

【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22年4月22日(2010.4.22)

【公表番号】特表2010-505836(P2010-505836A)

【公表日】平成22年2月25日(2010.2.25)

【年通号数】公開・登録公報2010-008

【出願番号】特願2009-531440(P2009-531440)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 405/06 (2006.01)**  
**A 6 1 K 31/443 (2006.01)**  
**A 6 1 P 7/02 (2006.01)**  
**A 6 1 P 9/10 (2006.01)**  
**A 6 1 P 9/08 (2006.01)**  
**A 6 1 P 9/12 (2006.01)**  
**A 6 1 P 9/06 (2006.01)**  
**A 6 1 P 9/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 9/04 (2006.01)**  
**A 6 1 P 13/12 (2006.01)**  
**A 6 1 P 29/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 19/02 (2006.01)**  
**A 6 1 P 1/16 (2006.01)**  
**A 6 1 P 11/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 37/02 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 19/10 (2006.01)**  
**A 6 1 P 13/10 (2006.01)**  
**A 6 1 P 3/10 (2006.01)**  
**A 6 1 P 35/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 17/02 (2006.01)**  
**A 6 1 P 11/06 (2006.01)**  
**A 6 1 P 27/06 (2006.01)**  
**A 6 1 P 27/02 (2006.01)**  
**A 6 1 P 17/06 (2006.01)**  
**A 6 1 P 1/04 (2006.01)**  
**A 6 1 P 1/02 (2006.01)**  
**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/16 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/28 (2006.01)**  
**A 6 1 P 25/14 (2006.01)**  
**A 6 1 P 21/00 (2006.01)**

【 F I 】

**C 0 7 D 405/06 C S P**  
**A 6 1 K 31/443**  
**A 6 1 P 7/02**  
**A 6 1 P 9/10 1 0 1**  
**A 6 1 P 9/08**  
**A 6 1 P 9/12**  
**A 6 1 P 9/10**  
**A 6 1 P 9/06**

A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	9/04	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	37/02	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	19/10	
A 6 1 P	13/10	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	27/06	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	1/02	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/14	
A 6 1 P	21/00	

【手続補正書】

【提出日】平成21年5月26日(2009.5.26)

【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

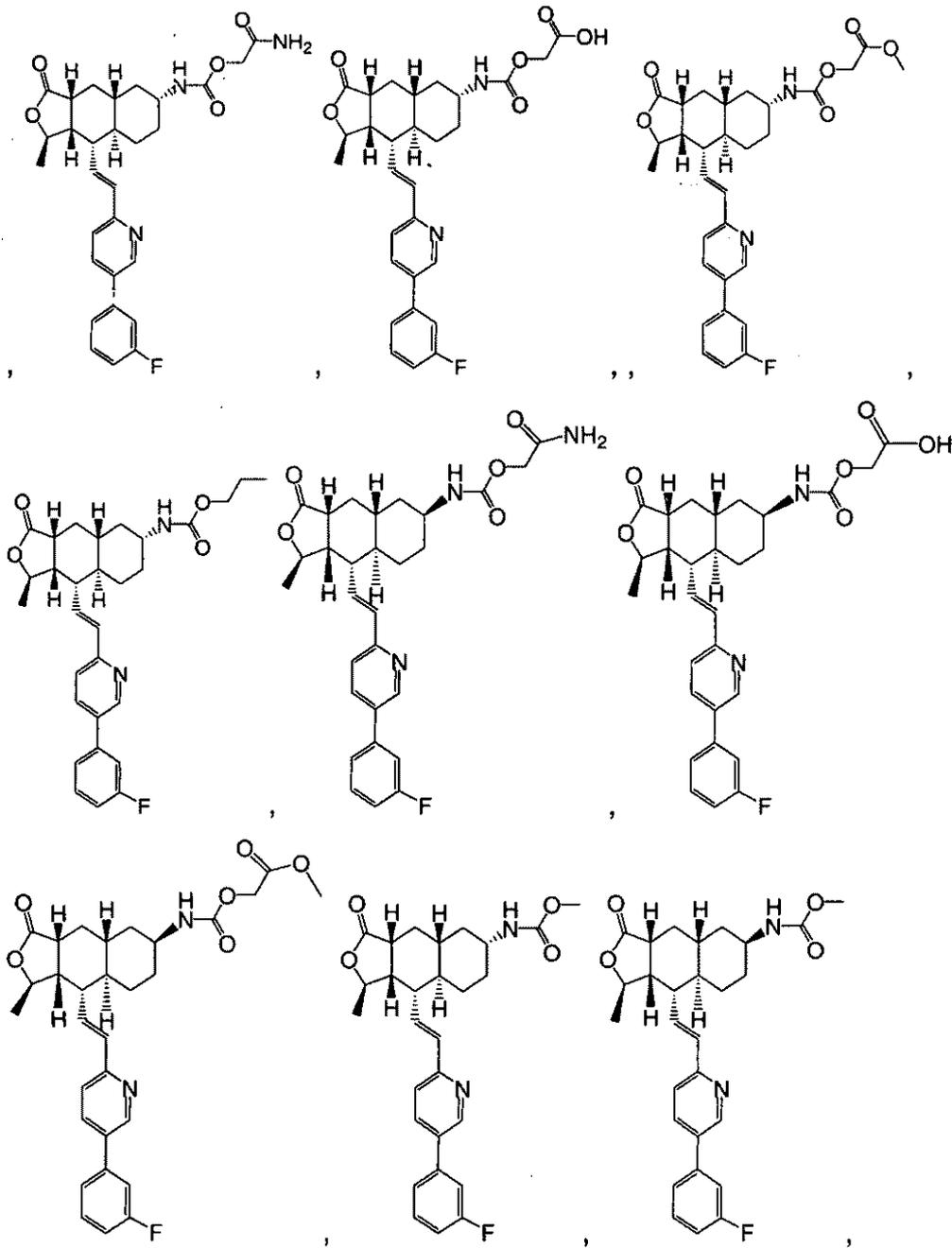
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

