

【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21年8月27日(2009.8.27)

【公表番号】特表2009-501234(P2009-501234A)

【公表日】平成21年1月15日(2009.1.15)

【年通号数】公開・登録公報2009-002

【出願番号】特願2008-521582(P2008-521582)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/395 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 7/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

C 0 7 D 225/06 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/395

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 7/00

A 6 1 P 35/02

C 0 7 D 225/06

【手続補正書】

【提出日】平成21年7月9日(2009.7.9)

【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

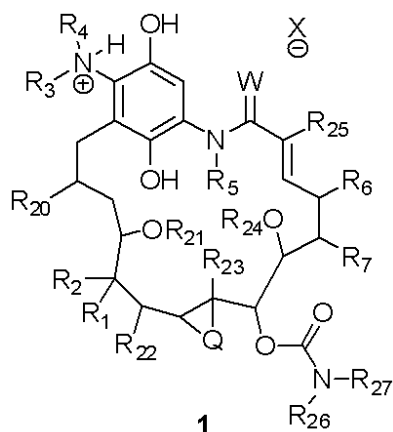
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

哺乳動物における 1 以上の消化管間質腫瘍の治療における使用のための医薬の製造における式1:

【化 1】



[式中、それぞれ独立して：

Wは酸素または硫黄であり；

Qは酸素、NR、N(アシル)または結合であり；

X⁻は医薬的に許容される酸の共役塩基であり；

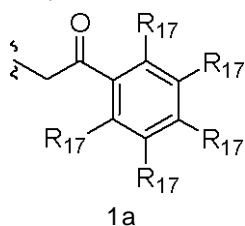
Rはそれぞれ、独立して水素、アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルからなる群から選択され；

R₁はヒドロキシル、アルコキシル、-OC(O)R₈、-OC(O)OR₉、-OC(O)NR₁₀R₁₁、-OSO₂R₁₂、-OC(O)NHSO₂NR₁₃R₁₄、-NR₁₃R₁₄またはハライドであり；R₂は水素、アルキルまたはアラルキルであるか；またはR₁およびR₂は結合している炭素と一緒にあって、-(C=O)-、-(C=N-O R)-、-(C=N-NHR)-または-(C=N-R)-を示し；

R₃およびR₄はそれぞれ、独立して水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルおよび-[(CR₂)_p]-R₁₆からなる群から選択されるか；またはR₃はR₄と一緒にあって、適宜置換されていてもよい4-8員ヘテロ環を示し；

R₅はH、アルキル、アラルキルおよび式1a：

【化 2】



(式中、R₁₇は独立して水素、ハライド、ヒドロキシル、アルコキシル、アリールオキシ、アシルオキシ、アミノ、アルキルアミノ、アリールアミノ、アシルアミノ、アラルキルアミノ、ニトロ、アシルチオ、カルボキサミド、カルボキシル、ニトリル、-COR₁₈、-CO₂R₁₈、-N(R₁₈)CO₂R₁₉、-OC(O)N(R₁₈)(R₁₉)、-N(R₁₈)SO₂R₁₉、-N(R₁₈)C(O)N(R₁₈)(R₁₉)および-CH₂O-ヘテロシクリルからなる群から選択される)

で示される基からなる群から選択され；

R₆およびR₇はともに水素であるか；またはR₆およびR₇は一緒になって結合を形成し；

R₈は水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルまたは-[(CR₂)_p]-R₁₆であり；

R₉はアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルまたは-[(CR₂)_p]-R₁₆であり；

R₁₀およびR₁₁はそれぞれ、独立して水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルおよび-[(CR₂)_p]-R₁₆からなる群から選択されるか；またはR₁₀およびR₁₁はそれら

が結合している窒素と一緒にあって、適宜置換されていてもよい4-8員ヘテロ環を示し；

R_{12} はアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルまたは $-(CR_2)_p-R_{16}$ であり；

