

【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4月24日 (2008.4.24)

【公表番号】特表2007-529426(P2007-529426A)

【公表日】平成19年10月25日 (2007.10.25)

【年通号数】公開・登録公報2007-041

【出願番号】特願2007-503101(P2007-503101)

【国際特許分類】

C 07 J 1/00 (2006.01)

C 07 J 3/00 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 27/02 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 37/06 (2006.01)

A 61 P 27/06 (2006.01)

A 61 P 1/02 (2006.01)

A 61 P 17/02 (2006.01)

A 61 P 31/00 (2006.01)

A 61 P 31/04 (2006.01)

A 61 P 31/22 (2006.01)

A 61 P 33/02 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 7/06 (2006.01)

A 61 P 9/14 (2006.01)

A 61 P 19/08 (2006.01)

A 61 P 27/10 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 35/02 (2006.01)

A 61 P 35/04 (2006.01)

A 61 P 37/04 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 P 17/06 (2006.01)

A 61 P 19/06 (2006.01)

A 61 P 19/10 (2006.01)

A 61 K 31/566 (2006.01)

A 61 K 31/56 (2006.01)

【 F I 】

C 07 J 1/00

C 07 J 3/00

A 61 P 43/00 1 0 5

A 61 P 27/02

A 61 P 9/10

A 61 P 37/06

A 61 P 27/06

A 61 P 1/02

A 61 P 17/02

A 61 P 31/00

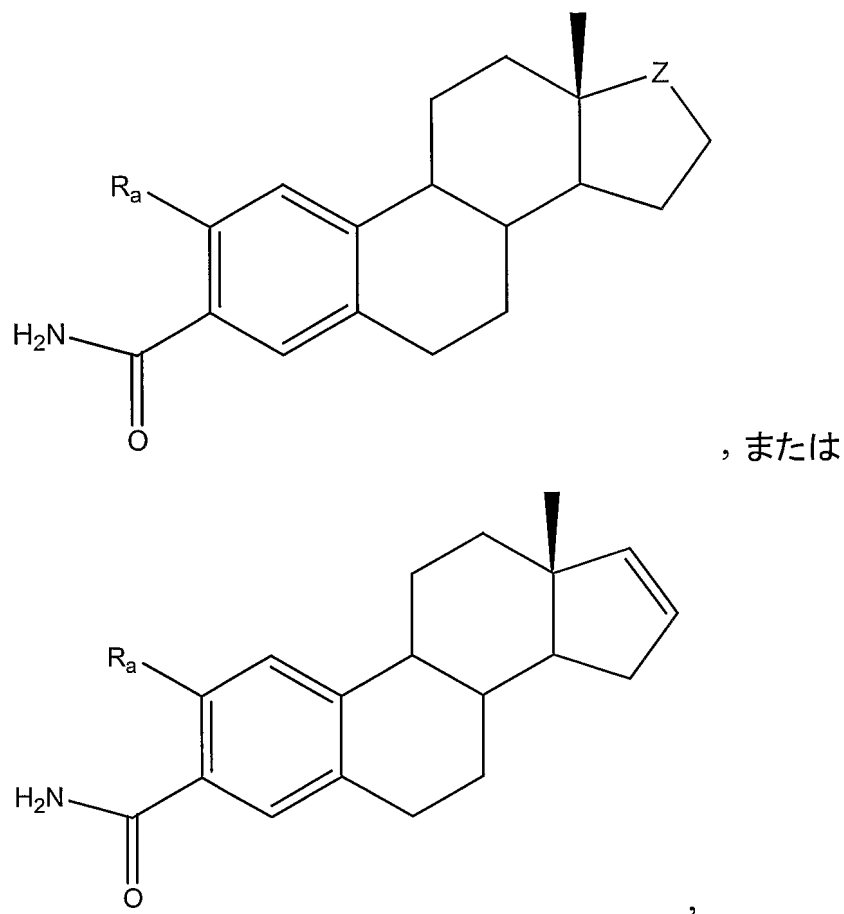
A 61 P 31/04

A 6 1 P	31/22	
A 6 1 P	33/02	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	7/06	
A 6 1 P	9/14	
A 6 1 P	19/08	
A 6 1 P	27/10	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	35/02	
A 6 1 P	35/04	
A 6 1 P	37/04	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	19/06	
A 6 1 P	19/10	
A 6 1 K	31/566	
A 6 1 K	31/56	

【手続補正書】**【提出日】**平成20年3月6日(2008.3.6)**【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】**

式：

【化 1】



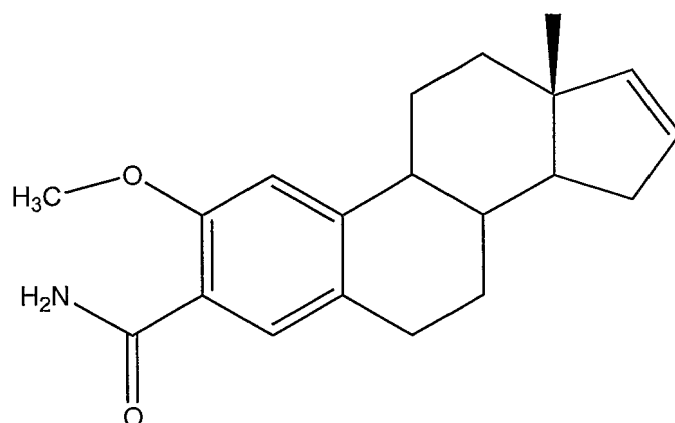
〔式中、 R_a は、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 又は $-CCCH_3$ から選択され；及び Z は、 $>C(H)-OH$ 、 $>C(H)-O-$ アルキル、 $>C(H)-O-$ スルファメートから選択され、前記アルキルは、1 - 10 個の炭素を含む線状、分岐及び / 又は環状炭化水素鎖である。〕

の化合物。

【請求項 2】

前記化合物が、

【化 2】

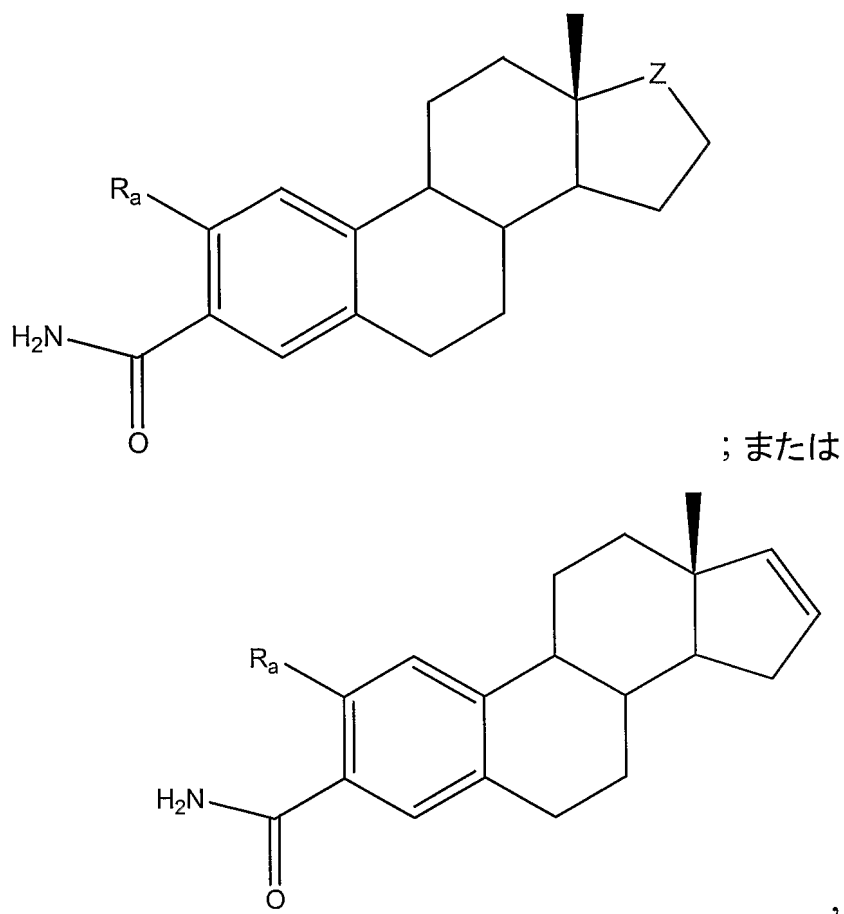


である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

有効量をヒトまたは動物に投与することを含む、ヒト又は動物において血管新生を阻害する薬剤を製造するための、以下の化学式で示される化合物の使用。

【化 3】



[式中、 R_a は、 $-\text{OCH}_3$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$ 又は $-\text{CCCH}_3$ から選択され；及び Z は、 $>\text{C}(\text{H})-\text{OH}$ 、 $>\text{C}(\text{H})-\text{O}-\text{アルキル}$ 、 $>\text{C}(\text{H})-\text{O}-\text{スルファメート}$ から選択され、前記アルキルは、1 - 10個の炭素を含む線状、分岐及び/又は環状炭化水素鎖である。]

【請求項 4】

前記化合物の投与が、血管新生の作用を阻害するためのヒトまたは動物への1日量、1日サブ用量 (Subdose)、又はその適宜分割量による、請求項 3 に記載の化合物の使用。

【請求項 5】

投与する化合物の量が、約 0.1 - 約 300 mg / kg / 日である、請求項 3 に記載の化合物の使用。

【請求項 6】

投与する化合物の量が、約 0.5 - 約 50 mg / kg / 日である、請求項 3 に記載の化合物の使用。

【請求項 7】

投与する化合物の量が、約 1 - 約 10 mg / kg / 日である、請求項 3 に記載の化合物の使用。

【請求項 8】

前記化合物の投与が、経口的、非経口的、経皮、局所、静脈内、皮下、筋肉内、皮内、眼、硬膜外、気管内、舌下、口腔、直腸、膣、鼻又は吸入である、請求項 3 に記載の化合物の使用。

【請求項 9】

前記化合物が、抗酸化剤、緩衝剤、静菌薬、液体担体、溶質、懸濁化剤、増粘剤、着香料、ゼラチン、グリセリン、結合剤、潤滑剤、不活性希釈剤、防腐剤、界面活性剤、分散剤、生分解性ポリマー、又はそれらの何らかの組み合わせから選択される添加物を含む組成物中で投与される、請求項 3 に記載の化合物の使用。

【請求項 10】

前記化合物が、錠剤、カプセル、ロセンジ、カシェ剤、溶液、懸濁液、乳剤、粉末、エアロゾル、坐薬、スプレー、香錠、軟膏、クリーム、ペースト、泡、ゲル、タンポン、膣坐薬、顆粒、ポーラス、うがい薬、又は経皮パッチの形態で投与される、請求項 3 に記載の化合物の使用。

【請求項 11】

前記血管新生が糖尿病性網膜症、未熟児網膜症、角膜移植拒絶反応、血管新生緑内障、水晶体後線維増殖症、流行性角結膜炎、ビタミン A 欠損症、コンタクトレンズ過剰着用、アトピー性角膜炎、上輪部角膜炎、翼状片乾性角膜炎、シューグレン症候群、しゅさ性皮膚瘡、フリクテン症、梅毒、マイコバクテリア感染、脂質変性、化学的熱傷、細菌性潰瘍、真菌性潰瘍、単純疱疹感染、带状疱疹感染、原生動物感染、カボジ肉腫、モーレン潰瘍、テリエン辺縁変性、辺縁角質溶解、外傷、慢性関節リウマチ、全身性狼瘡、多発性動脈炎、ヴェーゲナーサルコイドーシス、強膜炎、スティーブンス・ジョンソン病、放射状角膜切開、黄斑変性、鎌状赤血球貧血、類肉腫、弾性線維性仮性黄斑腫、バジェット病、静脈閉塞、動脈閉塞、頸動脈閉塞性疾患、慢性ブドウ膜炎、慢性硝子体炎、ライム病、イー LZ 病、ベーチェット病、近視、視神経乳頭小窩、シュタルガルト病、扁平部炎、慢性網膜剥離、過粘稠度症候群、トキシプラズマ症、レーザー後合併症、線維性血管組織の異常増殖、線維組織の異常増殖、増殖性硝子体網膜症、オースラー・ウェーバー・ランデュー病、固形腫瘍、血液由来の腫瘍、白血病、腫瘍転移、良性腫瘍、血管腫、後天性免疫不全症候群、眼血管新生疾患、加齢性黄斑変性、変形性関節症、慢性炎症によって引き起こされる疾患、クローン病、潰瘍性大腸炎、横紋筋肉腫の腫瘍、網膜芽細胞腫、ユーイング肉腫、神経芽細胞腫、骨肉腫、乾癬、アテローム性動脈硬化症、類天疱瘡、網膜炎を引き起こす感染、脈絡膜炎を引き起こす感染、推定眼ヒストプラズマ症、ベスト病、バルトネラ症、聴神経腫、神経線維腫、トラコーマ、化膿性肉芽腫、血管機能不全、異常創傷治癒、通風、通風性関節炎、横紋筋肉腫、血管新生依存性癌、遺伝性出血性毛細血管拡張症、閉経後症状、骨粗しょう症、心臓血管疾患、心筋血管新生、ブランク（粥腫）新生血管形成、血友病性関節、血管線維腫、創傷肉芽化、腸管癒着、強皮症、ケロイドまたは子宮内膜症に関連する、請求項 3 に記載の化合物の使用。

