

【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16年9月2日(2004.9.2)

【公表番号】特表2000-500758(P2000-500758A)

【公表日】平成12年1月25日(2000.1.25)

【出願番号】特願平9-519409

【国際特許分類第7版】

C 0 7 C 307/04

A 6 1 K 31/64

A 6 1 K 31/663

C 0 7 C 211/21

C 0 7 C 239/20

C 0 7 F 9/30

C 0 7 F 9/38

C 0 7 F 9/40

【F I】

C 0 7 C 307/04

A 6 1 K 31/64

A 6 1 K 31/66 6 0 4

C 0 7 C 211/21

C 0 7 C 239/20

C 0 7 F 9/30

C 0 7 F 9/38

C 0 7 F 9/40

【手続補正書】

【提出日】平成15年7月18日(2003.7.18)

【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】

手続補正書

平成15年7月18日

特許庁長官 太田 信一郎 殿

1. 事件の表示

平成9年特許願第519409号

PCT/EP96/05202

2. 補正をする者

事件との関係 特許出願人

住所 イタリア国, 56100 ピサ,

ヴィア サン ミケーレ デリ スカルツィ, 73

名称 ラボラトリ バルダッチ エス. ピー. エー.

3. 代理人

〒105-0003

住所 東京都港区西新橋 2-19-2. 西新橋YSビル3階

電話 03 (5401) 2521

氏名 (8554) 弁理士 松井 光夫



4. 補正により増加する請求項の数 なし

5. 補正対象書類名 特許法第184条の5第1項の規定による書面

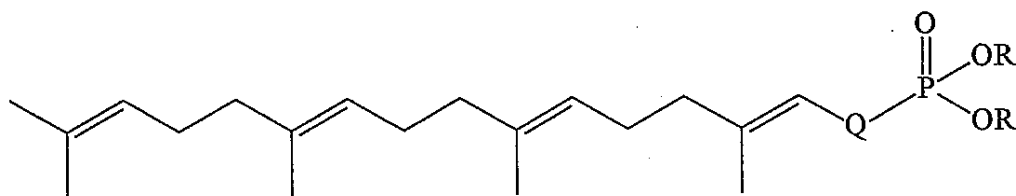
6. 補正対象項目名 特許請求の範囲

7. 補正の内容 別紙の通り

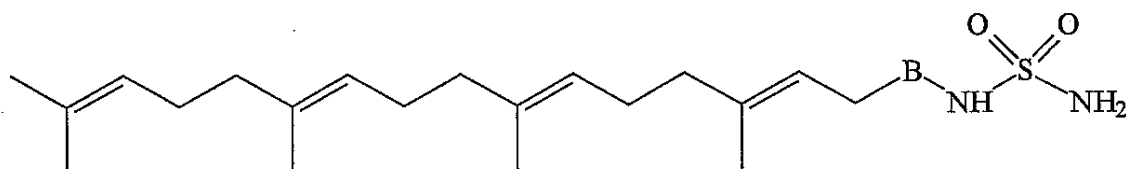
月 八 日
審 査

請求の範囲

1. 式：



I



II

(ここで：

$Q = CH_2-\overset{\text{X}}{\text{A}}$, CH_2-CH_2 から選ばれ；

$X = ONH, ONHCO, OCH_2CO, OCH_2P(O)OH, CH_2P(O)OH, NHCO, NCH_3CO, OSO_2$, または $NHSO_2$ ；

$A = R'CR', CHR', CH_2$ または、 $X=OSO_2, NHSO_2$ のとき NH ；

B = OCO, O, ONHCO, NHCO, または NCH₃CO;

R = H, CH₃, または CH₂CH₃;

R' = H, CH₃, または CH₂CH₃;

R' ' = H, CH₃, または CH₂CH₃;

R' ' ' = H, または COOH;

である)

