

【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】

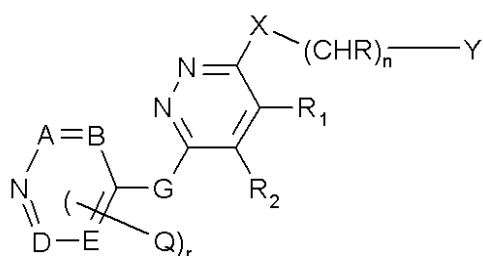
【請求項 1】

活性成分として、4 - ピリジルメチルフタ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】



( I )

〔式中〕

r は 0 ~ 2 であり、

n は 0 ~ 2 であり、

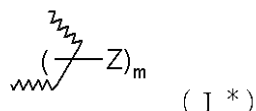
m は 0 ~ 4 であり、

R<sub>1</sub> および R<sub>2</sub> は、

( i ) 低級アルキルもしくは、

( i i ) 一緒になって、部分式 I \*

## 【化 2】

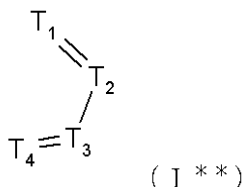


[ 結合は二つの末端炭素原子を介して達成される ]

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、 $-CH_2-O-$ 、 $-CH_2-S-$ 、 $-CH_2-NH-$ 、オキサ ( $-O-$ )、チア ( $-S-$ )、もしくはイミノ ( $-NH-$ ) 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、メルカプト、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、1 0 0 0 m g / 日から 1 4 0 0 m g / 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 1 2 0 0 m g / 日から 1 3 0 0 m g / 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 1 2 5 0 m g / 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。