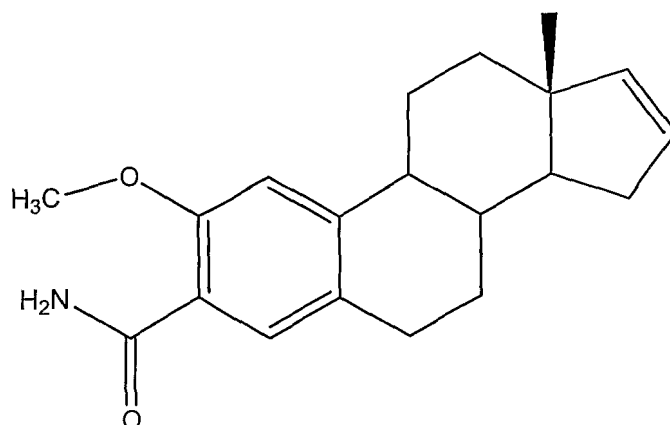
【請求項 12】

前記血管新生が、乳癌、前立腺癌、腎細胞癌、脳腫瘍、卵巣癌、結腸癌、膀胱癌、膵癌、胃癌、食道癌、皮膚黒色腫、肝癌、肺癌、精巣癌、腎癌、膀胱癌、子宮頸癌、リンパ腫、上皮小体癌、陰茎癌、直腸癌、小腸癌、甲状腺癌、子宮癌、ホジキンリンパ腫、唇及び口腔癌、皮膚癌、白血病または多発性骨髄腫から選択される血管新生依存性癌に関連する、請求項 3 に記載の化合物の使用。

【請求項 13】

前記化合物が、

【化 4】



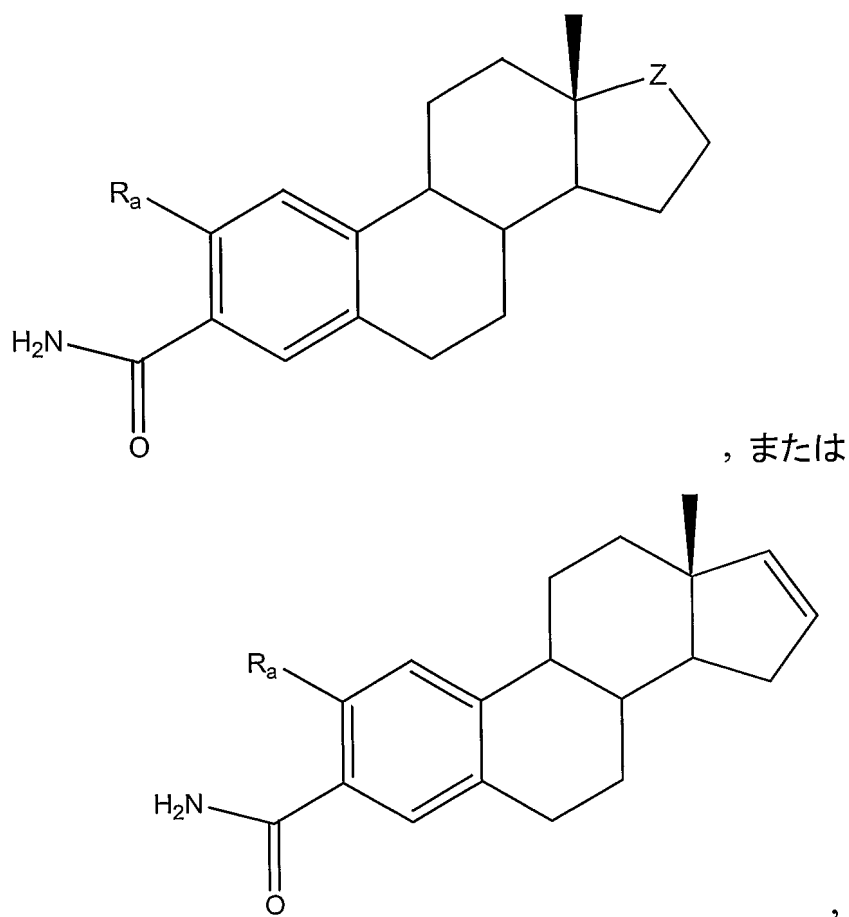
である、請求項 3 に記載の化合物の使用。

【請求項 1 4】

有効量をヒトまたは動物に投与することを含む、ヒト又は動物における血管新生依存性癌を治療する薬剤を製造するための、以下の化学式で示される化合物の使用。

式：

【化 5】



[式中、 R_a は、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 又は $-CCCH_3$ から選択され；及び Z は、 $>C(H)-OH$ 、 $>C(H)-O-$ アルキル、 $>C(H)-O-$ スルファメートから選択され、前記アルキルは、1 - 10個の炭素を含む線状、分岐及び/又は環状炭化水素鎖である。]

【請求項 15】

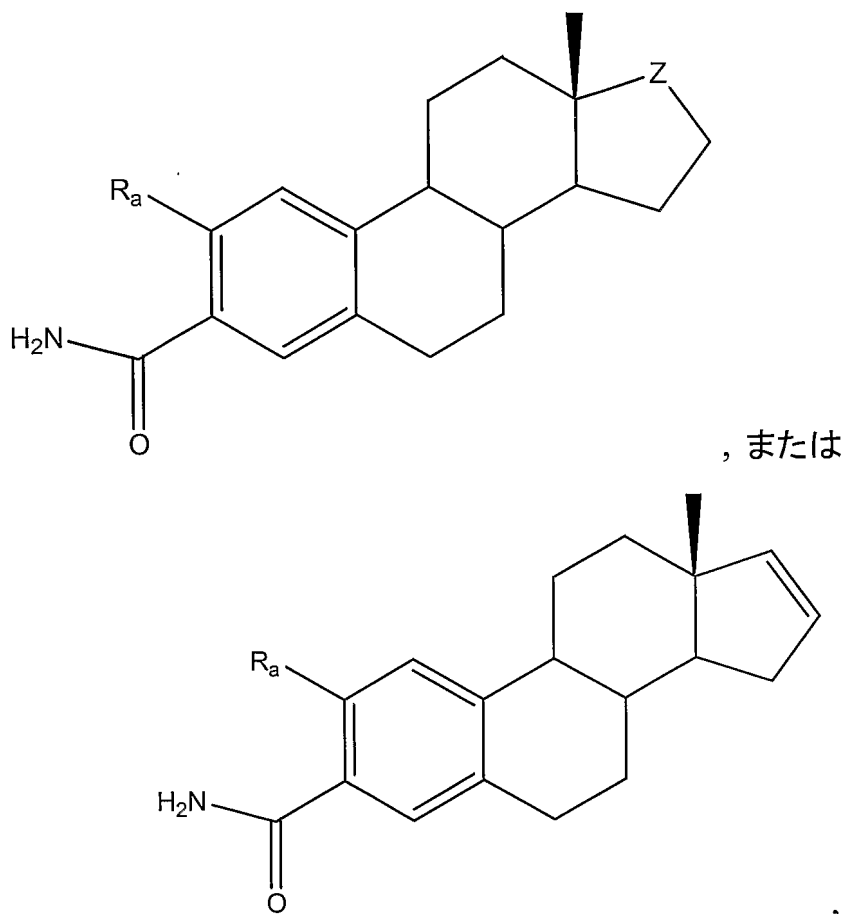
前記血管新生依存性癌が、乳癌、前立腺癌、腎細胞癌、脳腫瘍、卵巣癌、結腸癌、膀胱癌、膵癌、胃癌、食道癌、皮膚黒色腫、肝癌、肺癌、精巣癌、腎癌、膀胱癌、子宮頸癌、リンパ腫、上皮小体癌、陰茎癌、直腸癌、小腸癌、甲状腺癌、子宮癌、ホジキンリンパ腫、唇及び口腔癌、皮膚癌、白血病または多発性骨髄腫から選択される血管新生依存性癌に関連する、請求項 14 に記載の化合物の使用。

【請求項 16】

有効量をヒトまたは動物に投与することを含む、ヒト又は動物における眼状態を治療する薬剤を製造するための、以下の化学式で示される化合物の使用。

式：

【化 6】



[式中、 R_a は、 $-\text{OCH}_3$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$ 又は $-\text{CCCH}_3$ から選択され；及び Z は、 $>\text{C}(\text{H})-\text{OH}$ 、 $>\text{C}(\text{H})-\text{O}-$ アルキル、 $>\text{C}(\text{H})-\text{O}-$ スルファメートから選択され、前記アルキルは、1 - 10個の炭素を含む線状、分岐及び/又は環状炭化水素鎖である。]

【請求項 17】

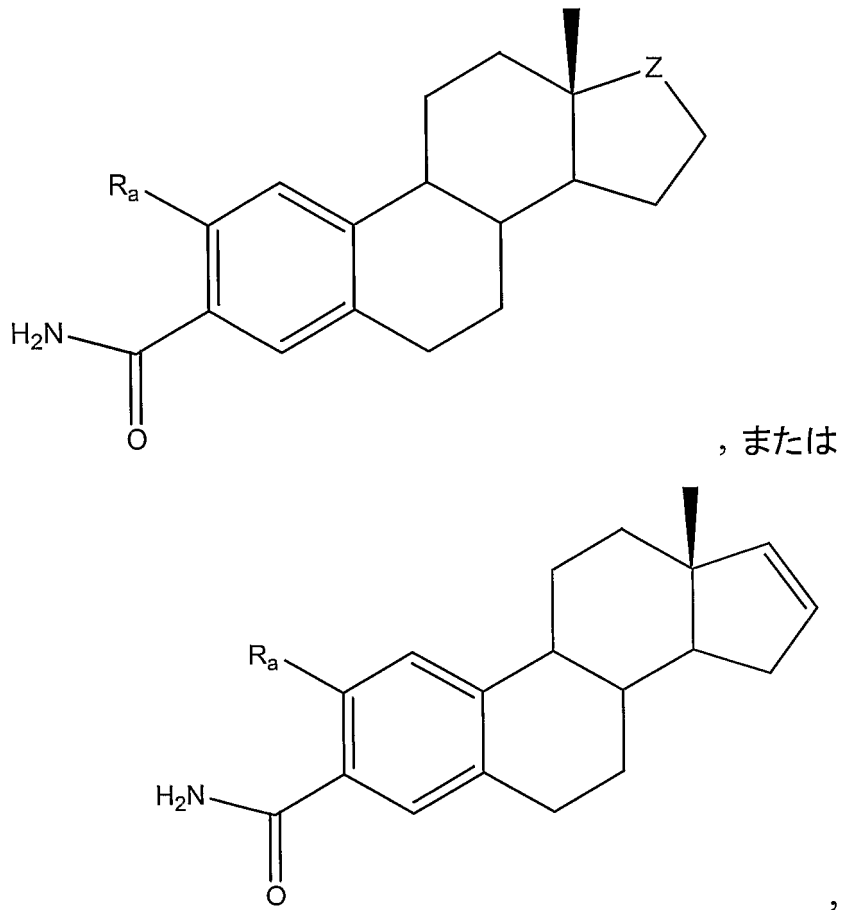
前記眼状態が、眼血管新生疾患、糖尿病性網膜症、未熟児網膜症、黄斑変性、角膜移植拒絶反応、血管新生緑内障、水晶体後線維増殖症、流行性角結膜炎、コンタクトレンズ過剰着用、アトピー性角膜炎、上輪部角膜炎、翼状片乾性角膜炎、近視、慢性網膜剥離、視神経乳頭小窩、テリエン辺縁変性、過粘稠度症候群、慢性ブドウ膜炎、慢性硝子体炎、推定眼ヒストプラスマ症、網膜炎、脈絡膜炎、増殖性硝子体網膜症、強膜炎、イールズ病、ベスト病、トラコーマまたはレーザー後合併症である、請求項 16 に記載の化合物の使用

