

【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19年1月18日(2007.1.18)

【公表番号】特表2002-530388(P2002-530388A)

【公表日】平成14年9月17日(2002.9.17)

【出願番号】特願2000-583878(P2000-583878)

【国際特許分類】

C 0 7 D 215/20 (2006.01)

A 6 1 K 31/47 (2006.01)

A 6 1 K 31/498 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 241/44 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 215/20

A 6 1 K 31/47

A 6 1 K 31/498

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 241/44

【手続補正書】

【提出日】平成18年11月21日(2006.11.21)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

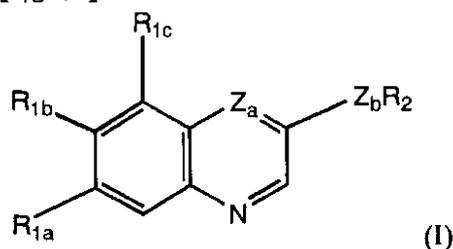
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 ポリマーコーティングを含むステント装置において、該ポリマーコーティングが式Iの化合物を含むことを特徴とするステント装置。

【化1】



式中、

R_{1a} は任意に置換されたアルキル、ヒドロキシ、アシルオキシ、任意に置換されたアルコキシ、任意に置換されたシクロアルキルオキシ、任意に置換されたオキサヘテロシクリルオキシ、任意に置換されたヘテロシクリルカルボニルオキシまたはハロゲン；

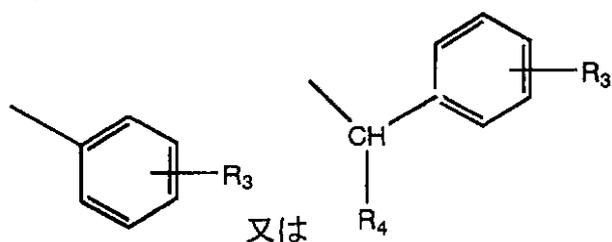
R_{1b} は水素、任意に置換されたアルキル、ヒドロキシ、アシルオキシ、任意に置換されたアルコキシ、任意に置換されたシクロアルキルオキシ、任意に置換されたオキサヘテロ

シクリルオキシ、任意に置換されたヘテロシクリルカルボニルオキシまたはハロゲン；

R_{1c} は水素、任意に置換されたアルキル、任意に置換されたアリアル、任意に置換されたヘテロアリアル、ヒドロキシ、アシルオキシ、任意に置換されたアルコキシ、任意に置換されたシクロアルキルオキシ、任意に置換されたヘテロシクリルオキシ、任意に置換されたアリアルオキシ、任意に置換されたヘテロアリアルオキシ、任意に置換されたヘテロシクリルカルボニルオキシ、ハロゲン、シアノ、 R_5R_6N -またはアシル R_5N -；

R_2 は

【化2】



であり、

R_3 は水素、またはオルト若しくはパラフルオロ、またはメタ低級アルキル、低級アルコキシ、ハロゲンまたはカルバモイル；

R_4 は水素または低級アルキル；

R_5 および R_6 は独立に水素またはアルキル、または R_5 および R_6 は、 R_5 および R_6 が結合している窒素原子と共に、アザヘテロシクリルを形成する；

Z_a はNまたはCH；および

Z_b はNHまたはO、または

これらのN-オキシド、水和物、溶媒和物、プロドラッグ、または塩。

但し、 R_{1a} および R_{1b} は同時に任意に置換されたアルキルを表さない。

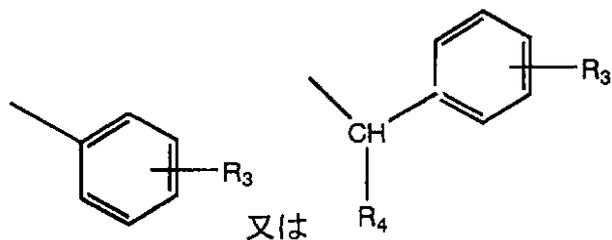
【請求項2】 R_{1a} が、メトキシ、エトキシ、2-(エトキシ)エトキシ、2-(4-モルホリニル)エトキシまたはフラニルオキシであり、

