

【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 17 年 6 月 30 日 (2005.6.30)

【公表番号】特表 2002-537331 (P2002-537331A)

【公表日】平成 14 年 11 月 5 日 (2002.11.5)

【出願番号】特願 2000-600638 (P2000-600638)

【国際特許分類第 7 版】

C 07 C 233/11

A 61 K 31/165

A 61 P 7/00

A 61 P 43/00

【F I】

C 07 C 233/11

A 61 K 31/165

A 61 P 7/00

A 61 P 43/00 1 0 5

【手続補正書】

【提出日】平成 15 年 9 月 26 日 (2003.9.26)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

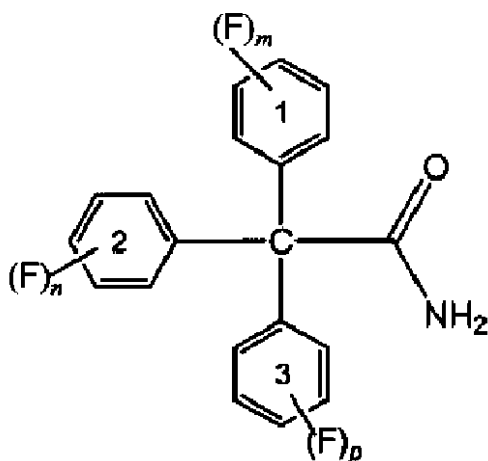
【補正の内容】

【発明の名称】ガルドスチャンネル拮抗物質

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

構造：



( I )

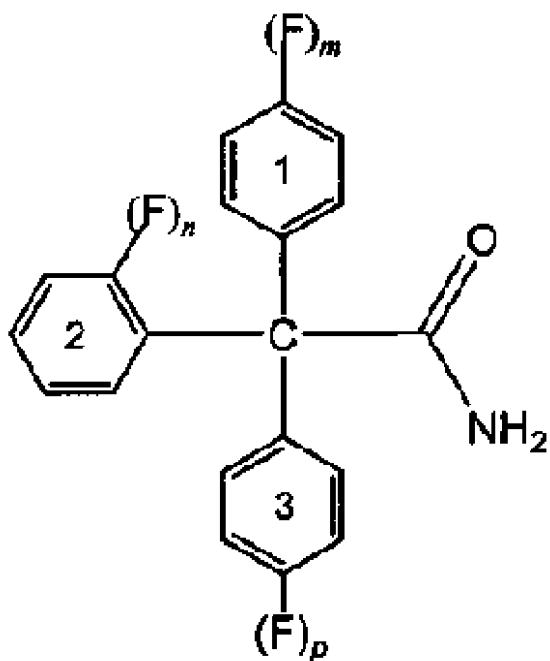
[ 式中、m、n 及び p は独立して 0 及び 1 から選択され、m、n 及び p の少なくとも 1 つが 1 であり、

m、n 及び p がすべて 1 であるときには、環 1 及び環 2 のフルオロ置換基は、アセトアミド置換基に対してオルト、アセトアミド置換基に対してメタ及びアセトアミド置換基に対してパラの中から独立して選択される位置に存在し、環 3 の置換基は、アセトアミド置換基に対してオルト及びアセトアミド置換基に対してパラから選択される位置にあり、そして

p が 0、m が 1 で n が 1 であるときには、環 1 のフルオロ置換基はアセトアミド置換基に対してパラであり、環 2 の置換基は、アセトアミド置換基に対してオルト及びアセトアミド置換基に対してパラから選択される位置にある ]  
を持つ化合物。

【請求項 2】

構造：



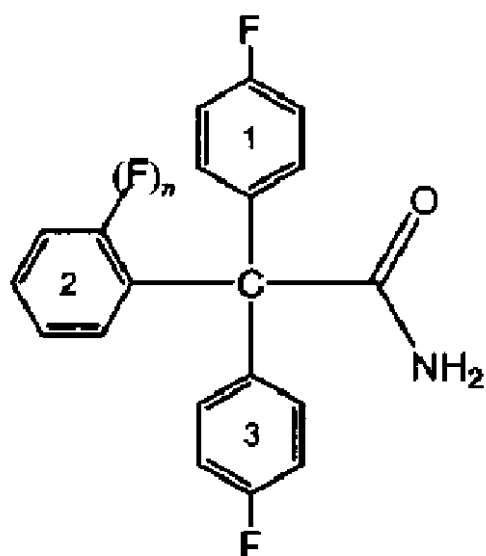
( II )

