

【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23年3月10日 (2011.3.10)

【公表番号】特表2010-529193(P2010-529193A)

【公表日】平成22年8月26日 (2010.8.26)

【年通号数】公開・登録公報2010-034

【出願番号】特願2010-512173(P2010-512173)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

C 0 7 D 403/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 27/06 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 19/06 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 17/14 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 405/14

A 6 1 K 31/506

C 0 7 D 403/14

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 403/12

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 27/06

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 9/10 1 0 1

A 6 1 P 17/02

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 19/06

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 17/14

【手続補正書】

【提出日】平成23年1月24日(2011.1.24)

【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

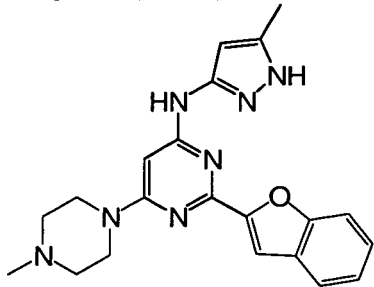
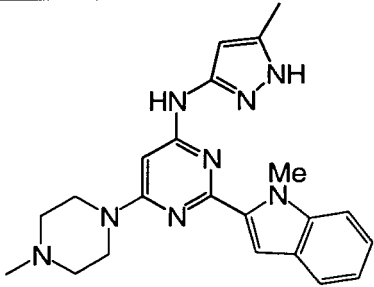
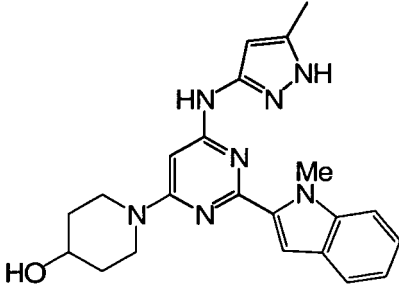
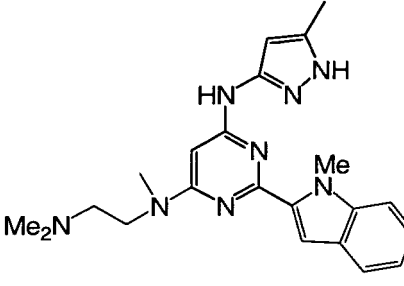
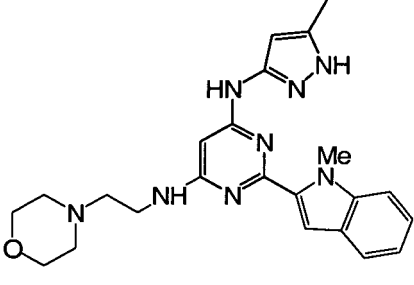
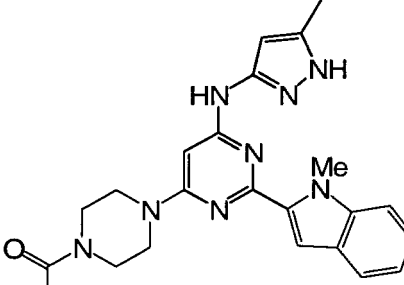
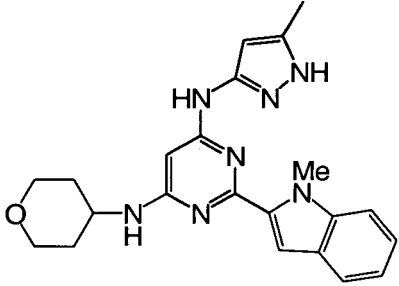
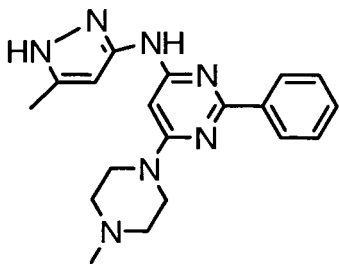
【補正の内容】

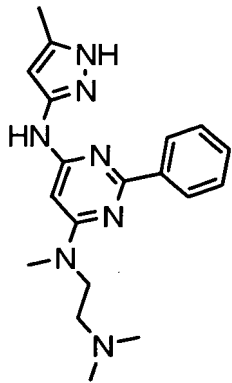
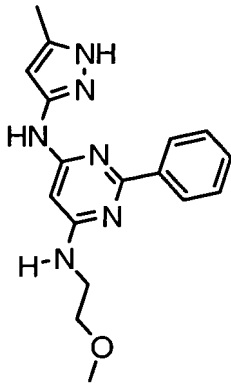
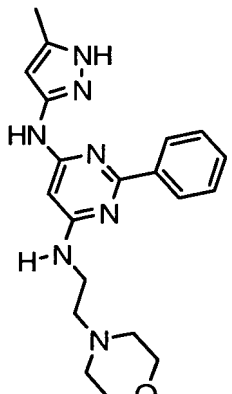
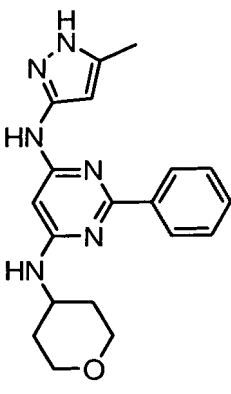
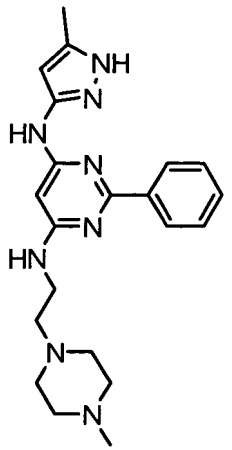
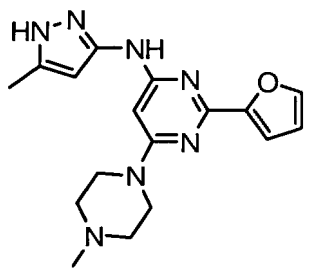
【特許請求の範囲】

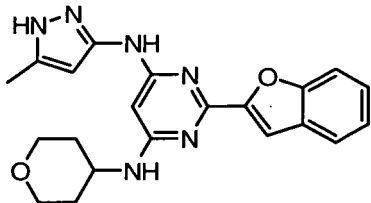
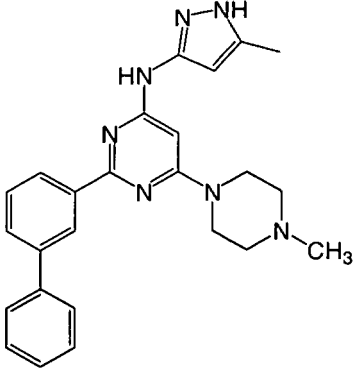
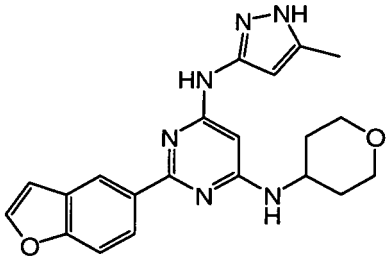
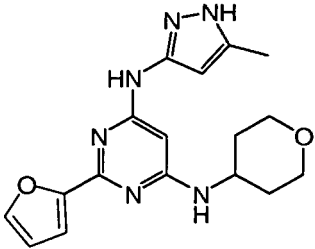
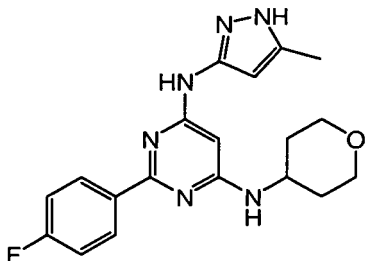
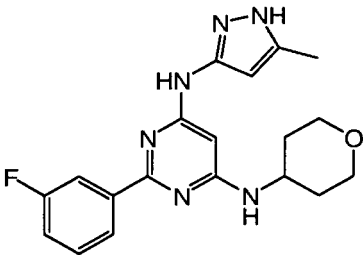
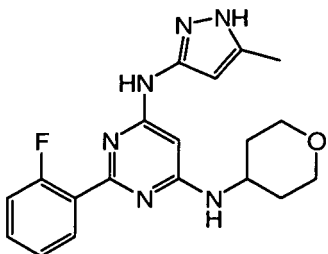
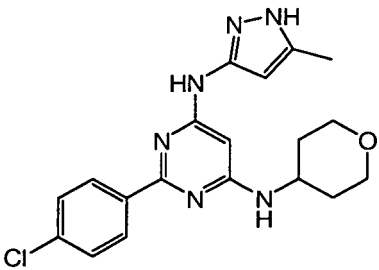
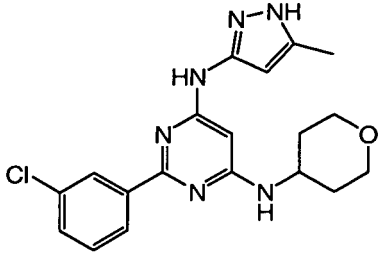
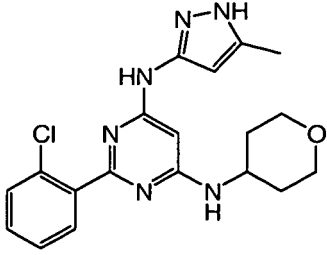
【請求項 1】

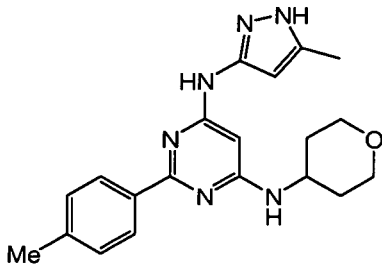
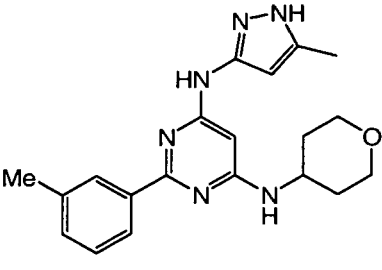
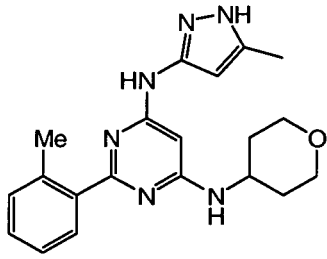
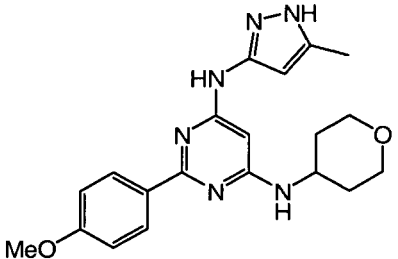
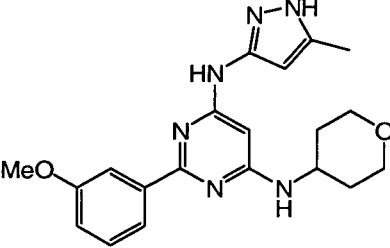
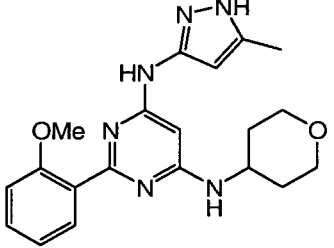
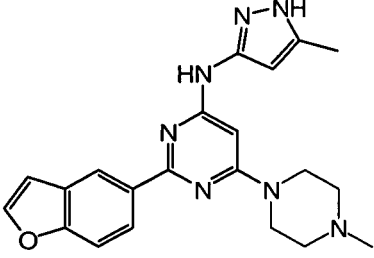
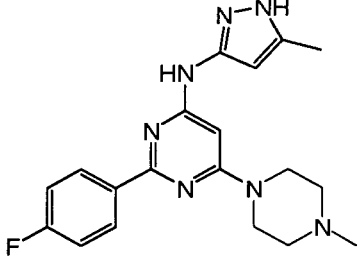
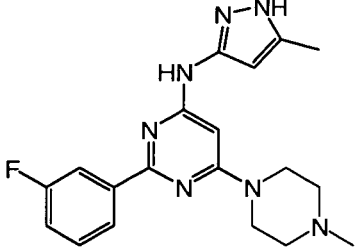
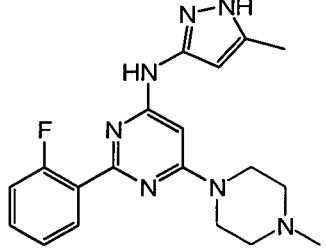
以下の群から選択される化合物、およびこれらの生物学的に受容可能な塩またはプロドラッグ：

