

【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 5 月 24 日 (2007.5.24)

【公表番号】特表 2007-502865 (P2007-502865A)

【公表日】平成 19 年 2 月 15 日 (2007.2.15)

【年通号数】公開・登録公報 2007-006

【出願番号】特願 2006-533333 (P2006-533333)

【国際特許分類】

**C 07 C 215/54 (2006.01)**

**A 61 K 31/137 (2006.01)**

**A 61 P 21/00 (2006.01)**

**A 61 P 7/12 (2006.01)**

**A 61 P 1/06 (2006.01)**

**A 61 P 11/06 (2006.01)**

**A 61 P 11/08 (2006.01)**

**A 61 P 13/02 (2006.01)**

**A 61 P 1/16 (2006.01)**

**A 61 K 45/00 (2006.01)**

**A 61 P 43/00 (2006.01)**

**A 61 P 23/02 (2006.01)**

**A 61 P 29/00 (2006.01)**

**A 61 P 1/12 (2006.01)**

**A 61 P 9/04 (2006.01)**

**A 61 P 9/06 (2006.01)**

**A 61 P 9/10 (2006.01)**

**A 61 P 13/12 (2006.01)**

**A 61 P 13/10 (2006.01)**

**A 61 P 15/08 (2006.01)**

【F I】

C 07 C 215/54 C S P

A 61 K 31/137

A 61 P 21/00

A 61 P 7/12

A 61 P 1/06

A 61 P 11/06

A 61 P 11/08

A 61 P 13/02

A 61 P 1/16

A 61 K 45/00

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 23/02

A 61 P 43/00 1 1 3

A 61 P 43/00 1 2 1

A 61 P 29/00

A 61 P 1/12

A 61 P 9/04

A 61 P 9/06

A 61 P 9/10

A 61 P 13/12

A 6 1 P 13/10

A 6 1 P 15/08

## 【手続補正書】

【提出日】平成19年3月27日(2007.3.27)

## 【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

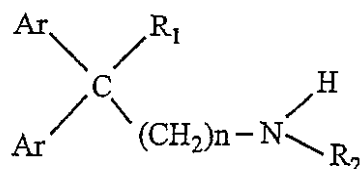
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

次式の化合物であって、

【化1】



その立体化学的異性体及びその薬剤として許容される塩を含み、上式で、

Arは、それぞれフェニル基を表し、場合によっては独立にA及び/又はBで置換されており、

Aは、エチル、又はn-プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、sec-ブチル、t-ブチル又はヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチルであり、Bは、H、ヒドロキシ又は低級(1~3)アルコキシであり、

R<sub>1</sub>は、水素又は低級アルキルであり、

R<sub>2</sub>は、メチル、エチル、n-プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、sec-ブチル又はt-ブチルであり、

nは、2~4である、上記化合物。

【請求項2】

それぞれのArが、フェニル基を表し、そのうち1個は、2位がヒドロキシ基で、5位がt-ブチル基で置換されており、R<sub>1</sub>は水素、R<sub>2</sub>はイソプロピル、nは2である請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

それぞれのArが、フェニル基を表し、そのうち1個は、2位がヒドロキシ基で、5位がt-ブチル基で置換されており、R<sub>1</sub>は水素、R<sub>2</sub>はイソプロピルであり、nは2である請求項1に記載の化合物のS-異性体。

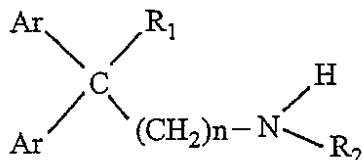
【請求項4】

それぞれのArが、フェニル基を表し、そのうち1個は、2位がヒドロキシ基で、5位がt-ブチル基で置換されており、R<sub>1</sub>は水素、R<sub>2</sub>はイソプロピルであり、nは2である請求項1に記載の化合物のR-異性体。