[ 式中、m、n 及び p は独立して 0 及び 1 から選択され、m、n 及び p の少なくとも 1 つが 1 である ]

を持つ、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

構造：

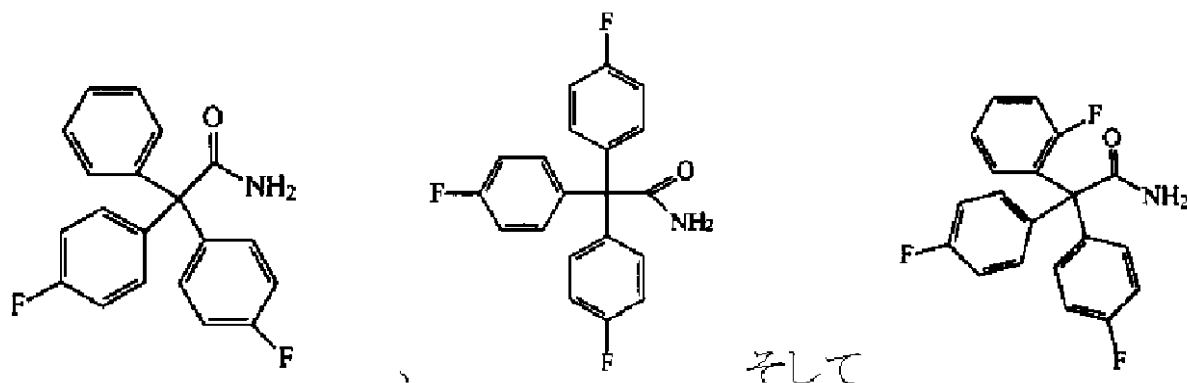


( III )

[ 式中、n は 0 若しくは 1 である ]

を持つ、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】



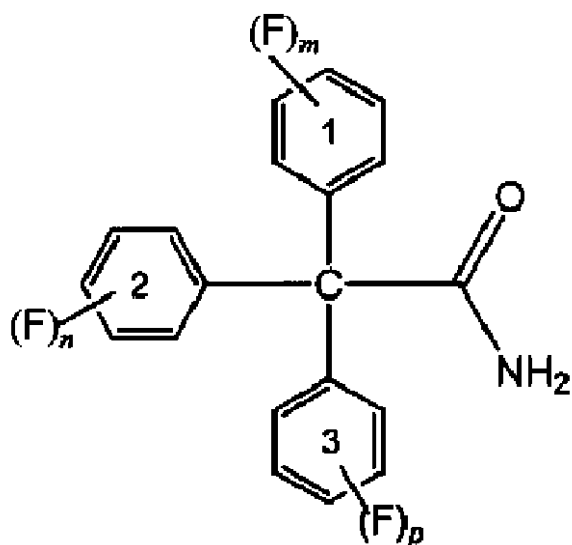
から選択される構造を持つ、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

請求項 1 の化学式 I で定義される化合物であって、前項までのいずれかの請求項にて例として表示されている化合物。

【請求項 6】

製薬上許容される賦形剤と混合して、構造：



( I )

[ 式中、 $m$ 、 $n$  及び  $p$  は独立して 0 及び 1 から選択され、 $m$ 、 $n$  及び  $p$  の少なくとも 1 つが 1 であり、