。
【請求項 18】

有効量をヒトまたは動物に投与することを含む、ヒト又は動物における炎症性又は免疫介在性疾患を治療する薬剤を製造するための、以下の化学式で示される化合物の使用。

式：

【化 7】



[式中、 R_a は、 $-OCH$ 、 $-OCH_2CH_3$ 又は $-CCCH_3$ から選択され；及び Z は、 $>C(H)-OH$ 、 $>C(H)-O-$ アルキル、 $>C(H)-O-$ スルファメートから選択され、前記アルキルは、1 - 10 個の炭素を含む線状、分岐及び / 又は環状炭化水素鎖である。]

【請求項 19】

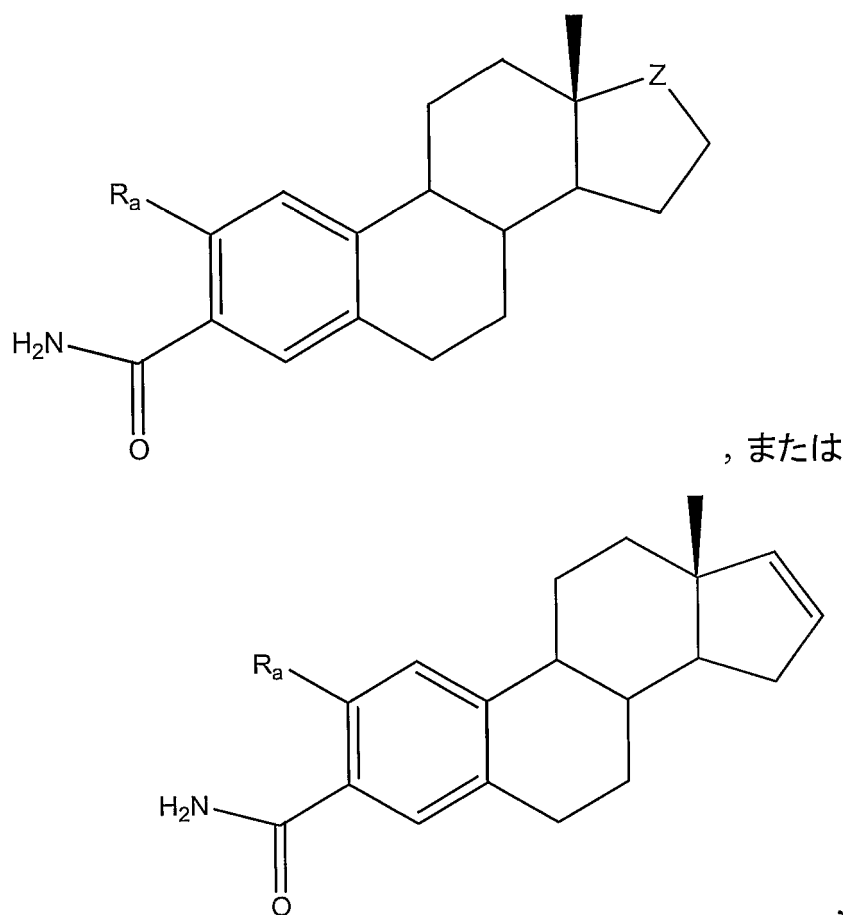
前記炎症性又は免疫介在性疾患が、慢性関節リウマチ、変形性関節症、潰瘍性大腸炎、クローン病、モーレン潰瘍、関節炎、サルコイドーシス、炎症性又は免疫介在性腸疾患、全身性狼瘡、ヴェーゲナー症候群、スティーブンス - ジョンソン病、ベーチェット病、類天疱瘡、ライム病、喘息または後天性免疫不全症候群である、請求項 18 に記載の化合物の使用。

【請求項 20】

有効量をヒトまたは動物に投与することを含む、ヒト又は動物における感染症を治療する薬剤を製造するための、以下の化学式で示される化合物の使用。

式：

【化 8】



[式中、 R_a は、 $-\text{OCH}_3$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$ 又は $-\text{CCCH}_3$ から選択され；及び Z は、 $>\text{C}(\text{H})-\text{OH}$ 、 $>\text{C}(\text{H})-\text{O}-\text{アルキル}$ 、 $>\text{C}(\text{H})-\text{O}-\text{スルファメート}$ から選択され、前記アルキルは、1 - 10個の炭素を含む線状、分岐及び/又は環状炭化水素鎖である。]

【請求項 21】

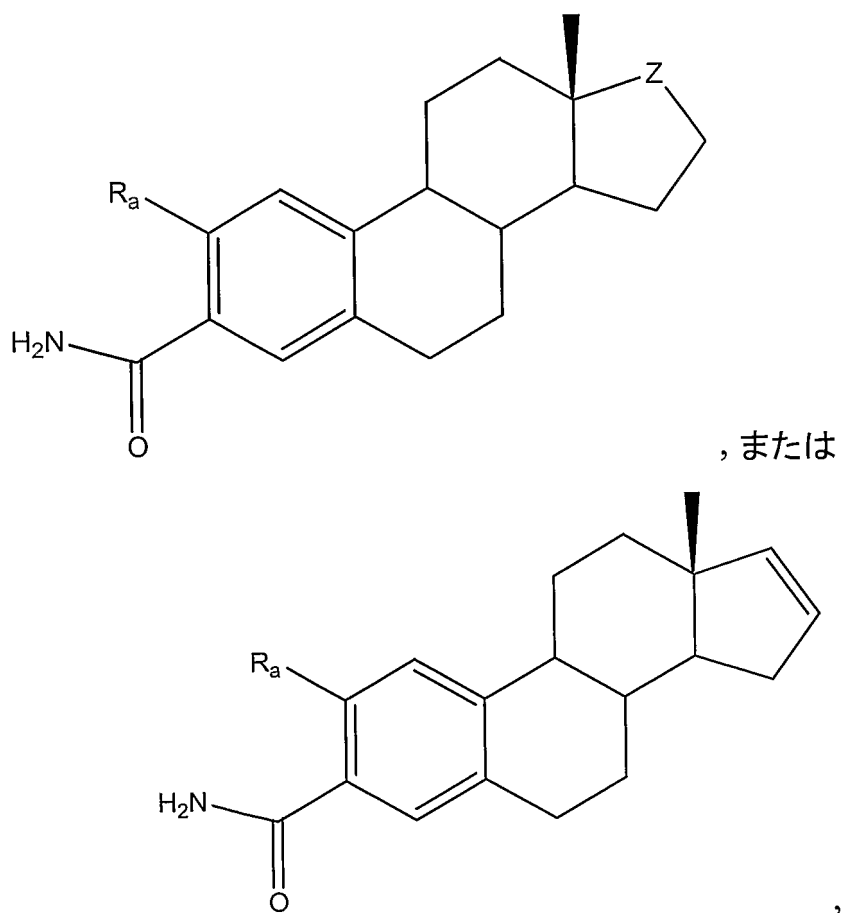
前記感染症が、梅毒、細菌感染、マイコバクテリア感染、細菌性潰瘍、真菌性潰瘍、単純疱疹感染、带状疱疹感染、原生動物感染、バルトネラ感染症又は、トキソプラズマ症である、請求項 20 に記載の化合物の使用。

【請求項 22】

有効量をヒトまたは動物に投与することを含む、ヒト又は動物における癌性疾患であって、横紋筋肉腫、網膜芽細胞腫、ユーイング肉腫、神経芽細胞腫、骨肉腫、聴神経腫、神経線維腫又は血管腫である癌性疾患を治療する薬剤を製造するための、以下の化学式で示される化合物の使用。

式：

【化 9】



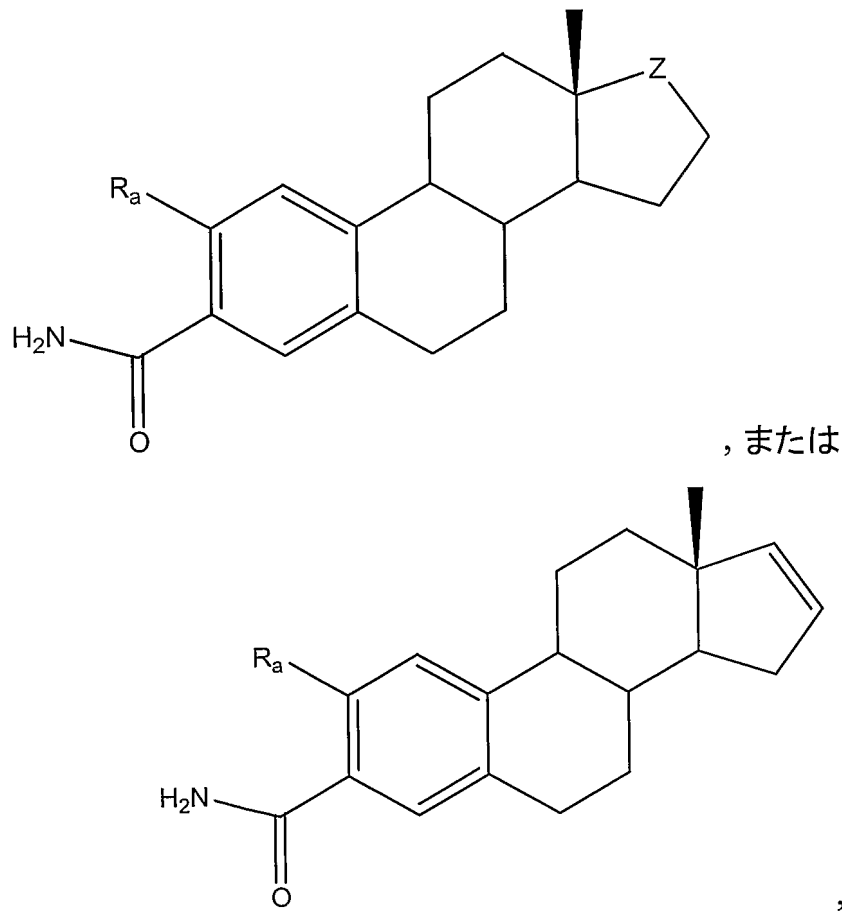
[式中、 R_a は、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 又は $-CCCH_3$ から選択され；及び Z は、 $>C(H)-OH$ 、 $>C(H)-O-$ アルキル、 $>C(H)-O-$ スルファメートから選択され、前記アルキルは、1 - 10個の炭素を含む線状、分岐及び/又は環状炭化水素鎖である。]

【請求項 23】

有効量をヒトまたは動物に投与することを含む、ヒト又は動物における血液又は血管疾患を治療する薬剤を製造するための、以下の化学式で示される化合物の使用。

式：

【化 10】



[式中、 R_a は、 $-\text{OCH}_3$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$ 又は $-\text{CCCH}_3$ から選択され；及び Z は、 $>\text{C}(\text{H})-\text{OH}$ 、 $>\text{C}(\text{H})-\text{O}-$ アルキル、 $>\text{C}(\text{H})-\text{O}-$ スルファメートから選択され、前記アルキルは、1 - 10個の炭素を含む線状、分岐及び/又は環状炭化水素鎖である。]

【請求項 24】

前記血液又は血管疾患または状態が、静脈閉塞、動脈閉塞、頸動脈閉塞性疾患、多発性動脈炎、アテローム性動脈硬化症、オースラー・ウェーバー・ランデュ病、鎌状赤血球貧血、白血病、骨髓の急性又は慢性腫瘍性疾患、血管腫、遺伝性出血性毛細血管拡張症、骨髓の疾患、貧血、再狭窄、血液凝固障害、あるいはリンパ節、肝臓又は脾臓の腫脹である、請求項 23 に記載の化合物の使用。

