

【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1月18日(2007.1.18)

【公表番号】特表2006-507319(P2006-507319A)

【公表日】平成18年3月2日(2006.3.2)

【年通号数】公開・登録公報2006-009

【出願番号】特願2004-550987(P2004-550987)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/502 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

C 0 7 D 401/06 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/502

A 6 1 P 35/00

C 0 7 D 401/06

【手続補正書】

【提出日】平成18年11月24日(2006.11.24)

【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】

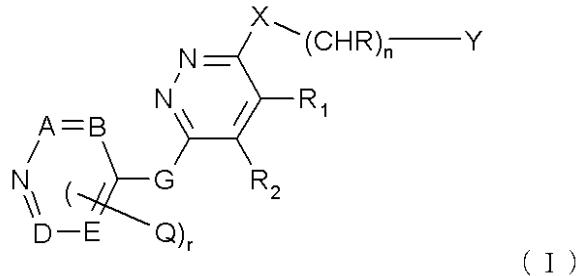
【請求項1】

活性成分として、4-ピリジルメチルフラジン誘導体を含む、温血動物における中皮腫を処置するための薬剤。

【請求項2】

活性成分として、式I

【化1】



〔式中

rは0～2であり、

nは0～2であり、

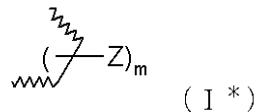
mは0～4であり、

R₁およびR₂は、

(i)低級アルキルもしくは、

(ii)一緒にになって、部分式I^{*}

【化2】

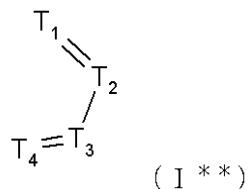


[結合は二つの末端炭素原子を介して達成される]

の架橋を形成するかまたは、

(i i i) 一緒になって部分式 I **

【化3】



[式中、環の構成員 T_1 、 T_2 、 T_3 および T_4 の 1 または 2 つは窒素であり、そして残りのものはそれぞれの場合において C H であり、そして結合は T_1 および T_4 を介して達成される]

の架橋を形成し；

A、B、D、およびEは互いに独立してNまたはC H であり、ただしこれらの基のうち2つ以下がNであり；

Gは低級アルキレン、アシルオキシまたはヒドロキシに置換された低級アルキレン、-C H₂-O-、-C H₂-S-、-C H₂-N H-、オキサ(-O-)、チア(-S-)、もしくはイミノ(-N H-)であり；

Qは低級アルキルであり；

RはHまたは低級アルキルであり；

Xはイミノ、オキサ、またはチアであり；

Yは置換または非置換アリール、ピリジル、もしくは置換または非置換シクロアルキルであり；そして

Zはアミノ、1または2置換のアミノ、ハロゲン、アルキル、置換アルキル、ヒドロキシ、エーテル化またはエステル化ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、カルボキシ、エステル化カルボキシ、アルカノイル、カルバモイル、N-モノもしくはN,N-ジ置換カルバモイル、アミジノ、グアニジノ、メルカブト、スルホ、フェニルチオ、フェニル-低級アルキルチオ、アルキルフェニルチオ、フェニルスルホニル、フェニル-低級アルキルスルフィニルまたはアルキルフェニルスルフィニルであり、1をこえるZ基が存在する場合には、置換基Zは互いに独立して同じかまたは異なるものであり；

および式中波線により特徴づけられる結合は、存在するならば、単結合または二重結合のいずれかである。]

で示される4-ピリジルメチルフタラジン誘導体、または、1つまたはそれ以上の窒素原子が酸素原子を担持する上記化合物のN-オキシド、もしくは少なくとも1つの塩形成基を有する上記化合物の塩を含む、請求項1に記載の薬剤。

【請求項3】

式Iで示す4-ピリジルメチル-フタラジン誘導体が1-(4-クロロアニリノ)-4-(4-ピリジルメチル)フタラジンである、請求項2に記載の薬剤。

【請求項4】

該疾患が胸膜中皮腫、腹膜中皮腫、心膜中皮腫、上皮性中皮腫、肉腫性中皮腫および二相性中皮腫から選択される、請求項1ないし3のいずれに記載の薬剤。

【請求項5】

温血動物がヒトである、請求項 1 ないし 4 のいずれかに記載の薬剤。

【請求項 6】

1 - (4 - クロロアニリノ) - 4 - (4 - ピリジルメチル) フタラジンまたはその薬学的に許容される塩を、患者に 1 日に 1 回の用法で、1000 mg / 日から 1400 mg / 日の範囲の用量で投与することを含む、請求項 5 に記載の薬剤。

【請求項 7】

1 日に 1 回の投与量が 1200 mg / 日から 1300 mg / 日である、請求項 6 に記載の薬剤。

【請求項 8】

1 日に 1 回の投与量が 1250 mg / 日である、請求項 6 に記載の薬剤。

【請求項 9】

外科手術および / または放射線療法との組み合わせにおいて、中皮腫に対して使用するための、活性成分として 4 ピリジルメチル - フタラジン誘導体、または、1 つまたはそれ以上の窒素原子が酸素原子を担持する上記化合物の N - オキシド、もしくは少なくとも 1 つの塩形成基を有する上記化合物の塩を含む、温血動物における中皮腫を処置するための薬剤。

【請求項 10】

4 ピリジルメチル - フタラジン誘導体とともに、中皮腫の処置におけるその使用のための指示書を含む、商品パッケージ。

【請求項 11】

中皮腫の処置のための医薬製造における 4 ピリジルメチル - フタラジン誘導体の使用。

【請求項 12】

4 ピリジルメチル - フタラジン誘導体が 1 - (4 - クロロアニリノ) - 4 - (4 - ピリジルメチル) フタラジン、もしくは遊離形または薬学的に許容される塩形の 1 - (4 - クロロアニリノ) - 4 - (4 - ピリジルメチル) フタラジンである、請求項 11 に記載の使用。

【請求項 13】

薬学的に許容される塩が 4 ピリジルメチル - フタラジン誘導体のコハク酸塩である、請求項 12 に記載の使用。