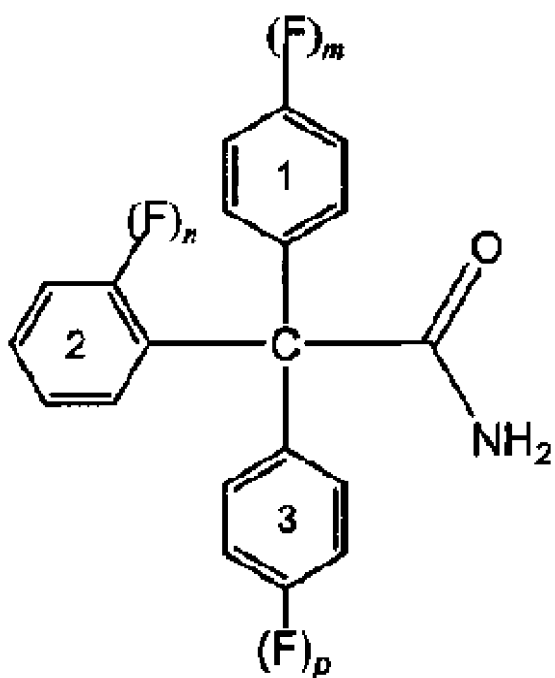
$m$ 、 $n$  及び  $p$  がすべて 1 であるときには、環 1 及び環 2 のフルオロ置換基は、アセトアミド置換基に対してオルト、アセトアミド置換基に対してメタ及びアセトアミド置換基に対してパラの中から独立して選択される位置に存在し、環 3 の置換基は、アセトアミド置換基に対してオルト及びアセトアミド置換基に対してパラから選択される位置にあり、そして

$p$  が 0、 $m$  が 1 で  $n$  が 1 であるときには、環 1 のフルオロ置換基はアセトアミド置換基に対してパラであり、環 2 の置換基は、アセトアミド置換基に対してオルト及びアセトアミド置換基に対してパラから選択される位置にある ]

を持つ化合物を含む製薬組成物。

【請求項 7】

上記化合物が構造：



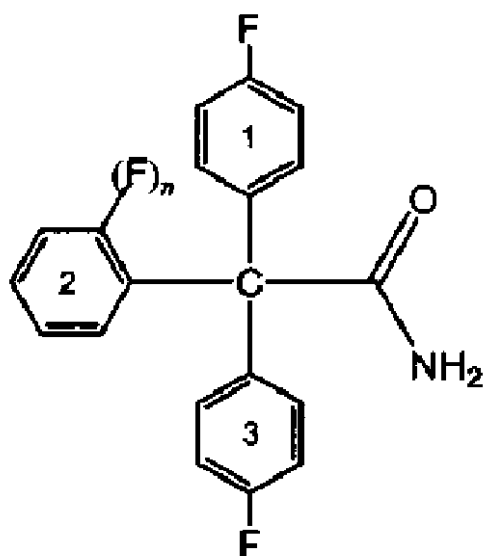
( II )

[ 式中、 $m$ 、 $n$  及び  $p$  は独立して 0 及び 1 から選択され、 $m$ 、 $n$  及び  $p$  の少なくとも 1 つが 1 である ]

を持つ、請求項 6 に記載の製薬製剤。

【請求項 8】

上記化合物が構造：



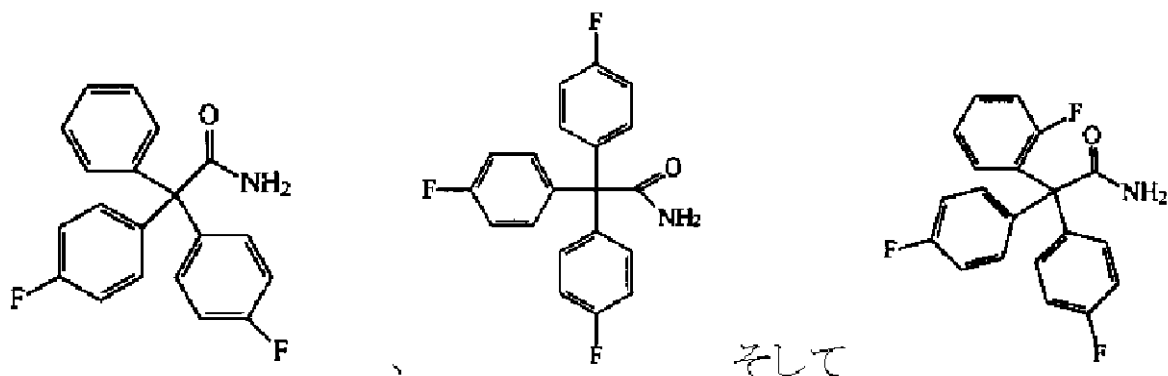
( III )