【請求項 25】

前記骨髓の急性又は慢性腫瘍性疾患が多発性骨髓腫である、請求項 24 に記載の化合物の使用。

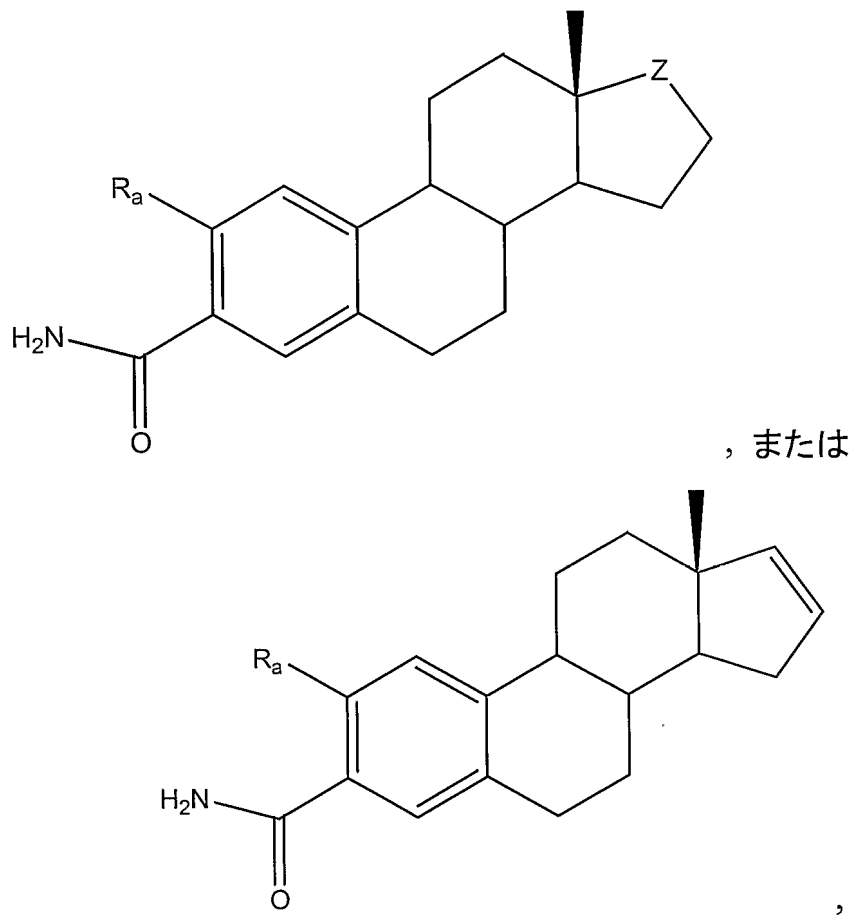
【請求項 26】

前記骨髓の急性又は慢性腫瘍性疾患が骨髓形成異常症候群である、請求項 24 に記載の化合物の使用。

【請求項 27】

有効量をヒトまたは動物に投与することを含む、ヒト又は動物における皮膚状態を治療する薬剤を製造するための、以下の化学式で示される化合物の使用。

式：
【化 1 1】



[式中、 R_a は、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 又は $-CCCH_3$ から選択され；及び Z は、 $>C(H)-OH$ 、 $>C(H)-O-$ アルキル、 $>C(H)-O-$ スルファメートから選択され、前記アルキルは、1 - 10個の炭素を含む線状、分岐及び/又は環状炭化水素鎖である。]

【請求項 28】

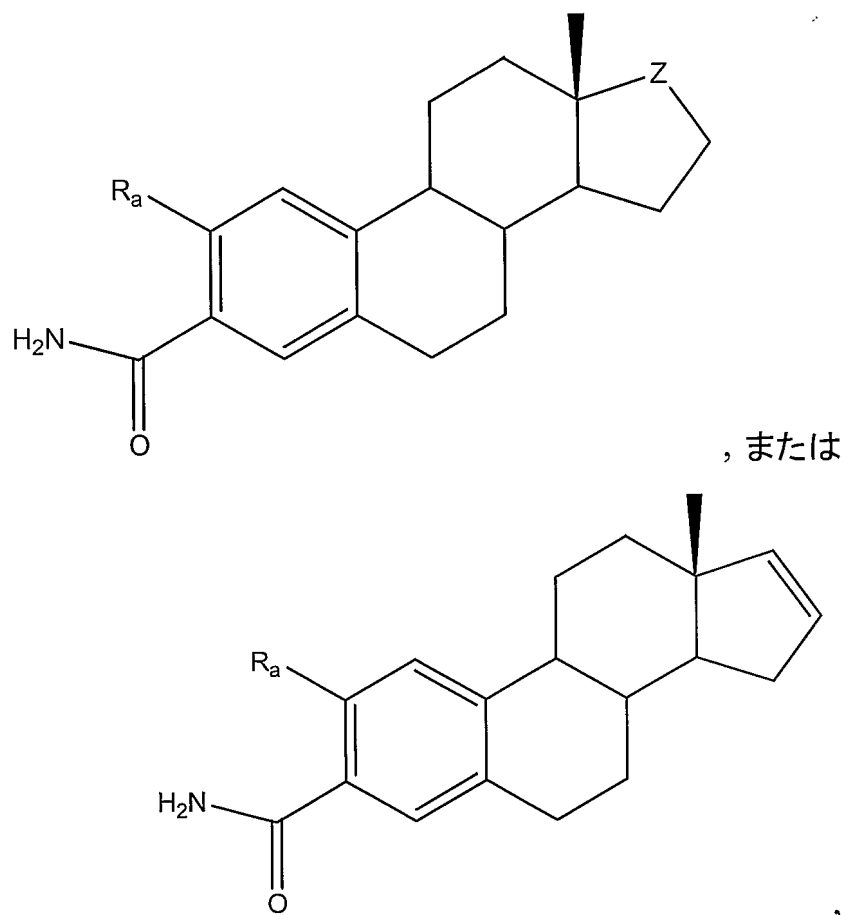
前記皮膚状態が、異常創傷治癒、しゅさ性座総瘡、皮膚の化学的熱傷、又は乾癬である、請求項 27 に記載の化合物の使用。

【請求項 29】

有効量をヒトまたは動物に投与することを含む、ヒト又は動物における血管新生依存性腫瘍を治療する薬剤を製造するための、以下の化学式で示される化合物の使用。

式：

【化 1 2】



[式中、 R_a は、 $-\text{OCH}_3$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$ 又は $-\text{CCCH}_3$ から選択され；及び Z は、 $>\text{C}(\text{H})-\text{OH}$ 、 $>\text{C}(\text{H})-\text{O}-\text{アルキル}$ 、 $>\text{C}(\text{H})-\text{O}-\text{スルファメート}$ から選択され、前記アルキルは、1 - 10個の炭素を含む線状、分岐及び/又は環状炭化水素鎖である。]

【請求項 30】

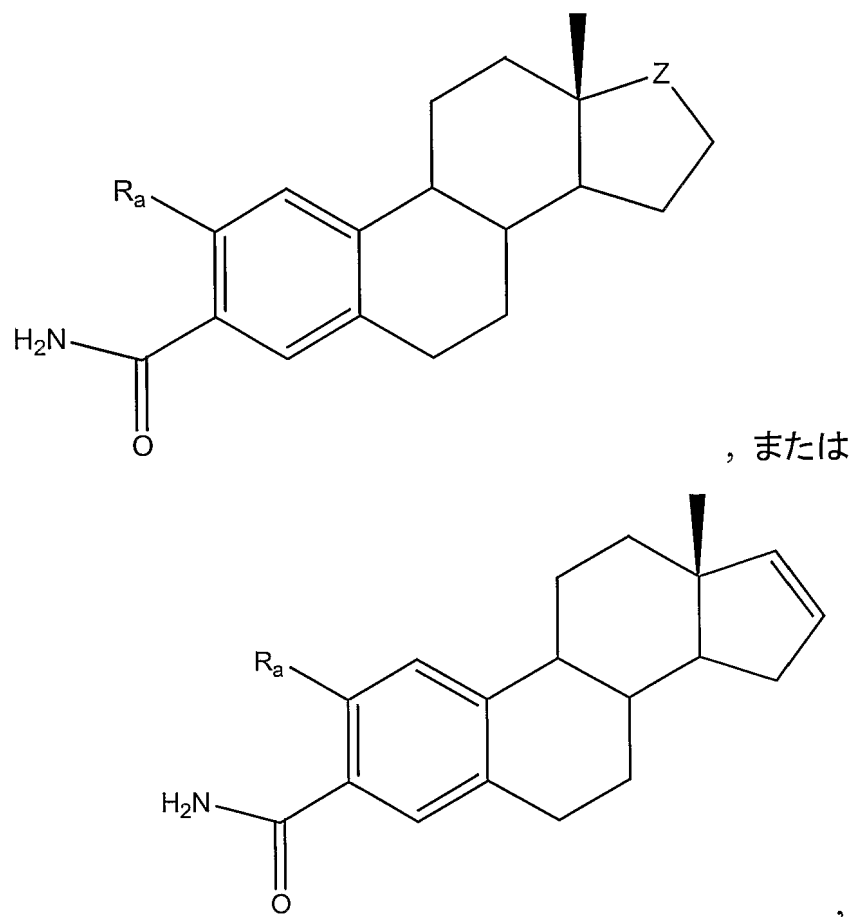
前記腫瘍が、血液由来腫瘍、固形腫瘍、良性腫瘍、又は癌性腫瘍である、請求項 29 に記載の化合物の使用。

【請求項 31】

有効量をヒトまたは動物に投与することを含む、ヒト又は動物における子宮内膜症を治療する薬剤を製造するための、以下の化学式で示される化合物の使用。

式：

【化 1 3】



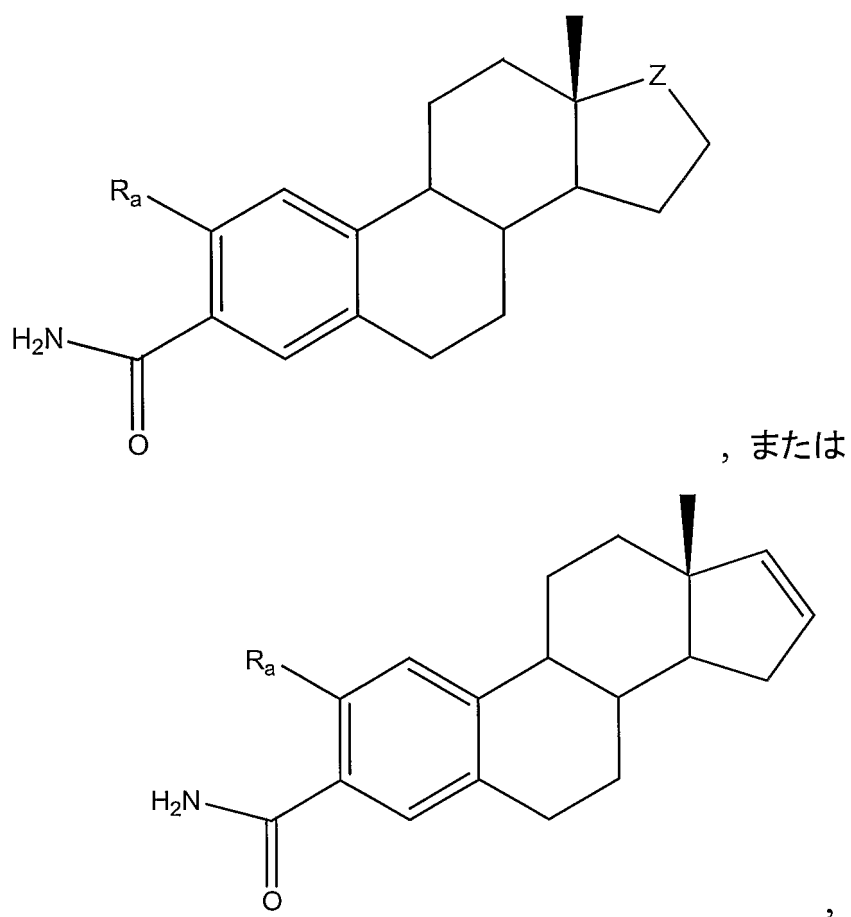
[式中、 R_a は、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 又は $-CCCH_3$ から選択され；及び Z は、 $>C(H)-OH$ 、 $>C(H)-O-$ アルキル、 $>C(H)-O-$ スルファメートから選択され、前記アルキルは、1 - 10個の炭素を含む線状、分岐及び/又は環状炭化水素鎖である。]

【請求項 3 2】

有効量をヒト女性または雌性動物に投与することを含む、ヒト女性又は雌性動物における排卵をブロックする、胞胚の着床をブロックする又は月経をブロックする（無月経を含む）薬剤を製造するための、以下の化学式で示される化合物の使用。