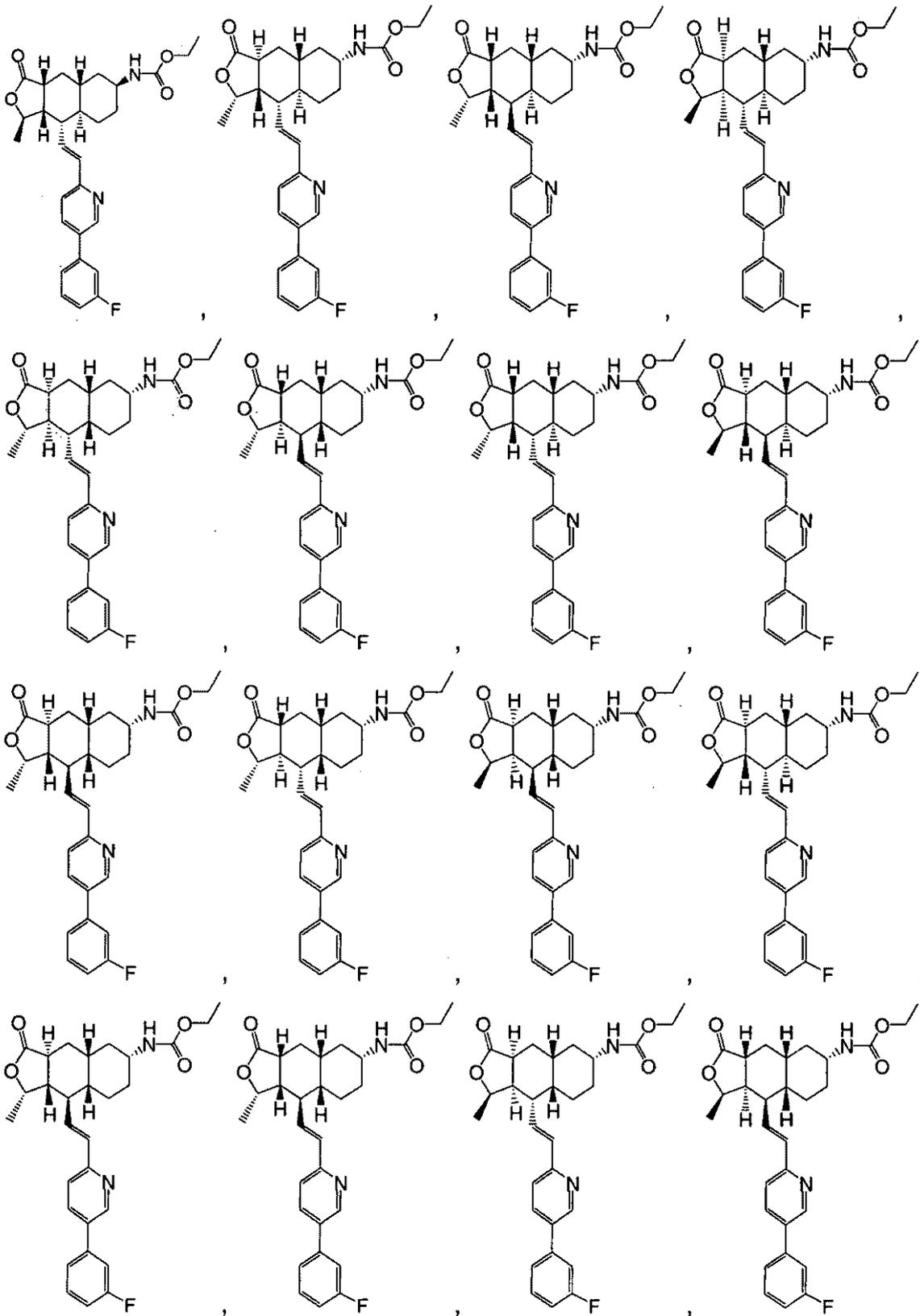
【請求項1】

下記の構造式のいずれかによって表される化合物：

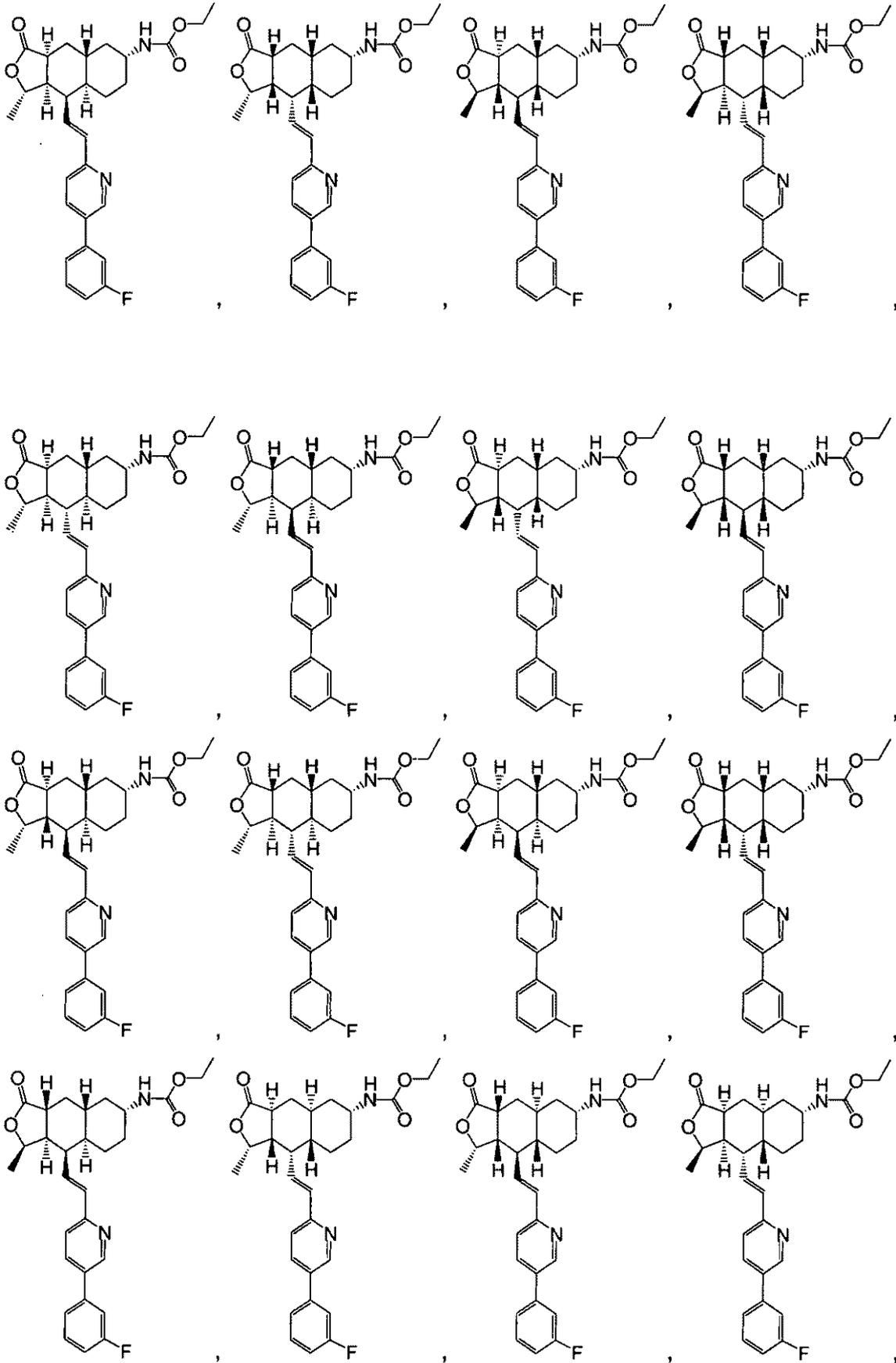
【化 3 1】



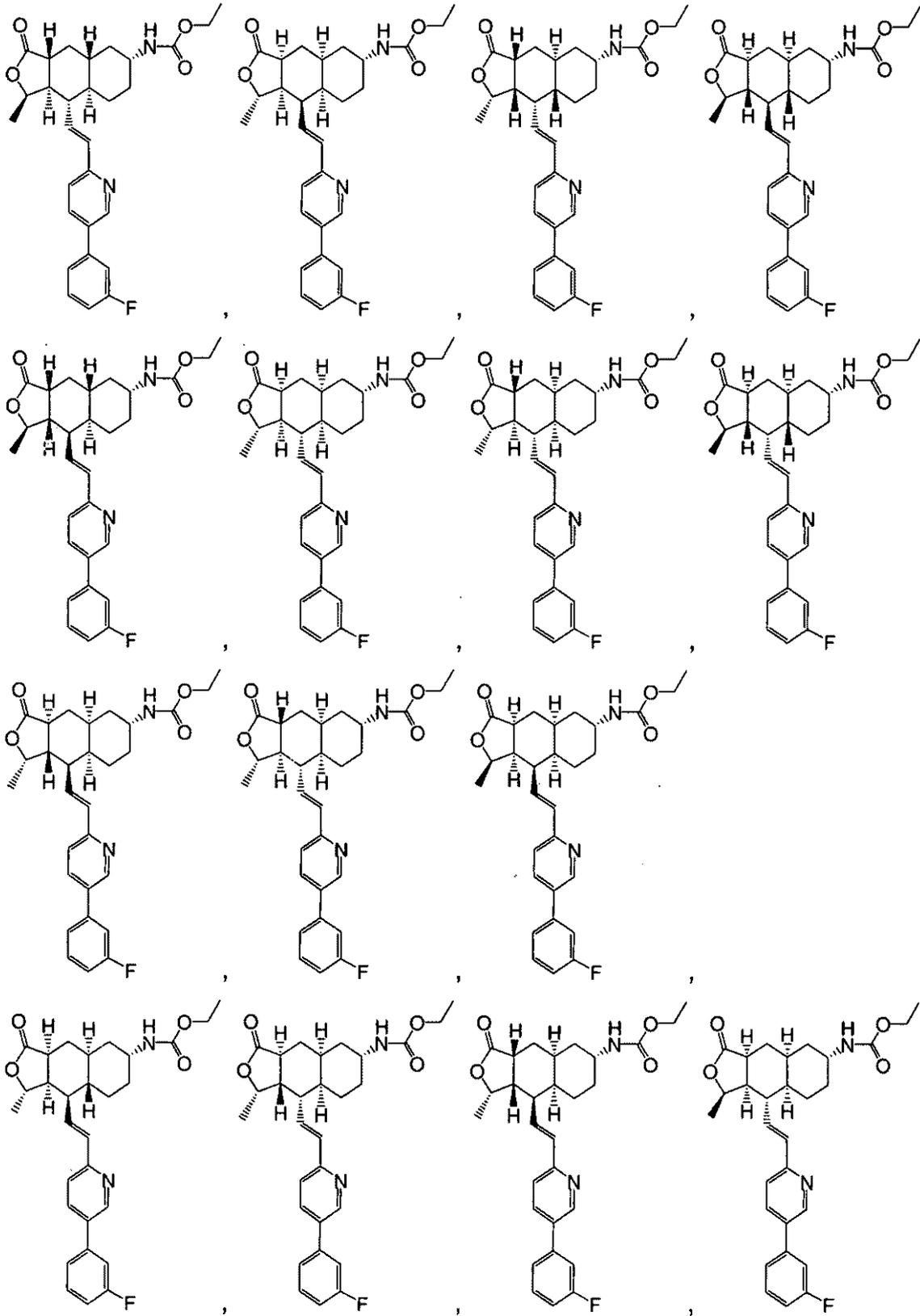
【化 3 2】



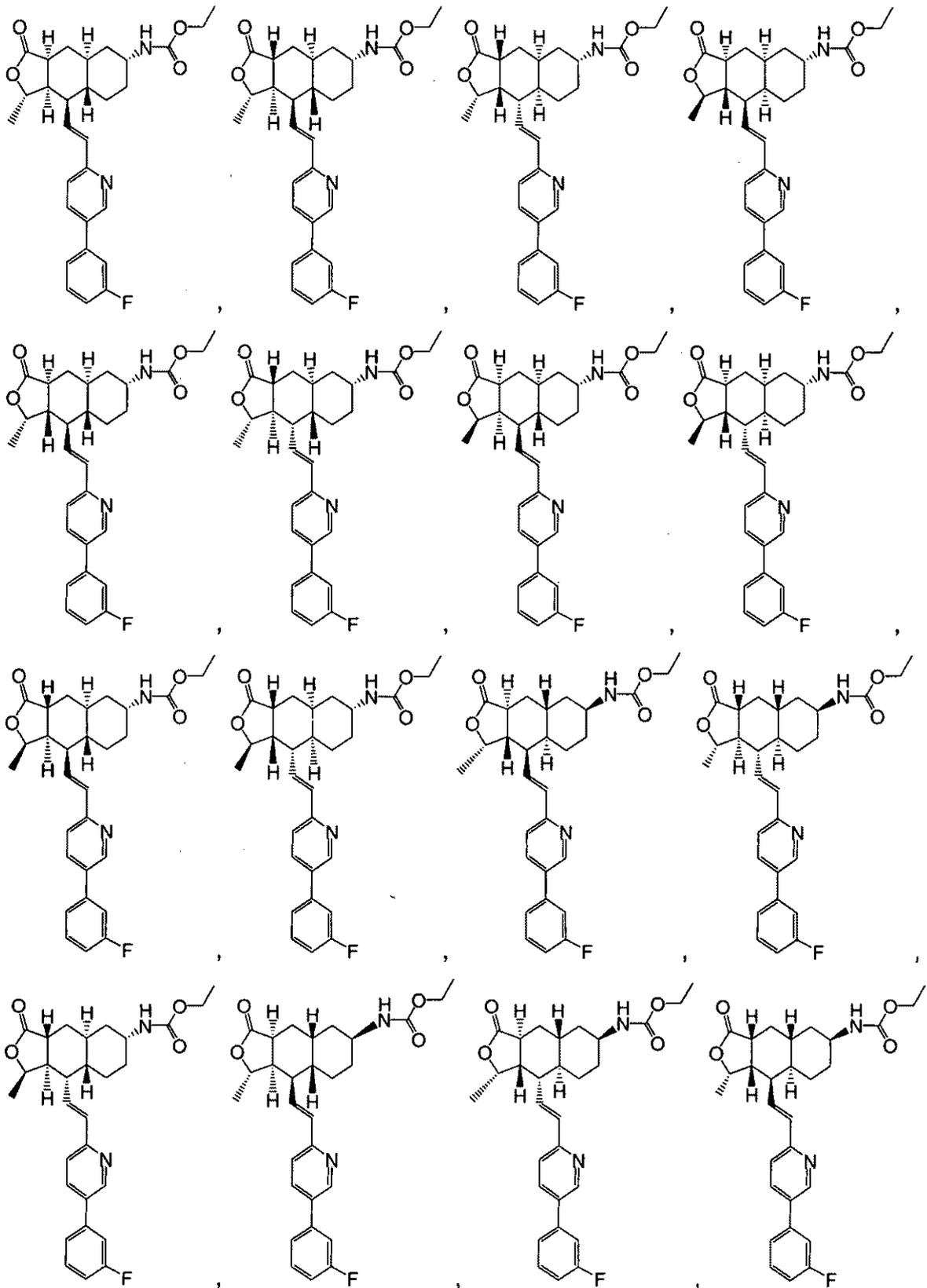
【化 3 3】



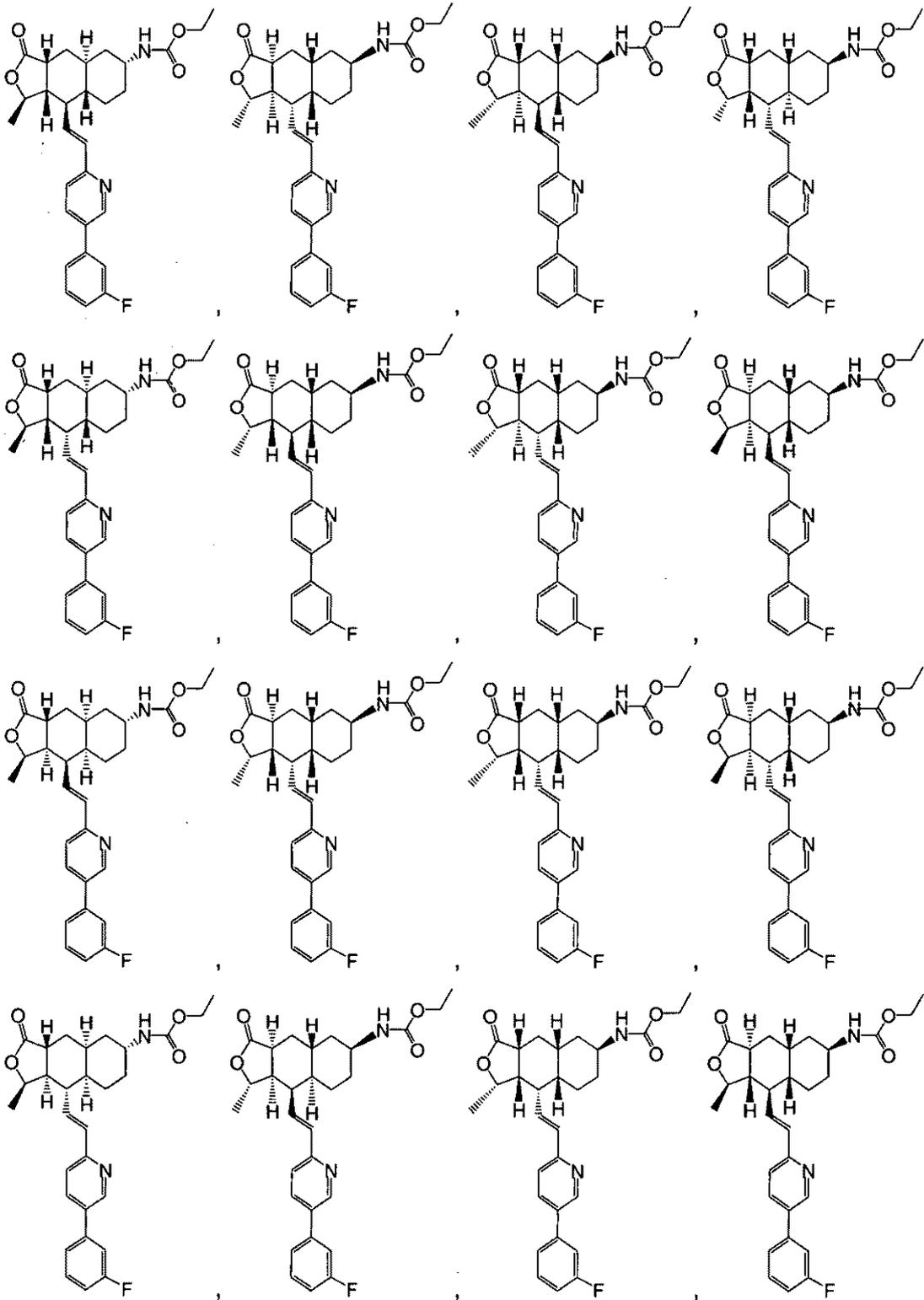
【化 3 4】



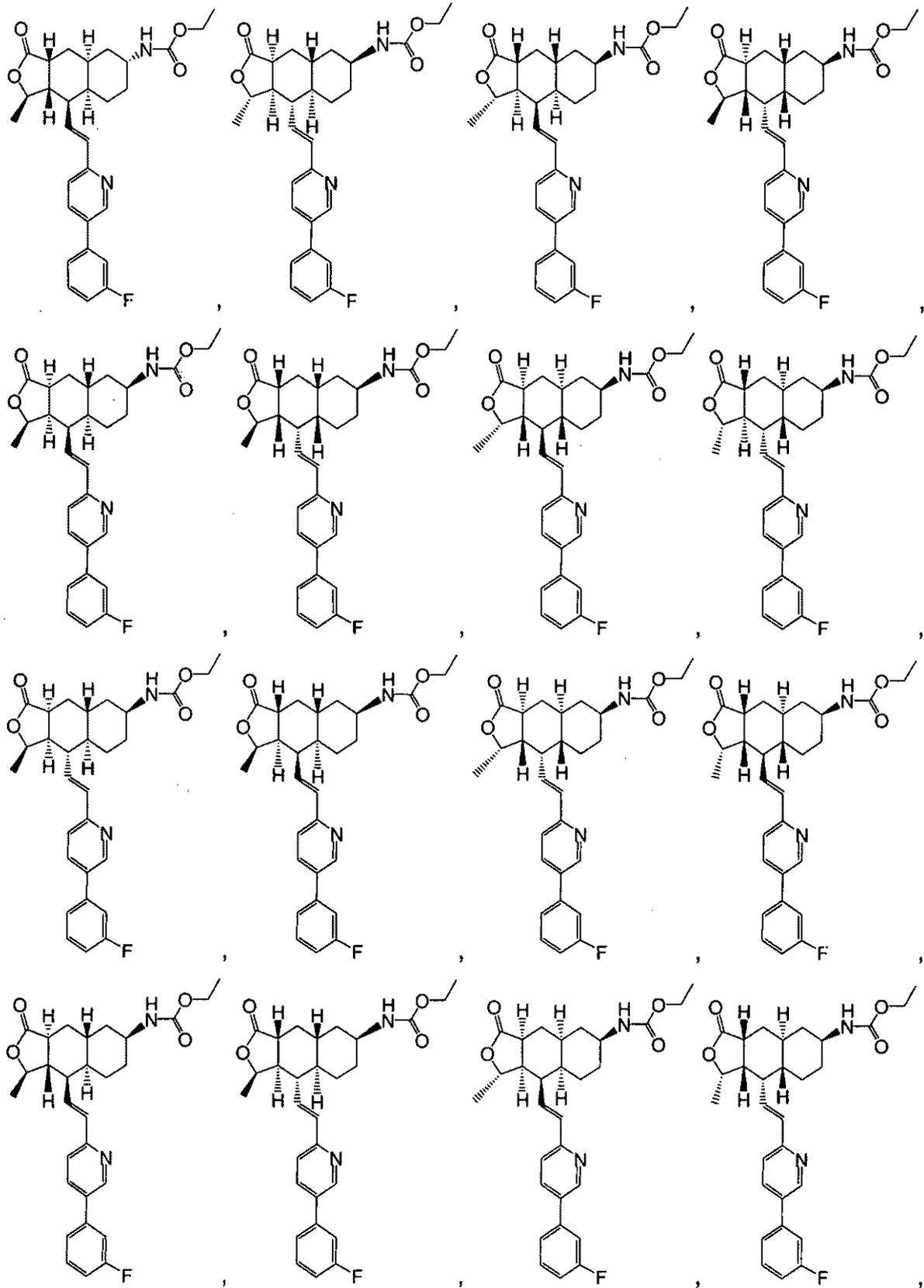
【化 3 5】



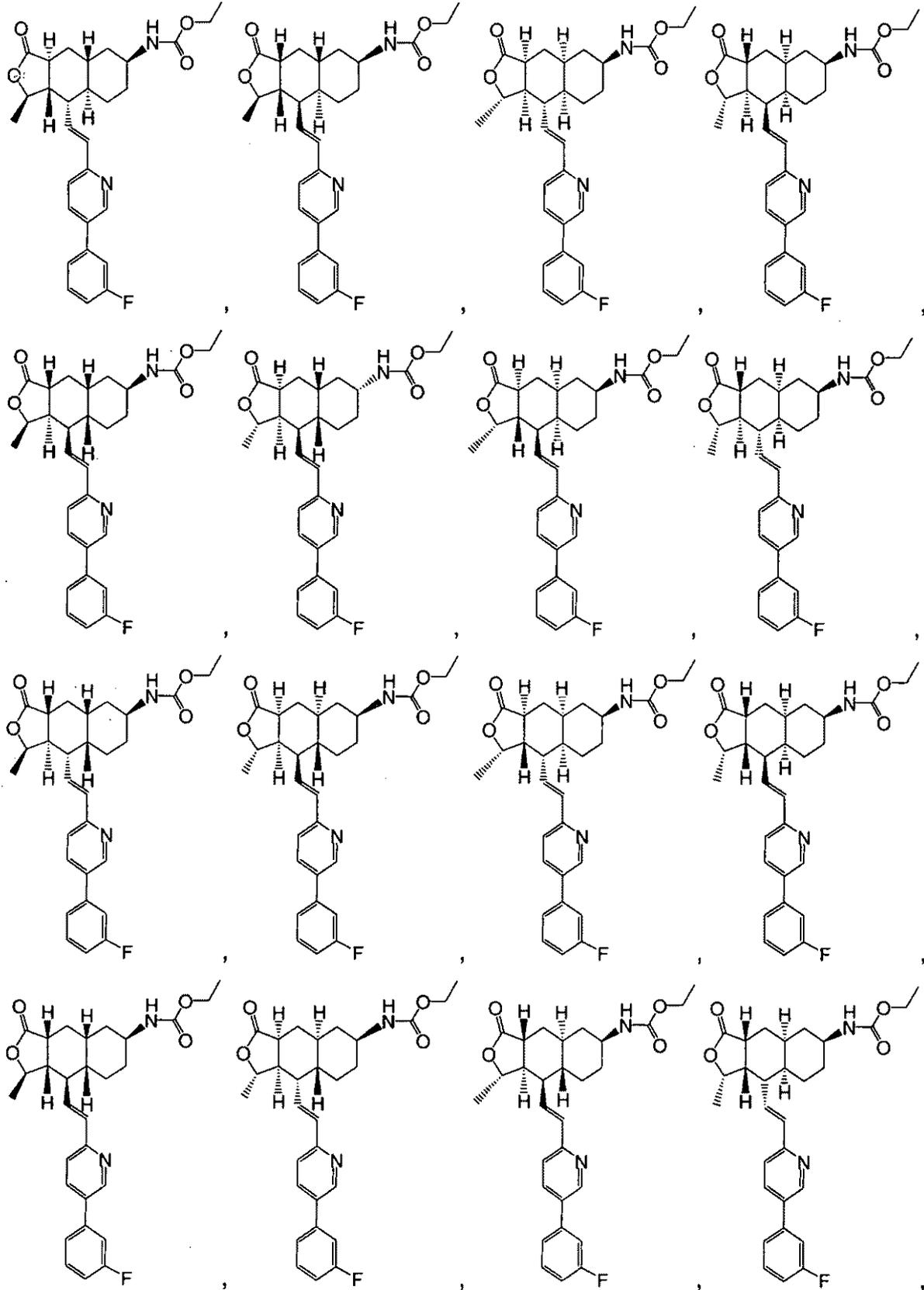