[ 式中、 $n$  は 0 若しくは 1 である ]

を持つ、請求項 7 に記載の製薬製剤。

【請求項 9】

上記化合物が、



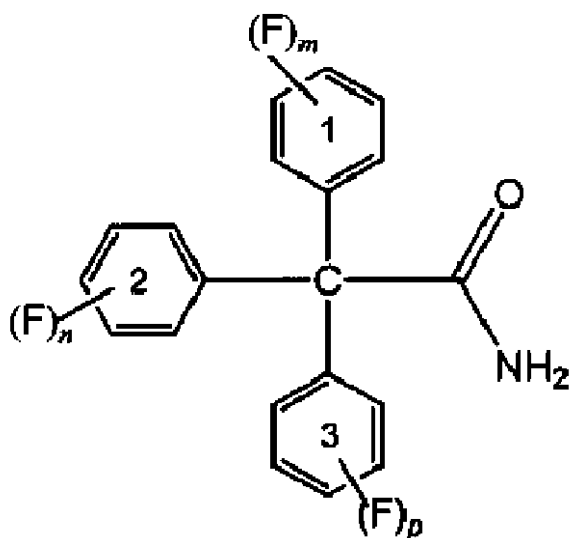
から選択される構造を持つ、請求項 6 に記載の製薬組成物。

【請求項 10】

薬剤として認められる賦形剤でありかつ請求項 5 記載の化合物を混合してなる製薬組成物。

【請求項 11】

構造：



( I )

[ 式中、 $m$ 、 $n$  及び  $p$  は独立して 0 及び 1 から選択され、 $m$ 、 $n$  及び  $p$  の少なくとも 1 つが 1 であり、

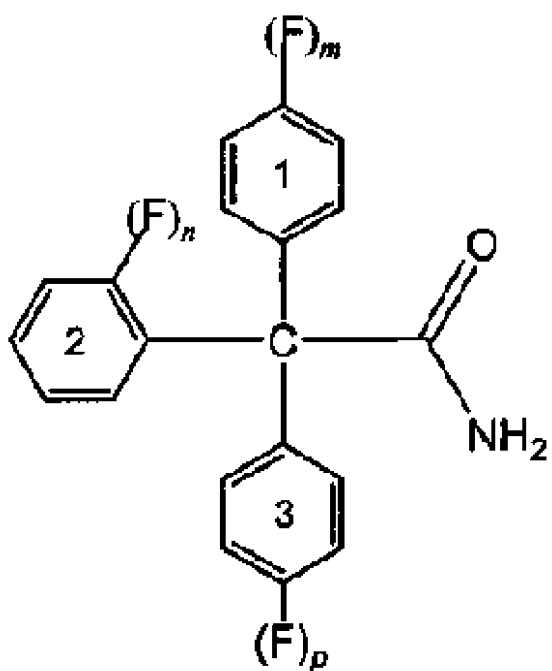
$m$ 、 $n$  及び  $p$  がすべて 1 であるときには、環 1 及び環 2 のフルオロ置換基は、アセトアミド置換基に対してオルト、アセトアミド置換基に対してメタ及びアセトアミド置換基に対してパラの中から独立して選択される位置に存在し、環 3 の置換基は、アセトアミド置換基に対してオルト及びアセトアミド置換基に対してパラから選択される位置にあり、そして

$p$  が 0、 $m$  が 1 で  $n$  が 1 であるときには、環 1 のフルオロ置換基はアセトアミド置換基に対してパラであり、環 2 の置換基は、アセトアミド置換基に対してオルト及びアセトアミド置換基に対してパラから選択される位置にある ]