式：

【化 1 4】

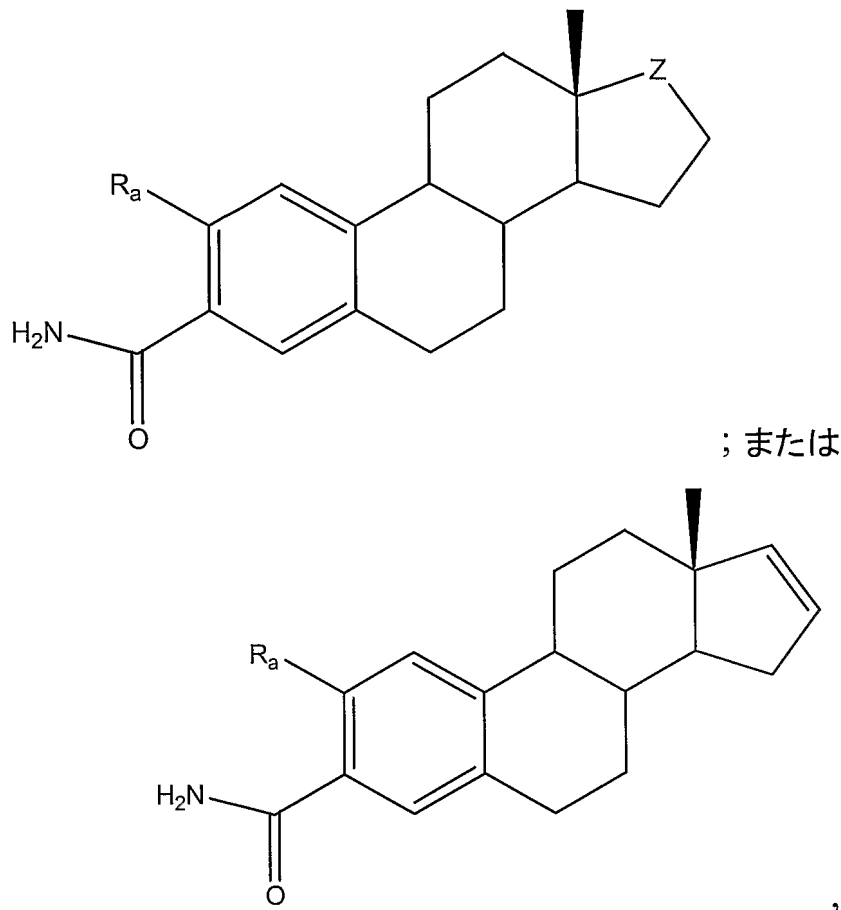


[式中、 R_a は、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 又は $-CCCH_3$ から選択され；及び Z は、 $>C(H)-OH$ 、 $>C(H)-O-$ アルキル、 $>C(H)-O-$ スルファメートから選択され、前記アルキルは、1 - 10個の炭素を含む線状、分岐及び/又は環状炭化水素鎖である。]

【請求項 33】

以下の化学式の化合物：

【化 15】



[式中、 R_a は、 $-\text{OCH}_3$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$ 又は $-\text{CCCH}_3$ から選択され；及び Z は、 $>\text{C}(\text{H})-\text{OH}$ 、 $>\text{C}(\text{H})-\text{O}-\text{アルキル}$ 、 $>\text{C}(\text{H})-\text{O}-\text{スルファメート}$ から選択され、前記アルキルは、1 - 10個の炭素を含む線状、分岐及び／又は環状炭化水素鎖である。]

の有効量を動物（ヒトを除く）に投与することを含む、動物（ヒトを除く）において血管新生を阻害する方法。

【請求項 34】

前記化合物の投与が、血管新生の作用を阻害するための動物（ヒトを除く）への1日量、1日サブ用量（*Subdose*）、又はその適宜分割量による、請求項 33に記載の方法。

【請求項 35】

投与する化合物の量が、約0.1 - 約300 mg / kg / 日である、請求項 33に記載の方法。

【請求項 36】

投与する化合物の量が、約0.5 - 約50 mg / kg / 日である、請求項 33に記載の方法。

【請求項 37】

投与する化合物の量が、約1 - 約10 mg / kg / 日である、請求項 33に記載の方法。

【請求項 38】

前記化合物の投与が、経口的、非経口的、経皮、局所、静脈内、皮下、筋肉内、皮内、

眼、硬膜外、気管内、舌下、口腔、直腸、膣、鼻又は吸入である、請求項 3 3に記載の方法。

【請求項 3 9】

前記化合物が、抗酸化剤、緩衝剤、静菌薬、液体担体、溶質、懸濁化剤、増粘剤、着色料、ゼラチン、グリセリン、結合剤、潤滑剤、不活性希釈剤、防腐剤、界面活性剤、分散剤、生分解性ポリマー、又はそれらの何らかの組み合わせから選択される添加物を含む組成物中で投与される、請求項 3 3に記載の方法。

【請求項 4 0】

前記化合物が、錠剤、カプセル、ロセンジ、カシェ剤、溶液、懸濁液、乳剤、粉末、エアロゾル、坐薬、スプレー、香錠、軟膏、クリーム、ペースト、泡、ゲル、タンポン、膣坐薬、顆粒、ポーラス、うがい薬、又は経皮パッチの形態で投与される、請求項 3 3に記載の方法。

【請求項 4 1】

前記血管新生が糖尿病性網膜症、未熟児網膜症、角膜移植拒絶反応、血管新生緑内障、水晶体後線維増殖症、流行性角結膜炎、ビタミン A 欠損症、コンタクトレンズ過剰着用、アトピー性角膜炎、上輪部角膜炎、翼状片乾性角膜炎、シューグレン症候群、しゅさ性座瘡、フリクテン症、梅毒、マイコバクテリア感染、脂質変性、化学的熱傷、細菌性潰瘍、真菌性潰瘍、単純疱疹感染、帯状疱疹感染、原生動物感染、カボジ肉腫、モーレン潰瘍、テリエン辺縁変性、辺縁角質溶解、外傷、慢性関節リウマチ、全身性狼瘡、多発性動脈炎、ヴェーゲナーサルコイドーシス、強膜炎、スティーブンス - ジョンソン病、放射状角膜切開、黄斑変性、鎌状赤血球貧血、類肉腫、弾性線維性仮性黄斑腫、バジェット病、静脈閉塞、動脈閉塞、頸動脈閉塞性疾患、慢性ブドウ膜炎、慢性硝子体炎、ライム病、イールズ病、ベーチェット病、近視、視神経乳頭小窩、シュタルガルト病、扁平部炎、慢性網膜剥離、過粘稠度症候群、トキソプラズマ症、レーザー後合併症、線維性血管組織の異常増殖、線維組織の異常増殖、増殖性硝子体網膜症、オースラー・ウェーバー・ランデュー病、固形腫瘍、血液由来の腫瘍、白血病、腫瘍転移、良性腫瘍、血管腫、後天性免疫不全症候群、眼血管新生疾患、加齢性黄斑変性、変形性関節症、慢性炎症によって引き起こされる疾患、クローン病、潰瘍性大腸炎、横紋筋肉腫の腫瘍、網膜芽細胞腫、ユーイング肉腫、神経芽細胞腫、骨肉腫、乾癬、アテローム性動脈硬化症、類天疱瘡、網膜炎を引き起こす感染、脈絡膜炎を引き起こす感染、推定眼ヒストプラズマ症、ベスト病、バルトネラ症、聴神経腫、神経線維腫、トラコーマ、化膿性肉芽腫、血管機能不全、異常創傷治癒、通風、通風性関節炎、横紋筋肉腫、血管新生依存性癌、遺伝性出血性毛細血管拡張症、閉経後症状、骨粗しょう症、心臓血管疾患、心筋血管新生、ブランク（粥腫）新生血管形成、血友病性関節、血管線維腫、創傷肉芽化、腸管癒着、強皮症、ケロイドまたは子宮内膜症に関連する、請求項 3 3 に記載の方法。

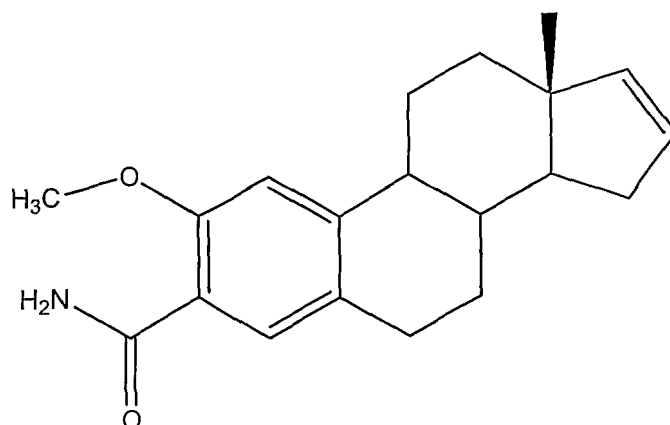
【請求項 4 2】

前記血管新生が、乳癌、前立腺癌、腎細胞癌、脳腫瘍、卵巣癌、結腸癌、膀胱癌、膵癌、胃癌、食道癌、皮膚黒色腫、肝癌、肺癌、精巣癌、腎癌、膀胱癌、子宮頸癌、リンパ腫、上皮小体癌、陰茎癌、直腸癌、小腸癌、甲状腺癌、子宮癌、ホジキンリンパ腫、唇及び口腔癌、皮膚癌、白血病または多発性骨髄腫から選択される血管新生依存性癌に関連する、請求項 3 3に記載の方法。

【請求項 4 3】

前記化合物が、

【化 1 6】

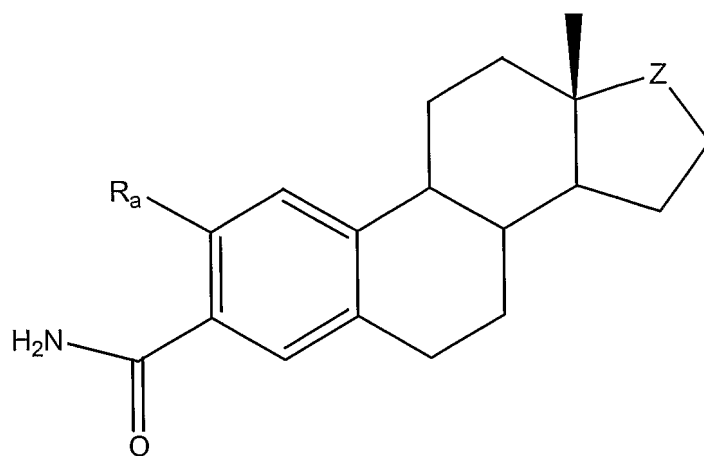


である、請求項 3 3 に記載の方法。

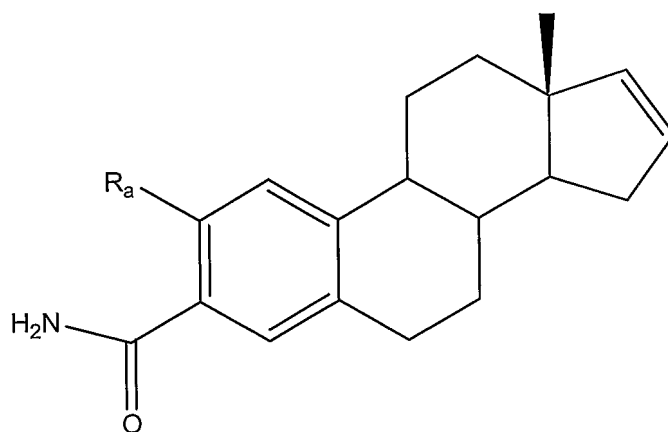
【請求項 4 4】

式：

【化 1 7】



，または



，

[式中、 R_a は、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 又は $-CCCH_3$ から選択され；及び Z は、 $>C(H)-OH$ 、 $>C(H)-O-$ アルキル、 $>C(H)-O-$ スルファメートから選択され、前記アルキルは、1 - 10個の炭素を含む線状、分岐及び/又は環状炭化水素鎖である。]

を有する化合物の有効な血管新生依存性癌治療量を、血管新生依存性癌を有する動物（ヒトを除く）に投与することを含む、動物（ヒトを除く）において血管新生依存性癌を治療する方法。