【請求項5】

次式の化合物であって、

## 【化 2】



その立体化学的異性体及びその薬剤として許容される塩を含み、上式で、

A r は、それぞれフェニル基を表し、場合によっては独立に A 及び / 又は B で置換されており、

A は、エチル、又は n - プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、s e c - ブチル、t - ブチル又はヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチルであり、B は、H、ヒドロキシ又は低級（1 ~ 3）アルコキシであり、

R<sub>1</sub> は、水素又は低級アルキルであり、

R<sub>2</sub> は、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、s e c - ブチル又は t - ブチルであり、

n は、2 ~ 4 である上記化合物

の薬理学的に有効な量を含む、哺乳動物の平滑筋機能亢進を治療又は予防するための薬剤組成物。

## 【請求項 6】

前記平滑筋機能亢進が、尿失禁の原因である請求項 5 に記載の薬剤組成物。

## 【請求項 7】

前記平滑筋機能亢進が、切迫性尿失禁の原因である請求項 5 に記載の薬剤組成物。

## 【請求項 8】

前記平滑筋機能亢進が、腸管平滑筋の機能亢進である請求項 5 に記載の薬剤組成物。

## 【請求項 9】

前記平滑筋機能亢進が、呼吸器官平滑筋の機能亢進である請求項 5 に記載の薬剤組成物。

## 【請求項 10】

前記平滑筋機能亢進が、尿路結石症の原因である請求項 5 に記載の薬剤組成物。

## 【請求項 11】

前記平滑筋機能亢進が、胆石症又は総胆管結石症の原因である請求項 5 に記載の薬剤組成物。

## 【請求項 12】

前記化合物又はその薬剤として許容される塩を、0 . 5 m g ~ 約 2 0 0 m g の量で、1 日に 1 ~ 4 回投与するための、請求項 5 に記載の薬剤組成物。

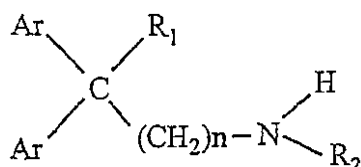
## 【請求項 13】

前記化合物又はその薬剤として許容される塩を、経口、非経口、経皮、経眼、直腸内、腔内又は吸入により投与するための、請求項 5 に記載の薬剤組成物。

## 【請求項 14】

次式の化合物であって、

## 【化 3】



その立体化学的異性体及びその薬剤として許容される塩を含み、上式で、

$A_r$  は、それぞれフェニル基を表し、場合によっては独立に A 及び / 又は B で置換されており、

A は、エチル、又は n - プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、sec - ブチル、t - ブチル又はヒドロキシメチル、ヒドロキシエチル、ヒドロキシプロピル、ヒドロキシブチルであり、B は、H、ヒドロキシ又は低級 ( 1 ~ 3 ) アルコキシであり、

$R_1$  は、水素又は低級アルキルであり、

$R_2$  は、メチル、エチル、n - プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチル、sec - ブチル又は t - ブチルであり、

n は、2 ~ 4 である上記化合物

を、製薬上許容される担体と共に含む、薬剤組成物。

【請求項 15】

前記組成物がまた、抗コリン薬、カルシウム拮抗薬、カリウムチャンネル活性化薬、アドレナリン 作動薬、アドレナリン 作動薬、鎮痛薬、抗炎症薬、抗ヒスタミン薬、及び局所麻酔薬からなる群から選択される 1 種又は複数の有効成分をも含む請求項 14 に記載の薬剤組成物。

【請求項 16】

前記化合物の光学的に純粋な ( S ) - 異性体又はその薬剤として許容される塩を、治療効果のある量含む請求項 14 に記載の薬剤組成物であって、ラセミ混合物及び ( R ) - 異性体に関連する副作用に付随する障害を軽減しつつ、哺乳動物の平滑筋機能亢進を治療するための薬剤組成物。

【請求項 17】

前記化合物のラセミ体又は前記化合物の光学的に純粋な ( R ) - 異性体或いはその薬剤として許容される塩を、治療効果のある量含む請求項 14 に記載の薬剤組成物であって、コリン作動的に媒介されるものと非コリン作動的に媒介されるものとが混在する、哺乳動物の平滑筋機能亢進を治療するための薬剤組成物。