

【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18年7月13日(2006.7.13)

【公表番号】特表2002-518468(P2002-518468A)

【公表日】平成14年6月25日(2002.6.25)

【出願番号】特願2000-555854(P2000-555854)

【国際特許分類】

C 0 7 C 215/78 (2006.01)

A 6 1 K 31/137 (2006.01)

A 6 1 P 11/08 (2006.01)

C 0 7 C 213/02 (2006.01)

C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C 215/78

A 6 1 K 31/137

A 6 1 P 11/08

C 0 7 C 213/02

C 0 7 B 61/00 3 0 0

【手続補正書】

【提出日】平成18年5月23日(2006.5.23)

【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

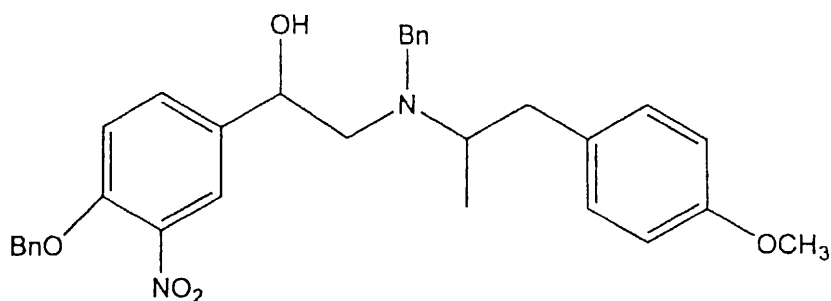
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