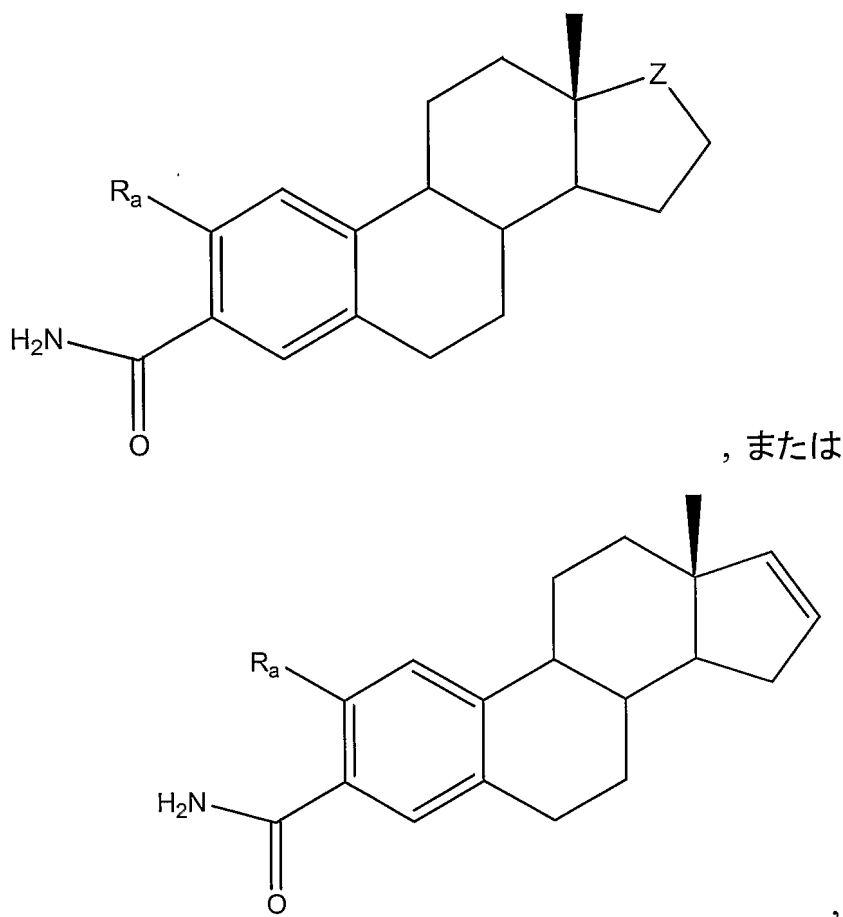
【請求項45】

前記血管新生依存性癌が、乳癌、前立腺癌、腎細胞癌、脳腫瘍、卵巣癌、結腸癌、膀胱癌、膵癌、胃癌、食道癌、皮膚黒色腫、肝癌、肺癌、精巣癌、腎癌、膀胱癌、子宮頸癌、リンパ腫、上皮小体癌、陰茎癌、直腸癌、小腸癌、甲状腺癌、子宮癌、ホジキンリンパ腫、唇及び口腔癌、皮膚癌、白血病または多発性骨髄腫から選択される血管新生依存性癌に関連する、請求項44に記載の方法。

【請求項46】

式：

【化18】



[式中、 R_a は、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 又は $-CCCH_3$ から選択され；及び Z は、 $>C(H)-OH$ 、 $>C(H)-O-$ アルキル、 $>C(H)-O-$ スルファメートから選択され、前記アルキルは、1 - 10個の炭素を含む線状、分岐及び/又は環状炭化水素鎖である。]

を有する化合物の有効な眼治療量を、動物（ヒトを除く）に投与することを含む、動物（

ヒトを除く)において眼状態を治療する方法。

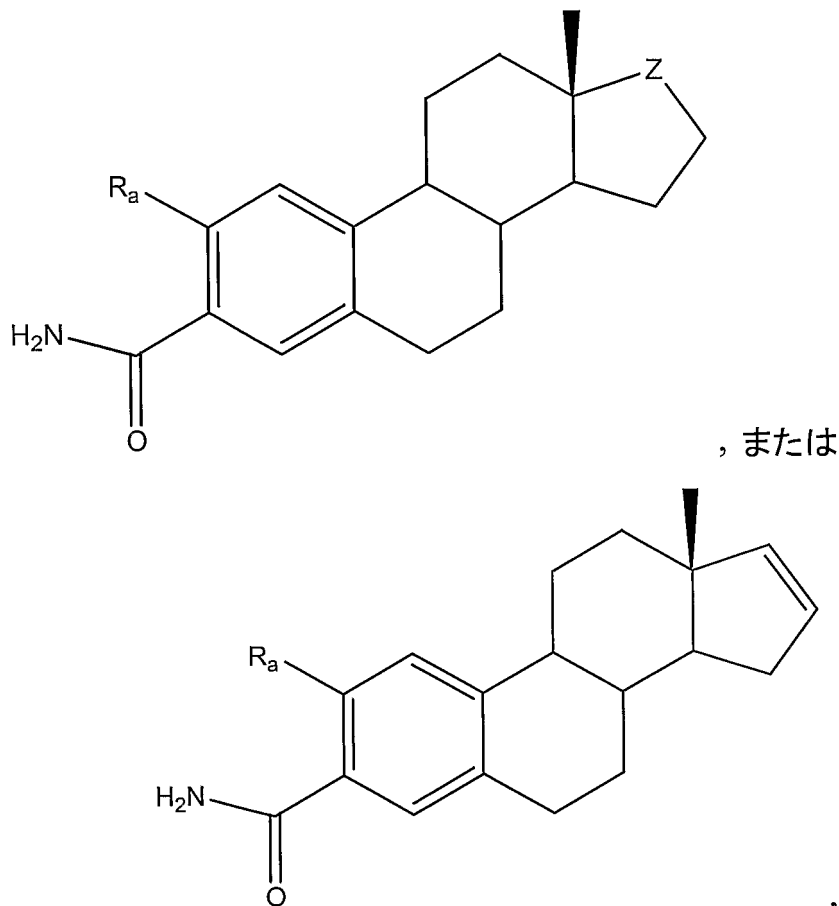
【請求項 4 7】

前記眼状態が、眼血管新生疾患、糖尿病性網膜症、未熟児網膜症、黄斑変性、角膜移植拒絶反応、血管新生緑内障、水晶体後線維増殖症、流行性角結膜炎、コンタクトレンズ過剰着用、アトピー性角膜炎、上輪部角膜炎、翼状片乾性角膜炎、近視、慢性網膜剥離、視神経乳頭小窩、テリエン辺縁変性、過粘稠度症候群、慢性ブドウ膜炎、慢性硝子体炎、推定眼ヒストプラスマ症、網膜炎、脈絡膜炎、増殖性硝子体網膜症、強膜炎、イールズ病、ベスト病、トラコーマまたはレーザー後合併症である、請求項 4 6に記載の方法。

【請求項 4 8】

式：

【化 1 9】



[式中、 R_a は、 $-OCH$ 、 $-OCH_2CH_3$ 又は $-CCCH_3$ から選択され；及び Z は、 $>C(H)-OH$ 、 $>C(H)-O-$ アルキル、 $>C(H)-O-$ スルファメートから選択され、前記アルキルは、1 - 10個の炭素を含む線状、分岐及び/又は環状炭化水素鎖である。]

を有する化合物の有効な炎症性又は免疫介在性疾患治療量を、動物（ヒトを除く）に投与することを含む、動物（ヒトを除く）において炎症性又は免疫介在性疾患を治療する方法。

【請求項 4 9】

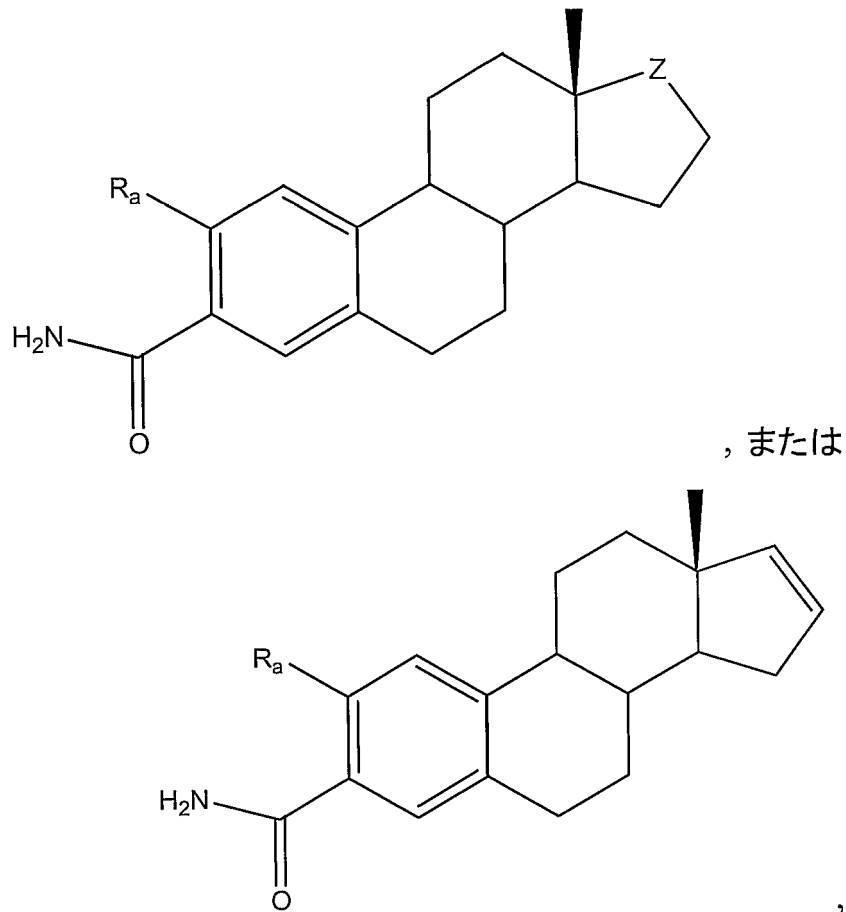
前記炎症性又は免疫介在性疾患が、慢性関節リウマチ、変形性関節症、潰瘍性大腸炎、クローン病、モーレン潰瘍、関節炎、サルコイドーシス、炎症性又は免疫介在性腸疾患、

全身性狼瘡、ヴェーゲナー症候群、スティーブンス - ジョンソン病、ベーチェット病、類天疱瘡、ライム病、喘息または後天性免疫不全症候群である、請求項 4 8に記載の方法。

【請求項 5 0】

式：

【化 2 0】



[式中、R_aは、-OCH₃、-OCH₂CH₃又は-CCCH₃から選択され；及びZは、>C(H)-OH、>C(H)-O-アルキル、>C(H)-O-スルファメートから選択され、前記アルキルは、1 - 10個の炭素を含む線状、分岐及び/又は環状炭化水素鎖である。]

を有する化合物の有効な感染症治療量を、動物（ヒトを除く）に投与することを含む、動物（ヒトを除く）において感染症を治療する方法。

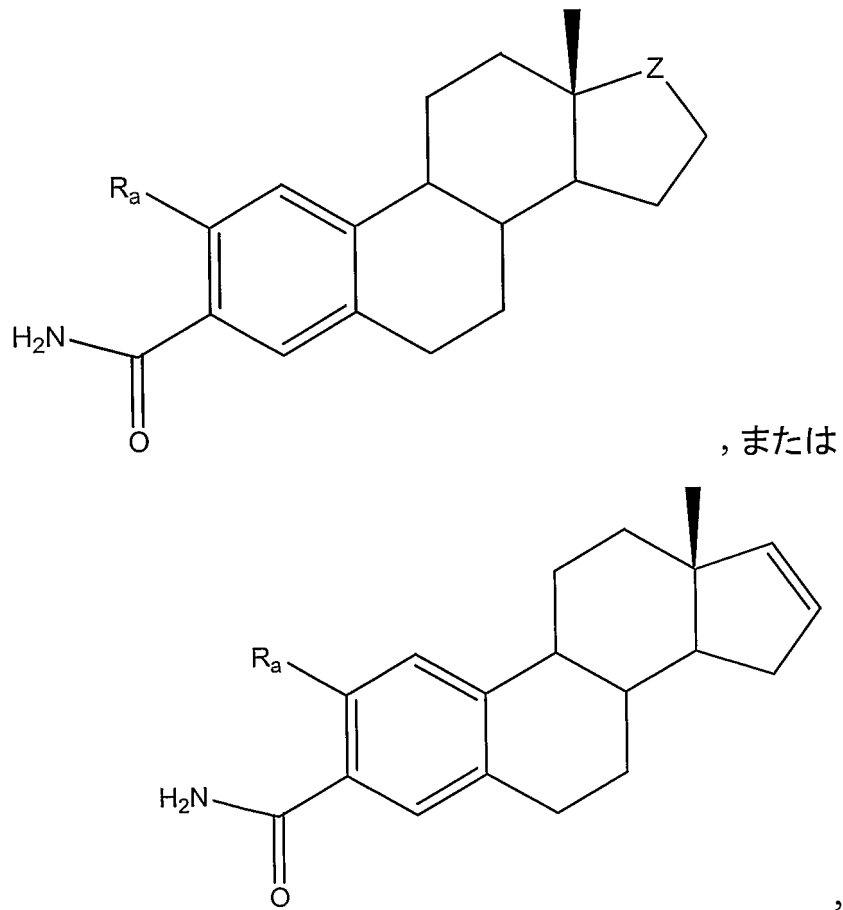
【請求項 5 1】

前記感染症が、梅毒、細菌感染、マイコバクテリア感染、細菌性潰瘍、真菌性潰瘍、単純疱疹感染、帯状疱疹感染、原生動物感染、バルトネラ感染症又は、トキソプラズマ症である、請求項 5 0に記載の方法。

