

【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2004-521134(P2004-521134A)

【公表日】平成16年7月15日(2004.7.15)

【年通号数】公開・登録公報2004-027

【出願番号】特願2002-569122(P2002-569122)

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 45/06  
A 6 1 K 9/08  
A 6 1 K 9/10  
A 6 1 K 9/14  
A 6 1 K 9/48  
A 6 1 K 31/275  
A 6 1 K 31/439  
A 6 1 K 31/44  
A 6 1 K 31/46  
A 6 1 K 31/522  
A 6 1 K 47/04  
A 6 1 K 47/06  
A 6 1 K 47/10  
A 6 1 K 47/12  
A 6 1 K 47/18  
A 6 1 K 47/22  
A 6 1 K 47/26  
A 6 1 K 47/34  
A 6 1 K 47/36  
A 6 1 M 11/02  
A 6 1 P 11/00  
A 6 1 P 29/00

【F I】

A 6 1 K 45/06  
A 6 1 K 9/08  
A 6 1 K 9/10  
A 6 1 K 9/14  
A 6 1 K 9/48  
A 6 1 K 31/275  
A 6 1 K 31/439  
A 6 1 K 31/44  
A 6 1 K 31/46  
A 6 1 K 31/522  
A 6 1 K 47/04  
A 6 1 K 47/06  
A 6 1 K 47/10  
A 6 1 K 47/12  
A 6 1 K 47/18  
A 6 1 K 47/22  
A 6 1 K 47/26  
A 6 1 K 47/34

A 6 1 K 47/36

A 6 1 M 11/02 G

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 29/00

## 【手続補正書】

【提出日】平成17年2月25日(2005.2.25)

## 【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】

一種以上のPDE-IV阻害剤(2)と組み合わせた、一種以上の抗コリン作動薬(1)を、場合によりそのエナンチオマー、そのエナンチオマーの混合物としてまたはそのラセミ体として、場合によりその溶媒和物または水和物として、および場合により製薬上許容される賦形剤と共に含むことを特徴とする、医薬組成物。

【請求項2】

該活性物質1および2が、単一の処方物中に一緒に、あるいは2つの異なる処方物中に存在する、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項3】

該活性物質1が、チオトロピウム塩、オキシトロピウム塩またはイプラトロピウム塩からなる群から選択され、好ましくはチオトロピウム塩である、請求項1又は2記載の医薬組成物。

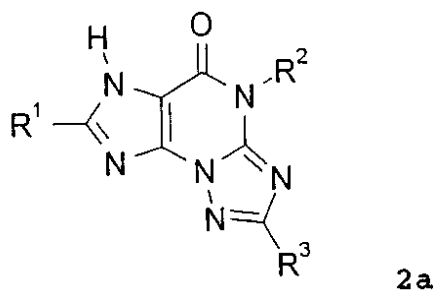
【請求項4】

該活性物質1が塩化物、臭化物、ヨウ化物、メタンスルホネート、p-トルエンスルホネートまたはメチル硫酸塩として存在する、好ましくは臭化物として存在する、請求項1～3の何れか1項に記載の医薬組成物。

【請求項5】

該活性物質2がエンプロフィリン、ロフルミラスト、アリフロ、ベイ 198004、CP-325,366、BY343、D-4396(Sch-351591)、V-11294A、AWD-12-281および以下の一般式2aで表される三環式含窒素ヘテロ環式化合物からなる群から選択され：

【化1】



ここで、 $R^1$ は $C_1$ - $C_5$ -アルキル基、 $C_5$ - $C_6$ -シクロアルキル基、フェニル、ベンジルまたは酸素および窒素から選択される1または2個のヘテロ原子を含むことができる、5-または6-員の、飽和または不飽和ヘテロ環式リングを表し、

$R^2$ は $C_1$ - $C_5$ -アルキル基または $C_2$ - $C_4$ -アルケニル基を表し、

$R^3$ は場合により $C_1$ - $C_4$ -アルコキシ基、 $C_5$ - $C_6$ -シクロアルキル基、フェノキシまたは酸素および窒素から選択される1または2個のヘテロ原子を含むことができる、5-または6-員の飽和または不飽和ヘテロ環式リングで置換されていても良い $C_1$ - $C_5$ -アルキル基、又は

場合により $C_1$ - $C_4$ -アルコキシ基で置換されていても良いフェニルまたはベンジル基又は

C<sub>5</sub>-C<sub>6</sub>-シクロアルキル基を表し、

該活性物質 2 が、場合によりそのラセミ体として、そのエナンチオマーとして、そのジアステレオマーとしておよびこれらの混合物として存在し、場合によりその互変異性体として、および場合によりその薬理的に許容される酸付加塩として存在する、請求項 1 ~ 4 の何れか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

該活性物質 2 が、エンプロフィリン、ロフルミラスト、アリフロ、AWD-12-281および上記一般式 2a で表される三環式含窒素ヘテロ環式化合物から選択される、請求項 1 ~ 5 の何れか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

該組成物が、吸入に適した処方物形状にある、請求項 1 ~ 6 の何れか 1 項に記載の医薬組成物。

【請求項 8】

該組成物が吸入性の粉末、プロペラント 含有計量エアゾルおよびプロペラントを含まない吸入性溶液または懸濁液から選択される処方物である、請求項 7 記載の医薬組成物。

【請求項 9】

該組成物が吸入性の粉末であり、該粉末が、単糖類、二糖類、オリゴ糖および多糖類、ポリアルコール類、塩類、またはこれら賦形剤相互の混合物から選択される、適当な生理的に許容される賦形剤との混合物として、該活性物質 1 および 2 を含む、請求項 8 記載の医薬組成物。

【請求項 10】

該組成物がプロペラント 含有吸入性エアゾルであり、該エアゾルが、溶解したまたは分散した状態で該活性物質 1 および 2 を含む、請求項 8 記載の医薬組成物。

【請求項 11】

該エアゾルが、プロペラントガスとして、n-プロパン、n-ブタンまたはイソブタン等の炭化水素、またはメタン、エタン、プロパン、ブタン、シクロプロパンまたはシクロブタンの塩素化および/またはフッ素化誘導体等のハロ炭化水素を含む、請求項 10 記載の医薬組成物。

【請求項 12】

該組成物がプロペラントを含まない吸入性の溶液または懸濁液であり、該溶液または懸濁液が、溶媒として、水、エタノールまたは水とエタノールとの混合物を含む、請求項 8 記載の医薬組成物。

【請求項 13】

気道の炎症性のまたは閉塞性の諸疾患を治療するための、医薬を調製するための、請求項 1 ~ 12 の何れか 1 項に記載の組成物の使用。