

【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2月10日(2005.2.10)

【公表番号】特表2000-514461(P2000-514461A)

【公表日】平成12年10月31日(2000.10.31)

【出願番号】特願平10-506966

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 31/7072

A 6 1 K 31/7068

A 6 1 K 31/7076

A 6 1 P 11/02

A 6 1 P 43/00

C 0 7 H 19/067

C 0 7 H 19/167

【F I】

A 6 1 K 31/7072

A 6 1 K 31/7068

A 6 1 K 31/7076

A 6 1 P 11/02

A 6 1 P 43/00 1 0 5

C 0 7 H 19/067

C 0 7 H 19/167

【手続補正書】

【提出日】平成16年5月26日(2004.5.26)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】補正の内容のとおり

【補正方法】変更

【補正の内容】

## 手 続 换 正 書

平成16年5月26日

特許庁長官 今井 康夫 殿

## 1. 事件の表示

平成10年特許願第506966号

## 2. 换正をする者

名称 インスパイアーファーマシューティカルズ,  
インコーポレイティド



## 3. 代理人

住所 〒105-8423 東京都港区虎ノ門三丁目5番1号 虎ノ門37森ビル

青和特許法律事務所 電話 03-5470-1900

氏名 弁理士(7751)石田 敬



## 4. 换正対象書類名

請求の範囲

## 5. 换正対象項目名

請求の範囲

## 6. 换正の内容

請求の範囲を別紙の通り変更する。

## 7. 添付書類の目録

請求の範囲

1通

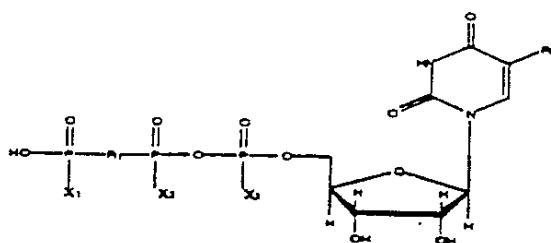
方 式 番 号  
佐藤

## 請求の範囲

## 1. 副鼻腔炎(sinusitis) の治療の必要な患者における副鼻腔炎治療用医薬組成物であつて：

その副鼻腔からの排液を促進するために有効な量の下記化合物を有する医薬担体中に、式 (I) 、 (II) 、 (III) 又は (IV) の化合物又は医薬として許容されるその塩を含む、前記組成物：

式 I

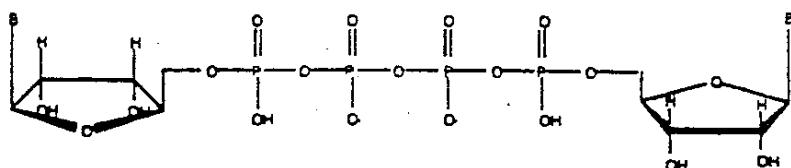


{式中、  $X_1$  、  $X_2$  、及び  $X_3$  は互いに独立して、 OH 及び SH から成る群から選ばれ；

$R_1$  は、 O 、イミド、メチレン、及びジハロメチレンから成る群から選ばれ；  
そして

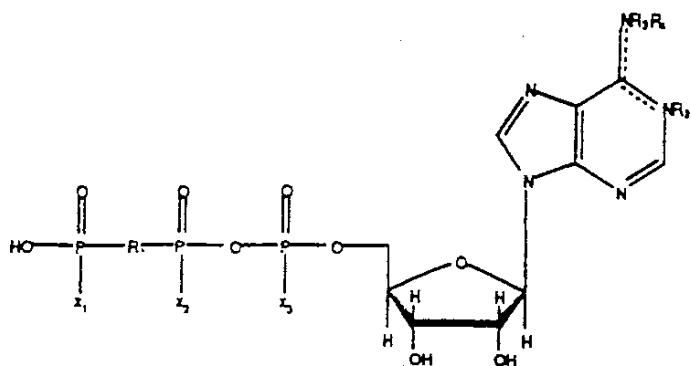
$R_2$  は、 H 及び Br から成る群から選ばれる。} ；

式 II



{式中、

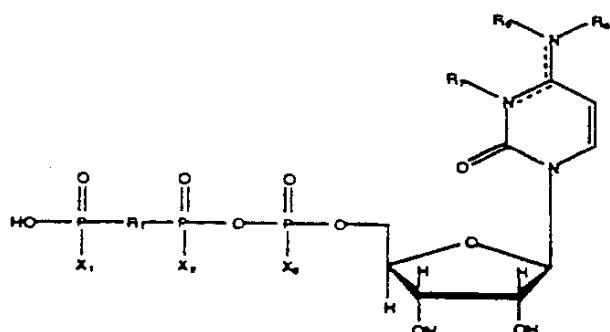
B は、下記式 (I) 及び (III) において付加されたウラシル又はアデニンである。} ；

式III

{式中、

R<sub>1</sub> , X<sub>1</sub> , X<sub>2</sub> 、及びX<sub>3</sub> は式 (I) において定義されたものと同じであり

;

