

【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4月19日(2007.4.19)

【公表番号】特表2006-520761(P2006-520761A)

【公表日】平成18年9月14日(2006.9.14)

【年通号数】公開・登録公報2006-036

【出願番号】特願2006-504337(P2006-504337)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/132 (2006.01)

A 6 1 K 31/16 (2006.01)

A 6 1 K 31/4196 (2006.01)

A 6 1 K 31/445 (2006.01)

A 6 1 K 31/495 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 39/02 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/132

A 6 1 K 31/16

A 6 1 K 31/4196

A 6 1 K 31/445

A 6 1 K 31/495

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 P 39/02

【手続補正書】

【提出日】平成19年2月28日(2007.2.28)

【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

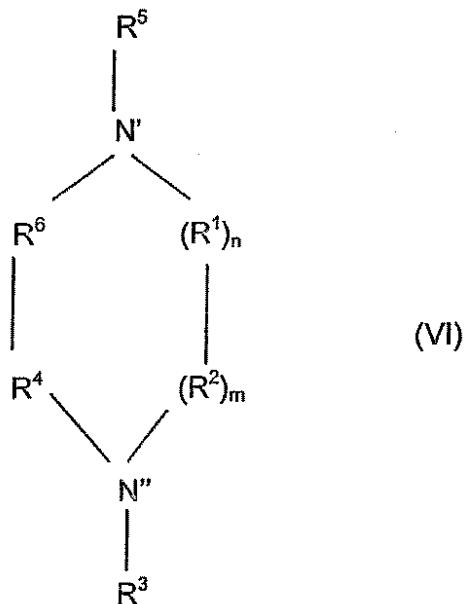
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

誘発された細胞毒性の予防および／または処置のための医薬の製造のための、一般式(VI)：

## 【化1】



[式中、

各  $R^1$  および各  $R^2$  は独立に C、S、N、O から選択され、C、S、N、O、OH、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、フェニル、ベンジル、アミン (NH)、ハロゲン、置換された低級アルキル、アリール、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、アリール - (C<sub>1-4</sub>) - アルキル、ヘテロアリール - (C<sub>1-4</sub>) - アルキル、ヘテロシクリル - (C<sub>1-4</sub>) - アルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルで置換されていてもよく、これら置換基は、さらに 1 以上の C、S、N、O、OH、フェニル、アミン (NH)、ハロゲン、置換された低級アルキル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、アリール - (C<sub>1-4</sub>) - アルキル、ヘテロアリール - (C<sub>1-4</sub>) - アルキル、ヘテロシクリル - (C<sub>1-4</sub>) - アルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、カルボキシ、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、アミノ、またはニトロで置換されていてもよく、

m は 1 ~ 8 の整数であり、

n は 1 ~ 8 の整数であり、

N' および N'' は窒素であり、

$R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  は、C、S、N、O、OH、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、フェニル、ベンジル、アミン (NH)、ハロゲン、置換された低級アルキル、アリール、ヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、アリール - (C<sub>1-4</sub>) - アルキル、ヘテロアリール - (C<sub>1-4</sub>) - アルキル、ヘテロシクリル - (C<sub>1-4</sub>) - アルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルから独立に選択され、さらに 1 以上の C、S、N、O、OH、フェニル、アミン (NH)、ハロゲン、置換された低級アルキル、アリール、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、アリール - (C<sub>1-4</sub>) - アルキル、ヘテロアリール - (C<sub>1-4</sub>) - アルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキル、アルコキシ、カルボキシ、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、アミノ、またはニトロで置換されていてもよいか、または

 $R^3$ 、 $R^4$ 、 $R^5$  および  $R^6$  の 1 つ以上は化学結合である]

で示される構造を含んでなる化合物またはその製薬的に許容し得る付加塩もしくは水和物、あるいはジアミノメタン、1,2-ジアミノエタン、1,3-ジアミノプロパン、1,4-ジアミノブタン、1,5-ジアミノペンタン、1,6-ジアミノヘキサン、1,7-ジアミノヘプタン、1,8-ジアミノオクタンである化合物またはその製薬的に許容し得る付加塩もしくは水和物の使用。

## 【請求項 2】

細胞がレセプター・メガリンおよび / またはレセプター・キュビリンを提示している、

請求項 1 記載の使用。

【請求項 3】

R<sup>1</sup>またはR<sup>2</sup>の少なくとも 1 つが C である、請求項 1 または 2 に記載の使用。

【請求項 4】

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>が C である、請求項 1 または 2 に記載の使用。

