

【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9月11日(2008.9.11)

【公表番号】特表2008-517924(P2008-517924A)

【公表日】平成20年5月29日(2008.5.29)

【年通号数】公開・登録公報2008-021

【出願番号】特願2007-538054(P2007-538054)

【国際特許分類】

C 0 7 D 215/48 (2006.01)

A 6 1 K 31/4704 (2006.01)

A 6 1 P 25/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 215/48 C S P

A 6 1 K 31/4704

A 6 1 P 25/02

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 9/10

【手続補正書】

【提出日】平成20年7月24日(2008.7.24)

【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

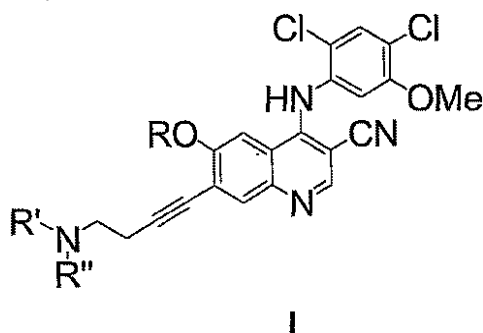
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

以下の構造を有する化合物、およびそれらの薬学的に受容可能な塩：

【化 1】



ここで：

R は、メチルまたはエチルである；

R' および R'' は、別個に、1 個～3 個の炭素原子のアルキルであるか、あるいは R' および R'' は、それらが結合する窒素と一緒に、5 員または 6 員飽和環を形成でき、該飽和環は、必要に応じて、追加ヘテロ原子を含有し得、該追加ヘテロ原子は、N、R'、O または S(O)<sub>n</sub> から選択される；

n は、0～2 である；

R' は、水素または 1 個～3 個の炭素原子のアルキルである、

化合物、およびそれらの薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 2】

R' および R'' が、それぞれ、メチルである、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 3】

R' および R'' が、それらが結合する窒素と一緒にあって、N - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>) - アルキルピペラジン環、ピペラジン環またはモルホリン環を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 4】

前記 N - (C<sub>1</sub> ~ C<sub>3</sub>) アルキルピペラジン環が、N - メチル - ピペラジンである、請求項 3 に記載の化合物。

## 【請求項 5】

R が、メチルである、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

## 【請求項 6】

前記化合物が、以下から選択される、請求項 1 に記載の化合物：

4 - [(2, 4 - ジクロロ - 5 - メトキシフェニル) アミノ] - 7 - [4 - (ジメチルアミノ) ブト - 1 - イニル] - 6 - メトキシ - 3 - キノリンカルボニトリル；

4 - [(2, 4 - ジクロロ - 5 - メトキシフェニル) アミノ] - 6 - メトキシ - 7 - [4 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) ブト - 1 - イニル] - 3 - キノリンカルボニトリル；

4 - [(2, 4 - ジクロロ - 5 - メトキシフェニル) アミノ] - 6 - メトキシ - 7 - (4 - モルホリン - 4 - イルブト - 1 - イニル) - 3 - キノリンカルボニトリル；

4 - [(2, 4 - ジクロロ - 5 - メトキシフェニル) アミノ] - 6 - メトキシ - 7 - (4 - ピペラジン - 1 - イルブト - 1 - イニル) - 3 - キノリンカルボニトリル；および

4 - [(2, 4 - ジクロロ - 5 - メトキシフェニル) アミノ] - 6 - エトキシ - 7 - [4 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) ブト - 1 - イニル] - 3 - キノリンカルボニトリル；およびそれらの薬学的に受容可能な塩。

## 【請求項 7】

請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物およびそれらの薬学的に受容可能な塩と、少なくとも 1 種の薬学的に受容可能な担体または賦形剤とを含有する、医薬組成物。

## 【請求項 8】

請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物およびそれらの薬学的に受容可能な塩の血管浸透阻止量と、少なくとも 1 種の薬学的に受容可能な担体または賦形剤とを含有する、医薬組成物。

## 【請求項 9】

静脈投与形態である、請求項 7 または 8 に記載の組成物。

## 【請求項 10】

脳血管虚血事象後の患者において神経保護を与えるための組成物であって、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物の治療有効量を含む、組成物。

## 【請求項 11】

脳血管虚血事象後の患者において神経欠損を阻止するための組成物であって、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物の治療有効量を含む、組成物。

## 【請求項 12】

脳血管虚血事象後の患者において梗塞の体積を減らすための組成物であって、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物の治療有効量を含む、組成物。

## 【請求項 13】

脳血管事象に罹っている患者において脳血管の虚血後血管浸透を阻止するための組成物であって、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物の治療有効量を含む、組成物。

## 【請求項 14】

前記組成物が、前記虚血事象後、約 6 ~ 約 24 時間の間に投与される、請求項 10 ~ 13 のいずれか 1 項に記載の組成物。

## 【請求項 15】

前記治療有効量が、約 1 m g / k g ~ 約 3 0 m g / k g である、請求項 1 0 ~ 1 4 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 1 6】

式 I の化合物を含む前記組成物が、静脈内投与される、請求項 1 0 ~ 1 5 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 1 7】

前記患者が、ヒトである、請求項 1 0 ~ 1 6 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 1 8】

前記虚血事象が、一過性である、請求項 1 0 ~ 1 7 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 1 9】

前記虚血事象が、急性である、請求項 1 0 ~ 1 7 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 2 0】

前記虚血事象が、脳卒中、頭部外傷、脊髄外傷、広汎性無酸素症、または低酸素症である、請求項 1 9 に記載の組成物。

【請求項 2 1】

前記虚血事象が、脳出血、周産期呼吸停止、心停止またはてんかん重積状態中に起こる、請求項 1 0 ~ 2 0 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 2 2】

脳血管虚血事象後の患者において神経保護を与える医薬、脳血管虚血事象後の患者において神経欠損を阻止する医薬、脳血管虚血事象後の患者において梗塞の体積を減らす医薬、および脳血管事象に罹っている患者において脳血管の虚血後血管浸透を阻止する医薬の製造における、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 2 3】

前記患者が、ヒトである、請求項 2 2 に記載の使用。

【請求項 2 4】

前記虚血事象が、一過性である、請求項 2 2 または請求項 2 3 に記載の使用。

【請求項 2 5】

前記虚血事象が、急性である、請求項 2 2 または請求項 2 3 に記載の使用。

【請求項 2 6】

前記虚血事象が、脳卒中、頭部外傷、脊髄外傷、広汎性無酸素症、または低酸素症である、請求項 2 5 に記載の使用。

【請求項 2 7】

前記虚血事象が、脳出血、周産期呼吸停止、心停止またはてんかん重積状態中に起こる、請求項 2 2 ~ 2 6 のいずれか 1 項に記載の使用。