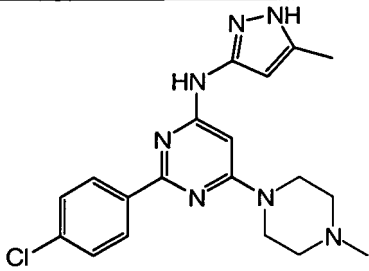
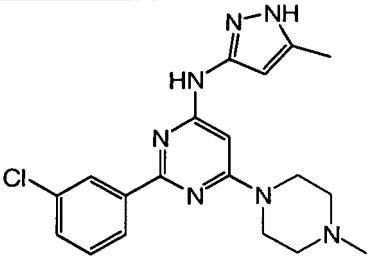
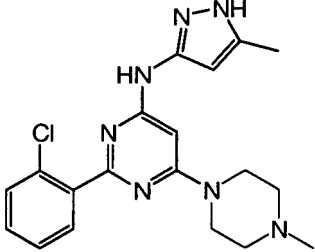
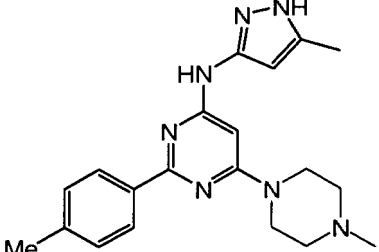
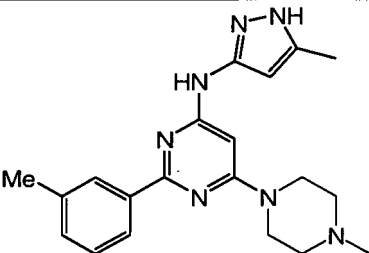
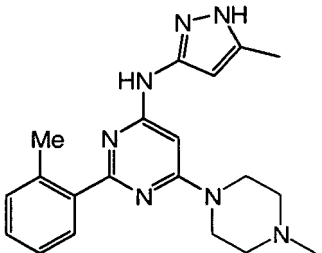
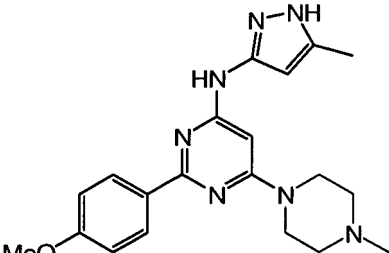
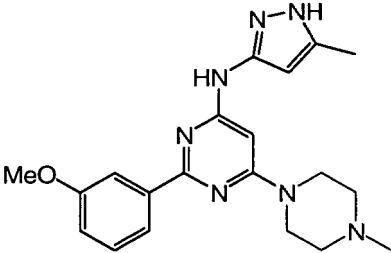
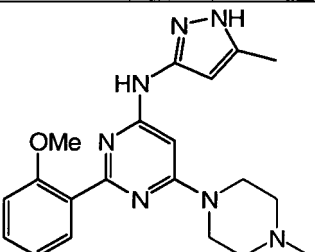
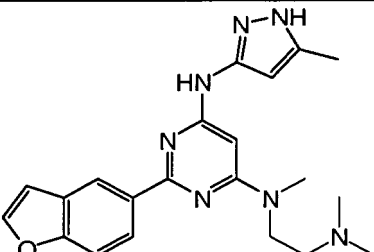
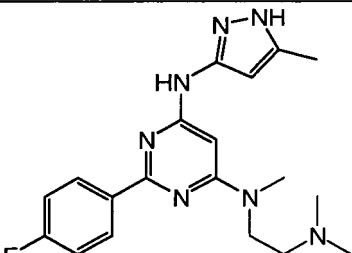
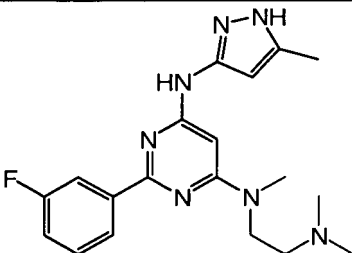
【表 1】

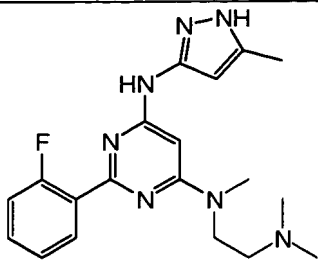
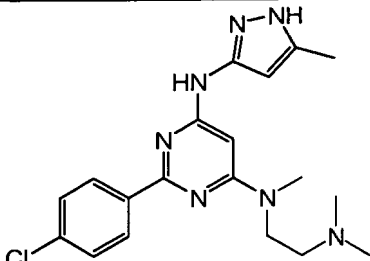
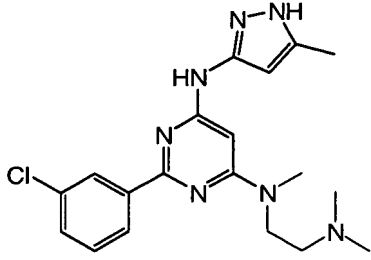
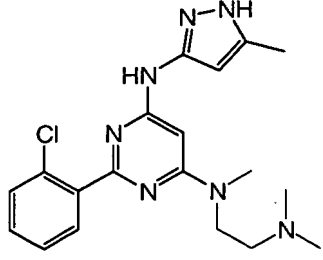
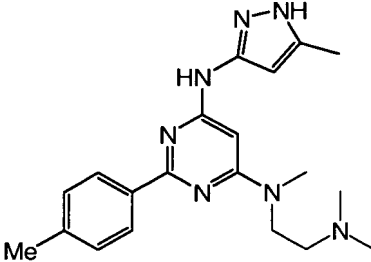
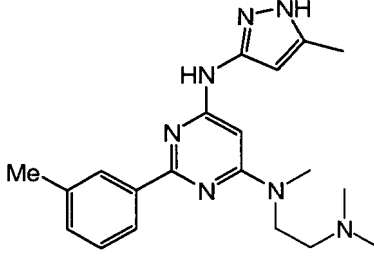
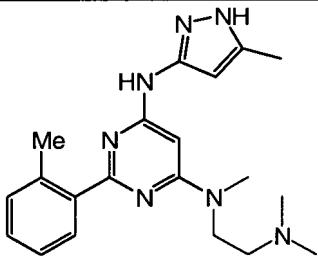
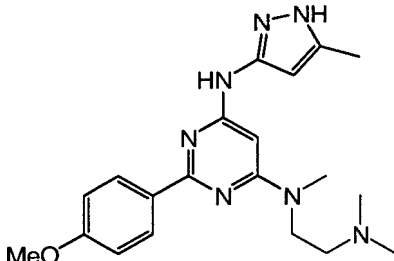
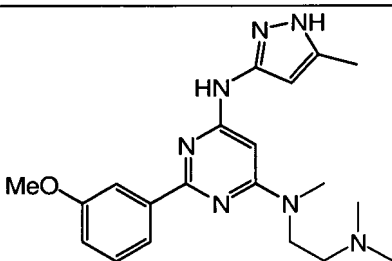
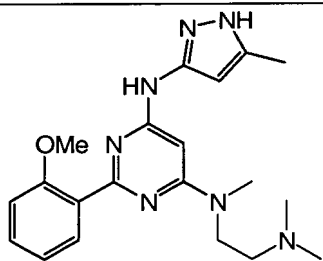
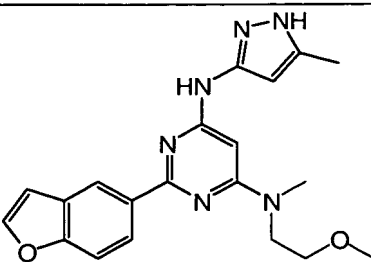
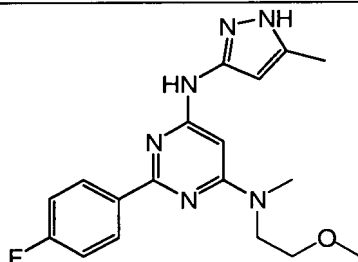
化合物番号	構造	化合物番号	構造
1		2	
3		4	
5		6	
7		8	

