

【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 5 月 7 日 (2009.5.7)

【公表番号】特表 2008-536918 (P2008-536918A)

【公表日】平成 20 年 9 月 11 日 (2008.9.11)

【年通号数】公開・登録公報 2008-036

【出願番号】特願 2008-507677 (P2008-507677)

【国際特許分類】

C 07D 213/89 (2006.01)

A 61K 31/455 (2006.01)

A 61K 45/00 (2006.01)

A 61P 43/00 (2006.01)

A 61P 7/02 (2006.01)

A 61P 9/10 (2006.01)

A 61P 9/08 (2006.01)

A 61P 11/00 (2006.01)

A 61P 19/02 (2006.01)

A 61P 17/02 (2006.01)

A 61P 25/16 (2006.01)

A 61P 25/28 (2006.01)

A 61P 27/02 (2006.01)

A 61P 31/04 (2006.01)

A 61L 33/00 (2006.01)

A 61K 51/00 (2006.01)

C 07D 215/60 (2006.01)

C 07D 241/10 (2006.01)

C 07D 239/24 (2006.01)

【F I】

C 07D 213/89 C S P

A 61K 31/455

A 61K 45/00

A 61P 43/00 1 1 1

A 61P 7/02

A 61P 9/10

A 61P 9/08

A 61P 9/10 1 0 3

A 61P 11/00

A 61P 19/02

A 61P 17/02

A 61P 25/16

A 61P 25/28

A 61P 27/02

A 61P 31/04

A 61L 33/00 Z

A 61K 49/02 A

C 07D 215/60

C 07D 241/10

C 07D 239/24

【手続補正書】

【提出日】平成21年3月19日(2009.3.19)

【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 I

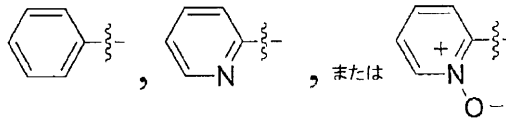
【化 1】



[式中、

X は、

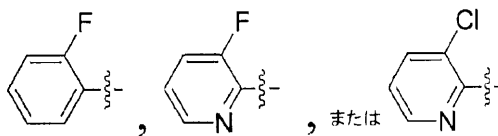
【化 2】



であり、そして

Y は、

【化 3】



である]

で表される化合物またはこれの製薬学的に許容され得る塩。

【請求項 2】

請求項 1 記載の化合物または製薬学的に許容され得る担体を含んで成る製薬学的組成物。

【請求項 3】

更に抗凝血薬、抗血小板薬または血栓溶解薬の中の少なくとも 1 種も含んで成る請求項 2 記載の製薬学的組成物。

【請求項 4】

化合物が約 0.1 から約 500 mg の範囲の量で存在する請求項 2 記載の製薬学的組成物。

【請求項 5】

請求項 1 記載の化合物を有効成分として含んでなる、深部静脈血栓症、播種性血管内凝血障害、眼内フィブリン形成、心筋梗塞、脳梗塞、または血栓溶解治療または経皮経管冠動脈形成術のいずれかの結果としてもたらされる血栓形成の予防または治療を必要としている哺乳動物における該血栓形成の予防または治療用製薬学的製剤。

【請求項 6】

請求項 1 記載の化合物を有効成分として含んでなる、冠動脈血管形成術、冠動脈バイパス術または人工関節置換手術を受ける前または後のヒトの処置用製薬学的製剤。

【請求項 7】

請求項 1 記載の化合物を有効成分として含んでなる、哺乳動物におけるトロンビン生成または作用のいずれかが関与する異常な静脈もしくは動脈血栓で特徴づけられる症状を治療または予防するための製薬学的製剤。

【請求項 8】

請求項 1 記載の化合物を有効成分として含んでなる、哺乳動物における血小板凝集物の生成を抑制するか、フィブリンの生成を抑制するか、血栓の形成を抑制するか或は塞栓の形成を抑制するための製薬学的製剤。

【請求項 9】

血液採取、血液貯蔵または血液循環で用いるに適した医学デバイスであって、請求項 1 記載の化合物が埋め込まれているか或は物理的に結合している医学デバイス。

【請求項 10】

カテーテル、ステント、血液透析機、血液採取用シリンジまたは管または血液ラインである医学デバイスであって、請求項 1 記載の化合物が埋め込まれているか或は物理的に結合している医学デバイス。

