

【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21年12月24日(2009.12.24)

【公表番号】特表2005-507387(P2005-507387A)

【公表日】平成17年3月17日(2005.3.17)

【年通号数】公開・登録公報2005-011

【出願番号】特願2003-528540(P2003-528540)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/135 (2006.01)

A 6 1 K 31/137 (2006.01)

A 6 1 K 31/138 (2006.01)

A 6 1 K 31/216 (2006.01)

A 6 1 K 31/4025 (2006.01)

A 6 1 K 31/485 (2006.01)

A 6 1 P 13/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/135

A 6 1 K 31/137

A 6 1 K 31/138

A 6 1 K 31/216

A 6 1 K 31/4025

A 6 1 K 31/485

A 6 1 P 13/02

A 6 1 P 43/00 1 2 1

【誤訳訂正書】

【提出日】平成21年11月6日(2009.11.6)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】特許請求の範囲

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

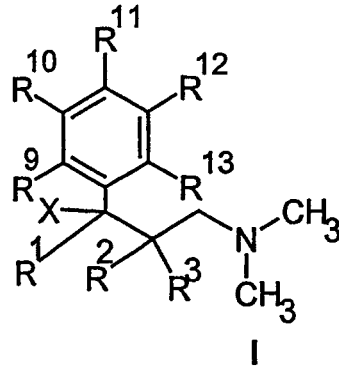
【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記グループc)から選ばれる化合物Aのうちの少なくとも1個及び化合物Bからなる有効物質コンビネーションを増加した尿意又は尿失禁の治療用医薬の製造に使用する方法において、上記グループc)は：

一般式I

【化1】



{ 式中、

XはOHを示し、

R^1 は非分枝状、飽和の、置換されていない C_{1-4} - アルキルから選ばれ、

R^2 及び R^3 はそれぞれ相互に無関係にH又は非分枝状、飽和の、置換されていない C_{1-4} - アルキルから選ばれ、

$R^9 \sim R^{13}$ はそれぞれ相互に無関係にH又は OR^{1-4} から選ばれ、

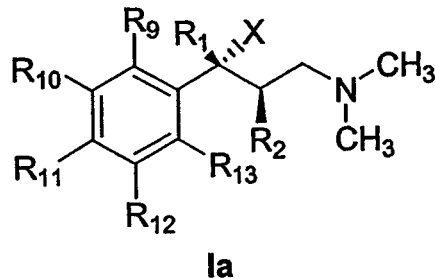
この際 R^{1-4} は C_{1-6} - アルキルである。}

で表わされる 1 - フェニル - 3 - ジメチルアミノ - プロパン化合物、又はその対掌体又はその生理学的に許容し得る塩からなり、そして化合物 B がオキシブチニンである、上記使用する方法。

【請求項 2】

一般式 I ($R^3 = H$) の化合物が相対配置 I a

【化 2】



(式中、X、 R^1 、 R^2 及び $R^9 - R^{13}$ は請求項 1 に定義された通りである。)
 に対応する (+) - 対掌体の形で存在する、請求項 1 記載の使用する方法。

【請求項 3】

グループ c) から選ばれる化合物 A のうちの少なくとも 1 個がつぎの群：

・ (+) - (2 R、3 R) - 1 - ジメチルアミノ - 3 - (3 - メトキシ - フェニル) - 2 - メチル - ペンタン - 3 - オール、及び

・ (+) - (2 R、3 R) - 4 - ジメチルアミノ - 2 - (3 - メトキシ - フェニル) - 3 - メチル - ブタン - 2 - オール

又はそれらの塩酸塩

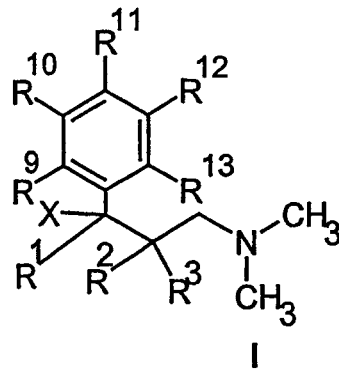
から選ばれる、請求項 1 又は 2 記載の使用する方法。

【請求項 4】

下記グループ c) から選ばれる化合物 A のうちの少なくとも 1 個及び化合物 B からなる、増加した尿意又は尿失禁の治療用の有効物質組成物において、上記グループ c) は：

