

【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1月31日(2008.1.31)

【公表番号】特表2003-528917(P2003-528917A)

【公表日】平成15年9月30日(2003.9.30)

【出願番号】特願2001-572104(P2001-572104)

【国際特許分類】

A 6 1 K	45/06	(2006.01)
A 6 1 K	31/517	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/12	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 K	38/55	(2006.01)

【F I】

A 6 1 K	45/06	
A 6 1 K	31/517	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	9/12	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	43/00	1 2 3
A 6 1 K	37/64	

【手続補正書】

【提出日】平成19年12月5日(2007.12.5)

【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】

ヒトなどの温血動物における血管新生に関連した疾患状態の処置用の薬剤の製造において用いるための抗血管新生薬および抗高血圧薬の組合せの使用。

【請求項2】

抗血管新生薬が、酸化窒素のレベルに影響を与える請求項1に記載の使用。

【請求項3】

抗血管新生薬がVEGF受容体チロシンキナーゼ阻害剤である請求項1に記載の使用。

【請求項4】

抗血管新生薬が、

6-メトキシ-4-(2-メチルインドール-5-イルオキシ)-7-(3-(ピロリジン-1-イル)プロポキシ)キナゾリン、

4-(4-フルオロインドール-5-イルオキシ)-6-メトキシ-7-(1-メチルピペリジン-4-イルメトキシ)キナゾリン、

4-(4-フルオロインドール-5-イルオキシ)-6-メトキシ-7-(3-(4-メチルピペラジン-1-イル)プロポキシ)キナゾリン、

4-(6-フルオロインドール-5-イルオキシ)-6-メトキシ-7-(3-(ピロリジン-1-イル)プロポキシ)キナゾリン、

4-(4-フルオロインドール-5-イルオキシ)-6-メトキシ-7-(3-(ピロリジン-1-イル)プロポキシ)キナゾリン、

4 - (4 - フルオロインドール - 5 - イルオキシ) - 6 - メトキシ - 7 - (3 - ピペリジノプロポキシ) キナゾリン、

4 - (4 - フルオロ - 2 - メチルインドール - 5 - イルオキシ) - 6 - メトキシ - 7 - (3 - (ピロリジン - 1 - イル) プロポキシ) キナゾリン、

4 - (4 - フルオロ - 2 - メチルインドール - 5 - イルオキシ) - 6 - メトキシ - 7 - (3 - ピペリジノプロポキシ) キナゾリン、

4 - (4 - フルオロ - 2 - メチルインドール - 5 - イルオキシ) - 6 - メトキシ - 7 - ((1 - メチルピペリジン - 4 - イル) メトキシ) キナゾリン、

4 - (4 - フルオロ - 2 - メチルインドール - 5 - イルオキシ) - 6 - メトキシ - 7 - (3 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) プロポキシ) キナゾリン、

4 - (4 - フルオロインドール - 5 - イルオキシ) - 6 - メトキシ - 7 - (2 - (1 - メチルピペリジン - 4 - イル) エトキシ) キナゾリン、

(2R) - 7 - (2 - ヒドロキシ - 3 - (ピロリジン - 1 - イル) プロポキシ) - 4 - (4 - フルオロ - 2 - メチルインドール - 5 - イルオキシ) - 6 - メトキシキナゾリン、および

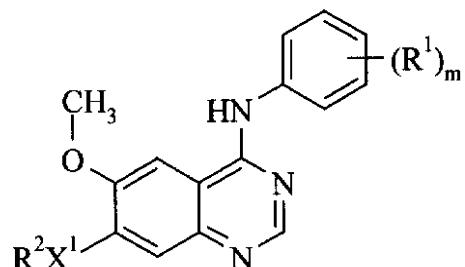
4 - (4 - フルオロ - 2 - メチルインドール - 5 - イルオキシ) - 6 - メトキシ - 7 - (2 - (1 - メチルピペリジン - 4 - イル) エトキシ) キナゾリン；

またはそれらの薬学的に許容しうる塩より選択される請求項3に記載の使用。

#### 【請求項5】

抗血管新生薬が、式II

#### 【化1】



式 (II)

[式中、

mは、1～3の整数であり；

R<sup>1</sup>は、ハロゲノまたはC<sub>1～3</sub>アルキルであり；

X<sup>1</sup>は、-O-であり；

R<sup>2</sup>は、次の3種類の基、

(1) C<sub>1～5</sub>アルキル R<sup>3a</sup> (式中、R<sup>3a</sup>は、ヒドロキシ、ハロゲノ、C<sub>1～4</sub>アルキル、C<sub>1～4</sub>ヒドロキシアルキルおよびC<sub>1～4</sub>アルコキシより選択される1個または2個の置換基を有していてよいピペリジン - 4 - イルである)；

(2) C<sub>2～5</sub>アルケニル R<sup>3a</sup> (式中、R<sup>3a</sup>は、本明細書中に定義の通りである)；

(3) C<sub>2～5</sub>アルキニル R<sup>3a</sup> (式中、R<sup>3a</sup>は、本明細書中に定義の通りである)の内の一つより選択され；

そしてここにおいて、いずれのアルキル基、アルケニル基またはアルキニル基も、ヒドロキシ、ハロゲノおよびアミノより選択される1個またはそれより多い置換基を有していてよい]

を有する化合物；またはその薬学的に許容しうる塩である請求項3に記載の使用。

#### 【請求項6】

抗血管新生薬が、4 - (4 - プロモ - 2 - フルオロアニリノ) - 6 - メトキシ - 7 - (

1 - メチルピペリジン - 4 - イルメトキシ)キナゾリンまたはその薬学的に許容しうる塩である請求項 1、2、3 および 5 のいずれか 1 項に記載の使用。

**【請求項 7】**

抗血管新生薬が、血管標的薬である、請求項 1 に記載の使用。

**【請求項 8】**

抗血管新生薬が、N - アセチルコルヒチノール - O - リン酸である、請求項 7 に記載の使用。

**【請求項 9】**

抗高血圧薬が、カルシウムチャンネル遮断薬、A - IIアンタゴニスト、ACE阻害剤または遮断薬である、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の使用。

**【請求項 10】**

抗高血圧薬が ACE 阻害剤である請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の使用。

**【請求項 11】**

抗高血圧薬がリシノプリルまたはカプトプリルである請求項 10 に記載の使用。

**【請求項 12】**

医薬組成物であって、

( a ) 抗血管新生薬またはその薬学的に許容しうる塩、溶媒和化合物またはプロドラッグ；

( b ) 抗高血圧薬またはその薬学的に許容しうる塩、溶媒和化合物またはプロドラッグ；および

場合により、( c ) 薬学的に許容しうる担体または希釈剤を含む医薬組成物。

**【請求項 13】**

ヒトなどの温血動物において抗血管新生作用および / または血管透過性減少作用を生じるのに用いるためのキットであって、

( a ) 抗血管新生薬またはその薬学的に許容しうる塩、溶媒和化合物またはプロドラッグ、またはその医薬組成物；

( b ) 抗高血圧薬またはその薬学的に許容しうる塩、溶媒和化合物またはプロドラッグ、またはその医薬組成物；および

( c ) 該薬剤を含有するための容器手段を含むキット。

**【請求項 14】**

血管新生に関連した疾患状態の処置方法であって、ヒトなどの温血動物への抗血管新生薬および抗高血圧薬の有効量の組合せの投与を含む方法。