9		10	
11		12	
13		14	

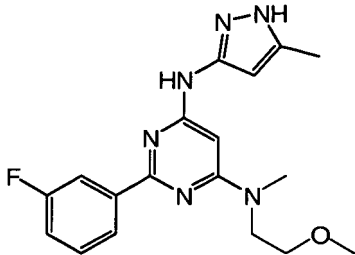
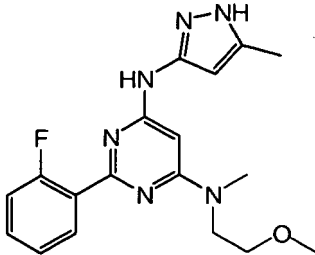
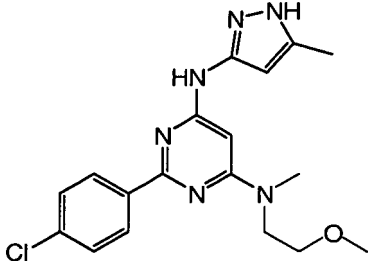
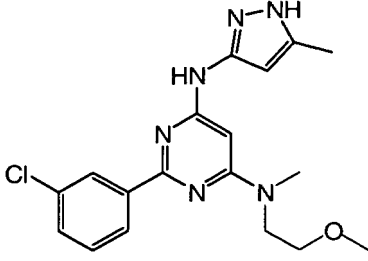
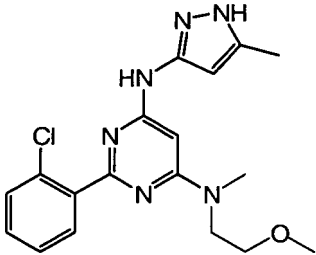
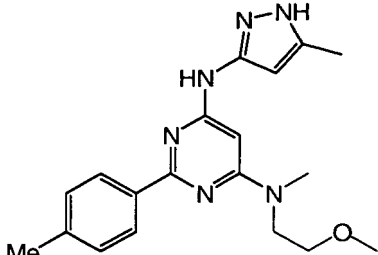
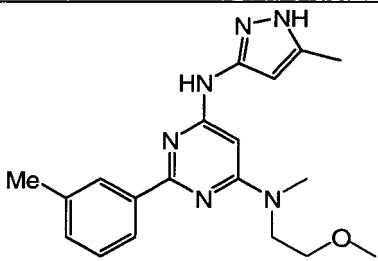
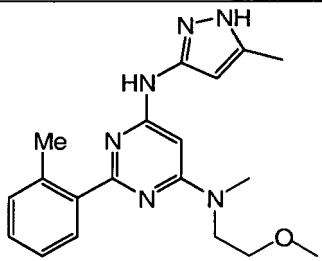
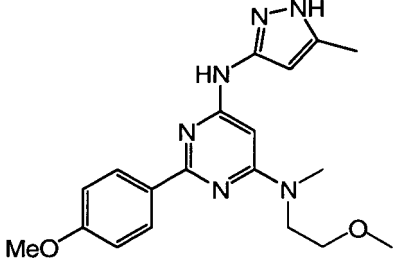
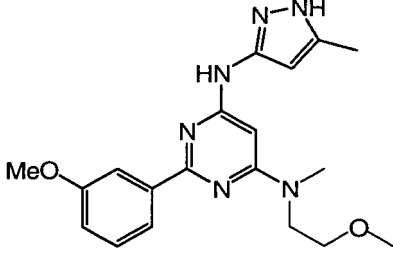
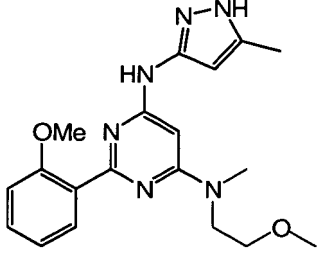
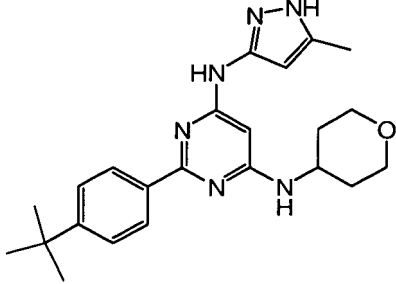
15		16	
17		18	
19		20	
21		22	
23		24	

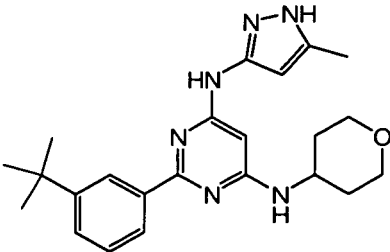
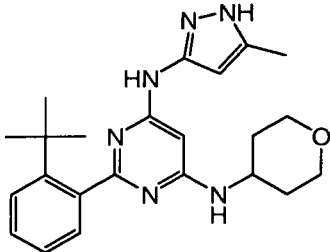
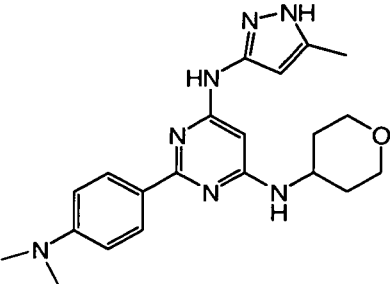
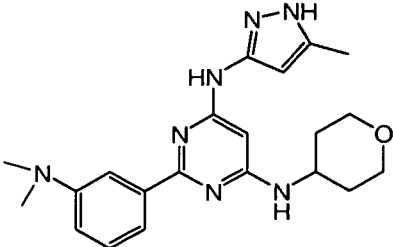
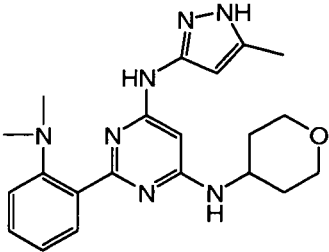
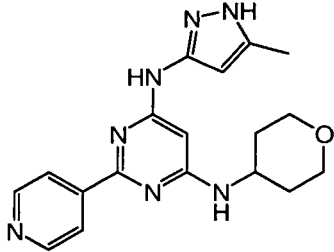
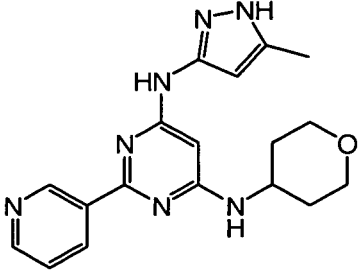
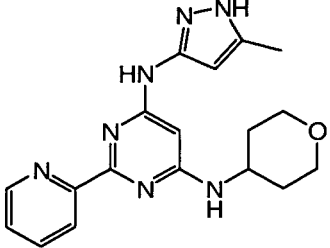
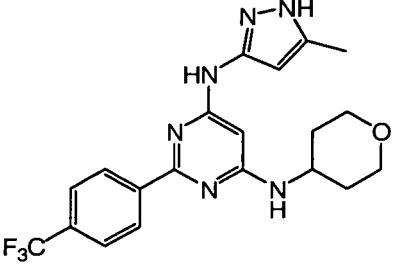
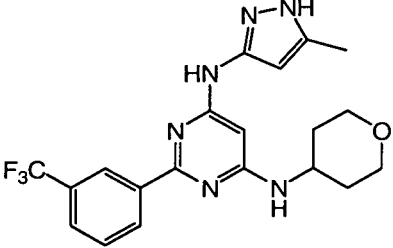
25		26	
27		28	
29		30	
31		32	
33		34	

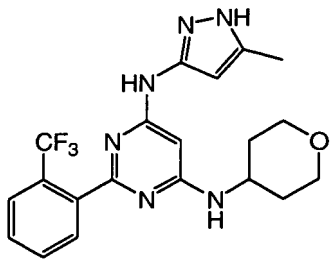
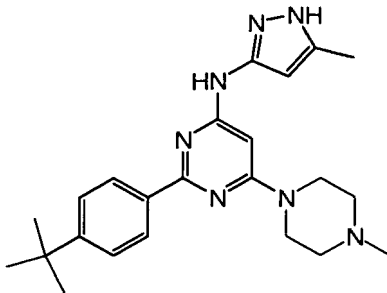
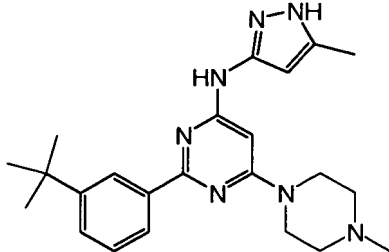
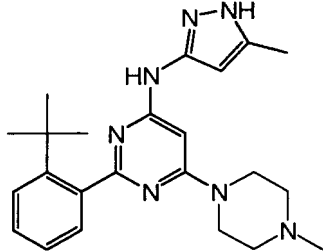
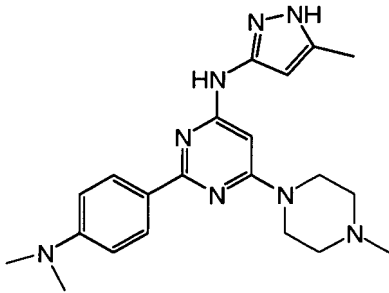
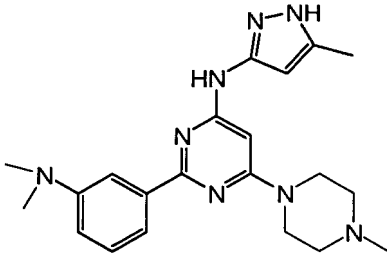
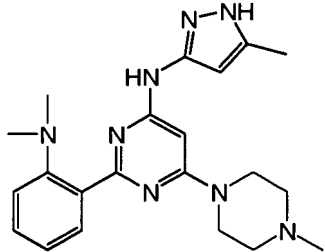
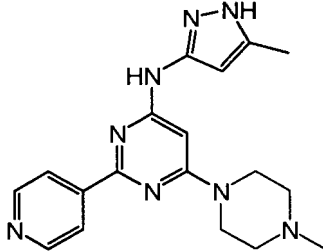
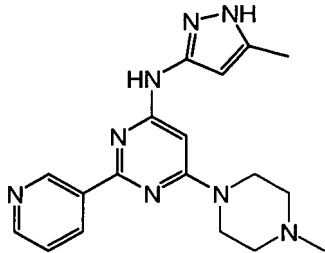
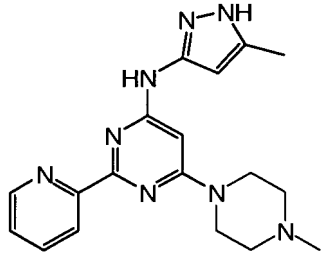
35		36	
37		38	
39		40	
41		42	
43		44	
45		46	

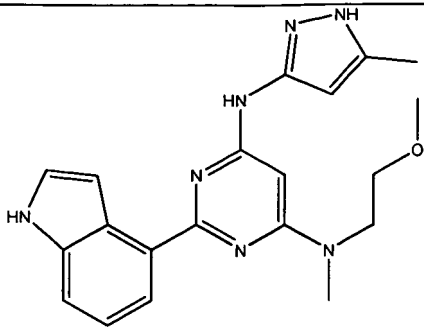
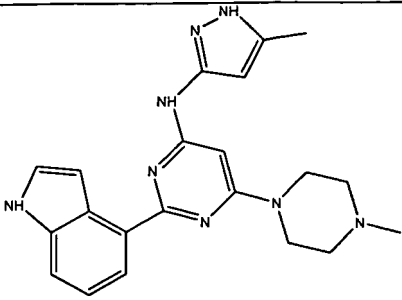
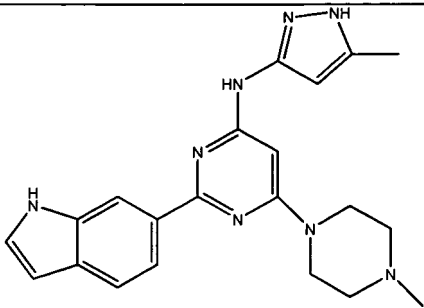
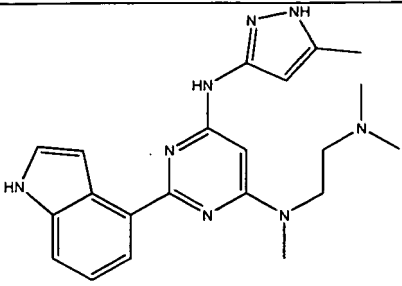
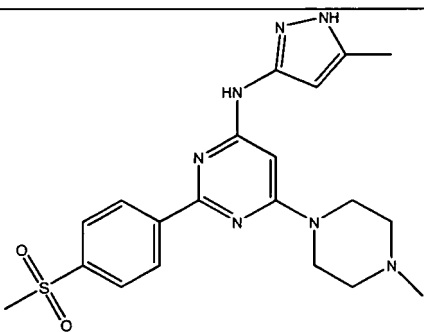
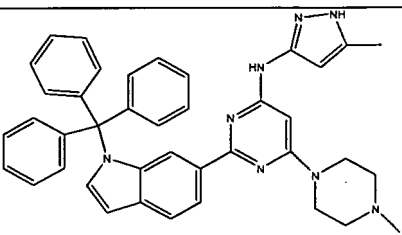
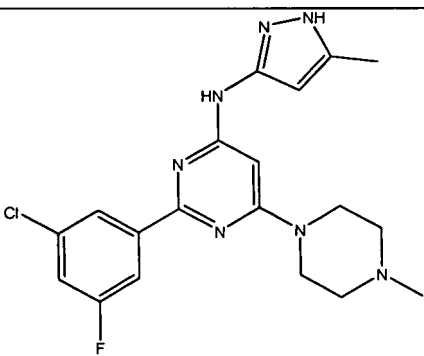
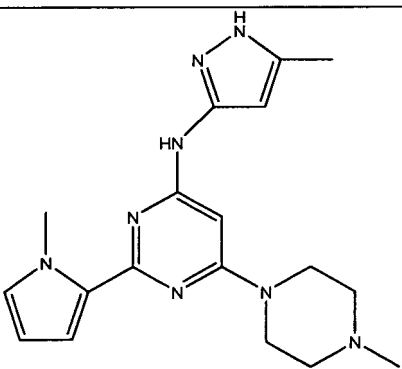
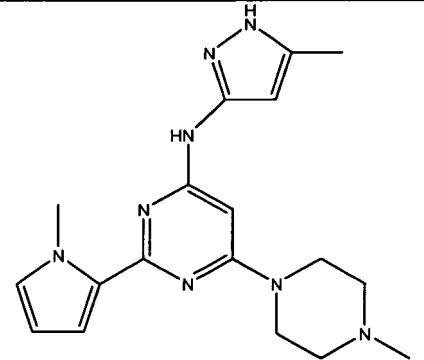
47		48	
49		50	
51		52	
53		54	
55		56	
57		58	