(a) 下式の化合物

【化1】

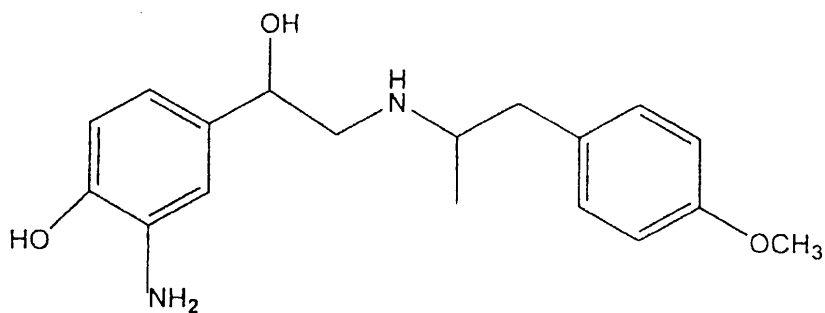


を用意し、

(b) この化合物を還元する

という逐次行程を包含する、下式の化合物

【化2】

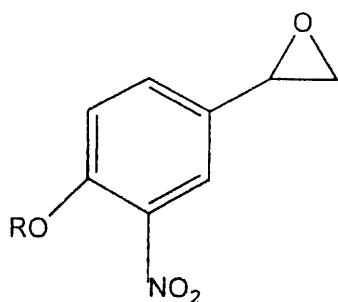


の製造方法。

【請求項 2】

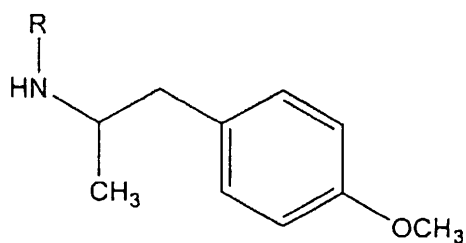
下式の化合物

【化 3】



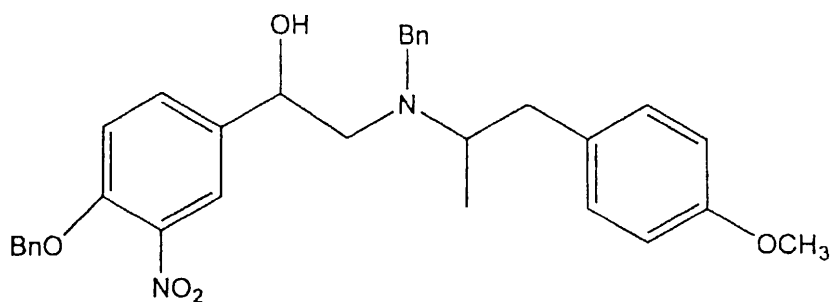
と下式の化合物

【化 4】



(ここに、R はベンジル基あるいは置換ベンジル基である) とを反応させることによって
下式の化合物

【化 1】

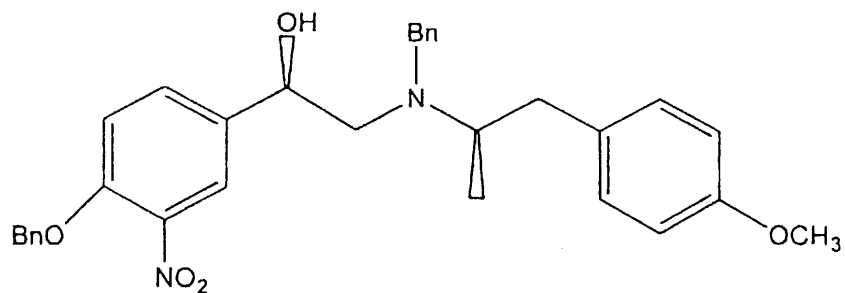


を製造する、請求項 1 による方法。

【請求項 3】

(a) 下式の化合物

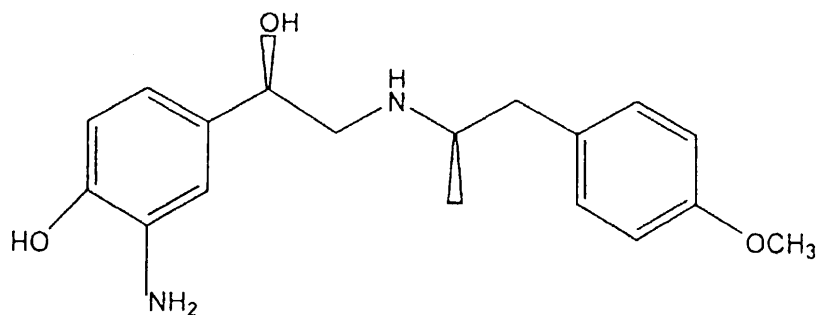
【化5】



を用意し、

(b) この化合物を酸の存在下に還元するという逐次行程を包含する、下式の化合物

【化6】

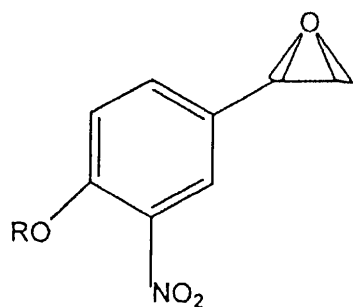


の塩の製造方法。

【請求項4】

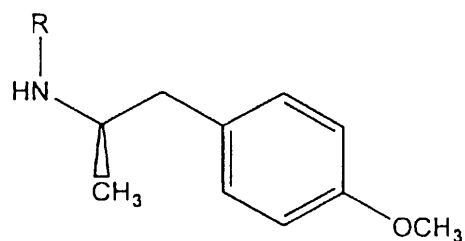
下式の化合物

【化7】



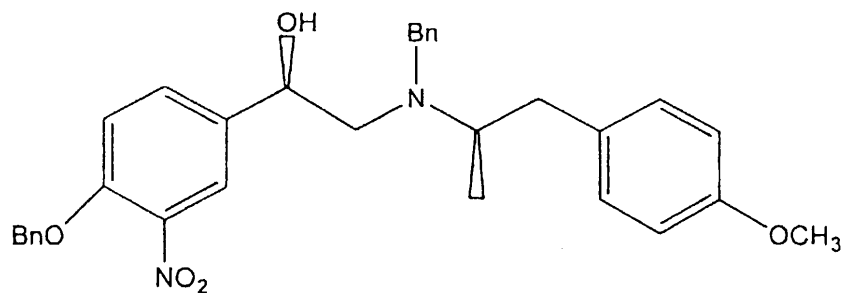
と下式の化合物

【化8】



(ここに、Rはベンジル基あるいは置換ベンジル基である)とを反応させることによって下式の化合物

【化 5】



を製造する、請求項 3 による方法。

【請求項 5】

貴金属触媒の存在下に水素源を用いて前記の還元行程を実施する請求項 1 又は 3 による方法。

【請求項 6】

前記の貴金属触媒がパラジウムである請求項 5 による方法。

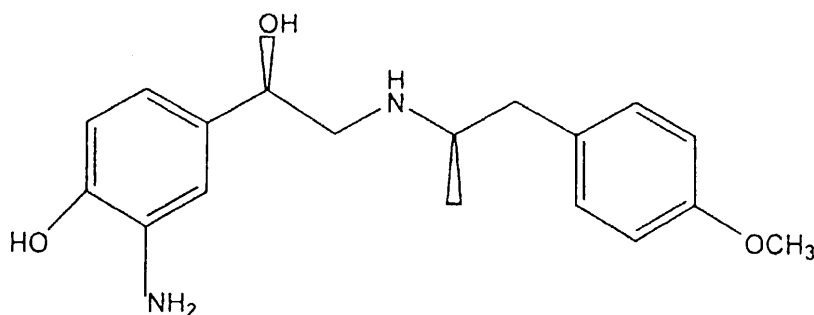
