【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】令和3年10月21日(2021.10.21)

【公表番号】特表2019-523265(P2019-523265A)
【公表日】令和1年8月22日(2019.8.22)
【年通号数】公開・登録公報2019-034
【出願番号】特願2019-503925(P2019-503925)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｃ 311/08 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 239/26 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 401/10 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 237/08 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/501 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/506 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/505 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/50 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 7/02 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 7/12 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/12 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 11/14 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4965 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/497 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4418 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 213/56 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4439 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 277/30 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/426 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 263/44 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/421 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4015 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/42 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/165 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/18 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/137 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/138 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/05 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/192 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/7036 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/341 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/381 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/415 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4188 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4192 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4184 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/428 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/423 (2006.01)

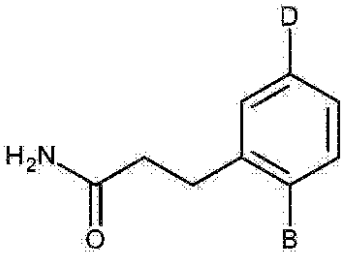
A 6 1 K 31/4035 (2006.01)
A 6 1 K 31/17 (2006.01)
A 6 1 K 31/404 (2006.01)

【ＦＩ】

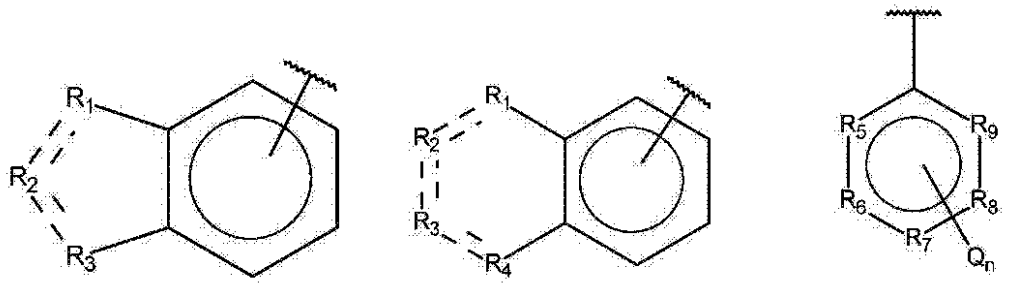
Ｃ０７Ｃ 311/08
Ｃ０７Ｄ 239/26 ＣＳＰ
Ｃ０７Ｄ 401/10
Ｃ０７Ｄ 237/08
Ａ６１Ｋ 31/501
Ａ６１Ｋ 31/506
Ａ６１Ｋ 31/505
Ａ６１Ｋ 31/50
Ａ６１Ｐ 7/02
Ａ６１Ｐ 7/12
Ａ６１Ｐ 9/12
Ａ６１Ｐ 11/00
Ａ６１Ｐ 9/00
Ａ６１Ｐ 11/14
Ａ６１Ｐ 35/00
Ａ６１Ｋ 31/4965
Ａ６１Ｋ 31/497
Ａ６１Ｋ 31/4418
Ｃ０７Ｄ 213/56
Ａ６１Ｋ 31/4439
Ｃ０７Ｄ 277/30
Ａ６１Ｋ 31/426
Ｃ０７Ｄ 263/44
Ａ６１Ｋ 31/421
Ａ６１Ｋ 31/4015
Ａ６１Ｋ 31/42
Ａ６１Ｋ 31/165
Ａ６１Ｋ 31/18
Ａ６１Ｋ 31/137
Ａ６１Ｋ 31/138
Ａ６１Ｋ 31/05
Ａ６１Ｋ 31/192
Ａ６１Ｋ 31/7036
Ａ６１Ｋ 31/341
Ａ６１Ｋ 31/381
Ａ６１Ｋ 31/415
Ａ６１Ｋ 31/4188
Ａ６１Ｋ 31/4192
Ａ６１Ｋ 31/4184
Ａ６１Ｋ 31/428
Ａ６１Ｋ 31/423
Ａ６１Ｋ 31/4035
Ａ６１Ｋ 31/17
Ａ６１Ｋ 31/404