を有する化合物ならびに、有機および無機の酸もしくは塩基を用いて形成される、薬剤的に許容されるそれらの塩。

2. (E, E, E)-{2-オキソ-2-[[(3, 7, 11, 15-テトラメチル-2, 6, 10, 14-ヘキサデカテトラエニル) オキシ] アミノ] エチル} ホスホン酸ならびに、有機および無機の酸もしくは塩基を用いて形成される、薬剤的に許容されるそれらの塩。

3. エチル-(E, E, E)-{2-オキソ-2-[[(3, 7, 11, 15-テトラメチル-2, 6, 10, 14-ヘキサデカテトラエニル) オキシ] アミノ] エチル} ホスホネートならびに、有機および無機の酸もしくは塩基を用いて形成される、薬剤的に許容されるそれらの塩。

4. (E, E, E)-1-[[(3, 7, 11, 15-テトラメチル-2, 6, 10, 14-ヘキサデカテトラエニル) オキシ] アミノカルボニル] エチルホスホン酸ならびに、有機および無機の酸もしくは塩基を用いて形成される、薬剤的に許容されるそれらの塩。

5. (E, E, E)-1-[[(3, 7, 11, 15-テトラメチル-2, 6, 10, 14-ヘキ

サデカテトラエニル) オキシ] アミノカルボニル] プロピル
ホスホン酸ならびに、有機および無機の酸もしくは塩基を用
いて形成される、薬剂的に許容されるそれらの塩。

6. (E, E, E)-{3-オキソ-3-[[(3, 7, 11, 15-テトラメチル
-2, 6, 10, 14-ヘキサデカテトラエニル) オキシ]アミノ] プロ
ピル}ホスホン酸ならびに、有機および無機の酸もしくは塩基
を用いて形成される、薬剂的に許容されるそれらの塩。

7. (E, E, E)-3-オキソ-2-(ホスホノメチル)-3-[[(3, 7, 11, 15-
テトラメチル-2, 6, 10, 14-ヘキサデカテトラエニル) オキシ]
アミノ] プロパン酸ならびに、有機および無機の酸もしくは
塩基を用いて形成される、薬剂的に許容されるそれらの塩。

8. (E, E, E)-[2-オキソ-2-[(3, 7, 11, 15-テトラメチル
-2, 6, 10, 14-ヘキサデカテトラエニル) アミノ] エチル] ホス
ホン酸ならびに、有機および無機の酸もしくは塩基を用いて
形成される、薬剂的に許容されるそれらの塩。

9. (E, E, E)-1-[(3, 7, 11, 15-テトラメチル-2, 6, 10, 14-ヘキサ
デカテトラエニル) アミノカルボニル] エチルホスホン酸な
らびに、有機および無機の酸もしくは塩基を用いて形成され
る、薬剂的に許容されるそれらの塩。

10. (E, E, E)-1-[(3, 7, 11, 15-テトラメチル-2, 6, 10, 14-ヘキサ

デカテトラエニル) アミノカルボニル] プロピルホスホン酸ならびに、有機および無機の酸もしくは塩基を用いて形成される、薬剂的に許容されるそれらの塩。

11. (E, E, E)-[3-オキソ-3-[(3, 7, 11, 15-テトラメチル-2, 6, 10, 14-ヘキサデカテトラエニル) アミノ] プロピル] ホスホン酸ならびに、有機および無機の酸もしくは塩基を用いて形成される、薬剂的に許容されるそれらの塩。

12. (E, E, E)-3-オキソ-2-(ホスホノメチル)-3-[(3, 7, 11, 15-テトラメチル-2, 6, 10, 14-ヘキサデカテトラエニル) アミノ] プロパン酸ならびに、有機および無機の酸もしくは塩基を用いて形成される、薬剂的に許容されるそれらの塩。

13. (E, E, E)-[[(4, 8, 12, 16-テトラメチル-3, 7, 11, 15-ヘプタデカテトラエニル) ヒドロキシホスホリル] メチル] ホスホン酸ならびに、有機および無機の酸もしくは塩基を用いて形成される、薬剂的に許容されるそれらの塩。