R_{1b} が、メトキシまたはエトキシであり、

R_{1c} が、水素、メトキシまたはエトキシであり、

R_2 が、

【化3】



であり、

R_3 が、水素、オルトまたはパラフルオロ、メタメチル、トリフルオロメチル、メトキシ、フルオロ、クロロ、プロモまたはカルバモイルであり、

R_4 が、水素またはメチルである、請求項1記載のステント装置。

【請求項3】 Z_a が、Nである、請求項1記載のステント装置。

【請求項 4】 Z_a が、CHである、請求項 1 記載のステント装置。

【請求項 5】 Z_b が、NHである、請求項 1 記載のステント装置。

【請求項 6】 Z_b が、0である、請求項 1 記載のステント装置。

【請求項 7】 式 I の化合物が、下記の種から選択される、請求項 1 記載のステント装置。

2-アニリノ-6-キノキサリノール；

2-((R)- -メチルベンジル-アミノ)-6,7-ジエトキシキノキサリン；

2-アニリノ-6-イソプロポキシキノキサリン；

2-フェノキシ-6-メトキシキノキサリン；

(3-プロモベンジル)-(6,7-ジメトキシキノキサリン-2-イル)-アミン；

2-(3-カルバモイルフェニルアミノ)-6-メトキシキノキサリン；

2-(2-フルオロフェニルアミノ)-6,7-ジエトキシキノキサリン；

2-(3-トリフルオロメチルフェニルアミノ)-6,7-ジエトキシキノキサリン；

フェニル-[6-(テトラヒドロフラン-3(R)-イルオキシ)キノキサリン-2-イル]アミン；

ベンジル-(6,7-ジメトキシキノキサリン-2-イル)-アミン；

2-((S)- -メチルベンジル-アミノ)-6,7-ジエトキシキノキサリン；

2-ベンジルアミノ-6,7-ジエトキシキノキサリン；

(6-メトキシキノキサリン-2-イル)-(3-メチルフェニル)-アミン；

6-メトキシ-2-フェニルアミノ-キノキサリン；

2-アニリノ-6-エトキシキノキサリン；

2-(3-メトキシフェニルアミノ)-6,7-ジエトキシキノキサリン；

2-(4-フルオロフェニルアミノ)-6,7-ジエトキシキノキサリン；

(6,7-ジメトキシキノキサリン-2-イル)-(3-フルオロフェニル)-アミン；

2-(3-フルオロフェニルアミノ)-6,7-ジエトキシキノキサリン；

(3-プロモフェニル)-(6,7-ジメトキシキノキサリン-2-イル)-アミン；

(6,7-ジメトキシキノキサリン-2-イル)-フェニル-アミン； および

(3-クロロフェニル)-(6,7-ジメトキシキノキサリン-2-イル)-アミン、

またはこれらのN-オキシド、水和物、溶媒和物、プロドラッグ、若しくは薬学的に許容される塩。

【請求項 8】 該ポリマーコーティングが、ポリカプロラクトン、ポリ(エチレン-コ-ビニルアセテート)、ポリ(ビニルアセテート)およびシリコーンゴムラバーからなる群から選ばれる少なくとも1種を含む、請求項 1 記載のステント装置。

【請求項 9】 該ポリマーコーティングが、ラテックス、ウレタン、ポリシロキサン、およびスチレン-エチレン/ブチレン-スチレンブロック共重合体からなる群から選ばれる少なくとも1種を含む、請求項 1 記載のステント装置。

【請求項 10】 該ポリマーコーティングが、ポリ-DL-乳酸、ポリ-L-乳酸、ポリオルトエステル、ポリイミノカーボネート、脂肪族ポリカーボネート、及びポリホスファゼンからなる群から選ばれる少なくとも1種を含む、請求項 1 記載のステント装置。

【請求項 11】 該ポリマーコーティングが、さらにポロシゲンを含む、請求項 1 記載のステント装置。

【請求項 12】 該ポロシゲンが、塩化ナトリウム、ラクトース、又はヘパリンナトリウムの微粒剤からなる群から選ばれる少なくとも1種である、請求項 11 記載のステント装置。

【請求項 13】 該ポロシゲンが、ポリエチレングリコールおよびポリエチレン酸化物/ポリプロピレン酸化物共重合体からなる群から選ばれる少なくとも1種である、請求項 11 記載のステント装置。

【請求項 14】 速度コントロールメンブランが、ポリマーコーティング上に適用され、式 I の化合物の該ポリマーコーティングからの放出速度を制限している、請求項 1 記載のステント装置。

【請求項 15】 速度コントロールメンブランが、塩化ナトリウム、ラクトース、へ

パリンナトリウム、ポリエチレングリコール、ポリエチレン酸化物/ポリプロピレン酸化物共重合体、およびこれらの混合物からなる群から選ばれる少なくとも1種のポロシゲンを含む、請求項1記載のステント装置。