を持つ化合物若しくは請求項 6 から 10 のいずれか 1 の製薬組成物の有効量細胞に細胞を接触させることを含む、細胞のカリウムフラックスを阻害する方法。

【請求項 12】

上記化合物が構造：



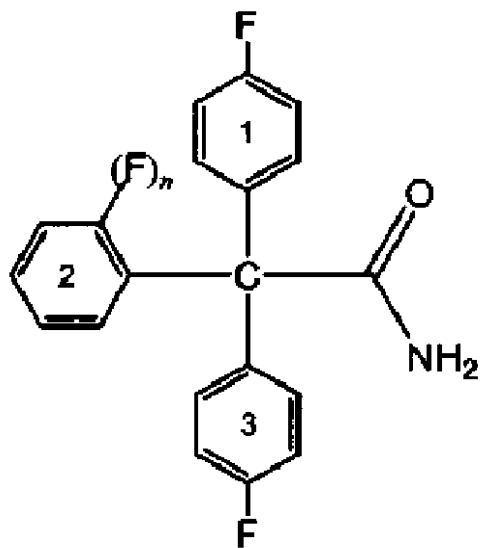
( II )

[ 式中、 $m$ 、 $n$  及び  $p$  は独立して 0 及び 1 から選択され、 $m$ 、 $n$  及び  $p$  の少なくとも 1 つが 1 である ]

を持つ、請求項 1 1 に記載の方法。

【請求項 1 3】

上記化合物が構造：



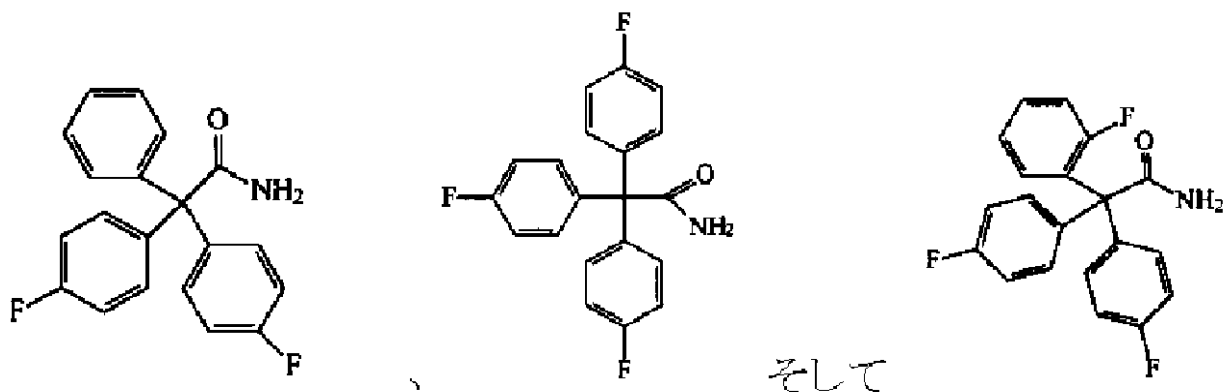
( III )

[ 式中、 $n$  は 0 若しくは 1 である ]

を持つ、請求項 1 1 に記載の方法。

【請求項 1 4】

上記化合物が、



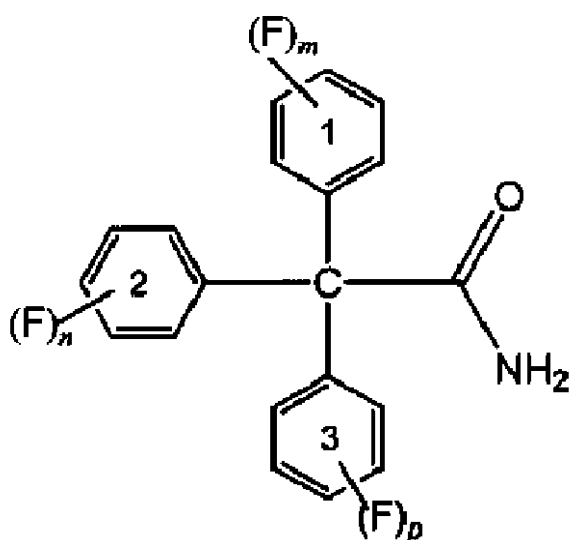
から選択される構造を持つ、請求項 1 1 に記載の方法。

【請求項 1 5】

上記細胞が赤血球である、請求項 1 1 に記載の方法。

【請求項 1 6】

構造：



( I )

[ 式中、 $m$ 、 $n$  及び  $p$  は独立して 0 及び 1 から選択され、 $m$ 、 $n$  及び  $p$  の少なくとも 1 つが 1 であり、