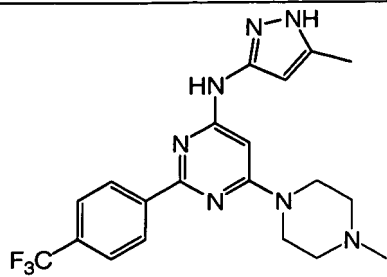
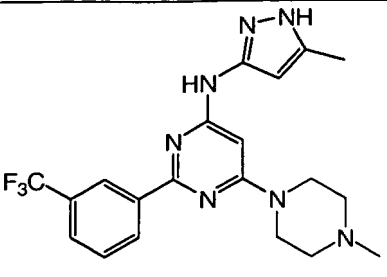
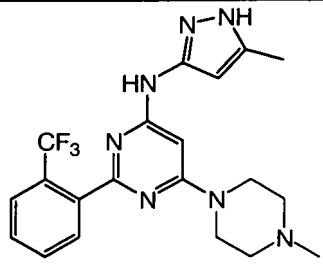
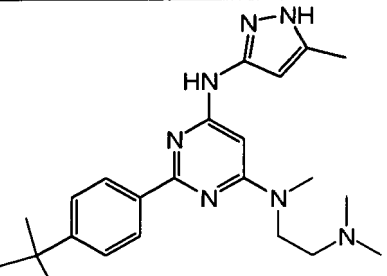
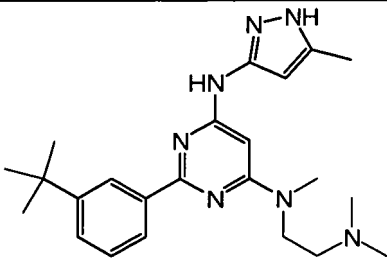
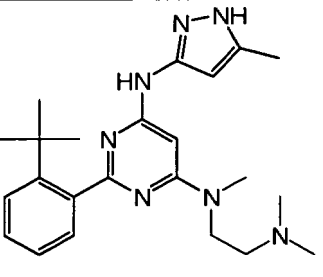
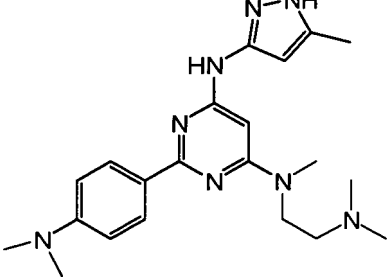
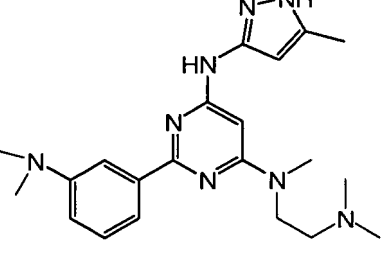
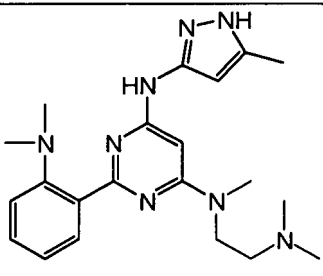
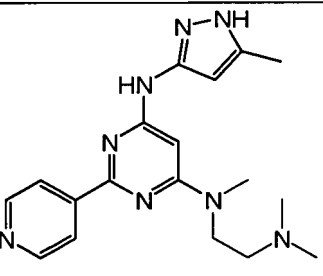
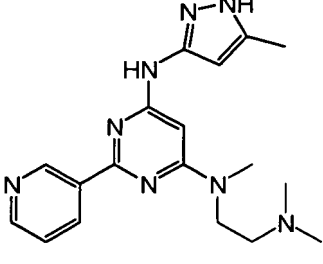
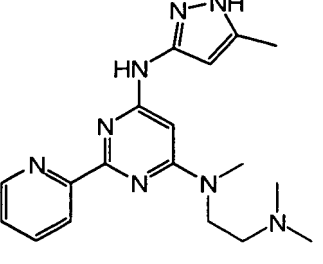


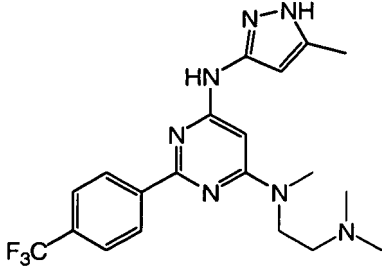
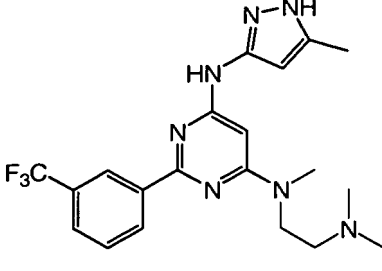
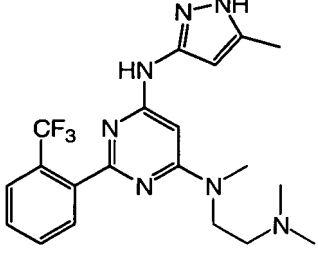
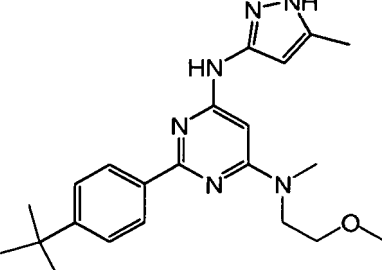
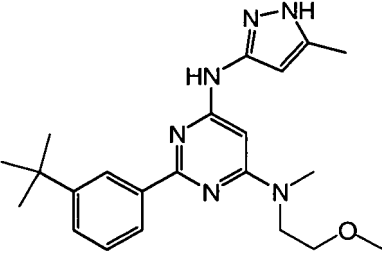
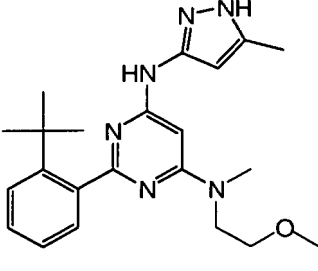
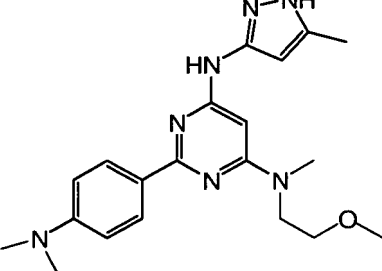
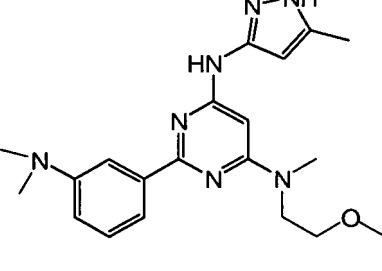
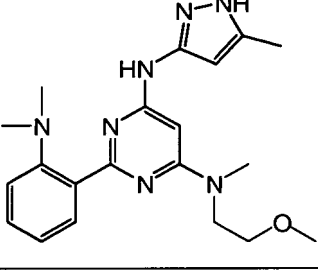
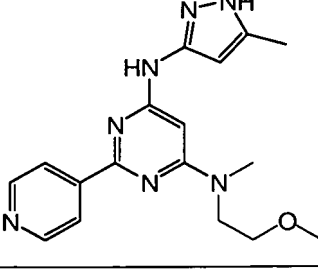
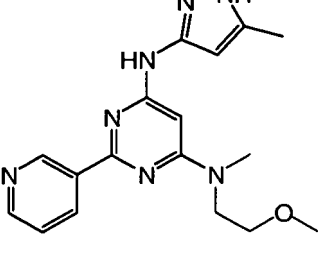
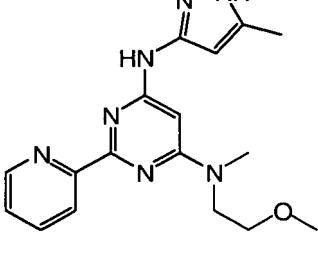
59		60	
61		62	
63		64	
65		66	
67		68	
69		70	