【請求項 7】

前記の塩が酒石酸塩であり、貴金属触媒及び酒石酸の存在下に水素源を用いて前記の還元行程を実施する請求項 3 による方法。

【請求項 8】

前記の下式の化合物

【化 6】

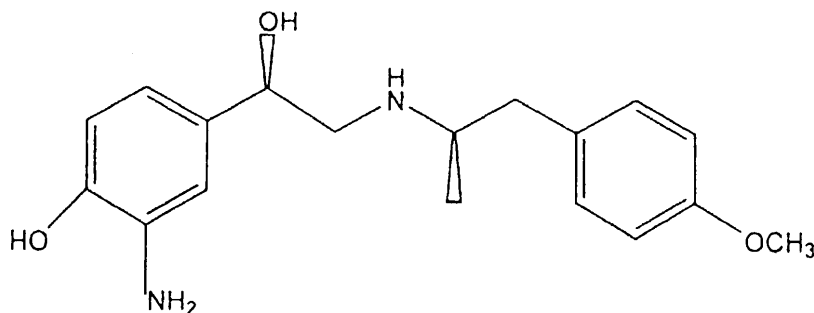


が R, R 配置のものである請求項 3 による方法。

【請求項 9】

前記の下式の化合物

【化 6】

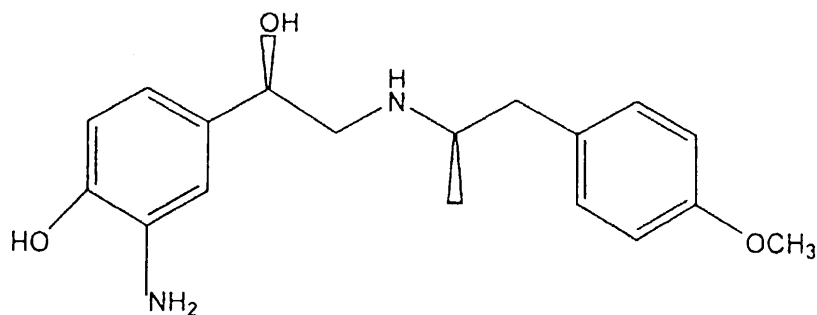


が S, S 配置のものである請求項 3 による方法。

【請求項 10】

前記の下式の化合物

【化6】

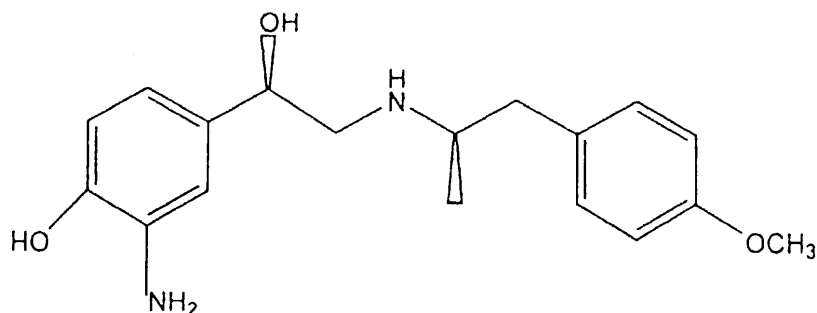


が R, S 配置のものである請求項3による方法。

【請求項11】

前記の下式の化合物

【化6】



が S, R 配置のものである請求項3による方法。

【請求項12】

薬効量のデスフォルモテロール、あるいはその医薬的に容認し得る塩を個体に投与することを包含する気管支拡張を誘発、あるいは気管支狭窄を予防する方法。

【請求項13】

経口的に、あるいは皮下注射、静脈注入、吸入又は経皮的送達によってデスフォルモテロールを投与する請求項12の方法。

【請求項14】

経口的にデスフォルモテロールを投与する請求項13による方法。

【請求項15】

吸入によって前記のデスフォルモテロールを投与する請求項13による方法。

【請求項16】

吸入による投与量が1日当たり約1 µg ないし約100 µg である請求項15による方法。

【請求項17】

ラセミ体デスフォルモテロール、あるいはその医薬的に容認し得る塩を投与する請求項12の方法。

【請求項18】

R, R - デスフォルモテロール、あるいはその医薬的に容認し得る塩を投与する請求項12の方法。

【請求項19】

R, S - デスフォルモテロール、あるいはその医薬的に容認し得る塩を投与する請求項12の方法。

【請求項20】