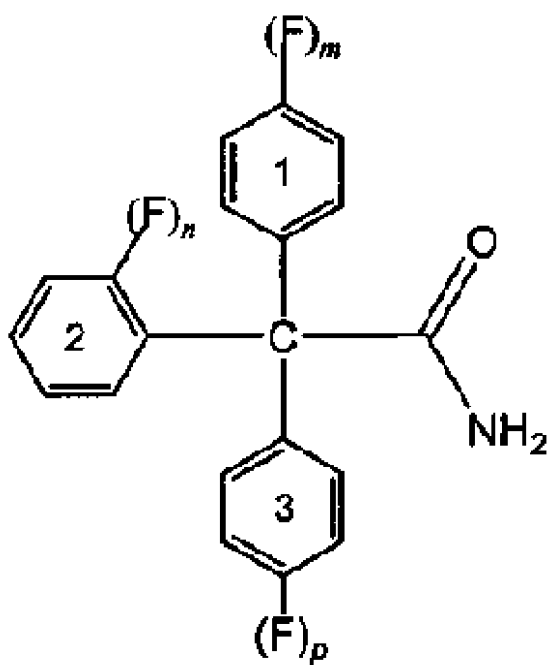
$m$ 、 $n$  及び  $p$  がすべて 1 であるときには、環 1 及び環 2 のフルオロ置換基は、アセトアミド置換基に対してオルト、アセトアミド置換基に対してメタ及びアセトアミド置換基に対してパラの中から独立して選択される位置に存在し、環 3 の置換基は、アセトアミド置換基に対してオルト及びアセトアミド置換基に対してパラから選択される位置にあり、そして

$p$  が 0、 $m$  が 1 で  $n$  が 1 であるときには、環 1 のフルオロ置換基はアセトアミド置換基に対してパラであり、環 2 の置換基は、アセトアミド置換基に対してオルト及びアセトアミド置換基に対してパラから選択される位置にある ]

を持つ化合物若しくは請求項 6 から 1 0 のいずれかの製薬組成物の有効量に赤血球を接触させて、赤血球の脱水を低減することを含む、赤血球の脱水を低減するための方法。

【請求項 1 7】

上記化合物が構造：



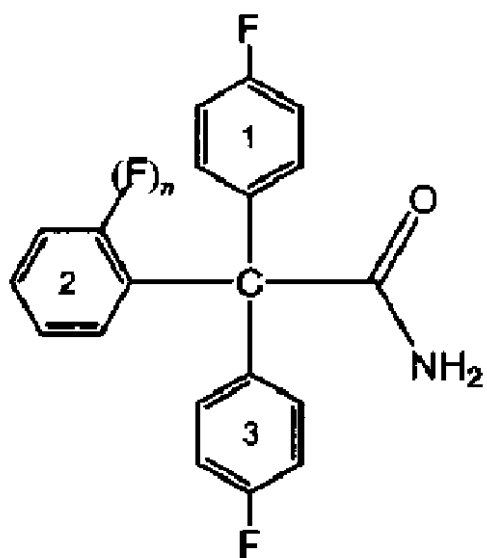
( II )

[ 式中、 $m$ 、 $n$  及び  $p$  は独立して 0 及び 1 から選択され、 $m$ 、 $n$  及び  $p$  の少なくとも 1 つが 1 である ]

を持つ、請求項 16 に記載の方法。

【請求項 18】

上記化合物が構造：



( III )