【化 3 6】



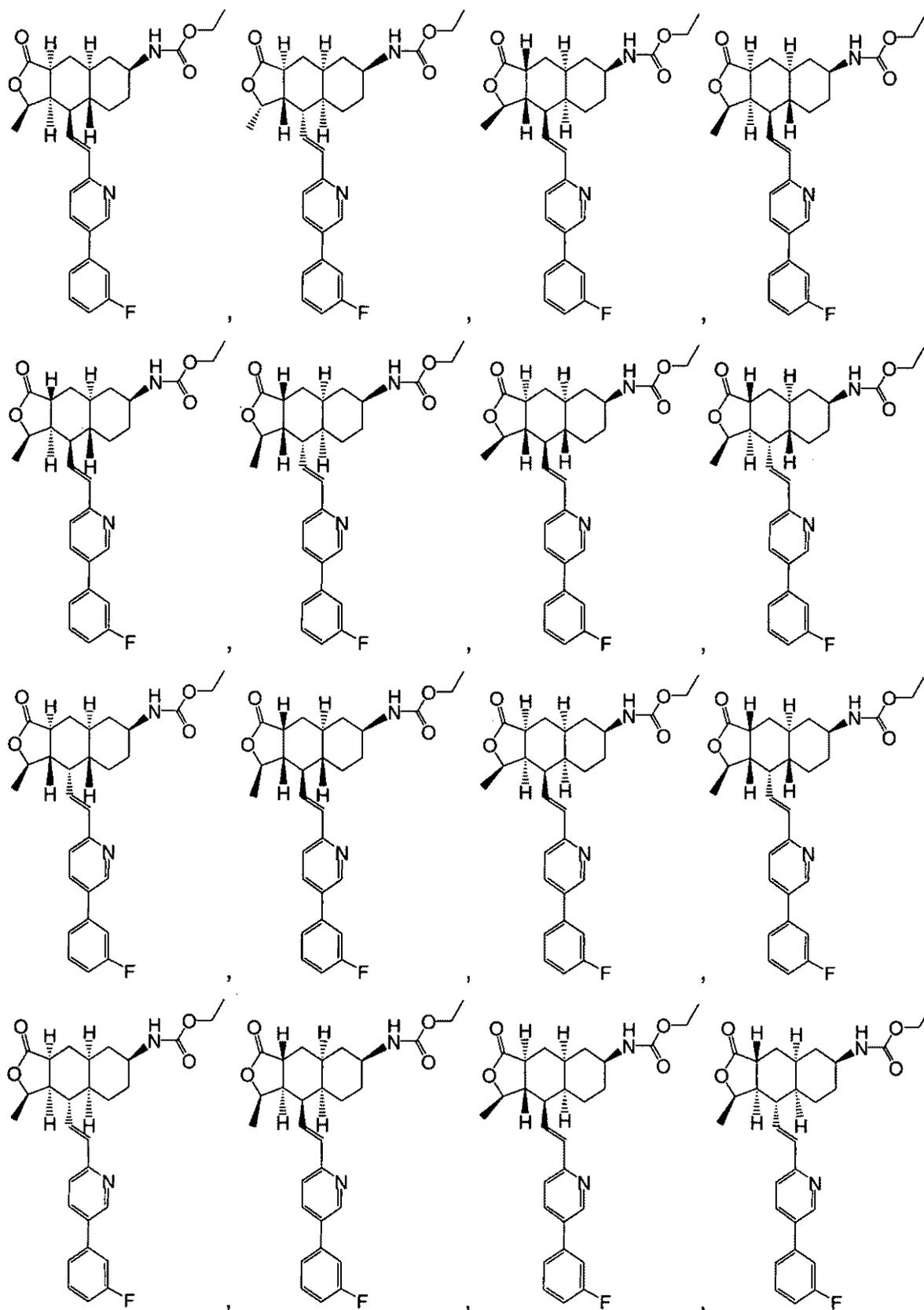
【化 3 7】



【化 3 8】



## 【化 3 9】



または薬学的に許容し得る該化合物の塩、溶媒和物もしくはエステル。

## 【請求項 2】

血栓症、アテローム性動脈硬化症、再狭窄、高血圧、狭心症、新脈管形成に関連した障害、不整脈、心臓血管のまたは循環器系の疾患もしくは状態、心不全、心筋梗塞、糸球体

腎炎、血栓性の脳卒中、血栓塞栓性の脳卒中、末梢血管疾患、脳虚血、リウマチ性関節炎、リウマチ、星膠症、肝臓、腎臓、肺または腸管の線維性障害、全身性エリテマトーデス、多発性硬化症、骨粗しょう症、糸球体腎炎、腎疾患、急性腎不全、慢性腎不全、腎血管ホメオスタシス、腎虚血、膀胱炎、糖尿