【請求項 5 2】

式：

【化 2 1】



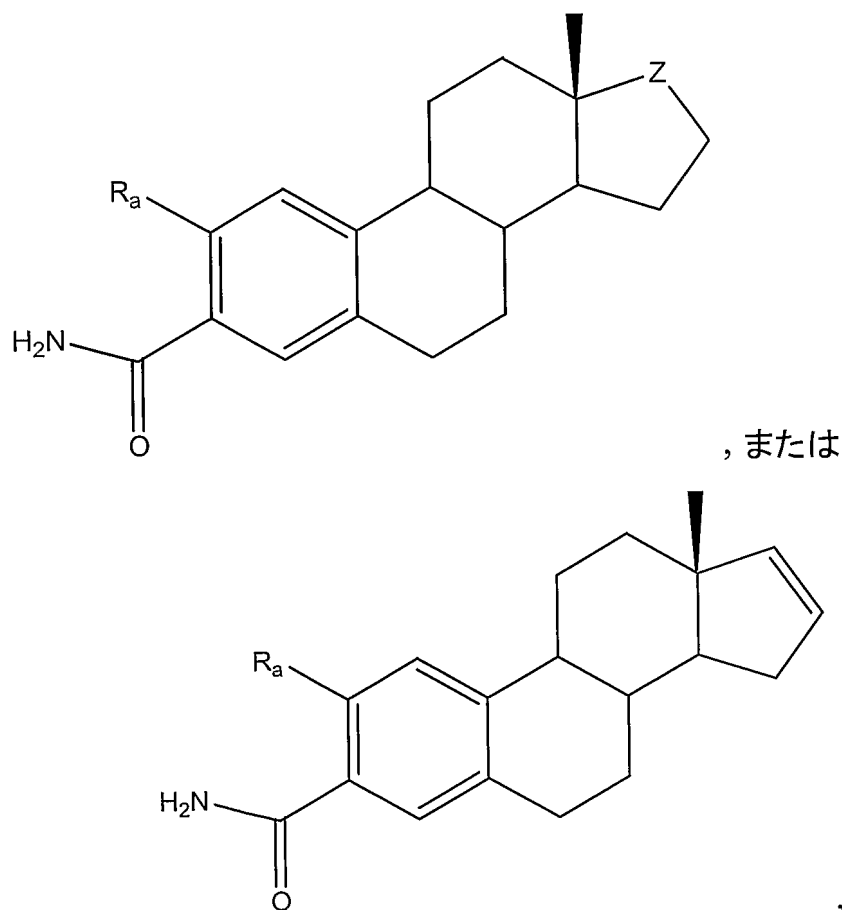
[式中、 R_a は、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 又は $-CCCH_3$ から選択され；及び Z は、 $>C(H)-OH$ 、 $>C(H)-O-$ アルキル、 $>C(H)-O-$ スルファメートから選択され、前記アルキルは、1 - 10個の炭素を含む線状、分岐及び/又は環状炭化水素鎖である。]

を有する化合物の有効な癌性疾患治療量を、動物（ヒトを除く）に投与することを含み、前記癌性疾患が、横紋筋肉腫、網膜芽細胞腫、ユーイング肉腫、神経芽細胞腫、骨肉腫、聴神経腫、神経線維腫又は血管腫である、動物（ヒトを除く）において癌性疾患を治療する方法。

【請求項 53】

式：

【化 2 2】



[式中、 R_a は、 $-\text{OCH}_3$ 、 $-\text{OCH}_2\text{CH}_3$ 又は $-\text{CCCH}_3$ から選択され；及び Z は、 $>\text{C}(\text{H})-\text{OH}$ 、 $>\text{C}(\text{H})-\text{O}-$ アルキル、 $>\text{C}(\text{H})-\text{O}-$ スルファメートから選択され、前記アルキルは、1 - 10個の炭素を含む線状、分岐及び/又は環状炭化水素鎖である。]

を有する化合物の有効な血液又は血管疾患治療量を、動物（ヒトを除く）に投与することを含む、動物（ヒトを除く）において血液又は血管疾患または状態を治療する方法。

【請求項 5 4】

前記血液又は血管疾患または状態が、静脈閉塞、動脈閉塞、頸動脈閉塞性疾患、多発性動脈炎、アテローム性動脈硬化症、オースラー・ウェーバー・ランデュ病、鎌状赤血球貧血、白血病、骨髓の急性又は慢性腫瘍性疾患、血管腫、遺伝性出血性毛細血管拡張症、骨髓の疾患、貧血、再狭窄、血液凝固障害、あるいはリンパ節、肝臓又は脾臓の腫脹である、請求項 5 3に記載の方法。

【請求項 5 5】

前記骨髓の急性又は慢性腫瘍性疾患が多発性骨髓腫である、請求項 5 4に記載の方法。

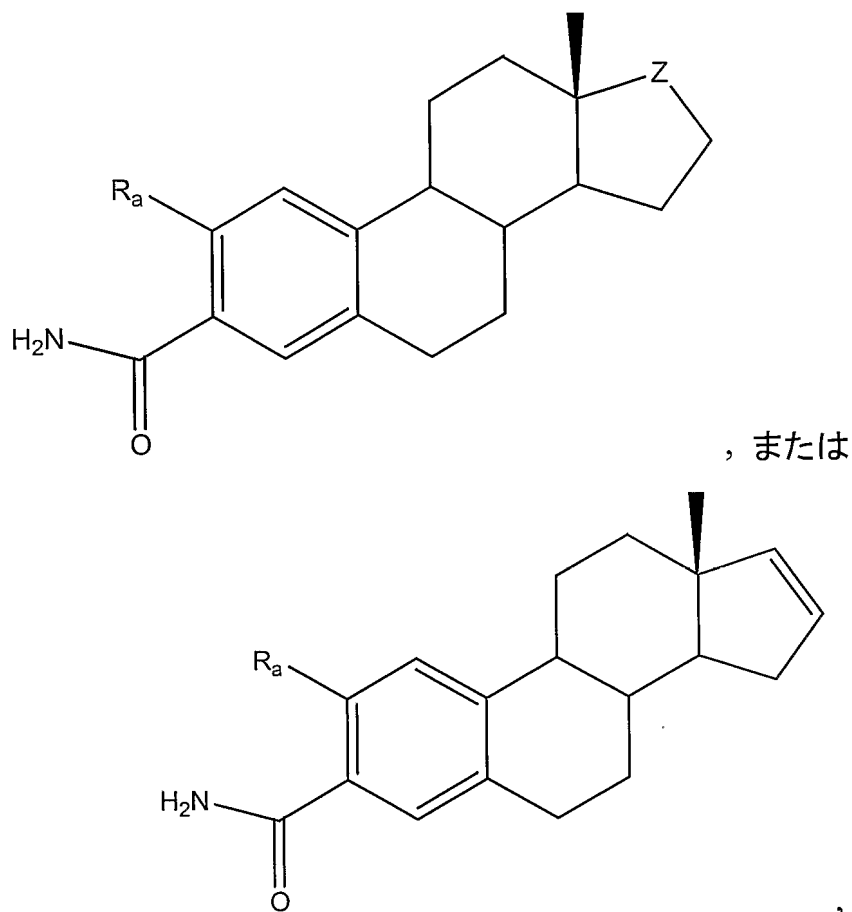
【請求項 5 6】

前記骨髓の急性又は慢性腫瘍性疾患が骨髓形成異常症候群である、請求項 5 4に記載の方法。

【請求項 5 7】

式：

【化 2 3】



[式中、 R_a は、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 又は $-CCCH_3$ から選択され；及び Z は、 $>C(H)-OH$ 、 $>C(H)-O-$ アルキル、 $>C(H)-O-$ スルファメートから選択され、前記アルキルは、1 - 10個の炭素を含む線状、分岐及び/又は環状炭化水素鎖である。]

を有する化合物の有効な皮膚状態治療量を、動物（ヒトを除く）に投与することを含む、動物（ヒトを除く）において皮膚状態を治療する方法。

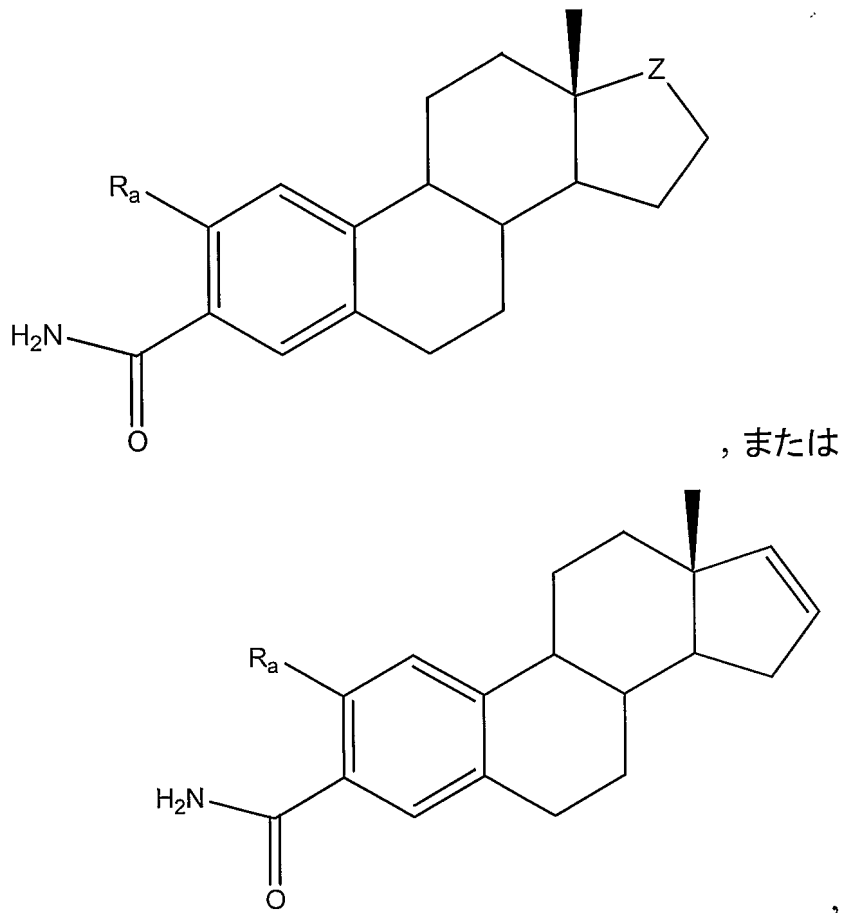
【請求項 5 8】

前記皮膚状態が、異常創傷治癒、しゅさ性座総瘡、皮膚の化学的熱傷、又は乾癬である、請求項 5 7に記載の方法。

【請求項 5 9】

式：

【化 2 4】



[式中、 R_a は、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 又は $-CCCH_3$ から選択され；及び Z は、 $>C(H)-OH$ 、 $>C(H)-O-$ アルキル、 $>C(H)-O-$ スルファメートから選択され、前記アルキルは、1 - 10個の炭素を含む線状、分岐及び/又は環状炭化水素鎖である。]