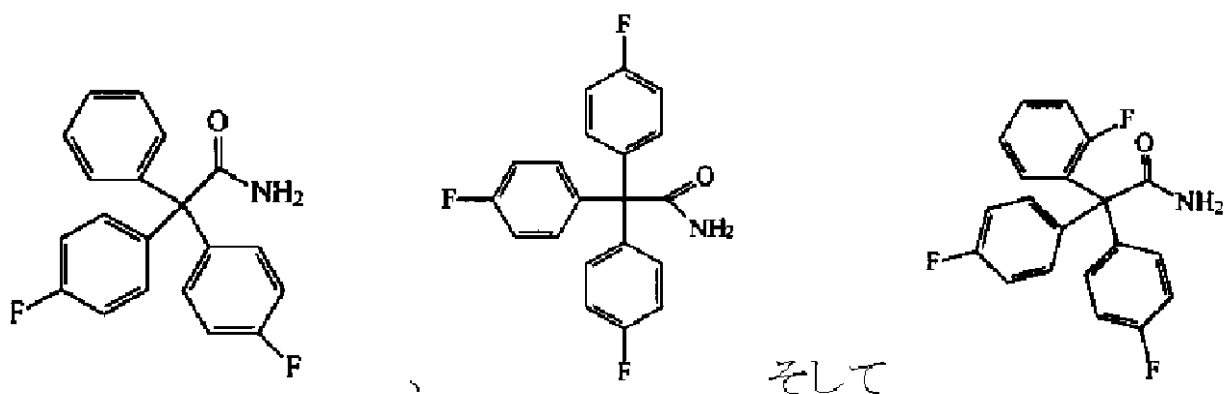
[ 式中、 $n$  は 0 若しくは 1 である ]

を持つ、請求項 17 に記載の方法。

【請求項 19】

上記化合物が、

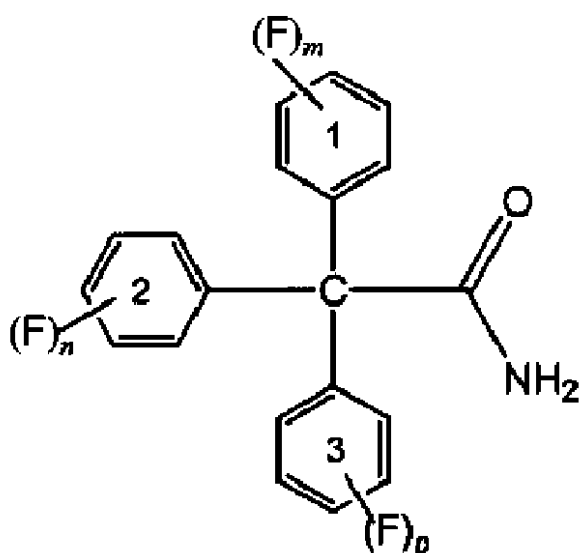




から選択される構造を持つ、請求項 16 に記載の方法。

【請求項 20】

鎌状赤血球症に罹患している対象者に、構造：



( I )

[ 式中、 $m$ 、 $n$  及び  $p$  は独立して 0 及び 1 から選択され、 $m$ 、 $n$  及び  $p$  の少なくとも 1 つが 1 であり、

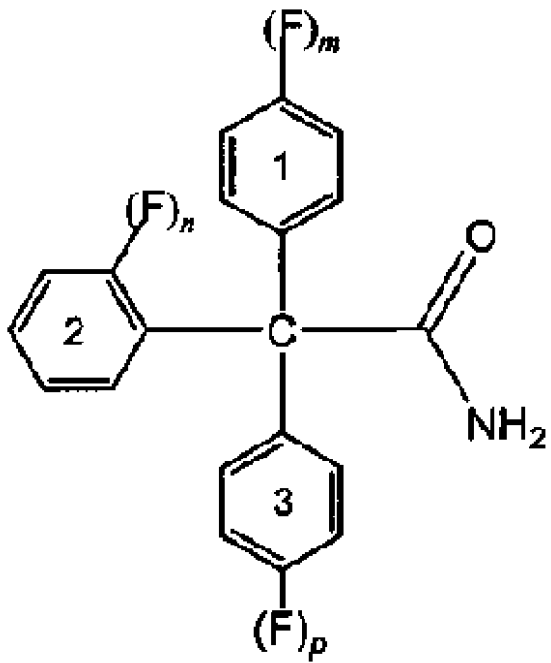
$m$ 、 $n$  及び  $p$  がすべて 1 であるときには、環 1 及び環 2 のフルオロ置換基は、アセトアミド置換基に対してオルト、アセトアミド置換基に対してメタ及びアセトアミド置換基に対してパラの中から独立して選択される位置に存在し、環 3 の置換基は、アセトアミド置換基に対してオルト及びアセトアミド置換基に対してパラから選択される位置にあり、そして

