

【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20年6月5日(2008.6.5)

【公表番号】特表2007-537282(P2007-537282A)

【公表日】平成19年12月20日(2007.12.20)

【年通号数】公開・登録公報2007-049

【出願番号】特願2007-513361(P2007-513361)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/22 (2006.01)

A 6 1 K 31/047 (2006.01)

A 6 1 P 27/04 (2006.01)

A 6 1 P 27/14 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/22

A 6 1 K 31/047

A 6 1 P 27/04

A 6 1 P 27/14

A 6 1 P 29/00

【手続補正書】

【提出日】平成20年4月16日(2008.4.16)

【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】

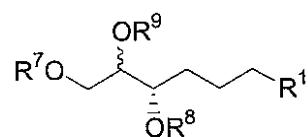
【特許請求の範囲】

【請求項1】

哺乳動物におけるドライアイまたはブドウ膜炎の処置のための組成物であって、該組成物は、

薬学的に受容可能なキャリアと薬学的に有効な量の式Iの化合物

【化1】



I

とを含み、該式Iの化合物において、

R<sup>1</sup>は、C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>、CO<sub>2</sub>R、CONR<sup>2</sup>R<sup>3</sup>、CH<sub>2</sub>OR<sup>4</sup>、またはCH<sub>2</sub>NR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>であり、Rは、H、C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>直鎖アルキルもしくはC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>分枝アルキル、C<sub>3</sub>~<sub>6</sub>シクロアルキル、またはフェニルであるか、または

R<sup>1</sup>は、式CO<sub>2</sub><sup>-</sup>R<sup>+</sup>のカルボン酸塩であり、R<sup>+</sup>は、Li<sup>+</sup>、Na<sup>+</sup>、K<sup>+</sup>、もしくは式<sup>+</sup>NR<sup>1</sup><sub>0</sub>R<sup>1</sup><sub>1</sub>R<sup>1</sup><sub>2</sub>R<sup>1</sup><sub>3</sub>のアンモニウム部分であり；

R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>は、独立して、H、C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル、C<sub>3</sub>~<sub>6</sub>シクロアルキル、ベンジル、フェニル、OH、OCH<sub>3</sub>、もしくはOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>であり、但し、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>のうちの多くとも1つだけが、OH、COH<sub>3</sub>、もしくはOC<sub>2</sub>H<sub>5</sub>であり；

$R^4$  は、  $H$ 、  $C(O)R^{1-4}$ 、  $C_{1-6}$  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、 独立して、  $H$ 、  $C(O)R^{1-4}$ 、  $C_{1-6}$  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  $OCH_2H_5$  であり、 但し、  $R^5$ 、  $R^6$  のうちの多くとも 1 つだけが、  $OH$ 、  $COH_3$ 、 もしくは  $OCH_2H_5$  であり；

$R^7$ 、  $R^8$ 、  $R^9$  は、 独立して、  $H$ 、  $CH_3$ 、  $C_2H_5$ 、  $C(O)R^{1-4}$ 、 もしくは  $C_2R^{1-5}$  であるか、 または

$R^7$  と  $R^8$  とが一緒になってカルボニル基を構成するか、 または  $R^8$  と  $R^9$  とが一緒になってカルボニル基を構成するか、 または  $OR^8$  と  $R^1$  とが一緒になって、 環状エステルを形成し；

$R^{10}$ 、  $R^{11}$ 、  $R^{12}$ 、  $R^{13}$  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、 必要に応じて、  $OH$  置換基もしくは  $OCH_3$  置換基を保有し；

$R^{1-4}$  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； そして

$R^{1-5}$  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る、

組成物。

**【請求項 2】**

請求項 1 に記載の組成物であって、 前記式 I の化合物について、

$R^1$  は、  $C_2H_5$ 、  $CO_2R$ 、 もしくは  $CH_2OR^4$  であり；

$R$  は、  $H$ 、  $Na^+$ 、  $NH_4^+$ 、  $CH_3$ 、  $C_2H_5$ 、  $n-C_3H_7$ 、 もしくは  $i-C_3H_7$  であり；

$R^4$  は、  $H$ 、  $COCH_3$ 、 もしくは  $CH_3$  であり； そして

$R^7$ 、  $R^8$ 、  $R^9$  は、 独立して、  $H$ 、  $CH_3$ 、  $CH_3CO$  であるか、

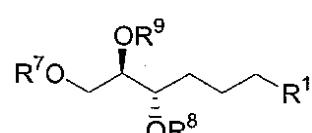
$R^7$  と  $R^8$  とが一緒になってカルボニル基を構成するか、 または  $R^8$  と  $R^9$  とが一緒になってカルボニル基を構成するか、 または  $OR^8$  と  $R^1$  とが一緒になって、 環状エステルを形成する、

組成物。

**【請求項 3】**

請求項 2 に記載の組成物であって、 前記式 I の化合物は、 構成

**【化 2】**

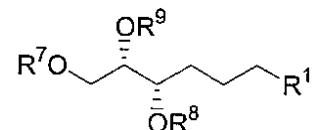


を有する、組成物。

**【請求項 4】**

請求項 1 に記載の組成物であって、 前記式 I の化合物は、 構成

**【化 3】**



を有する、組成物。

**【請求項 5】**

請求項 3 に記載の組成物であって、 前記式 I の化合物は、 ブドウ膜炎を処置するために効果的である、組成物。

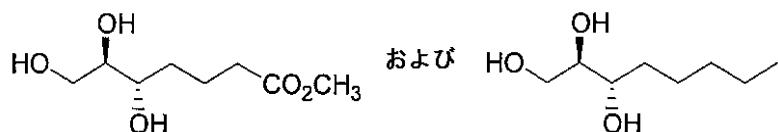
**【請求項 6】**

請求項 3 に記載の組成物であって、前記式 I の化合物は、ドライアイを処置するために効果的である、組成物。

【請求項 7】

請求項 5 に記載の組成物であって、前記化合物は、

【化 4】

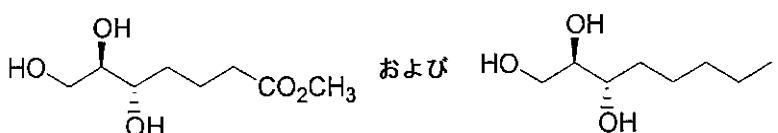


からなる群より選択される、組成物。

【請求項 8】

請求項 6 に記載の組成物であって、前記化合物は、

【化 5】



からなる群より選択される、組成物。

【請求項 9】

請求項 5 に記載の組成物であって、前記薬学的に有効な量は、0.1% (重量 / 体積) ~ 1% (重量 / 体積) である、組成物。

【請求項 10】

請求項 6 に記載の組成物であって、前記薬学的に有効な量は、0.00003% (重量 / 体積) ~ 0.001% (重量 / 体積) である、組成物。

【請求項 11】

請求項 9 に記載の組成物であって、前記薬学的に受容可能なキャリアは、界面活性剤、張度調整剤、緩衝剤、防腐剤、共溶媒、および増粘剤からなる群より選択される 1 種以上の成分を含む、組成物。

【請求項 12】

請求項 10 に記載の組成物であって、前記薬学的に受容可能なキャリアは、界面活性剤、張度調整剤、緩衝剤、防腐剤、共溶媒、および増粘剤からなる群より選択される 1 種以上の成分を含む、組成物。