

【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17年12月22日(2005.12.22)

【公表番号】特表2004-508327(P2004-508327A)

【公表日】平成16年3月18日(2004.3.18)

【年通号数】公開・登録公報2004-011

【出願番号】特願2002-524492(P2002-524492)

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 31/558

A 6 1 K 31/23

A 6 1 K 31/5575

A 6 1 P 1/10

C 0 7 D 311/94

【F I】

A 6 1 K 31/558

A 6 1 K 31/23

A 6 1 K 31/5575

A 6 1 P 1/10

C 0 7 D 311/94 1 0 1

【手続補正書】

【提出日】平成16年6月16日(2004.6.16)

【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

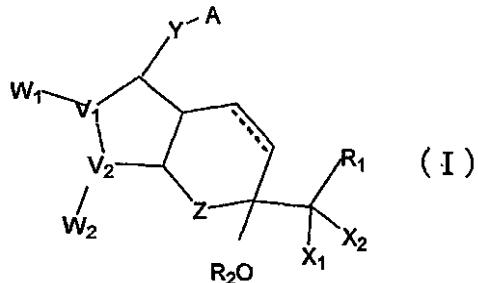
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 下記式(I)で表される二環式化合物を、便通誘導のために有効な量含む下剤組成物：

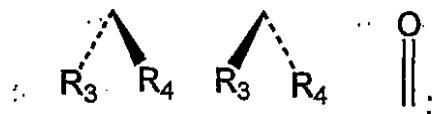
【化1】



[式中V<sub>1</sub>およびV<sub>2</sub>は炭素または酸素である；

V<sub>1</sub>が炭素である場合のW<sub>1</sub>およびV<sub>2</sub>が炭素である場合のW<sub>2</sub>は以下の、

【化2】



である；

(式中R<sub>3</sub>およびR<sub>4</sub>は水素であるか、あるいは、これらの1つがOHである；)

$X_1$  および  $X_2$  は水素、低級アルキルまたはハロゲンであり、これらの少なくとも 1 つはハロゲンである；

$Z$  は炭素、酸素、硫黄、または窒素である；

$R_2$  は水素またはアルキルである；

$Y$  は非置換またはオキソ、ハロゲン、アルキル、ヒドロキシル、アリール、または複素環基で置換された、飽和または不飽和  $C_{2-1}$  炭化水素鎖である；

$A$  は  $-CH_2OH$ 、 $-COCH_2OH$ 、 $-COOH$  またはその官能性誘導体である；そして、

$R_1$  は非置換またはハロゲン、オキソ、ヒドロキシ、低級アルコキシ、低級アルカノイルオキシ、低級シクロアルキル、低級シクロアルキルオキシ、アリール、アリールオキシ、複素環基、または複素環 - オキシ基で置換された直鎖または分枝鎖を形成する飽和または不飽和低級炭化水素；低級シクロアルキル；低級シクロアルキルオキシ；アリール、アリールオキシ、複素環基または複素環 - オキシ基である；

$C-13$  位と  $C-14$  位の間の結合は二重結合または単結合である；そして、

$C-15$  は  $R$ 、 $S$  の立体配置を有するかその混合物である]。

【請求項 2】さらに式(I)の单環式互変異性体である化合物を、单環式構造に対する二環式構造の比が少なくとも 1 : 1 となる量含有する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 3】さらに式(I)の单環式互変異性体である化合物を、单環式構造に対する二環式構造の比が少なくとも 20 : 1 となる量含有する、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 4】 $A$  が  $-COOH$ 、 $W_1$  がケトン、 $Z$  が酸素原子、 $R_2$  が水素原子、そして  $X_1$  および  $X_2$  がフッ素原子である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 5】 $Z$  が硫黄原子または窒素原子である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 6】 $A$  が  $COOH$ ； $Y$  が  $(CH_2)_6$ ； $W_1$  が  $=O$ ； $R_3$  および  $R_4$  が水素原子； $V_1$  および  $V_2$  が炭素原子； $Z$  が酸素原子、 $X_1$  および  $X_2$  がフッ素原子；そして  $R_1$  が  $(CH_2)_3CH_3$  である、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 7】さらに中鎖脂肪酸トリグリセリドを含有する、請求項 1 - 6 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 8】中鎖脂肪酸トリグリセリドが、式(I)の二環式化合物 1 重量部に対して 1 - 1,000,000 重量部存在する、請求項 7 に記載の組成物。

【請求項 9】中鎖脂肪酸トリグリセリドが、式(I)の二環式化合物 1 重量部に対して 5 - 500,000 重量部存在する、請求項 8 に記載の組成物。

【請求項 10】中鎖脂肪酸トリグリセリドが、式(I)の二環式化合物 1 重量部に対して 10 - 200,000 重量部存在する、請求項 9 に記載の組成物。

【請求項 11】中鎖脂肪酸トリグリセリドが、6 - 14 の炭素原子を有する脂肪酸のトリグリセリドである、請求項 7 に記載の組成物。

【請求項 12】中鎖脂肪酸トリグリセリドが、カブリル酸トリグリセリドおよび/またはカプリン酸トリグリセリドである、請求項 11 に記載の組成物。

【請求項 13】ヒト便秘患者における便秘の軽減または予防のための、請求項 1 - 12 のいずれかに記載の組成物。

【請求項 14】腸洗浄のための、請求項 1 - 12 のいずれかに記載の組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0070

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0070】

含量(%) =  $Q_T / Q_S \times W_S \times 100 / W_T$

$W_S$ ：標準調製物中の化合物の量(mg)

$W_T$ ：試験調製物中の化合物 1 および 2 の量

$Q_S$ ：内部標準に対する標準調製物中の化合物のピーク面積比

$Q_T$  : 内部標準に対する試験調製物中の化合物のピーク面積比

測定条件 :

検出器 : 紫外線吸収分光計 ( 波長 294 nm )

カラム : 内径約 5 mm、長さ約 25 cm のステンレス管、5 μm の液体クロマトグラフ用オクタデシルシリカゲルを充填

カラム温度 : 35 付近で安定

移動相 : アセトニトリル ( 液体クロマトグラフグレード ) / 酢酸ナトリウム水溶液 ( 0.01 mol / L ) / 氷酢酸 ( 800 : 200 : 1 ) の混合溶液

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0076

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0076】

含量 ( % ) =  $Q_T / Q_S \times W_s \times 100 / 18$

$W_s$  : 標準調製物中の化合物の量 ( mg )

$Q_S$  : 内部標準に対する標準調製物中の化合物のピーク面積比

$Q_T$  : 内部標準に対する試験調製物中の化合物のピーク面積比

測定条件 :

検出器 : 蛍光分光計 ( 励起波長 259 nm ; 萤光波長 394 nm )

カラム : 内径約 5 mm、長さ約 25 cm のステンレス管、5 μm の液体クロマトグラフ用オクタデシルシリカゲルを充填

カラム温度 : 35 付近で安定

移動相 : アセトニトリル ( 液体クロマトグラフグレード ) / メタノール ( 液体クロマトグラフグレード ) / 酢酸アンモニウム水溶液 ( 0.05 mol / L ) ( 4 : 11 : 5 ) の混合溶液