

【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1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2005-502613(P2005-502613A)
【公表日】平成17年1月27日(2005.1.27)
【年通号数】公開・登録公報2005-004
【出願番号】特願2003-508342(P2003-508342)
【国際特許分類】

A 6 1 K 9/08 (2006.01)
A 6 1 K 9/14 (2006.01)
A 6 1 K 31/4745 (2006.01)
A 6 1 K 45/00 (2006.01)
A 6 1 P 25/16 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 9/08 Z N M
A 6 1 K 9/14
A 6 1 K 31/4745
A 6 1 K 45/00
A 6 1 P 25/16

【手続補正書】
【提出日】平成17年6月16日(2005.6.16)
【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】

log P値、約1.5以上を有する疎水性ドーパミン作動薬の、哺乳類の真皮への投与用薬剤の製造のための使用であって、疎水性ドーパミン作動薬の投与で、ボーラス注射により皮下にドーパミン作動薬を注射することで起こる吸収と比較して全身への吸収の改善が起こる、前記使用。

【請求項2】

log P値、約1.5以上を有する疎水性ドーパミン作動薬を哺乳類へ投与するための機器であって、疎水性ドーパミン作動薬を真皮に投与して該疎水性ドーパミン作動薬の全身への吸収を起こすように構成され、エレクトロポレーション注射方式であるか又はサーマルポレーション方式である、前記機器。

【請求項3】

哺乳類の真皮への投与のためのキットであって、log P値、約1.5以上を有する疎水性ドーパミン作動薬を含み、疎水性ドーパミン作動薬の真皮への投与で、皮下にドーパミン作動薬を注射することで起こる吸収と比較して全身への吸収の改善が起こる、前記キット。

【請求項4】

さらに疎水性ドーパミン作動薬を哺乳類へ投与するための機器を含み、該機器が疎水性ドーパミン作動薬を真皮に投与して該疎水性ドーパミン作動薬の全身への吸収を起こすように構成され、該機器がエレクトロポレーション注射方式であるか又はサーマルポレーション方式である、請求項3に記載のキット。

【請求項5】

投与がボーラス注射によるものである、請求項 1～4 のいずれかに記載の使用、機器又はキット。

【請求項 6】

哺乳類において少なくとも 1 つの薬物動態学的パラメータが改善され、薬物動態学的パラメータの改善が、疎水性ドーパミン作動薬のバイオアベイラビリティーの増加、 T_{max} の減少、 C_{max} の増加、及び T_{lag} の減少からなる群から選択される、請求項 1～4 のいずれかに記載の使用、機器又はキット。

【請求項 7】

$\log P$ 値、約 1.5 以上を有する疎水性ドーパミン作動薬を哺乳類へ投与することが、固体の射出、起電力、熱エネルギー又は気体の衝撃により形成される皮膚の微小孔を通じて疎水性ドーパミン作動薬を送達することを含む、請求項 1～4 のいずれかに記載の使用、機器又はキット。

【請求項 8】

$\log P$ 値、約 1.5 以上を有する疎水性ドーパミン作動薬を哺乳類へ投与することが、微小ニードルのアレイを通じて疎水性ドーパミン作動薬を送達することを含む、請求項 1～4 のいずれかに記載の使用、機器又はキット。

【請求項 9】

$\log P$ 値、約 1.5 以上を有する疎水性ドーパミン作動薬が、注入ポンプ、圧電ポンプ、起電力ポンプ、電磁ポンプ、さらばね、イオン導入、又は超音波導入によって送達される、請求項 1～4 のいずれかに記載の使用、機器又はキット。

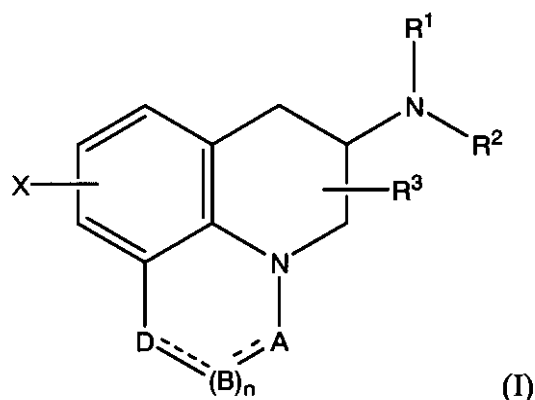
【請求項 10】

$\log P$ 値、約 1.5 以上を有する疎水性ドーパミン作動薬が、2.0 より大きい $\log P$ 値を有する、請求項 1～4 のいずれかに記載の使用、機器又はキット。

