

【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8月7日(2008.8.7)

【公表番号】特表2004-506010(P2004-506010A)

【公表日】平成16年2月26日(2004.2.26)

【年通号数】公開・登録公報2004-008

【出願番号】特願2002-518951(P2002-518951)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/165 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/165

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 25/02 1 0 1

A 6 1 P 27/02

【手続補正書】

【提出日】平成20年6月23日(2008.6.23)

【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

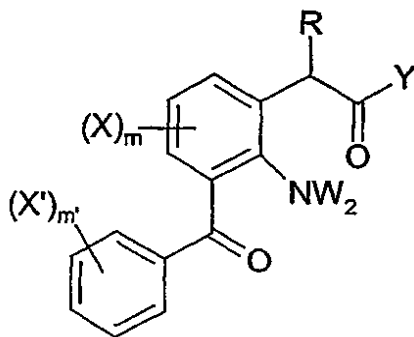
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 網膜または視神経乳頭の神経変性障害を罹患しているかまたは罹患しやすくなっている患者のそのような神経変性障害を処置または予防するための組成物であって、該組成物は、以下の式：

【化 1】



の 3 - ベンゾイルフェニル酢酸または誘導体の治療的に有効な量を含み、
ここで、

R は、H、C₁ - 4 分枝（非分枝）アルキル、CF₃、SR⁴ であり；

Y は、OR'、NR''R' であり；

R' は、H、置換（非置換）の C₁ - 10 分枝（非分枝）アルキル（以下の X により規定されるような置換基）、置換（非置換）複素環（以下の X により規定されるような置換基）、- (CH₂)_n Z (CH₂)_n・A であり；

n は、2 ~ 6 であり；

n' は、1 ~ 6 であり；

Z は、存在しない、O、C=O、OC(=O)、C(=O)O、C(=O)NR³、NR

$^3\text{C}(=\text{O})$ 、 $\text{S}(\text{O})_{n^2}$ 、 CHOR^3 、 NR^3 であり；

n^2 は、0～2 であり；

R^3 は、 H 、 C_{1-6} 分枝（非分枝）アルキル、置換（非置換）アリール（以下の X により規定されるような置換基）、置換（非置換）複素環（以下の X により規定されるような置換基）であり；

A は、 H 、 OH 、必要に応じて、置換（非置換）アリール（以下の X により規定されるような置換基）、置換（非置換）複素環（以下の X により規定されるような置換基）、 $-(\text{CH}_2)_n\text{OR}^3$ であり；

R'' は、 H 、 OH 、 OR' であり；

X および X' は、独立して、 H 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 OR' 、 CN 、 OH 、 $\text{S}(\text{O})_{n^2}\text{R}^4$ 、 CF_3 、 R^4 、 NO_2 であり；

R^4 は、 C_{1-6} 分枝（非分枝）アルキルであり；

m は、0～3 であり；

m' は、0～5 であり；そして、

W は、 O 、 H 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、ここで、

R は、 H 、 C_{1-2} アルキルであり；

Y は、 $\text{NR}'\text{R}''$ であり；

R' は、 H 、 C_{1-6} 分枝（非分枝）アルキル、 $-(\text{CH}_2)_n\text{Z}(\text{CH}_2)_n\cdot\text{A}$ であり；

Z は、存在しない、 O 、 CHOR^3 、 NR^3 であり；

R^3 は、 H であり；

A は、 H 、 OH 、置換（非置換）アリール（以下の X により規定されるような置換基）であり；

X および X' は、独立して、 H 、 F 、 Cl 、 Br 、 CN 、 CF_3 、 OR' 、 SR^4 、 R^4 であり；

R'' は、 H であり；

R^4 は、 C_{1-4} 分枝（非分枝）アルキルであり；

m は、0～2 であり；

m' は、0～2 であり；

W は、 H であり；

n は、2～4 であり；そして、

n' は、0～3 である、組成物。

【請求項 3】 請求項 2 に記載の組成物であって、前記 3 - ベンゾイルフェニル酢酸または誘導体が、2 - アミノ - 3 - (4 - フルオロベンゾイル) - フェニルアセトアミド；2 - アミノ - 3 - ベンゾイル - フェニルアセトアミド；および 2 - アミノ - 3 - (4 - クロロベンゾイル) - フェニルアセトアミドからなる群より選択される、組成物。

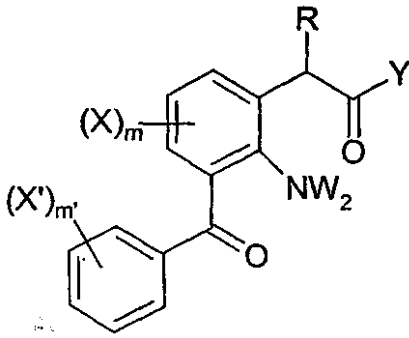
【請求項 4】 前記 3 - ベンゾイルフェニル酢酸または誘導体が、眼に局所投与されるのに適している、請求項 1 に記載の組成物。