病、糖尿病性神経障害、脳卒中、脳虚血、腎炎、癌、黒色腫、腎細胞癌、神経障害および/または悪性腫瘍、神経変性のおよび/または神経毒性の疾患、状態もしくは損傷、炎症、喘息、緑内障、黄斑変性、乾癬、肝臓、腎臓、または肺の内皮機能障害、肺および消化管の炎症性障害、気道疾患または状態、放射線線維症、内皮機能障害、歯周疾患または創傷あるいは脊髄損傷、または状態もしくはその結果の処置のための組成物であって、該組成物は、有効量の請求項1に記載の化合物を含み、そのような治療を必要とする哺乳動物に、少なくとも一つの追加の心臓血管薬を組み合わせ投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項3】

請求項2に記載の組成物であって、前記追加の心臓血管薬がトロンボキサンA2生合成阻害剤、GPIIb/IIIaアンタゴニスト、トロンボキサンアンタゴニスト、アデノシンニリン酸阻害剤、シクロオキシゲナーゼ阻害剤、アンジオテンシンアンタゴニスト、エンドセリンアンタゴニスト、アンジオテンシン変換酵素阻害剤、中性エンドペプチダーゼ阻害剤、抗凝固性物質、利尿薬、および血小板凝集阻害剤よりなる群から選択される、組成物。

【請求項4】

請求項2に記載の組成物であって、前記追加の心臓血管薬がアスピリン、カングレロール、重硫酸クロピドグレル、プラスグレルおよびフラグミンである、組成物。

【請求項5】

請求項2に記載の組成物であって、前記追加の心臓血管薬がアスピリンおよび重硫酸クロピドグレルである、組成物。

【請求項6】