を有する化合物の有効な血管新生依存性腫瘍治療量を、動物（ヒトを除く）に投与することを含む、動物（ヒトを除く）において血管新生依存性腫瘍を治療する方法。

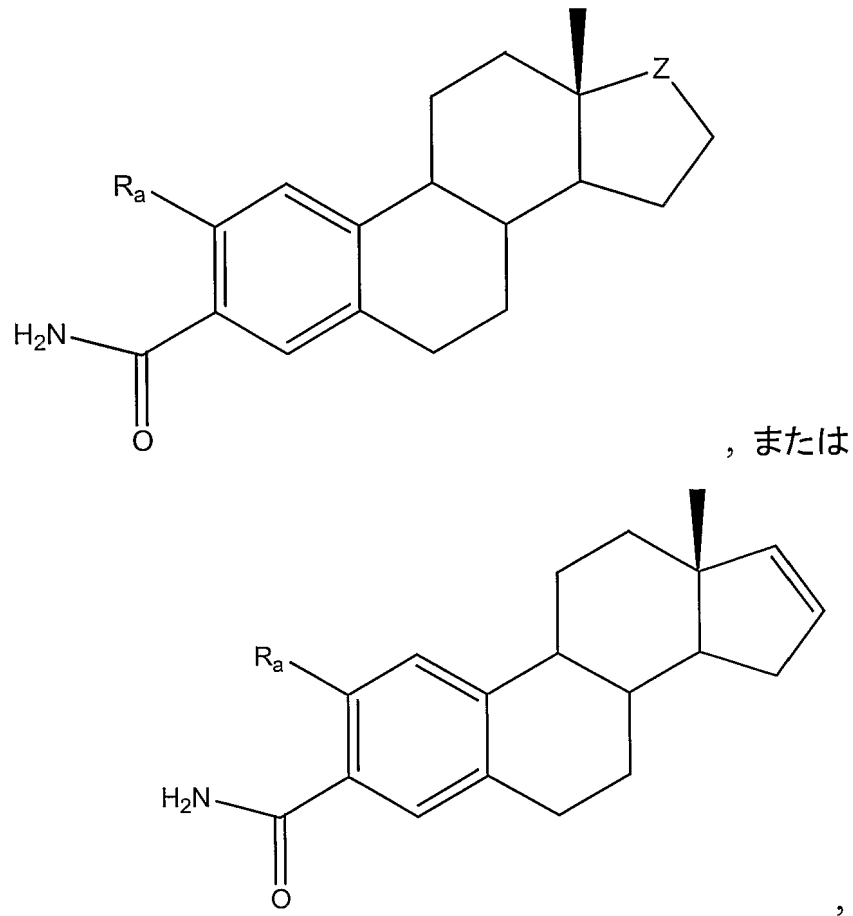
【請求項 60】

前記腫瘍が、血液由来腫瘍、固形腫瘍、良性腫瘍、又は癌性腫瘍である、請求項 59に記載の方法。

【請求項 61】

式：

【化 2 5】



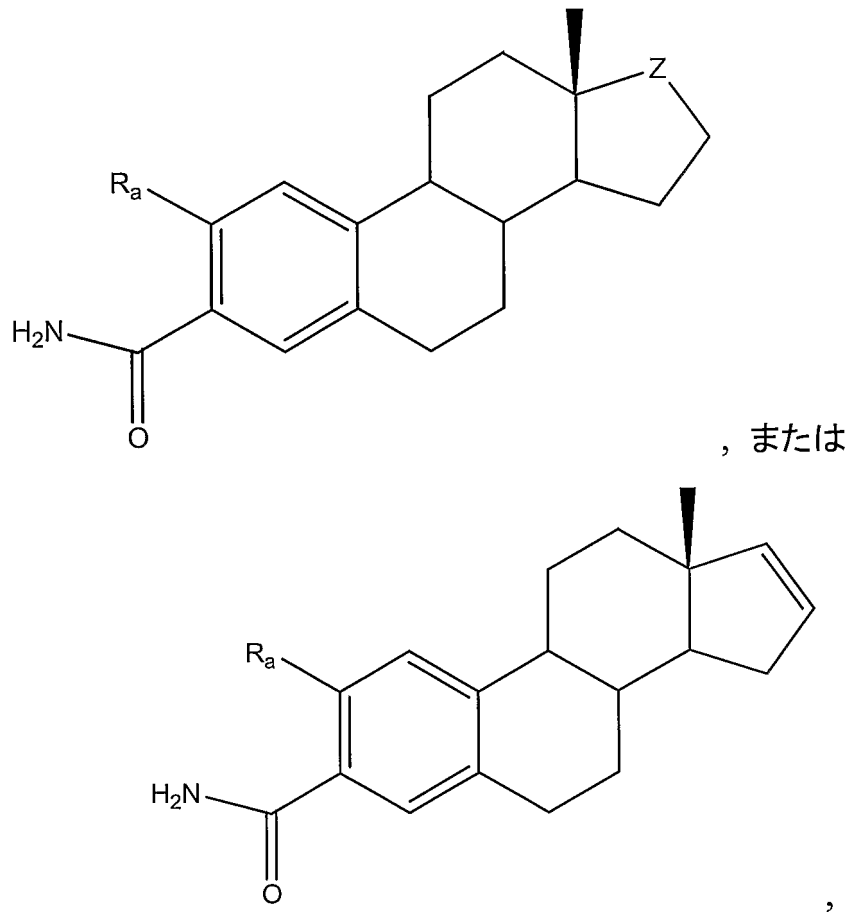
[式中、 R_a は、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 又は $-CCCH_3$ から選択され；及び Z は、 $>C(H)-OH$ 、 $>C(H)-O-$ アルキル、 $>C(H)-O-$ スルファメートから選択され、前記アルキルは、1 - 10個の炭素を含む線状、分岐及び/又は環状炭化水素鎖である。]

を有する化合物の有効な子宮内膜症治療量を、動物（ヒトを除く）に投与することを含む、動物（ヒトを除く）において子宮内膜症を治療する方法。

【請求項 6 2】

式：

【化 2 6】



[式中、 R_a は、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 又は $-CCCH_3$ から選択され；及び Z は、 $>C(H)-OH$ 、 $>C(H)-O-$ アルキル、 $>C(H)-O-$ スルファメートから選択され、前記アルキルは、1 - 10個の炭素を含む線状、分岐及び/又は環状炭化水素鎖である。]

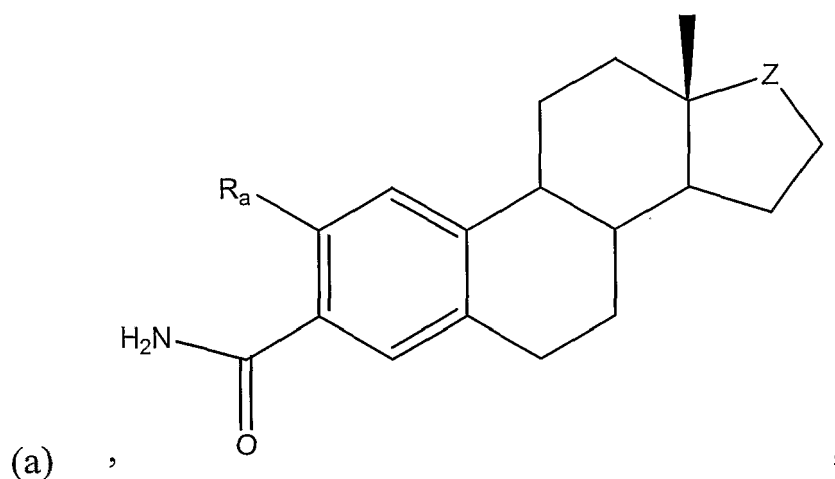
を有する化合物を雌性動物（ヒト女性を除く）に投与することを含む方法であって、前記化合物を、排卵をブロックする、胞胚の着床をブロックする又は月経をブロックする（無月経を含む）ために有効な量で投与する方法。

【請求項 63】

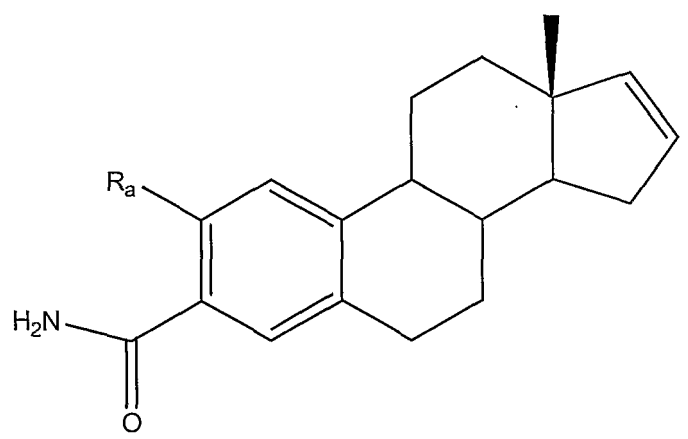
(a)

式：

【化 2 7】



または



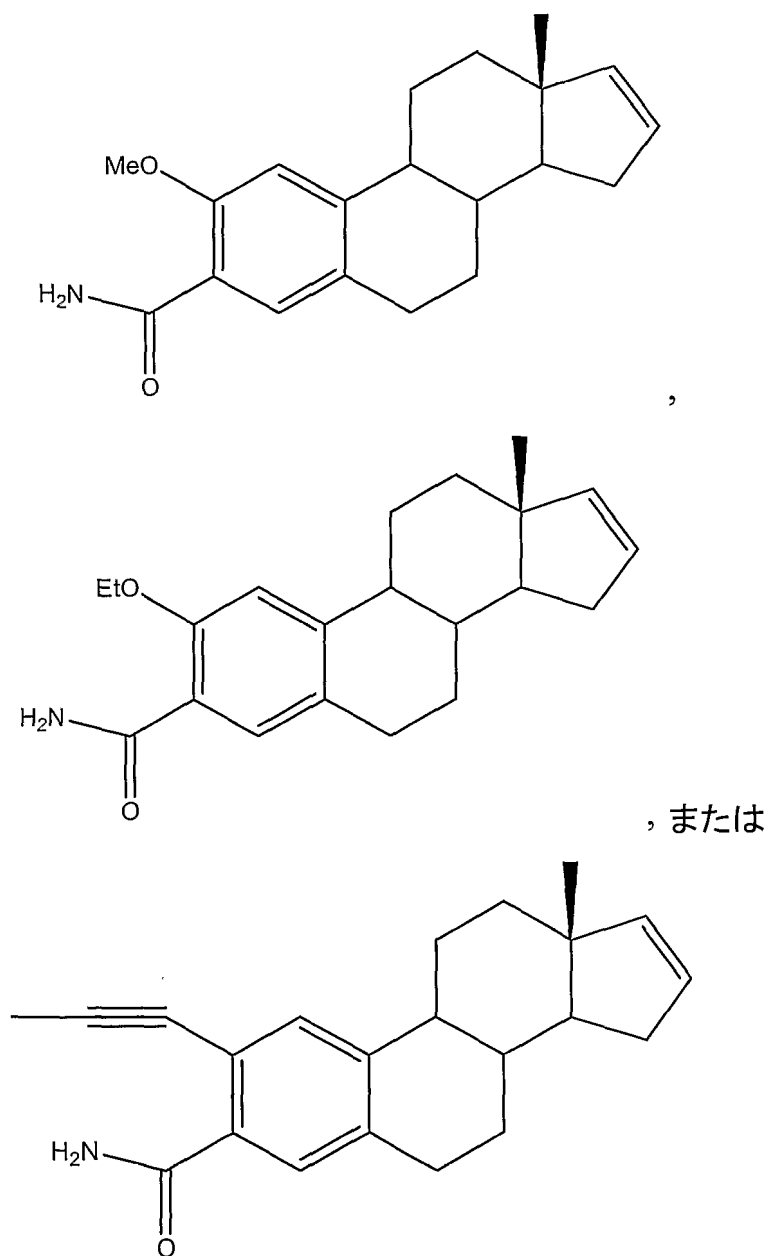
[式中、 R_a は、 $-OCH_3$ 、 $-OCH_2CH_3$ 又は $-CCCH_3$ から選択され；及び Z は、 $>C(H)-OH$ 、 $>C(H)-O-$ アルキル、 $>C(H)-O-$ スルファメートから選択され、前記アルキルは、1 - 10個の炭素を含む線状、分岐及び/又は環状炭化水素鎖である。]、および

(b) 製薬上許容される担体、賦形剤または希釈剤を含有する医薬製剤。

【請求項 6 4】

前記化合物が、

【化 2 8】



である、請求項 6 3 に記載の医薬製剤。