$p$  が 0、 $m$  が 1 で  $n$  が 1 であるときには、環 1 のフルオロ置換基はアセトアミド置換基に対してパラであり、環 2 の置換基は、アセトアミド置換基に対してオルト及びアセトアミド置換基に対してパラから選択される位置にある ]

を持つ化合物若しくは請求項 6 から 10 のいずれかの製薬組成物の治療上有効な量を投与することを含む、鎌状赤血球症の事象を治療する又は予防するための方法。

【請求項 21】

上記化合物が構造：



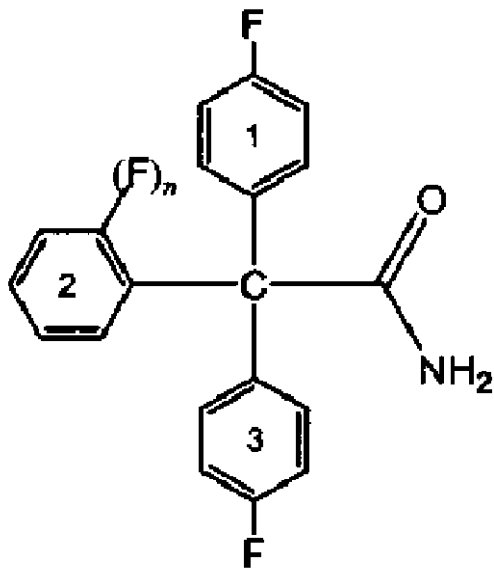
( II )

[ 式中、 $m$ 、 $n$  及び  $p$  は独立して 0 及び 1 から選択され、 $m$ 、 $n$  及び  $p$  の少なくとも 1 つが 1 である ]

を持つ、請求項 20 に記載の方法。

【請求項 22】

上記化合物が構造：



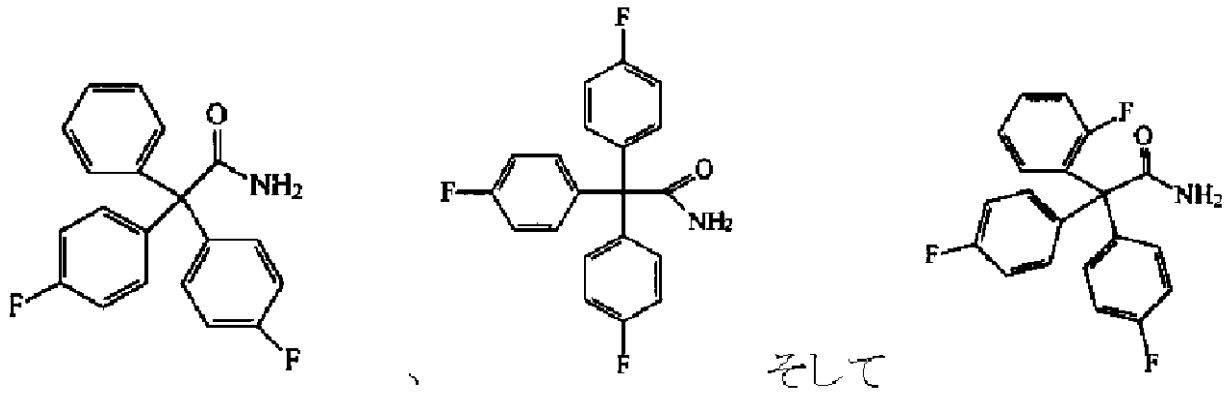
( III )

[ 式中、 $n$  は 0 若しくは 1 である ]

を持つ、請求項 21 に記載の方法。

【請求項 23】

上記化合物が、



から選択される構造を持つ、請求項 20 に記載の方法。

【請求項 24】

請求項 1 から 5 のいずれかの化合物を、細胞からカリウムが流生するのを阻害する医薬品としての製造に使用すること。

【請求項 25】

請求項 1 から 5 のいずれかの化合物を赤血球からの脱水を減少させる医薬品としての製造に使用すること。

【請求項 26】

請求項 1 から 5 のいずれかの化合物を鎌状赤血球症の治療や予防の医薬品としての製造に使用すること。