14. (E, E, E)-1-メチル-1-[(4, 8, 12, 16-テトラメチル-3, 7, 11, 15-ヘプタデカテトラエニル) ヒドロキシホスホリル] エチルホスホン酸ならびに、有機および無機の酸もしくは塩基を用いて形成される、薬剂的に許容されるそれらの塩。

15. (E, E, E)-1-エチル-1-[(4, 8, 12, 16-テトラメチル

-3, 7, 11, 15-ヘプタデカテトラエニル) ヒドロキシホスホリル] プロピルホスホン酸ならびに、有機および無機の酸もしくは塩基を用いて形成される、薬剂的に許容されるそれらの塩。

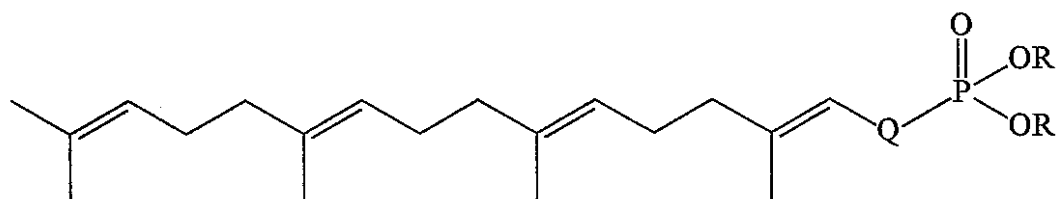
16. (E, E, E)-[[(3, 7, 11, 15-テトラメチル-2, 6, 10, 14-ヘキサデカテトラエニルオキシメチル) ヒドロキシホスホリル] メチル] ホスホン酸ならびに、有機および無機の酸もしくは塩基を用いて形成される、薬剂的に許容されるそれらの塩。

17. (E, E, E)-(4, 8, 12, 16-テトラメチル-3, 7, 11, 15-ヘプタデカテトラエニル) ホスホン酸ならびに、有機および無機の酸もしくは塩基を用いて形成される、薬剂的に許容されるそれらの塩。

18. (E, E, E)-O-(3, 7, 11, 15-テトラメチル-2, 6, 10, 14-ヘキサデカテトラエニル)-N-(アミノスルホニル) ウレタンならびに、有機および無機の酸もしくは塩基を用いて形成される、薬剂的に許容されるそれらの塩。

19. (E, E, E)-1-[(アミノスルホニル) アミノオキシ]-3, 7, 11, 15-テトラメチル-2, 6, 10, 14-ヘキサデカテトラエンならびに、有機および無機の酸もしくは塩基を用いて形成される、薬剂的に許容されるそれらの塩。

20. 式：



(ここで、

$Q = \text{CH}_2 - \text{X} - \text{A}$, $\text{CH}_2 - \text{CH}_2$ から選ばれ ;

$X = \text{ONH}, \text{ONHCO}, \text{OCH}_2\text{CO}, \text{OCH}_2\text{P}(\text{O})\text{OR}, \text{CH}_2\text{P}(\text{O})\text{OR}, \text{NHCO},$
または NCH_3CO ;

$A = \text{R}'\text{CR}'', \text{CHR}''', \text{CH}_2$, または、 $X = \text{OSO}_2$, NHSO_2 の
とき NH ;

$B = \text{OCO}, \text{O}, \text{ONHCO}, \text{NHCO}$, または NCH_3CO ;

$R = \text{CH}_3$, または CH_2CH_3 ;

$R' = \text{H}, \text{CH}_3$, または CH_2CH_3 ;

$R'' = \text{H}, \text{CH}_3$, または CH_2CH_3 ;

$R''' = \text{H}, \text{COOEt}$, または COOMe ;

である)