カンナビノイド受容体を阻害するための組成物であって、有効量の少なくとも一つの請求項1に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項7】

精製された形態の請求項1に記載の化合物。

【請求項8】

単離された形態の請求項1に記載の化合物。

【請求項9】

患者の非悪性組織における放射線により誘発されるまたは化学的に誘発される毒性の処置または予防のための組成物であって、治療有効量の少なくとも一つの請求項1に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項10】

請求項9に記載の組成物であって、前記放射線により誘発されるおよび/または化学的に誘発される毒性が腸管線維症、肺炎、腸管粘膜症、口腔粘膜症、腸管放射線症候群、または腸管の放射線暴露の病態生理学的な発現のうちの一つ以上である、組成物。

【請求項11】

放射線および/または化学的毒性に暴露されるだろう患者、現在暴露されている患者、または暴露された患者の構造的な放射線性の損傷を減少させるか；放射線および/または化学的毒性に暴露されるだろう患者、現在暴露されている患者、または暴露された患者の炎症を減少させるか；放射線および/または化学的毒性に暴露されるだろう患者、現在暴露されている患者、または暴露された患者の有害な組織を再構築するか；または放射線および/または化学的毒性に暴露されるだろう患者、現在暴露されている患者、または暴露された患者の線維増殖性組織の影響を減少させるための組成物であって、治療有効量の少なくとも一つの請求項1に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項12】