【誤訳訂正書】

【提出日】令和3年9月9日(2021.9.9)
【誤訳訂正１】
【訂正対象書類名】特許請求の範囲
【訂正対象項目名】全文
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
式:
【化１】

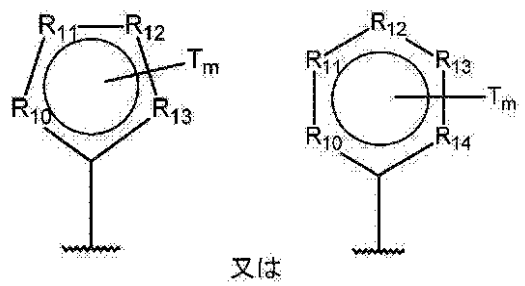


の化合物、又は薬理学的に許容されるその塩、立体異性体、ジアステレオマー、エナンチオマー、ラセミ体、水和物若しくは溶媒和物
[式中、
Bは、
【化２】



及び

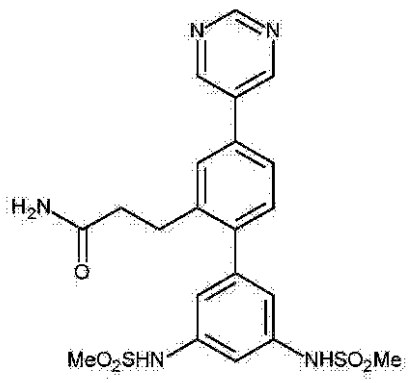
からなる群から選択され、
R_1、R_3及びR_4は、独立して、C、CH、CH_2、O、N、NH又はSであり、
R_2は、C、CH、CH_2、N、NH、C-CF_3、CH-CF_3又はC=Oであり、
R_1とR_2、R_2とR_3、及びR_3とR_4の間の結合は、独立して二重結合又は単結合であり、
R_5からR_9は、独立して、C又はNであり、
Qは、ハロ、アルキル、ヒドロキシ、アミノ及び置換アミノから独立して選択され、
nは、0、1、2、3、4又は5であり、
Dは、
【化３】

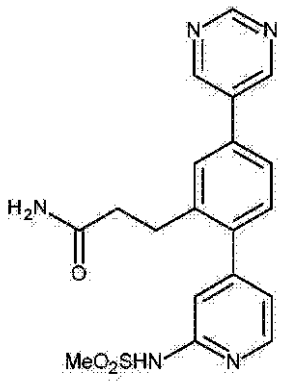


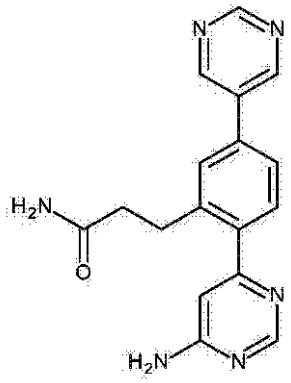
又は

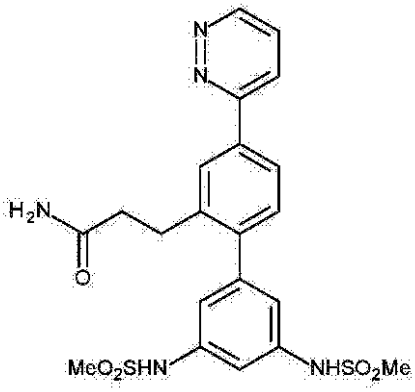
であり、

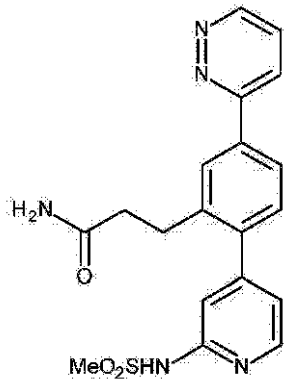
R_{10}からR_{14}は、独立して、C、N、O又はSであり、
Tは、$C_{1\sim6}$アルキル、ハロ、$C_{0\sim6}$アルキルカルボン酸、アミノ、ヒドロキシ及び$C_{1\sim6}$アルコキシから独立して選択され、
mは、0、1、2、3又は4であり、
ここで、Dは、非置換フェニルであることができず、そしてnが1であり、R^5からR^9がすべてCである場合、Qは、ヒドロキシであることができない]。
【請求項２】
化合物が、
【化４】