【請求項 11】

請求項 1 記載の化合物を有効成分として含んでなる、哺乳動物における不安定狭心症、再狭窄、成人呼吸窮迫症候群、内毒素性ショックまたは化学療法中の凝固性亢進を治療するための製薬学的製剤。

【請求項 12】

請求項 1 記載の化合物を有効成分として含んでなる、ヒトにおけるパーキンソン病またはアルツハイマー病を治療するための製薬学的製剤。

【請求項 13】

放射線同位体と連結した状態にある請求項 1 記載の化合物を有効成分として含んでなる、哺乳動物における生体内血栓映像化用製剤。

【請求項 14】

ピリジン N - オキサイドを合成する方法であって、ピリジンと過炭酸ナトリウムと無水トリフルオロメタンスルホン酸を各々が約半当量から各々が約 10 当量の量で温度が約 - 50 から約 40 の溶媒中で反応させることを含んで成る方法。

【請求項 15】

温度を - 10 から 10 の範囲にする請求項 14 記載の方法。

【請求項 16】

ピリミジンの N - オキサイドを合成する方法であって、ピリミジンと過炭酸ナトリウムと無水トリフルオロメタンスルホン酸を各々が約半当量から各々が約 10 当量の量で温度が約 - 50 から約 40 の溶媒中で反応させることを含んで成る方法。

【請求項 17】

キノリン N - オキサイドを合成する方法であって、キノリンと過炭酸ナトリウムと無水トリフルオロメタンスルホン酸を各々が約半当量から各々が約 10 当量の量で温度が約 - 50 から約 40 の溶媒中で反応させることを含んで成る方法。

【請求項 18】

ピラジン N - オキサイドを合成する方法であって、ピラジンと過炭酸ナトリウムと無水トリフルオロメタンスルホン酸を各々が約半当量から各々が約 10 当量の量で温度が約 - 50 から約 40 の溶媒中で反応させることを含んで成る方法。

【請求項 19】

出発ピラジン材料の 2 位が電子求引基で置換されておりかつ 5 位がメチル基で置換されている請求項 18 記載の方法。

【請求項 20】

電子求引基が -CONH₂である請求項 1 9 記載の方法。

【請求項 2 1】

ピリジンと過酸化水素尿素と無水トリフルオロメタンスルホン酸を各々が約半当量から各々が約 1 0 当量の量で温度が約 - 5 0 から約 4 0 の溶媒中で反応させることを含んで成るピリジン N - オキサイドの合成方法。

【請求項 2 2】

温度を - 1 0 から 1 0 の範囲にする請求項 2 1 記載の方法。

【請求項 2 3】

ピリミジンと過酸化水素尿素と無水トリフルオロメタンスルホン酸を各々が約半当量から各々が約 1 0 当量の量で温度が約 - 5 0 から約 4 0 の溶媒中で反応させることを含んで成るピリミジン N - オキサイドの合成方法。

【請求項 2 4】

キノリンと過酸化水素尿素と無水トリフルオロメタンスルホン酸を各々が約半当量から各々が約 1 0 当量の量で温度が約 - 5 0 から約 4 0 の溶媒中で反応させることを含んで成るキノリン N - オキサイドの合成方法。

【請求項 2 5】

ピラジンと過酸化水素尿素と無水トリフルオロメタンスルホン酸を各々が約半当量から各々が約 1 0 当量の量で温度が約 - 5 0 から約 4 0 の溶媒中で反応させることを含んで成るピラジン N - オキサイドの合成方法。

【請求項 2 6】

出発ピラジン材料の 2 位が電子求引基で置換されておりかつ 5 位がメチル基で置換されている請求項 2 5 記載の方法。

【請求項 2 7】

電子求引基が -CONH₂である請求項 2 6 記載の方法。

【請求項 2 8】

2 - [3 - シアノ - 6 - (2 , 2 - ジフルオロ - 2 - ピリジン - 2 - イル - エチルアミノ) - 5 - フルオロ - 1 - オキシ - ピリジン - 2 - イル] - N - (3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イルメチル) - アセトアミドである化合物およびこれの製薬学的に許容され得る塩。