医薬的に容認し得る担体と、デスフォルモテロール、あるいはその医薬的に適切な塩とを包含する医薬品組成物。

【請求項 2 1】

ラセミ体デスフォルモテロール、あるいはその医薬的に適切な塩と、医薬的に容認し得る担体とを包含する請求項20による医薬品組成物。

【請求項 2 2】

(R, R)-デスフォルモテロール、あるいはその医薬的に適切な塩と、医薬的に容認し得る担体とを包含する請求項20による医薬品組成物。

【請求項 2 3】

前記の医薬的に容認し得る担体が推進剤を包含するエアゾル製剤形態の請求項20による医薬品組成物。

【請求項 2 4】

経口投与用の請求項20による医薬品組成物。

【請求項 2 5】

シロップ剤形態の請求項24による医薬品組成物。

【請求項 2 6】

錠剤又はカプセル剤の形態の請求項24による医薬品組成物。

【請求項 2 7】

徐放性形態の請求項26による医薬品組成物。

【請求項 2 8】

R, R-デスフォルモテロール、あるいはその医薬的に容認し得る塩。

【請求項 2 9】

S, S-デスフォルモテロール、あるいはその医薬的に容認し得る塩。

【請求項 3 0】

R, S-デスフォルモテロール、あるいはその医薬的に容認し得る塩。

【請求項 3 1】

S, R-デスフォルモテロール、あるいはその医薬的に容認し得る塩。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0002

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0002】

発明の背景

フォルモテロール、すなわち(+/-)N-[2-ヒドロキシ-5-[1-ヒドロキシ-2[[1-(p-メトキシフェニル)-2-プロピル]アミノ]エチル]フェニル]フォルムアミドは、吸入した場合、持続性の気管支拡張効果を有する薬効性の高い、 β_2 -選択性アドレナリン受容体作動薬(β_2 -selective adrenoceptor agonist)である。フォルモテロールの構造式を以下に示す。

【化 9】