を有する化合物。

21. ジエチル (E, E, E)-{2-オキシ-2-[[(3, 7, 11, 15-テトラメチル-2, 6, 10, 14-ヘキサデカテトラエニル) オキシ] アミノ] エチル) ホスホネート。

22. ジエチル (E, E, E)-1-[[(3, 7, 11, 15-テトラメチル

-2, 6, 10, 14-ヘキサデカテトラエニル) オキシ] アミノカルボニル) エチルホスホネート。

23. ジエチル (E, E, E)-1-[[(3, 7, 11, 15-テトラメチル-2, 6, 10, 14-ヘキサデカテトラエニル) オキシ] アミノカルボニル) プロピルホスホネート。

24. ジメチル (E, E, E)-{3-オキソ-3-[[(3, 7, 11, 15-テトラメチル-2, 6, 10, 14-ヘキサデカテトラエニル) オキシ] アミノ] プロピル) ホスホネート。

25. エチル (E, E, E)-3-オキソ-2-(ジエチルホスホノメチル)-3-[[(3, 7, 11, 15-テトラメチル-2, 6, 10, 14-ヘキサデカテトラエニル) オキシ] アミノ] プロパノエート。

26. ジエチル (E, E, E)-[2-オキソ-2-[[(3, 7, 11, 15-テトラメチル-2, 6, 10, 14-ヘキサデカテトラエニル) アミノ] エチル] ホスホネート。

27. ジエチル (E, E, E)-1-[[(3, 7, 11, 15-テトラメチル-2, 6, 10, 14-ヘキサデカテトラエニル) アミノカルボニル] エチルホスホネート。

28. ジエチル (E, E, E)-1-[[(3, 7, 11, 15-テトラメチル-2, 6, 10, 14-ヘキサデカテトラエニル) アミノカルボニル] プ

ロピルホスホネート。

29. ジメチル (E, E, E)-[3-オキソ-3-[(3, 7, 11, 15-テトラメチル-2, 6, 10, 14-ヘキサデカテトラエニル) アミノ] プロピル) ホスホネート。

30. ジエチル (E, E, E)-(4, 8, 12, 16-テトラメチル-3, 7, 11, 15-ヘプタデカテトラエニル) ホスホネート。

31. ジエチル (E, E, E)-[[(4, 8, 12, 16-テトラメチル-3, 7, 11, 15-ヘプタデカテトラエニル) エトキシホスホリル) メチル] ホスホネート。

32. ジエチル (E, E, E)-1-メチル-1-[(4, 8, 12, 16-テトラメチル-3, 7, 11, 15-ヘプタデカテトラエニル) エトキシホスホリル) エチルホスホネート。

33. ジエチル (E, E, E)-1-エチル-1-[(4, 8, 12, 16-テトラメチル-3, 7, 11, 15-ヘプタデカテトラエニル) エトキシホスホリル) プロピルホスホネート酸。

34. ジメチル (E, E, E)-[[(3, 7, 11, 15-テトラメチル-2, 6, 10, 14-ヘキサデカテトラエニルオキシメチル) エトキシホスホリル) メチル] ホスホネート。

35. (E, E, E)-3, 7, 11, 15-テトラメチル-2, 6, 10, 14-ヘキサデカテトラエニルオキシアミン。

36. 請求項 1 記載の化合物を活性成分として含むことを特徴とする薬剤組成物。

37. 良性および悪性腫瘍ならびに、腎臓および血管の疾病のような過度の細胞増殖によって特徴付けられる他の病状の処置のための薬剤組成物であって、請求項 1 記載の化合物を活性成分として含むことを特徴とする薬剤組成物。

38. 良性および悪性腫瘍ならびに、腎臓および血管の疾病のような過度の細胞増殖によって特徴付けられる他の病状の処置のための薬剤組成物であって、請求項 2 ～ 19 のいずれか 1 項記載の化合物を活性成分として含むことを特徴とする薬剤組成物。