細胞増殖性障害を罹患した患者においてその障害を処置するための組成物であって、治

療有効量の少なくとも一つの請求項 1 に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項 1 3】

請求項 1 2 に記載の組成物であって、前記細胞増殖性障害が膵臓癌、神経膠腫、卵巣癌、直腸結腸癌、結腸癌、乳癌、前立腺癌、甲状腺癌、肺癌、黒色腫、または胃癌である、組成物。

【請求項 1 4】

請求項 1 3 に記載の組成物であって、神経膠腫が未分化星状細胞腫または多型膠芽腫である組成物。

【請求項 1 5】

有効量の少なくとも一つの請求項 1 に記載の化合物および薬学的に許容できるキャリアを含む薬学的組成物。

【請求項 1 6】

請求項 1 5 に記載の薬学的組成物であって、さらに血栓症、アテローム性動脈硬化症、再狭窄、高血圧、狭心症、新脈管形成に関連した障害、不整脈、心臓血管のまたは循環器系の疾患もしくは状態、心不全、心筋梗塞、糸球体腎炎、血栓性の脳卒中、血栓塞栓性の脳卒中、末梢血管疾患、脳虚血、リウマチ性関節炎、リウマチ、星膠症、肝臓、腎臓、肺または腸管の線維性障害、全身性エリテマトーデス、多発性硬化症、骨粗しょう症、糸球体腎炎、腎疾患、急性腎不全、慢性腎不全、腎血管ホメオスタシス、腎虚血、膀胱炎、糖尿病、糖尿病性神経障害、脳卒中、脳虚血、腎炎、癌、黒色腫、腎細胞癌、神経障害および/または悪性腫瘍、神経変性のおよび/または神経毒性の疾患、状態もしくは損傷、炎症、喘息、緑内障、黄斑変性、乾癬、肝臓、腎臓、または肺の内皮機能障害、肺および消化管の炎症性障害、気道疾患または状態、放射線線維症、内皮機能障害、歯周疾患または創傷あるいは脊髄損傷、または状態もしくはその結果の処置のための少なくとも一つの追加の心臓血管薬を含む、薬学的組成物。

【請求項 1 7】

請求項 1 6 に記載の薬学的組成物であって、上記追加の血管薬はトロンボキサン A 2 合成阻害剤、G P I I b / I I I a アンタゴニスト、トロンボキサンアンタゴニスト、アデノシン  
二リン酸阻害剤、シクロオキシゲナーゼ阻害剤、アンジオテンシンアンタゴニスト、エンドセリンアンタゴニスト、アンジオテンシン変換酵素阻害剤、中性エンドペプチダーゼ阻害剤、抗凝固性物質、利尿薬、および血小板凝集阻害剤よりなる群から選択される、薬学的組成物。

【請求項 1 8】

請求項 1 6 に記載の薬学的組成物であって、上記追加の心臓血管薬がアスピリン、カン  
グレロール、重硫酸クロピドグレル、プラスグレルおよびフラグミン ( f r a g m i n )  
である、薬学的組成物。

【請求項 1 9】

請求項 1 6 に記載の薬学的組成物であって、上記追加の心臓血管薬がアスピリン、およ  
び重硫酸クロピドグレルである、薬学的組成物。

【請求項 2 0】

トロンピン受容体を阻害するための組成物であって、有効量の少なくとも一つの請求項  
1 に記載の化合物を含み、そのような治療を必要とする哺乳動物に投与されることを特徴  
とする、組成物。

【請求項 2 1】

血栓症、アテローム性動脈硬化症、再狭窄、高血圧、狭心症、新脈管形成に関連した障  
害、不整脈、心臓血管のまたは循環器系の疾患もしくは状態、心不全、心筋梗塞、糸球体  
腎炎、血栓性の脳卒中、血栓塞栓性の脳卒中、末梢血管疾患、脳虚血、リウマチ性関節炎  
、リウマチ、星膠症、肝臓、腎臓、肺または腸管の線維性障害、全身性エリテマトーデス  
、多発性硬化症、骨粗しょう症、糸球体腎炎、腎疾患、急性腎不全、慢性腎不全、腎血管  
ホメオスタシス、腎虚血、膀胱炎、糖尿病、糖尿病性神経障害、脳卒中、脳虚血、腎炎、

癌、黒色腫、腎細胞癌、神経障害および/または悪性腫瘍、神経変性のおよび/または神経毒性の疾患、状態もしくは損傷、炎症、喘息、緑内障、黄斑変性、乾癬、肝臓、腎臓、または肺の内皮機能障害、肺および消化管の炎症性障害、気道疾患または状態、放射線線維症、内皮機能障害、歯周疾患または創傷あるいは脊髄損傷、または状態もしくはその結果の処置のための組成物であって、有効量の少なくとも一つの請求項1に記載の化合物を含み、そのような治療を必要とする哺乳動物に投与されることを特徴とする、組成物。

【請求項22】

請求項21に記載の組成物であって、上記炎症性疾患または状態が過敏性腸管症候群、クローン病、腎炎あるいは放射線により誘発されるもしくは化学療法により誘発される消化管、肺、膀胱、消化管または他の器官の増殖性障害もしくは炎症性障害である、組成物。

【請求項23】

請求項21に記載の組成物であって、上記気道疾患または状態が可逆性の気道閉塞、喘息、慢性喘息、気管支炎または慢性気道疾患である、組成物。

【請求項24】

請求項21に記載の組成物であって、上記癌が腎細胞癌または新脈管形成に関連する障害である、組成物。

【請求項25】

請求項21に記載の組成物であって、上記神経変性疾患がパーキンソン病、筋萎縮性側索硬化症、アルツハイマー病、ハンティングトン病またはウィルソン病である、組成物。