【請求項 5】 前記 3 - ベンゾイルフェニル酢酸または誘導体の治療的に有効な量が、約 0.001～約 4.0% (w/v) である、請求項 4 に記載の組成物。

【請求項 6】 請求項 1 に記載の組成物であって、前記 3 - ベンゾイルフェニル酢酸または誘導体が、経口投与、静脈内投与、結膜下注射または結膜下移植での投与、サブテノン注射またはサブテノン移植での投与、硝子体内注射または硝子体内移植での投与、あるいは外科的洗浄溶液での投与に適している、組成物。

【請求項 7】 網膜または視神経乳頭の神経変性障害を罹患しているかまたは罹患しやすくなっている患者のそのような神経変性障害を処置または予防するための組成物であって、該組成物は、以下の式：

【化 2】



の 3 - ベンゾイルフェニル酢酸または誘導体の治療的に有効な量を含む、
ここで、

R は、H、C₁ - 4 分枝（非分枝）アルキル、CF₃、SR⁴ であり；

Y は、OR'、NR''R' であり；

R' は、H、置換（非置換）の C₁ - 10 分枝（非分枝）アルキル（以下の X により規定されるような置換基）、置換（非置換）複素環（以下の X により規定されるような置換基）、- (CH₂)_n Z (CH₂)_n・A であり；

n は、2 ~ 6 であり；

n' は、1 ~ 6 であり；

Z は、存在しない、O、C=O、OC(=O)、C(=O)O、C(=O)NR³、NR³C(=O)、S(O)_{n2}、CHOR³、NR³ であり；

n² は、0 ~ 2 であり；

R³ は、H、C₁ - 6 分枝（非分枝）アルキル、置換（非置換）アリール（以下の X により規定されるような置換基）、置換（非置換）複素環（以下の X により規定されるような置換基）であり；

A は、H、OH、必要に応じて、置換（非置換）アリール（以下の X により規定されるような置換基）、置換（非置換）複素環（以下の X により規定されるような置換基）、- (CH₂)_n OR³ であり；

R'' は、H、OH、OR' であり；

X および X' は、独立して、H、F、Cl、Br、I、OR'、CN、OH、S(O)_{n2} R⁴、CF₃、R⁴、NO₂ であり；

R⁴ は、C₁ - 6 分枝（非分枝）アルキルであり；

m は、0 ~ 3 であり；

m' は、0 ~ 5 であり；そして、

W は、O、H であり；

ここで、

該障害は、萎縮性黄斑変性；色素性網膜炎；医原性網膜症；網膜裂孔および網膜孔；糖尿病性網膜症；鎌状赤血球網膜症；網膜の静脈閉塞および動脈閉塞；ならびに視神経症からなる群より選択される、組成物。

【請求項 8】 請求項 7 に記載の組成物であって、ここで、

R は、H、C₁ - 2 アルキルであり；

Y は、NR'R'' であり；

R' は、H、C₁ - 6 分枝（非分枝）アルキル、- (CH₂)_n Z (CH₂)_n・A であり；

Z は、存在しない、O、CHOR³、NR³ であり；

R³ は、H であり；

A は、H、OH、置換（非置換）アリール（以下の X により規定されるような置換基）であり；

X および X' は、独立して、H、F、Cl、Br、CN、CF₃、OR'、SR⁴、R⁴ であり；

R'' は、H であり；

R^4 は、 C_{1-4} 分枝（非分枝）アルキルであり；
 m は、0～2 であり；
 m' は、0～2 であり；
 W は、H であり；
 n は、2～4 であり；そして、
 n' は、0～3 である、組成物。

【請求項 9】 請求項 8 に記載の組成物であって、前記 3 - ベンゾイルフェニル酢酸または誘導体が、2 - アミノ - 3 - (4 - フルオロベンゾイル) - フェニルアセトアミド；2 - アミノ - 3 - ベンゾイル - フェニルアセトアミド；および 2 - アミノ - 3 - (4 - クロロベンゾイル) - フェニルアセトアミドからなる群より選択される、組成物。

【請求項 10】 前記 3 - ベンゾイルフェニル酢酸または誘導体が、眼に局所投与されるのに適している、請求項 7 に記載の組成物。

【請求項 11】 前記 3 - ベンゾイルフェニル酢酸または誘導体の治療的に有効な量が、約 0.001～約 4.0% (w/v) である、請求項 10 に記載の組成物。

【請求項 12】 請求項 7 に記載の組成物であって、前記 3 - ベンゾイルフェニル酢酸または誘導体が、経口投与、静脈内投与、結膜下注射または結膜下移植での投与、サブテノン注射またはサブテノン移植での投与、硝子体内注射または硝子体内移植での投与、あるいは外科的洗浄溶液での投与に適している、組成物。