$ 、もしくは  $R^8$  および  $R^9$  が、一緒になってカルボニル基 ( $C=O$ ) を構成し、したがって環状カーボネートを形成し、

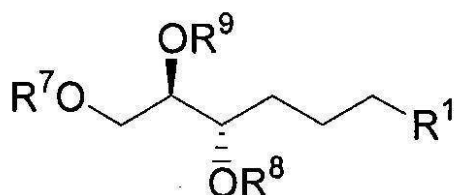
または、 $OR^8R^1$  が、一緒になって環状エステル(ラクトン)を形成する、

項目 1 に記載の方法。

( 項目 3 )

式 I の化合物が立体配置：

【化 1 6】

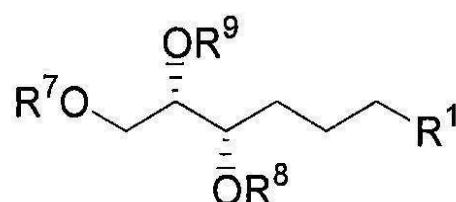


を有する、項目 2 に記載の方法。

( 項目 4 )

式 I の化合物が立体配置：

【化 1 7】



を有する、項目 2 に記載の方法。

( 項目 5 )

式 I の化合物が、喘息を治療するために使用される、項目 3 に記載の方法。

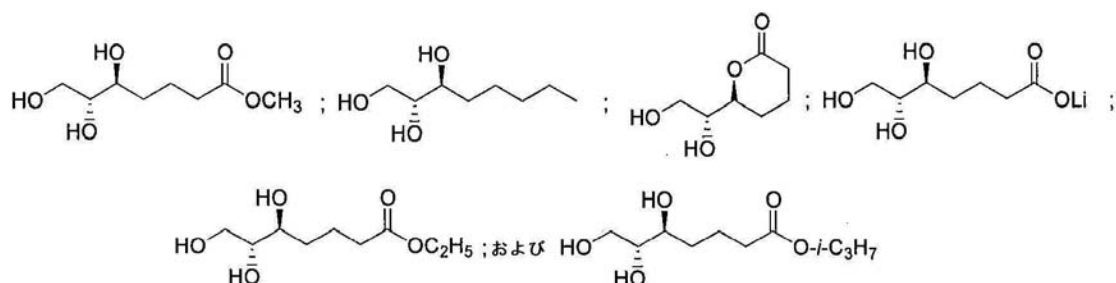
( 項目 6 )

式 I の化合物が、アレルギー性鼻炎に使用される、項目 3 に記載の方法。

( 項目 7 )

式 I の化合物が、

【化 1 8】



からなる群より選択される、項目 3 に記載の方法。

( 項目 8 )

前記化合物の薬学的有効量が 0 . 0 0 1 % から 5 % ( w / v ) である、項目 7 に記載の方法。

( 項目 9 )

前記薬学的有効量が、0 . 1 から 5 % ( w / v ) である、項目 8 に記載の方法。

( 項目 1 0 )

前記薬学的に受容可能な担体が、界面活性剤、等張剤、緩衝剤、保存剤、共溶媒および増粘剤からなる群より選択される 1 種または複数の成分を含む、項目 1 に記載の方法。

( 項目 1 1 )

喘息を治療するための方法である、項目 1 に記載の方法。

( 項目 1 2 )

アレルギー性鼻炎を治療するための方法である、項目 1 に記載の方法。

( 項目 1 3 )

アレルギー性皮膚炎、接触過敏症、蕁麻疹、酒さおよび乾癬からなる群より選択される皮膚障害を治療するための方法である、項目 1 に記載の方法。