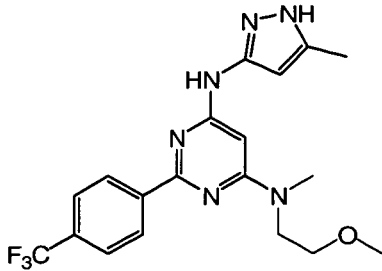
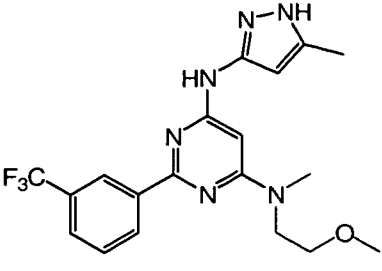
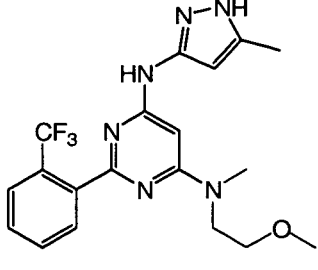
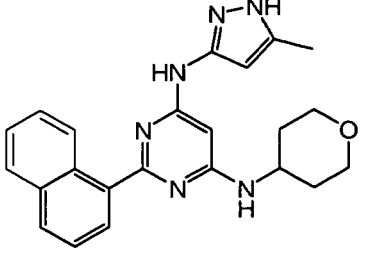
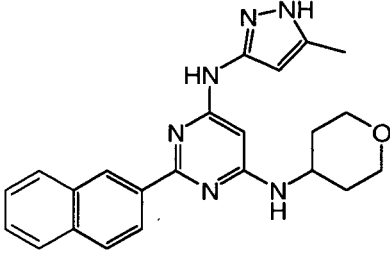
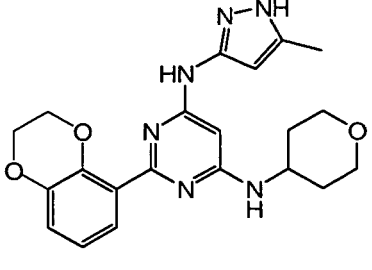
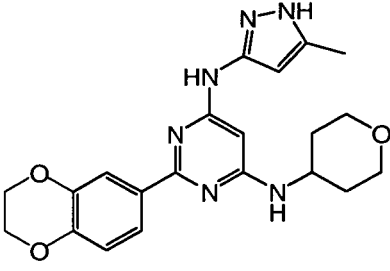
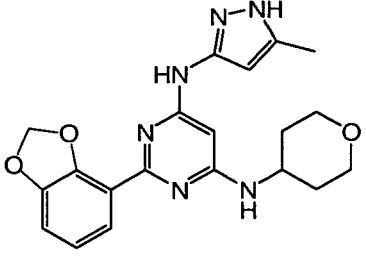
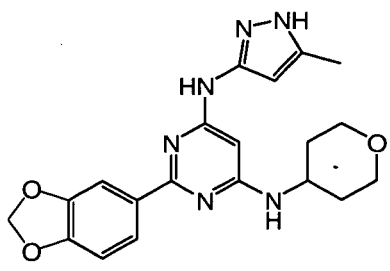
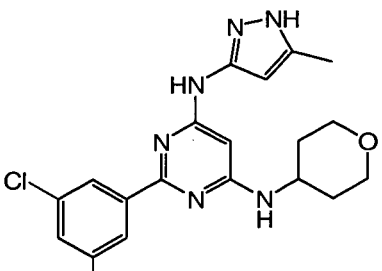
71		72	
73		74	
75		76	
77		78	
79		80	

81		82	
83		84	
85		86	
87		88	
89		90	

91		92	
93		94	
95		96	
97		98	
99			

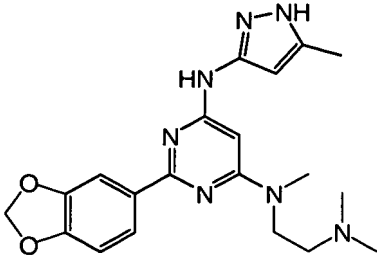
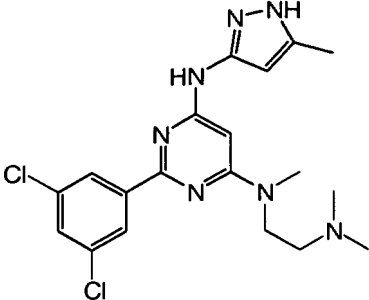
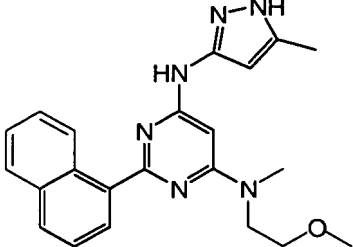
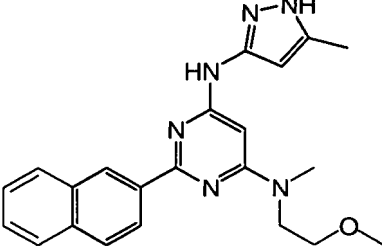
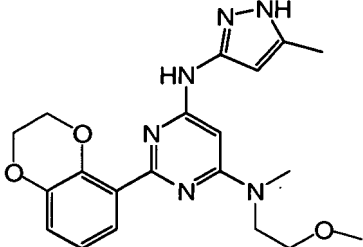
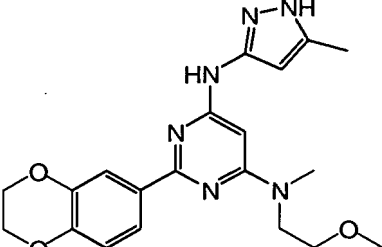
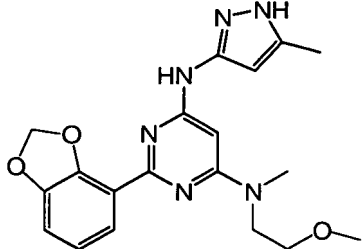
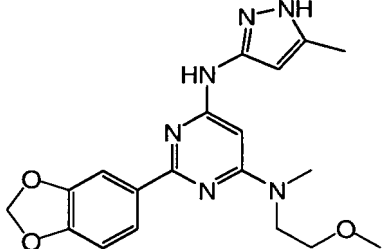
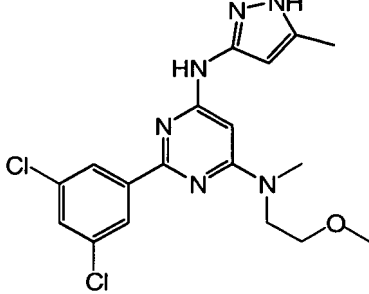
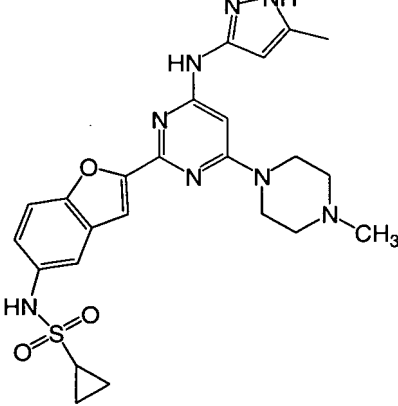
100		101	
102		103	
104		105	
106		107	
108		109	
110		111	

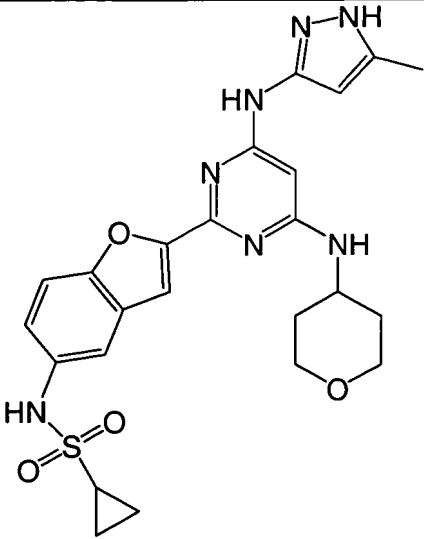
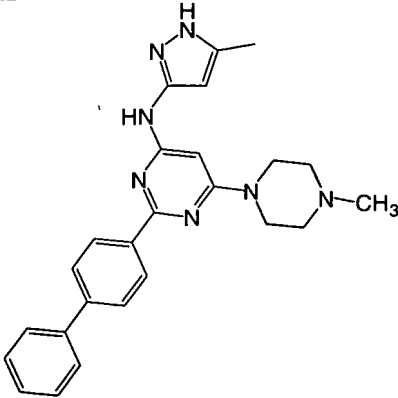
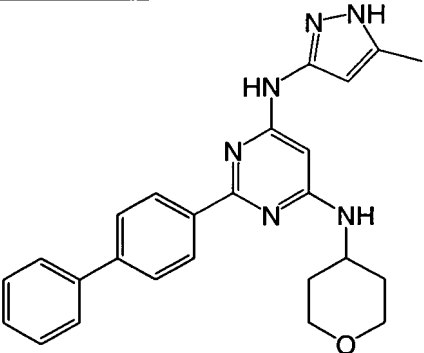
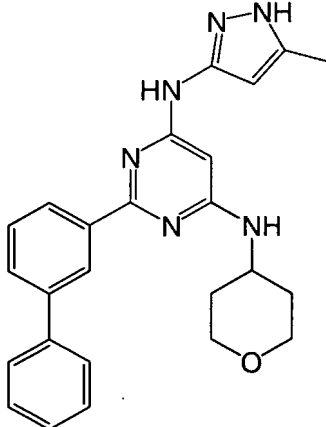
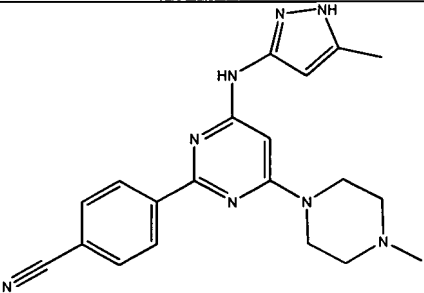
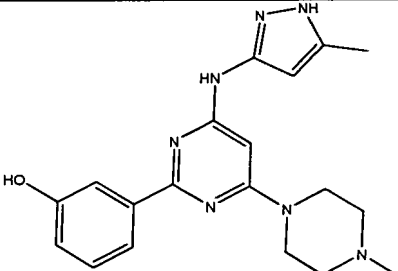
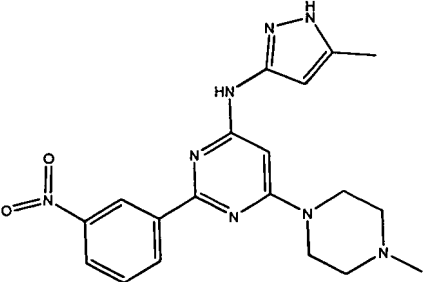
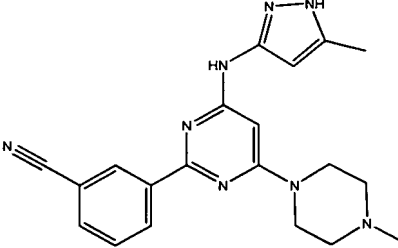
112		113	
114		115	
116		117	
118		119	
120		121	
122		123	