【請求項 11】

$\log P$ 値、約 1.5 以上を有する疎水性ドーパミン作動薬が以下の式 (I)

【化 1】



[式中、

R^1 、 R^2 および R^3 は等しいかまたは異なっていて、H、 C_{1-6} アルキル（所望によりフェニルに置換される）、 C_{3-5} アルケニル、 C_{3-5} アルキニルまたは C_{3-10} シクロアルキルであるか、あるいは R^3 が上記のとおりで、 R^1 と R^2 が N 原子を環上を含んで環化されてピロリジニル、ピペリジニル、モルフォリニル、4-メチルピペラジニルまたはイミダゾリル基を形成しており、

X は H、F、Cl、Br、I、OH、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、CN、カルボキサミド、カルボキシルまたは (C_{1-6} アルキル) カルボニルであり；

A は CH、 CH_2 、CHF、CHCl、CHBr、CHI、 $CHCH_3$ 、C=O、C=S、 $CSCH_3$ 、C=NH、 CNH_2 、 $CNHCH_3$ 、 $CNHCOOCH_3$ 、 $CNHCN$ 、 SO_2 または N であり；

B は CH、 CH_2 、CHF、CHCl、CHBr、CHI、C=O、N、NH または N

CH_3 であり；

Dは CH 、 CH_2 、 CHF 、 CHCl 、 CHBr 、 CHI 、 C=O 、 O 、 N 、 NH または NCH_3 であり；そしてnは0または1であり、

【化2】

は単結合または二重結合である、

ただし：

(1) nが0で、Aが CH_2 、 CH- （ハロゲン）（ハロゲンは上で定義されたとおり）、 CHCH_3 、 C=O 、 C=S 、 C=NH 、または SO_2 である場合；

その時、Dは CH_2 、 CH- （ハロゲン）（ハロゲンは上で定義されたとおり）、 C=O 、 O 、 NH 、または N-CH_3 であり；

(2) nが0で、Aが CH 、 C-SCH_3 、 C-NH_2 、 C-NHCH_3 、 C-NHCOOCH_3 、 C-NHCN 、またはNである場合；

その時、Dは CH またはNであり；

(3) nが1で、

Aが CH_2 、 CH- （ハロゲン）（ハロゲンは上で定義されたとおり）、 CHCH_3 、 C=O 、 C=S 、 C=NH 、または SO_2 で；

Bが CH_2 、 CH- （ハロゲン）（ハロゲンは上で定義されたとおり）、 C=O 、 NH 、または N-CH_3 である場合；

その時、Dは CH_2 、 C=O 、 O 、 NH または N-CH_3 であり；

(4) nが1で、

Aが CH 、 C-SCH_3 、 C-NH_2 、 C-NHCH_3 、 C-NHCOOCH_3 、 C-NHCN またはNで；

Bが CH またはNである場合；

その時、Dは CH_2 、 C=O 、 O 、 NH または N-CH_3 であり；

(5) nが1で、

Aが CH_2 、 CHCH_3 、 C=O 、 C=S 、 C=NH または SO_2 で；

Bが CH またはNである場合； その時

Dは CH またはNである]

で示されるものであるか、または医薬的に受容可能なその塩である、請求項1～4のいずれかに記載の使用、機器又はキット。

【請求項12】

$\log P$ 値、約1.5以上を有する疎水性ドーパミン作動薬が、(R)-5,6-ジヒドロ-5-(メチルアミノ)-4H-イミダゾ[4,5-i j]-キノリン-2(1H)-チオン、(R)-5,6-ジヒドロ-5-(メチルアミノ)-4H-イミダゾ[4,5-i j]-キノリン-2(1H)-オン、および医薬的に受容可能なその塩からなる群から選択される、請求項11に記載の使用、機器又はキット。

【請求項13】

$\log P$ 値、約1.5以上を有する疎水性ドーパミン作動薬がナノ粒子またはナノ結晶の形である、請求項1～4のいずれかに記載の使用、機器又はキット。