【請求項 5】

R<sup>1</sup>またはR<sup>2</sup>の少なくとも 1 つが S である、請求項 1 または 2 に記載の使用。

【請求項 6】

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>が S である、請求項 1 または 2 に記載の使用。

【請求項 7】

R<sup>1</sup>またはR<sup>2</sup>の少なくとも 1 つが N である、請求項 1 または 2 に記載の使用。

【請求項 8】

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>が N である、請求項 1 または 2 に記載の使用。

【請求項 9】

R<sup>1</sup>またはR<sup>2</sup>の少なくとも 1 つが O である、請求項 1 または 2 に記載の使用。

【請求項 10】

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>が O である、請求項 1 または 2 に記載の使用。

【請求項 11】

医薬がレセプター・メガリンおよび / またはレセプター・キュビリンに結合することができる、請求項 1 ~ 10 のいずれかに記載の使用。

【請求項 12】

化合物が、3 - メチルアミノ - 1 - (4 - メチルピペラジノ) - 2 - プロパノール、4 - ピペラジニアニリン、1 - (3 - クロロフェニル) ピペラジン二塩酸 (m - CPP) 、ピペラジン - 2 - オン - HC1、2 - [4 - (2 - アミノエチル) ピペラジン - 1 - イル] エチルアミン、無水ピペラジン、2,4 - ジアミノ - 6 - フェニル - 1,3,5 - トリアジン、3,5 - ジアミノ - 1,2,4 - トリアゾール、2,5 - ピペラジンジオン、ピペラジン、ピペラジン - 2 - オン - HC1、1 - (2 - ピリミジル) ピペラジンジハイドロクロライドまたはその製薬的に許容し得る付加塩または水和物から選択される、請求項 1 記載の使用。

【請求項 13】

化合物が、2 - [4 - (2 - アミノエチル) ピペラジン - 1 - イル] エチルアミン、3 - メチルアミノ - 1 - (4 - メチルピペラジノ) - 2 - プロパノールおよびピペラジンから選択される、請求項 12 記載の使用。

【請求項 14】

化合物がピペラジンである、請求項 1 記載の使用。

【請求項 15】

化合物が、1,7 - ジアミノヘプタン、1,2 - ジアミノエタン、1,4 - ジアミノブタン、1,6 - ジアミノヘキサン、および 1,5 - ジアミノペンタンから選択される、請求項 1 記載の使用。

【請求項 16】

化合物が 1,6 - ジアミノヘキサンである、請求項 1 記載の使用。

【請求項 17】

細胞が腎臓および / または内耳に由来する、請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の使用。

【請求項 18】

化合物が溶液中で少なくとも 1 、例えば少なくとも 2 の正電荷、例えば少なくとも 20 の正電荷を有する、請求項 1 ~ 17 のいずれかに記載の使用。

【請求項 19】

化合物が多塩基性電荷分布を有する、請求項 1 ~ 18 のいずれかに記載の使用。

【請求項 20】

一般式

(A<sub>q</sub>-X)<sub>p</sub> (VII)

[式中、

Aは、請求項1～19のいずれかに記載の化合物であり、

Xはスペーサーであり

qは1～100の整数であり、

pは1～100の整数である]

を有する化合物。

【請求項21】

スペーサーが共有結合である、請求項20記載の化合物。

【請求項22】

スペーサーが、炭素原子等の2～12原子からなり、例えば炭素原子等の4～10原子からなり、好ましくは炭素原子等の6～8原子からなる、請求項20記載の化合物。

【請求項23】

誘発された細胞毒性の予防および／または処置のための、請求項20記載の化合物の使用。

【請求項24】

使用が請求項1～19のいずれかにおいて定義される、請求項20記載の化合物の使用。

【請求項25】

請求項1～19のいずれかに記載の化合物および誘発性細胞毒性治療において、同時に、別々にまたは順次に使用するための治療剤を含んでなる複合医薬。

【請求項26】

細胞がレセプター・メガリンおよび／またはレセプター・キュビリンを提示している、請求項25記載の複合医薬。

【請求項27】

請求項20～22のいずれかに記載の化合物およびそのための製薬的に許容し得る担体、賦形剤または希釈剤を含有する医薬組成物。