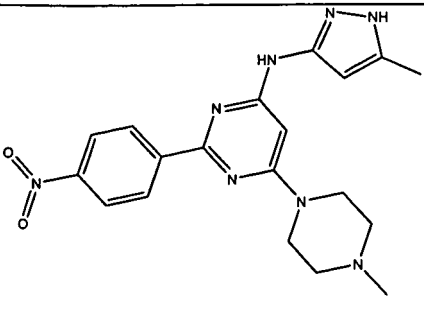
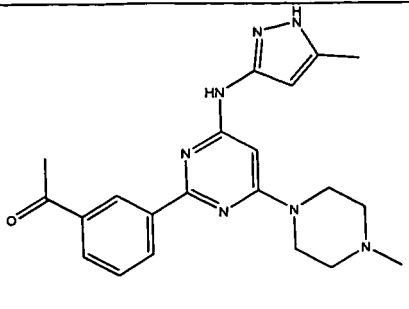
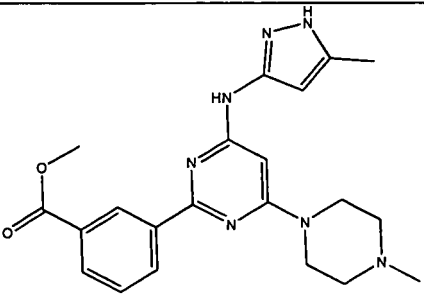
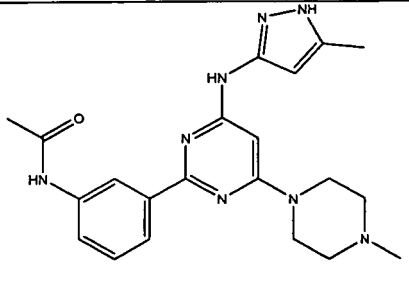
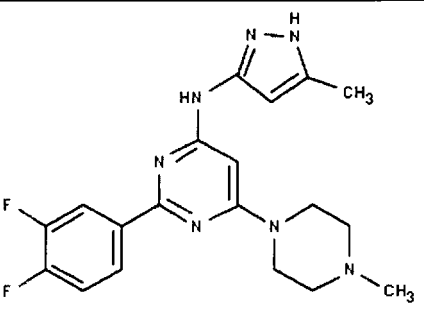
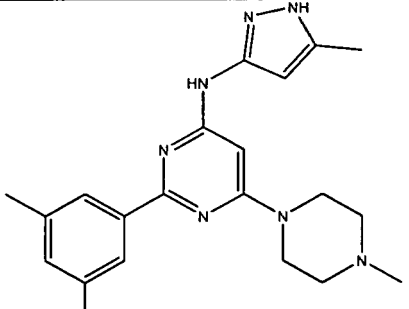
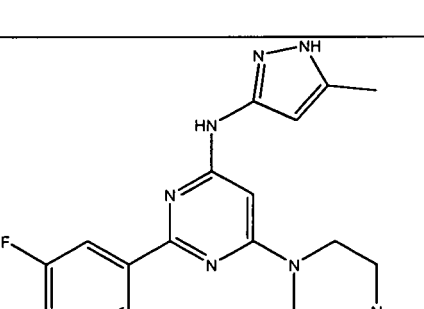
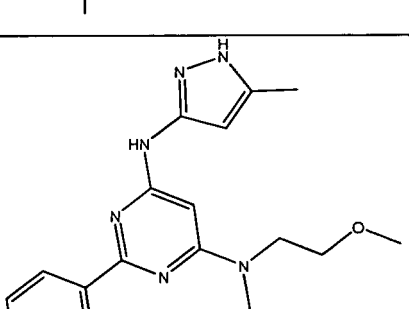
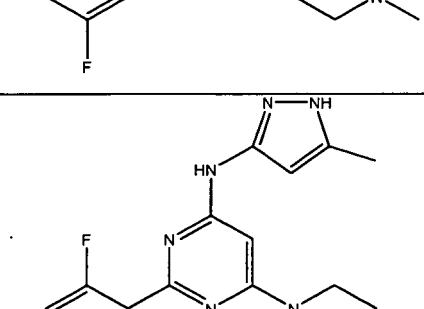
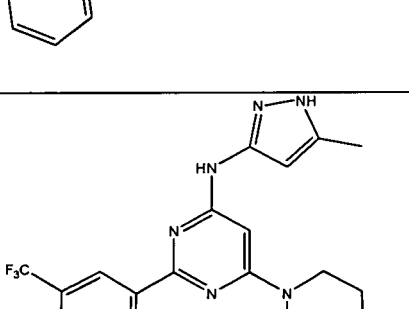
124		125	
126		127	
128		129	
130		131	
132		133	

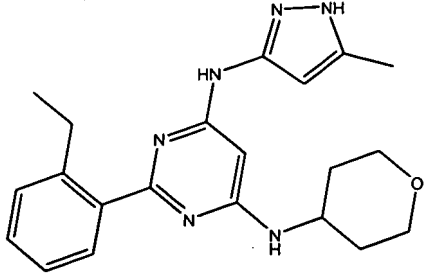
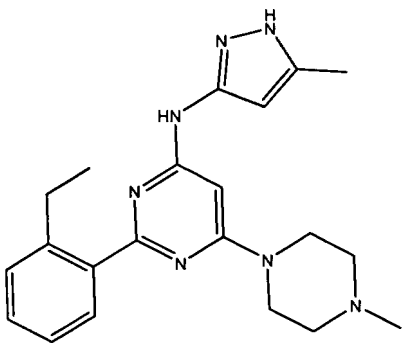
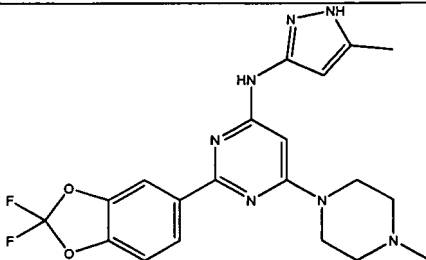
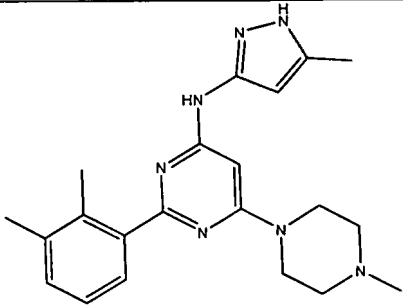
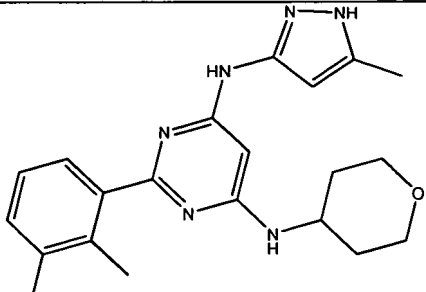
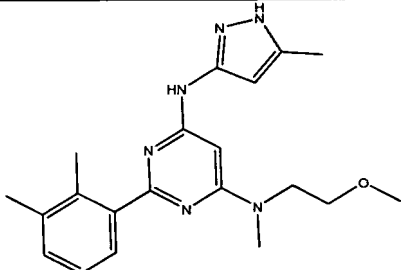
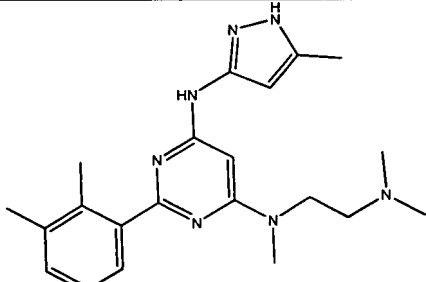
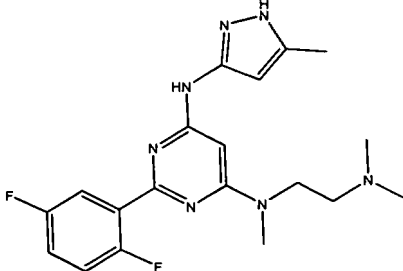
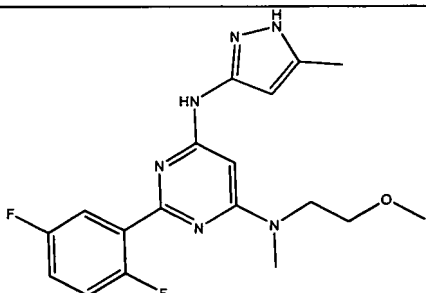
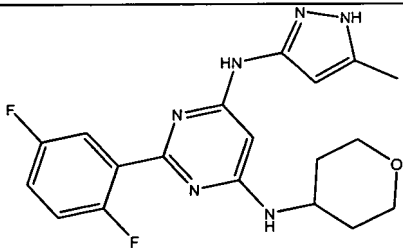
134	<chem>Cc1nc[nH]1NC2=NC(=C(NC3=CC=C(C=C3)N)N=C(NC4=CC=C(C=C4)N)N2C5=CC=C(C=C5)Cl</chem>	135	<chem>Cc1nc[nH]1NC2=NC(=C(NC3=CC=C(C=C3)N)N=C(NC4=CC=C(C=C4)N)N2C5=CC=C(C=C5)Cl</chem>
136	<chem>Cc1nc[nH]1NC2=NC(=C(NC3=CC=C(C=C3)N)N=C(NC4=CC=C(C=C4)N)N2C5=CC=C(C=C5)Cl</chem>	137	<chem>Cc1nc[nH]1NC2=NC(=C(NC3=CC=C(C=C3)N)N=C(NC4=CC=C(C=C4)N)N2C5=CC=C(C=C5)Cl</chem>
138	<chem>Cc1nc[nH]1NC2=NC(=C(NC3=CC=C(C=C3)N)N=C(NC4=CC=C(C=C4)N)N2C5=CC=C(C=C5)Cl</chem>	139	<chem>Cc1nc[nH]1NC2=NC(=C(NC3=CC=C(C=C3)N)N=C(NC4=CC=C(C=C4)N)N2C5=CC=C(C=C5)Cl</chem>
140	<chem>Cc1nc[nH]1NC2=NC(=C(NC3=CC=C(C=C3)N)N=C(NC4=CC=C(C=C4)N)N2C5=CC=C(C=C5)Cl</chem>	141	<chem>Cc1nc[nH]1NC2=NC(=C(NC3=CC=C(C=C3)N)N=C(NC4=CC=C(C=C4)N)N2C5=CC=C(C=C5)Cl</chem>
142	<chem>Cc1nc[nH]1NC2=NC(=C(NC3=CC=C(C=C3)N)N=C(NC4=CC=C(C=C4)N)N2C5=CC=C(C=C5)Cl</chem>	143	<chem>Cc1nc[nH]1NC2=NC(=C(NC3=CC=C(C=C3)N)N=C(NC4=CC=C(C=C4)N)N2C5=CC=C(C=C5)Cl</chem>
144	<chem>Cc1nc[nH]1NC2=NC(=C(NC3=CC=C(C=C3)N)N=C(NC4=CC=C(C=C4)N)N2C5=CC=C(C=C5)Cl</chem>	145	<chem>Cc1nc[nH]1NC2=NC(=C(NC3=CC=C(C=C3)N)N=C(NC4=CC=C(C=C4)N)N2C5=CC=C(C=C5)Cl</chem>