R_{13} および R_{14} はそれぞれ、独立して水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロアラルキルおよび $-(CR_2)_p-R_{16}$ からなる群から選択されるか；または R_{13} および R_{14} はそれらが結合している窒素と一緒にあって、適宜置換されていてもよい4-8員ヘテロ環を示し；

R_{16} はそれぞれ、独立して水素、ヒドロキシル、アシルアミノ、 $-N(R_{18})COR_{19}$ 、 $-N(R_{18})C(O)OR_{19}$ 、 $-N(R_{18})SO_2(R_{19})$ 、 $-CON(R_{18})(R_{19})$ 、 $-OC(O)N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-SO_2N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-N(R_{18})(R_{19})$ 、 $-OC(O)OR_{18}$ 、 $-COOR_{18}$ 、 $-C(O)N(OH)(R_{18})$ 、 $-OS(O)_2OR_{18}$ 、 $-S(O)_2OR_{18}$ 、 $-OP(O)(OR_{18})(OR_{19})$ 、 $-N(R_{18})P(O)(OR_{18})(OR_{19})$ および $-P(O)(OR_{18})(OR_{19})$ からなる群から選択され；

p は1、2、3、4、5または6であり；

R_{18} はそれぞれ、独立して水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルからなる群から選択され；

R_{19} はそれぞれ、独立して水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルからなる群から選択されるか；または R_{18} は R_{19} と一緒にあって、適宜置換されていてもよい4-8員環であり；

R_{20} 、 R_{21} 、 R_{22} 、 R_{24} および R_{25} はそれぞれ、独立してアルキルであり；

R_{23} はアルキル、 $-CH_2OH$ 、 $-CHO$ 、 $-COOR_{18}$ または $-CH(OR_{18})_2$ であり；

R_{26} および R_{27} はそれぞれ、独立して水素、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アラルキル、ヘテロアリールおよびヘテロアラルキルからなる群から選択され；

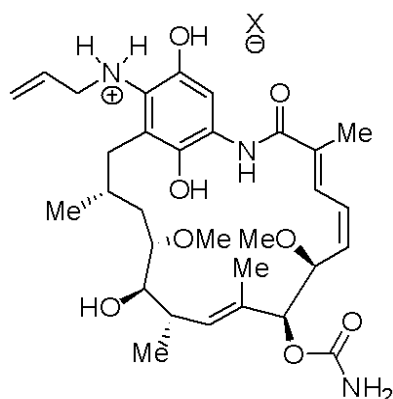
式1の立体中心における絶対立体化学はRもしくはSまたはその混合であることができ、二重結合の立体化学はEもしくはZまたはその混合であることができる]

で示されるヒドロキノンアンサマイシン化合物の使用。

【請求項2】

ヒドロキノンアンサマイシン化合物が式3：

【化3】



3

[式中、 X^- はクロリド、ブロミド、ヨーダイド、 $H_2PO_4^-$ 、 HSO_4^- 、メチルスルホネート、ベンゼンスルホネート、p-トルエンスルホネート、トリフルオロメチルスルホネート、10-カンファースルホネート、ナフタレン-1-スルホン酸-5-スルホネート、エタン-1-スルホン酸-2-スルホネート、シクラミン酸塩、チオシアン酸塩、ナフタレン-2-スルホネートおよびシュウ酸塩からなる群から選択される]

で示される請求項1記載の使用。

【請求項3】

ヒドロキノンアンサマイシン化合物が17-アリルアミノ-17-デメトキシ-18,21-ジヒドロゲルダナマイシンの医薬的に許容される塩である、請求項1記載の使用。

【請求項4】

ヒドロキノンアンサマイシンが17-アリルアミノ-17-デメトキシ-18,21-ジヒドロゲルダナマイシンの塩酸塩である、請求項1記載の使用。

【請求項5】

哺乳動物がヒトである、請求項1～4のいずれか記載の使用。

【請求項6】

ヒドロキノンアンサマイシン化合物の投与方法が吸入、経口、静脈内、舌下、眼内、経皮、直腸、腔内、局所、筋肉内、動脈内、髄腔内、皮下、口腔または鼻腔である、請求項1～5のいずれか記載の使用。