R<sub>2</sub> は無く、かつ、N-1とC-6の間に2重結合が存在しながら (アデニン) 、R<sub>3</sub> 及びR<sub>4</sub> はHであり ; 又はR<sub>2</sub> はOであり、かつ、N-1とC-6の間に2重結合が在りながら (アデニン-1-オキシド) 、R<sub>3</sub> 及びR<sub>4</sub> はHであり ; 又はR<sub>3</sub> , R<sub>4</sub> 、及びR<sub>2</sub> は一緒になって-CH-CH-であり、N-6とC-6の間に2重結合をもってN-6からN-1までの環を形成する (1, N<sup>6</sup>-エテノアデニン) 。} ;式IV

{式中、

R<sub>1</sub> , X<sub>1</sub> , X<sub>2</sub> 、及びX<sub>3</sub> は式 (I) において定義されたものと同じであり

;

$R_7$  は無く、かつ、 $N-3$  と  $C-4$  の間に 2 重結合が在りながら (シトシン) 、 $R_5$  及び  $R_6$  は H であり ; 又は

$R_5$  ,  $R_6$  及び  $R_7$  は一緒になって  $-CH-CH-$  であり、 $N-4$  と  $C-3$  の間に 2 重結合をもって  $N-3$  から  $N-4$  まで環を形成する (3,  $N^4$  -エテノシトシン) 。} 。

2. 前記化合物の治療的有効量が、直接的にか又は全身的吸収及び循環を介して前記患者の副鼻腔に接するように、前記化合物が、前記患者の鼻咽頭エアウェイに、前記化合物の眼への点眼液を含む液体／液体懸濁液、又は前記化合物の点鼻液、粉末又はスプレーを

投与することによりデリバリーされる、請求項 1 に記載の組成物。

3. 前記化合物の治療的有効量が全身的吸収及び循環を介して前記患者の副鼻腔に接するように、前記化合物が、前記患者の副鼻腔に前記化合物の経口形態を投与することによりデリバリーされる、請求項 1 に記載の組成物。

4. 前記化合物の治療的有効量が、直接的にか又は全身的吸収及び循環により前記患者の副鼻腔に接するように、前記化合物が、前記患者の鼻咽頭エアウェイに前記化合物の噴霧エアロゾル懸濁液又は溶液を投与することによりデリバリーされる、請求項 1 に記載の組成物。

5. 前記化合物の治療的有効量が直接的にか又は全身的吸収及び循環により前記患者の副鼻腔に接するように、前記化合物が、鼻、眼、外耳又は鼻咽頭エアウェイを介して前記副鼻腔に前記化合物の表在局所的形態を投与することによりデリバリーされる、請求項 1 に記載の組成物。

6. 前記化合物の治療的有効量が全身的吸収及び循環を介して前記患者の副鼻腔に接するように、前記化合物が、前記化合物の注射形態を投与することによりデリバリーされる、請求項 1 に記載の組成物。

7. 前記化合物の治療的有効量が全身的吸収及び循環を介して前記患者の副鼻腔に接するように、前記化合物が、前記化合物の坐剤形態を投与することによりデリバリーされる、請求項 1 に記載の組成物。

8. 前記化合物の治療的有効量が直接的にか又は全身的吸収及び循環を介して

前記副鼻腔に接するように、前記化合物が、前記活性化合物の、ゲル、クリーム、粉末、フォーム、結晶又は液体懸濁液形態の外科手術中の滴下物 (instillation) を投与することによりデリバリーされる、請求項 1 に記載の組成物。

9. 前記化合物が、約 $10^{-7}$  から約 $10^{-1}$  モル／リッターの、前記患者の副鼻腔の表面上にその濃度を記載するために十分な量で投与される、請求項 1 に記載の組成物。

10. 式中、 $X_2$  及び $X_3$  がOHである、請求項 1 に記載の組成物。

11. 式中、 $R_1$  が酸素である、請求項 1 に記載の組成物。

12. 式中、 $R_2$  がHである、請求項 1 に記載の組成物。

13. 前記式 (I) の化合物が、ウリジン5'－トリホスフェート、ウリジン5'－O－(3-チオトリホスフェート)、5-ブロモウリジン5'トリホスフェート及び医薬として許容されるそれらの塩から成る群から選ばれる、請求項 1 に記載の組成物。

14. 前記式 (II) の化合物が、 $P^1$ ， $P^4$ －ジ(ウリジン-5')テトラホスフェート( $U_2P_4$ ) 及び $P^1$ ， $P^4$ －ジ(アデノシン-5')テトラホスフェート( $A_2P_4$ ) 及び医薬として許容されるそれらの塩から成る群から選ばれる、請求項 1 に記載の組成物。

15. 前記式 (III) の化合物が、アデノシン5'－トリホスフェート、1,  $N^6$ －エテノアデノシン5'－トリホスフェート、アデノシン1－オキシド5'－トリホスフェート及び医薬として許容されるそれらの塩から成る群から選ばれる、請求項 1 に記載の組成物。

16. 前記式 (IV) の化合物が、シチジン5'－トリホスフェート(CTP)、3,  $N^4$ －エテノシチジン5'－トリホスフェート及び医薬として許容されるそれらの塩から成る群から選ばれる、請求項 1 に記載の組成物。