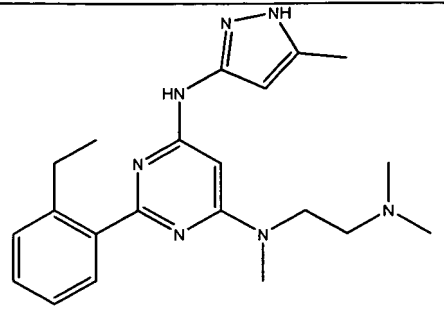
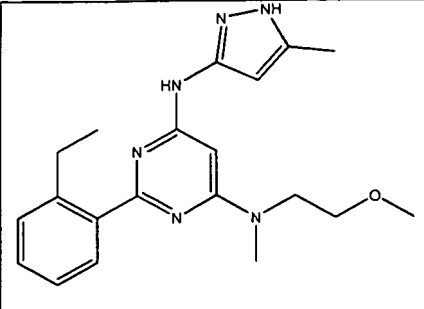
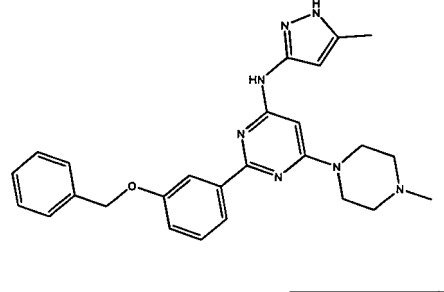
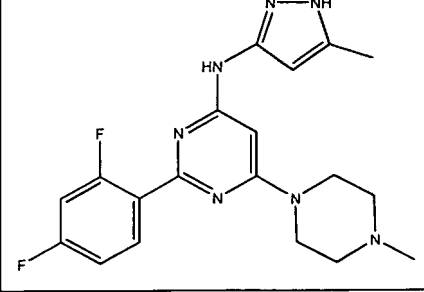
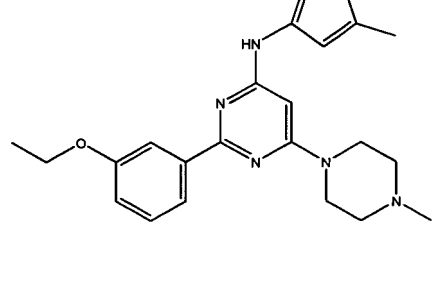
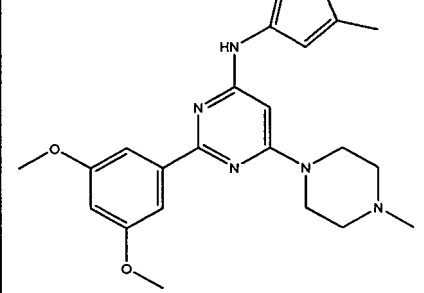
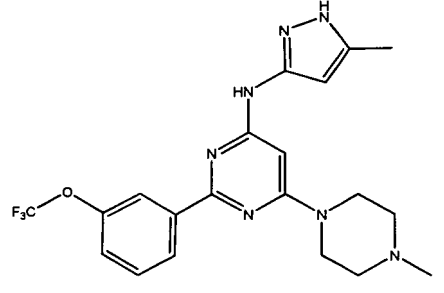
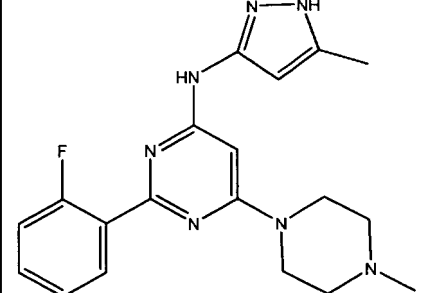
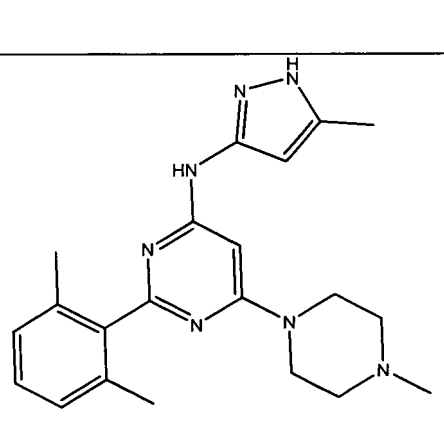
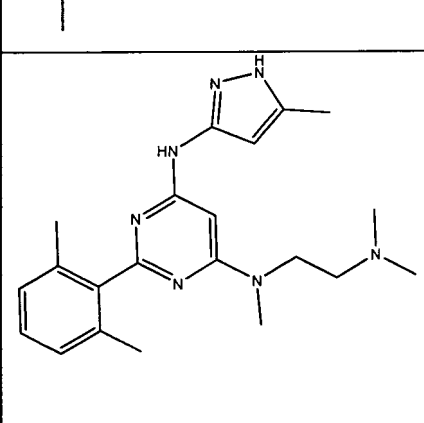


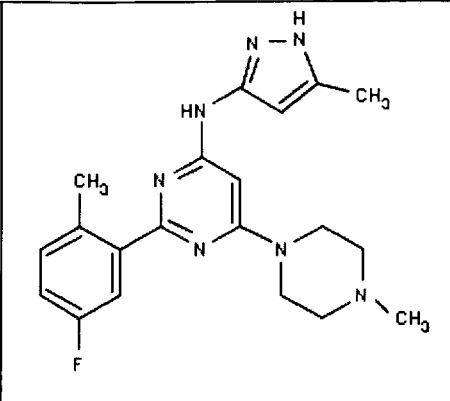
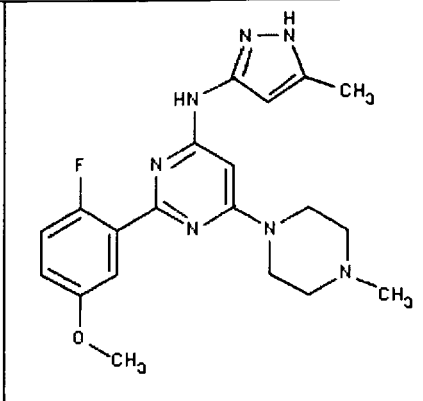
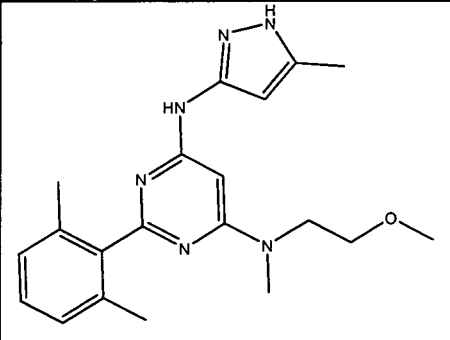
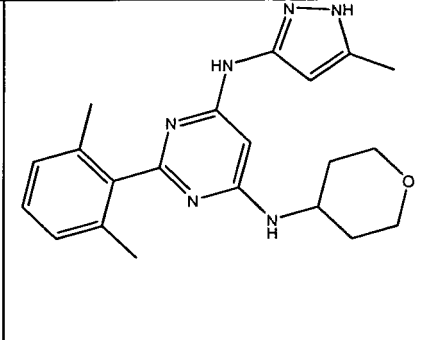
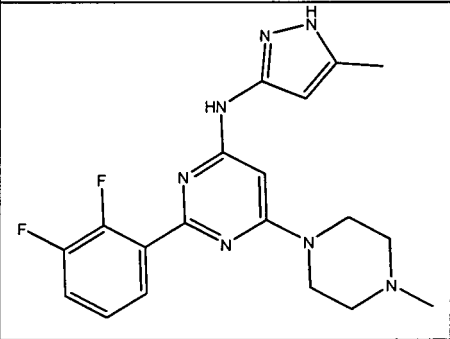
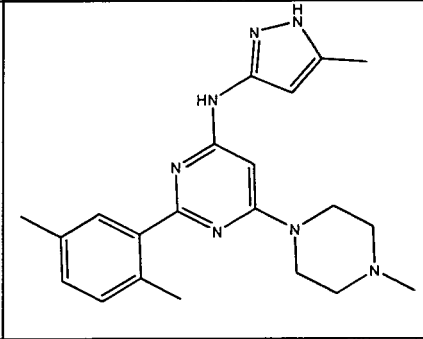
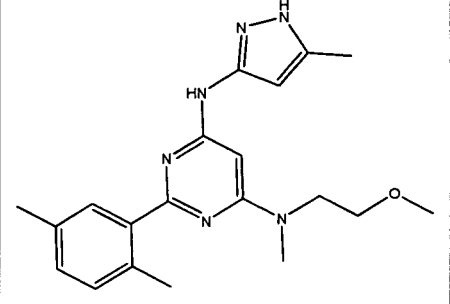
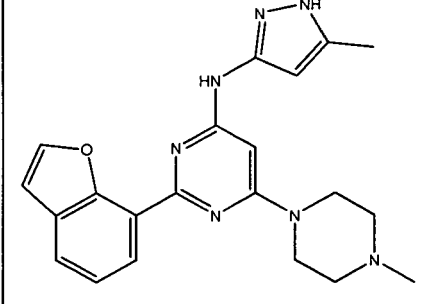
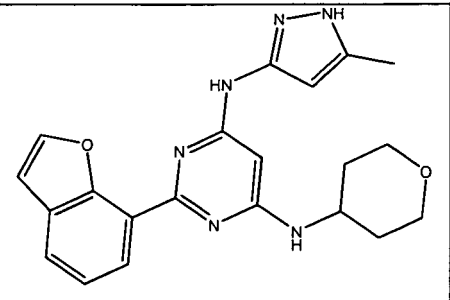
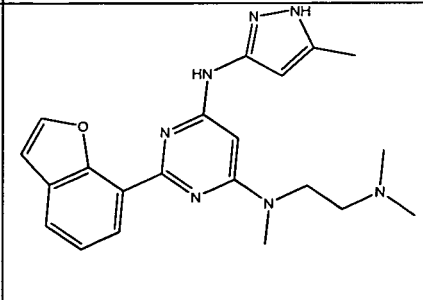
146		147	
148		149	
150		151	
152		153	
154		155	

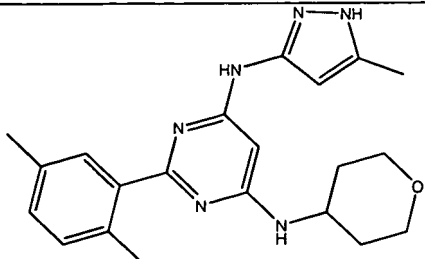
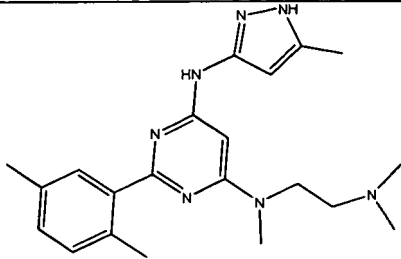
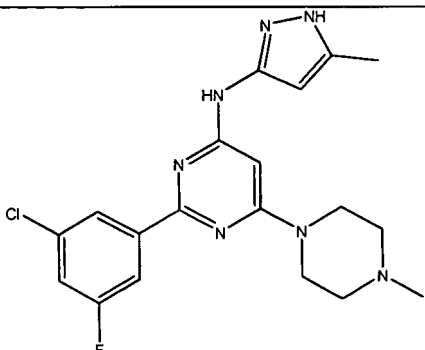
156		157	
158		159	
160		161	
162		163	

164		165	
166		167	
168		169	
170		171	
172		173	

174		175	
178		179	
180		181	
182		183	
184		185	

186		187	
188		189	
190		191	
192		193	
194		195	

196		197	
198		199	
200		201	
202		203	
204		205	

206		207	
208			

## 【請求項 2】

薬学的に受容可能なキャリア、アジュバントまたはビヒクルと組み合わせられた、オーロラキナーゼ A の阻害に有効な量の請求項 1 の化合物を含む、医薬組成物。

## 【請求項 3】

前記組成物は、約 2 ミクロン未満の平均粒径である粒子を含む、請求項 2 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 4】

前記組成物が、生分解性または非生分解性の重合体に取り込まれる、請求項 2 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 5】