【請求項16】 ステントデバイスの少なくとも1つの表面に式Iの化合物を適用して、生物活性層を形成し、次に、生物活性層の上に多孔性のポリマー材料の1以上のコーティングを適用することにより、該ポリマーコーティングに式Iの化合物が組み込まれている、請求項1記載のステント装置。

【請求項17】 多孔性のポリマー材料が、ポリアミド、パリレン又はパリレン誘導体を含む、請求項16記載のステント装置。

【請求項18】 多孔性のポリマー材料が、プラズマ蒸着によって付着されている、請求項16記載のステント装置。

【請求項19】 多孔性のポリマー材料が、ポリ(エチレン酸化物)、ポリ(エチレングリコール)、ポリ(プロピレン酸化物)及びメタン、シリコン、およびテトラフルオロエチレンテトラメチルジシロキサンからなる群から選ばれる、請求項18記載のステント装置。

【請求項20】 該ポリマーコーティングが、分子又はそれらの混合物当たり2つ以上のアクリレート又はメタクリレート基を含む、付加光重合性ポリエチレン性不飽和アクリル又はメタクリル酸エステル由来のものである、請求項1記載のステント装置。

【請求項21】 モノマーが、エチレングリコールジアクリレート、エチレングリコールジメタクリレート、トリメチロプロパントリアクリレート、トリメチロプロパントリメタクリレート、ペンタエリスリトールテトラアクリレート、ペンタエリスリトールテトラメタクリレート、1,6-ヘキサジオールジメチタクリレート及びジエチレングリコールジメタクリレートからなる群から選ばれる、請求項20記載のステント装置。

【請求項22】 モノマーが、n-ブチルアクリレート、n-ブチルメタクリレート、2-エチルヘキシルアクリレート、ラウリルアクリレート、及び2-ヒドロキシプロピルアクリレートからなる群から選ばれる、請求項20記載のステント装置。

【請求項23】 該ポリマーコーティングが、ポリ(L-乳酸)、ポリカプロラクトン、ポリ(ラクチド-コ-グリコリド)、ポリ(ヒドロキシブチレート)、ポリ(ヒドロキシブチレート-コ-バルレート)、ポリジオキサノン、ポリオルトエステル、ポリアンヒドリド、ポリ(グリコール酸)、ポリ(D,L-乳酸)、ポリ(グリコール酸-コトリメチレンカルボネート)、ポリホスホエステル、ポリホスホエステルウレタン、ポリ(アミノ酸)、シアノアクリレート、ポリ(トリメチレンカルボネート)、ポリ(イミノカルボネート)、コポリ(エーテル-エステル)、ポリアルキレンオキサレート、ポリホスファゼン、フィブリン、フィブリノーゲン、セルロース、スターチ、コラーゲンおよびヒアルロン酸からなる群から選ばれるポリマーを含む、請求項1記載のステント装置。

【請求項24】 該ポリマーコーティングが、ポリウレタン、シリコン、ポリエステル、ポリオレフィン、ポリイソブチレン、エチレン-アルファオレフィンコポリマー；アクリルポリマーおよびコポリマー、ハロゲン化ビニルポリマーおよびコポリマー；ポリビニルエーテル；ハロゲン化ポリビニリデン；ポリアクリロニトリル、ポリビニルケトン、ポリビニル芳香族、ポリビニルエステル；ビニルモノマーとビニルモノマーのコポリマー、ビニルモノマーとオレフィンのコポリマー、；ポリアミド；アルキルレジン、ポリカーボネート；ポリオキシメチレン；ポリイミド、ポリエーテル；エポキシレジン、ポリウレタン；レーヨン；レーヨン-トリアセテート；セルロース、セルロースアセテート、セルロースブチレート；セルロースアセテートブチレート；セロファン、硝酸セルロース；セルロースプロピオネート；セルロースエーテル；およびカルボキシメチルセルロースからなる群から選ばれるポリマーを含む、請求項1記載のステント装置。

【請求項25】 再狭窄防止用ステントの製造のための請求項1記載の式Iの化合物の使用であって、式Iの化合物が該ステントに適用されたポリマーコーティングに組み込まれている上記使用。

【請求項26】 該再狭窄が、血管形成術によるアテローム性動脈硬化症傷害の治療

によりつくられた動脈壁に対する物理的傷害部位にある請求項 2 5 記載の使用。