一般式 I

【化 3】



{ 式中、

XはOHを示し、

R^1 は非分枝状、飽和の、置換されていない C_{1-4} - アルキルから選ばれ、

R^2 及び R^3 はそれぞれ相互に無関係にH又は非分枝状、飽和の、置換されていない C_{1-4} - アルキルから選ばれ、

$R^9 \sim R^{13}$ はそれぞれ相互に無関係にH又は OR^{14} から選ばれ、

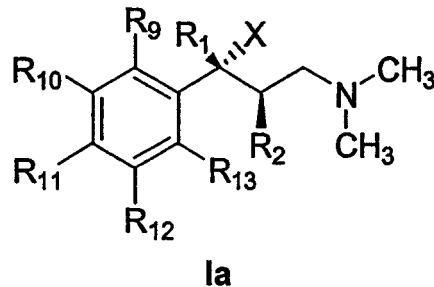
この際 R^{14} は C_{1-6} - アルキルである。}

で表わされる 1 - フェニル - 3 - ジメチルアミノ - プロパン化合物、又はその対掌体又はその生理学的に許容し得る塩からなり、そして化合物 B がオキシブチニンである、上記有効物質組成物。

【請求項 5】

一般式 I ($R^3 = H$) の化合物が相対配置 I a

【化 4】



(式中、X、 R^1 、 R^2 及び $R^9 - R^{13}$ は請求項 1 に定義された通りである。)
 に対応する (+) - 対掌体の形で存在する、請求項 4 記載の有効物質組成物。

【請求項 6】

グループ c) から選ばれる化合物 A のうちの少なくとも 1 個がつぎの群：

・ (+) - (2 R、3 R) - 1 - ジメチルアミノ - 3 - (3 - メトキシ - フェニル) - 2 - メチル - ペンタン - 3 - オール、及び

・ (+) - (2 R、3 R) - 4 - ジメチルアミノ - 2 - (3 - メトキシ - フェニル) - 3 - メチル - ブタン - 2 - オール

又はそれらの塩酸塩

から選ばれる、請求項 4 又は 5 に記載の有効物質組成物。

【請求項 7】

請求項 4 ~ 6 のいずれか 1 つに記載の有効物質組成物及び適する添加物及び / 又は助剤を含有する、増加した尿意又は尿失禁の治療用医薬。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0080

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0080】

実施例

例 1 : 麻酔された実験未使用の膀胱内圧測定テストシステム

Kimura等(1996)、Int. J. Urol. 3:218-227)の方法にしたがって実験未使用の雌性ラットの膀胱内圧測定試験を行う。麻酔され、酸素供給された(ventilierter)ラットを開腹し、尿管をつなげる。尿を腎臓から導く。カテーテルを膀胱に挿入し、固定する。このリズムカルな自発的活動が収縮の形で示されるまでこのカテーテルを介して生理食塩水を注入ポンプを用いて膀胱に注入する。この収縮は連結された圧力センサー(Druckaufnehmer)を介して記録することができる。テスト物質を安定な出発値が得られた後に累積法で静脈内投与する。膀胱機能の影響は、自発収縮の抑制によって示される。その際10分間収縮が起こらないことを抑制に関するパラメーターとみなす。

【誤訳訂正3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0081

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0081】

本例で、化合物A((+)-(2R,3R)-1-ジメチルアミノ-3-(3-メトキシ-フェニル)-2-メチル-ペンタン-3-オール;塩酸塩)を投薬量0.1mg/kg(静脈内i.v.)で、投薬量0.03mg/kg(静脈内i.v.)の化合物B(オキシブチニン)と組み合わせて、このコンビネーションの作用を個々の物質と比較する。個々の物質とコンビネーションは収縮度合の阻害率を示す(排尿発生/分)。データを次表に示す。

物質	化合物 A 0.1 mg / kg i.v.	化合物 B 0.03 mg / kg i.v.	化合物 A + 化合物 B 0.1 mg / kg i.v. + 0.03 mg / kg i.v.	賦形剤 コントロール i.v.
予備テスト に対する 収縮度合 の阻害率 [% MPE]	21.7%	10.7%	42.5%	4.0%

ここに挙げた物質及びコンビネーションすべてについて、ラットでの自発収縮の抑制を測定することができる。