

【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9月10日 (2009.9.10)

【公表番号】特表2009-502961 (P2009-502961A)

【公表日】平成21年1月29日 (2009.1.29)

【年通号数】公開・登録公報2009-004

【出願番号】特願2008-524206 (P2008-524206)

【国際特許分類】

C 07 D 471/14 (2006.01)

A 61 K 31/4985 (2006.01)

A 61 K 45/00 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 15/10 (2006.01)

A 61 P 15/00 (2006.01)

A 61 P 9/04 (2006.01)

A 61 P 9/12 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 13/12 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

A 61 P 13/08 (2006.01)

A 61 P 15/06 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 P 11/06 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 7/00 (2006.01)

A 61 P 19/10 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 25/04 (2006.01)

【F I】

C 07 D 471/14 1 0 2

C 07 D 471/14 C S P

A 61 K 31/4985

A 61 K 45/00

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 15/10

A 61 P 15/00

A 61 P 9/04

A 61 P 9/12

A 61 P 9/10

A 61 P 13/12

A 61 P 9/00

A 61 P 13/08

A 61 P 15/06

A 61 P 1/04

A 61 P 11/06

A 61 P 29/00

A 61 P 7/00

A 61 P 19/10

A 61 P 3/10

A 6 1 P 25/04

【手続補正書】

【提出日】平成21年7月27日(2009.7.27)

【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

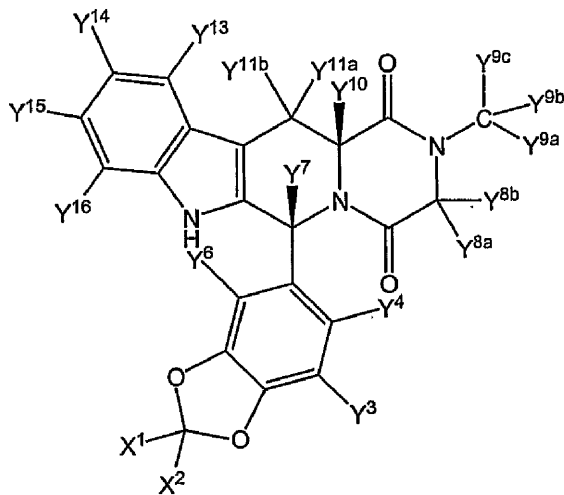
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I I の単離された化合物：

【化 1】



I I

(式中、 $X^1$  及び  $X^2$  は同時にフルオロであり、又は  $X^1$  は重水素であり、 $X^2$  は水素若しくは重水素から選択され、各 Y は独立して重水素又は水素から選択され、

前記化合物は以下：

a)  $Y^4$ 、

b)  $Y^7$ 、

c) 同時に  $Y^{8a}$  及び  $Y^{8b}$ 、又は

d) 同時に  $Y^{9a}$ 、 $Y^{9b}$  及び  $Y^{9c}$  の 1 箇所以上が重水素置換されている。)

又はプロドラッグ、又はそのプロドラッグの塩、又はその水和物、溶媒和物、又は多形体

。

【請求項 2】

$X^1$  及び  $X^2$  は同時に重水素である、請求項 1 に記載の化合物又はプロドラッグ、又はそのプロドラッグの塩、又はその水和物、溶媒和物、又は多形体。

【請求項 3】

重水素で置換されない水素原子すべては、天然の同位元素の存在度にて存在する、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

有効量の請求項 1 に記載の化合物、又はプロドラッグ、又はプロドラッグの塩、又はその水和物、溶媒和物又は多形体、及び薬学上許容可能なキャリアを含む組成物。

【請求項 5】

勃起不全、安定、不安定及び異型の狭心症、高血圧症、肺高血圧症、慢性閉塞性肺疾患、急性呼吸窮迫症候群、悪性高血圧症、褐色細胞腫、鬱血性心不全、急性腎不全、慢性腎不全、アテローム性硬化症、血管の開放性が低下した状態、末梢血管疾患、血管障害、血

小板血症、炎症性疾患、心筋梗塞、卒中、気管支炎、慢性喘息、アレルギー性喘息、アレルギー性鼻炎、緑内障、消化性潰瘍、消化管運動性障害、経皮経管冠動脈又は頸動脈血管形成後、バイパス手術後の移植狭窄、骨粗鬆症、早産陣痛、良性の前立腺肥大、及び刺激性腸症候群、男性のヒト及び動物における勃起不全、並びに女性における女性性的興奮障害、卵子との受精を促進するための精子数の減少、インスリン耐性の低下、濾胞の増殖の刺激から選ばれる疾患又は障害に罹っている又はそれに感受性である対象の治療に用いられる請求項 1 に記載の化合物、又はプロドラッグ、又はプロドラッグの塩、又はその水和物、溶媒和物又は多形体を含有する剤。

【請求項 6】

線維症を含む症状の予防又は治療に用いられる請求項 1 に記載の化合物、又はプロドラッグ、又はプロドラッグの塩、又はその水和物、溶媒和物又は多形体を含有する剤。

【請求項 7】

脊髄損傷を負っている患者における疼痛又は痙縮の緩和に用いられる請求項 1 に記載の化合物、又はプロドラッグ、又はプロドラッグの塩、又はその水和物、溶媒和物又は多形体を含有する剤。

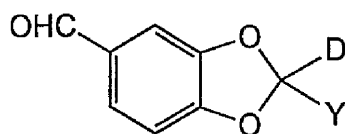
【請求項 8】

勃起不全の緩和又は予防に用いられる、請求項 5 に記載の剤。

【請求項 9】

式 X I I I a の化合物

【化 2】



X I I I a

(式中、D は重水素であり、Y は重水素であり、各水素原子は任意に重水素によって置換えられる。)。

【請求項 10】

重水素で置換されない水素原子すべて及び炭素原子すべては、天然の同位元素の存在度にて存在する、請求項 9 に記載の化合物。