請求項 1 から選択される化合物、および添加剤を含む、請求項 2 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 6】

前記添加剤が、抗酸化剤、緩衝剤、静菌薬、液体キャリア、溶質、懸濁化剤、増粘剤、香料添加剤、ゼラチン、グリセリン、結合剤、滑剤、不活性希釈剤、防腐剤、界面活性剤、分散剤、生分解性高分子またはその何れかの組み合わせから選択される、請求項 5 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 7】

前記キャリアが経口、非経口、吸入、局所的または皮内投与に適している、請求項 2 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 8】

疾患を有する非ヒト動物に、有効量の請求項 1 に記載の化合物、塩またはプロドラッグより選択される化合物、塩またはプロドラッグを投与することを含む、疾患を有する非ヒト動物を治療する方法であって、前記疾患が自己免疫疾患、炎症性疾患、神経性疾患または神経変性疾患、癌、循環器疾患、アレルギー、喘息またはホルモン関連の疾患である、方法。

## 【請求項 9】

癌を有する非ヒト動物に、癌の治療に有効な量の、請求項 1 に記載の化合物、塩またはプロドラッグより選択される化合物、塩またはプロドラッグを投与することを含む、癌を有する非ヒト動物を治療する方法。

## 【請求項 10】

前記癌が充実性腫瘍、血液感染性腫瘍、乳癌、卵巣癌、子宮頸癌、前立腺癌、睾丸癌、

尿生殖路癌、食道癌、喉頭癌、膠芽細胞腫、神経芽細胞腫、胃癌、皮膚癌、角化棘細胞腫、肺癌、扁平上皮癌、大細胞癌、小細胞癌、肺腺癌、骨肉腫、結腸癌、腺腫、膵臓癌、腺癌、甲状腺癌、濾胞腺癌、未分化癌、乳頭癌、精上皮腫、黒色腫、肉腫、膀胱癌、肝臓癌および胆道癌、腎臓癌、脊髄障害、リンパ障害、ホジキン腫、毛様細胞癌、口腔癌、咽頭癌、口唇癌、舌癌、口癌、咽頭癌、小腸癌、結腸直腸癌、大腸癌、直腸癌、脳癌および中枢神経系癌、または白血病である、請求項 9 に記載の方法。

【請求項 1 1】

好ましくない新血管形成を有する非ヒト動物に、有効量の請求項 1 に記載の化合物、塩またはプロドラッグより選択される化合物、塩またはプロドラッグを含む組成物を投与することを含む、好ましくない新血管形成に関連する疾患を有する非ヒト動物を治療する方法。

【請求項 1 2】

前記好ましくない新血管形成に関連する疾患が、眼内血管新生性疾患、糖尿病性網膜症、未熟児網膜症、角膜移植拒絶反応、血管新生緑内障および水晶体後部線維増殖症、流行性角結膜炎、ビタミン A 欠乏症、コンタクトレンズの過剰使用、アトピー性角膜炎、上辺縁角膜炎、翼状片角膜炎乾燥、シェーグレン症候群、酒さ、フィレクテヌローシス、梅毒、マイコバクテリア感染症、脂質変性、化学熱傷、細菌性潰瘍、真菌性潰瘍、単純ヘルペス感染症、帯状疱疹感染症、原虫感染症、カポジ肉腫、モーレン潰瘍、テリエン辺縁変性、辺縁表皮剥奪、精神的外傷、関節リウマチ、全身性狼瘡、多動脈炎、ウェゲナーサルコイドーシス、強膜炎、スティーブン-ジョンソン病、類天疱瘡、放射状角膜切除術、または角膜グラフト拒絶反応、類肉腫、鎌状赤血球貧血、弾性線維性仮性黄色腫、バジェット病、静脈閉塞、動脈閉塞、頸動脈閉塞疾患、慢性ブドウ膜炎 / 硝子体炎、ライム病、全身性紅斑性狼瘡、イールズ病、ベーチェット病、網膜炎または脈絡膜炎を引き起こす感染症、推定眼ヒストプラズマ症、ベスト病、近眼、視窩、スターガート病、扁平部炎、慢性網膜剥離、過粘稠度症候群、トキソプラズマ症またはレーザー後合併症であることを特徴とする、請求項 1 1 に記載の方法。

【請求項 1 3】

炎症性疾患を有する非ヒト動物に、有効量の請求項 1 に記載の化合物、塩またはプロドラッグより選択される化合物、塩またはプロドラッグを投与することを含む、炎症に関連する炎症性疾患を有する非ヒト動物を治療する方法。

【請求項 1 4】

前記炎症性疾患が内皮細胞の過剰または異常刺激、アテローム性動脈硬化、血管機能不全、異常創傷治癒、炎症性および免疫障害、ベーチェット病、通風または通風性関節炎、関節リウマチを伴う異常な血管形成、皮膚病、乾癬、糖尿病性網膜症、未熟児網膜症、水晶体後部線維増殖症、黄斑変性症、角膜移植拒絶反応、血管新生緑内障またはオスラー・ウェバー症候群である、請求項 1 3 に記載の方法。

【請求項 1 5】

G S K 3 によって媒介された疾患を有する非ヒト動物に、有効量の請求項 1 の化合物、塩またはプロドラッグより選択される化合物、塩またはプロドラッグを投与することを含む、G S K 3 媒介の疾患を有する非ヒト動物を治療する方法。

【請求項 1 6】

前記 G S K 3 によって媒介された疾患が、糖尿病、アルツハイマー病、ハンチントン病、パーキンソン病、エイズ関連の認知症、筋萎縮性側索硬化症 (A M L)、多発性硬化症 (M S)、統合失調症、心筋細胞肥大、再かん流 / 局所貧血または禿頭症である、請求項 1 5 に記載の方法。

【請求項 1 7】

前記化合物が、錠剤、カプセル、トローチ剤、カシエ、溶液、懸濁液、乳濁液、粉末、煙霧質、座薬、噴霧、トローチ、膏薬、クリーム、ペースト、発泡体、ジェル、タンポン、ペッサリー、顆粒、急速静注薬、うがい薬または経皮貼布の形式で投与される、請求項 8 に記載の方法。



**【請求項 18】**

自己免疫疾患、炎症性疾患、神経性疾患または神経変性疾患、癌、循環器疾患、アレルギー、喘息またはホルモン関連の疾患の治療剤製造のための、請求項 1 の化合物、塩またはプロドラッグより選択される、化合物、塩またはプロドラッグの使用。

**【請求項 19】**

癌の治療剤製造のための、請求項 1 の化合物、塩またはプロドラッグより選択される、化合物、塩またはプロドラッグの使用。

**【請求項 20】**

前記癌は、充実性腫瘍、血液感染性腫瘍、乳癌、卵巣癌、子宮頸癌、前立腺癌、睾丸癌、尿生殖路癌、食道癌、喉頭癌、膠芽細胞腫、神経芽細胞腫、胃癌、皮膚癌、角化棘細胞腫、肺癌、扁平上皮癌、大細胞癌、小細胞癌、肺腺癌、骨肉腫、結腸癌、腺腫、膵臓癌、腺癌、甲状腺癌、濾胞腺癌、未分化癌、乳頭癌、精上皮腫、黒色腫、肉腫、膀胱癌、肝臓癌および胆道癌、腎臓癌、脊髄障害、リンパ障害、ホジキン腫、毛様細胞癌、口腔癌、咽頭癌、口唇癌、舌癌、口癌、咽頭癌、小腸癌、結腸直腸癌、大腸癌、直腸癌、脳癌および中枢神経系癌、または白血病である、請求項 19 に記載の使用。

**【請求項 21】**

好ましくない新血管形成に関連する疾患の治療剤製造のための、請求項 1 の化合物、塩またはプロドラッグより選択される、化合物、塩またはプロドラッグの使用。

**【請求項 22】**

前記好ましくない新血管形成に関連する疾患は、眼内血管新生性疾患、糖尿病性網膜症、未熟児網膜症、角膜移植拒絶反応、血管新生緑内障および水晶体後部線維増殖症、流行性角結膜炎、ビタミン A 欠乏症、コンタクトレンズの過剰使用、アトピー性角膜炎、上辺縁角膜炎、翼状片角膜炎乾燥、シェーグレン症候群、酒さ、フィレクテヌロース、梅毒、マイコバクテリア感染症、脂質変性、化学熱傷、細菌性潰瘍、真菌性潰瘍、単純ヘルペス感染症、带状疱疹感染症、原虫感染症、カポジ肉腫、モーレン潰瘍、テリエン辺縁変性、辺縁表皮剥奪、精神的外傷、関節リウマチ、全身性狼瘡、多動脈炎、ウェゲナーサルコイドーシス、強膜炎、スティーブン-ジョンソン病、類天疱瘡、放射状角膜切除術、または角膜グラフト拒絶反応、類肉腫、鎌状赤血球貧血、弾性線維性仮性黄色腫、バジェット病、静脈閉塞、動脈閉塞、頸動脈閉塞疾患、慢性ブドウ膜炎 / 硝子体炎、ライム病、全身性紅斑性狼瘡、イールズ病、ベーチェット病、網膜炎または脈絡膜炎を引き起こす感染症、推定眼ヒストプラズマ症、ベスト病、近眼、視窩、スターガート病、扁平部炎、慢性網膜剥離、過粘稠度症候群、トキソプラズマ症またはレーザー後合併症である、請求項 21 に記載の使用。

**【請求項 23】**

炎症に関連する炎症性疾患の治療剤製造のための、請求項 1 の化合物、塩またはプロドラッグより選択される、化合物、塩またはプロドラッグの使用。

**【請求項 24】**

前記炎症性疾患は、内皮細胞の過剰または異常刺激、アテローム性動脈硬化、血管機能不全、異常創傷治癒、炎症性および免疫障害、ベーチェット病、通風または通風性関節炎、関節リウマチを伴う異常な血管形成、皮膚病、乾癬、糖尿病性網膜症、未熟児網膜症、水晶体後部線維増殖症、黄斑変性症、角膜移植拒絶反応、血管新生緑内障またはオスラー・ウェバー症候群である、請求項 23 に記載の使用。

**【請求項 25】**

G S K 3 媒介の疾患の治療剤製造のための、請求項 1 の化合物、塩またはプロドラッグより選択される、化合物、塩またはプロドラッグの使用。

**【請求項 26】**

前記 G S K 3 媒介の疾患は、糖尿病、アルツハイマー病、ハンチントン病、パーキンソン病、エイズ関連の認知症、筋萎縮性側索硬化症 (A M L)、多発性硬化症 (M S)、統合失調症、心筋細胞肥大、再かん流 / 局所貧血または禿頭症である、請求項 25 に記載の使用。

## 【請求項 27】

前記化合物は、錠剤、カプセル、トローチ剤、カシエ、溶液、懸濁液、乳濁液、粉末、煙霧質、座薬、噴霧、トローチ、膏薬、クリーム、ペースト、発泡体、ジェル、タンポン、ペッサリー、顆粒、急速静注薬、うがい薬または経皮貼布の形式で投与される、請求項 18 に記載の使用。