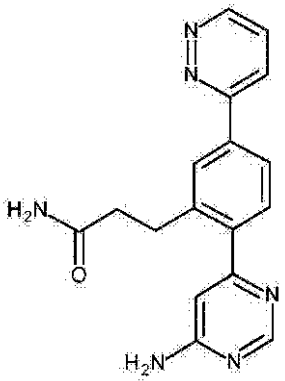

(D4),

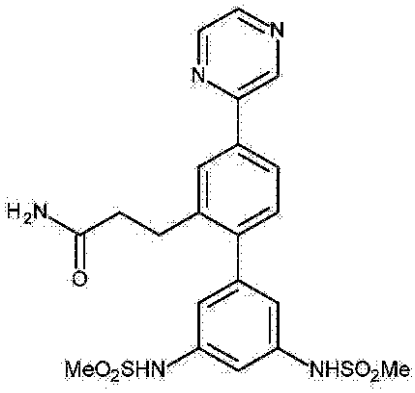

(D5),

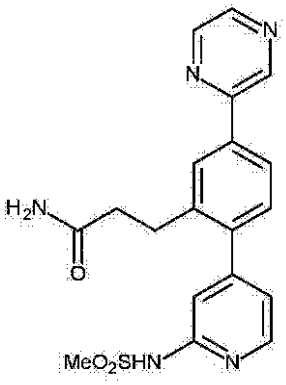

(D6),

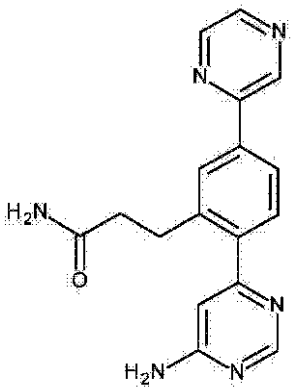

(D10),

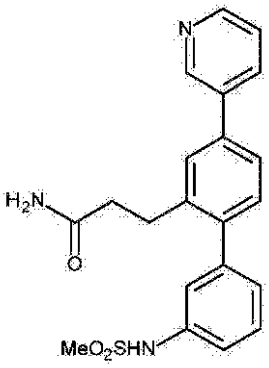

(D11),

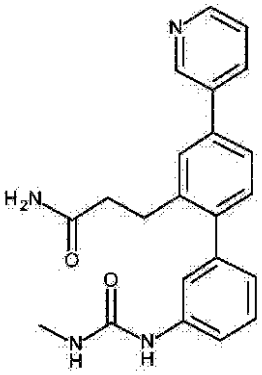

(D12),

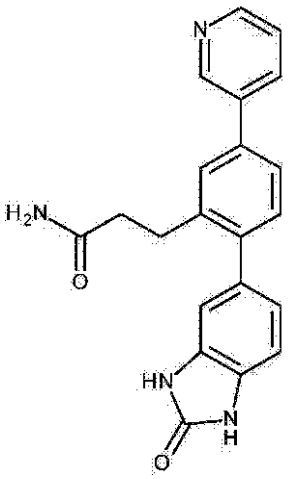

(**D16**),

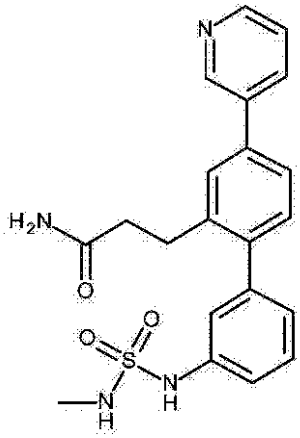

(**D17**),

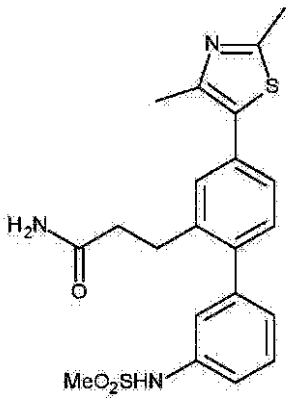

(**D18**),

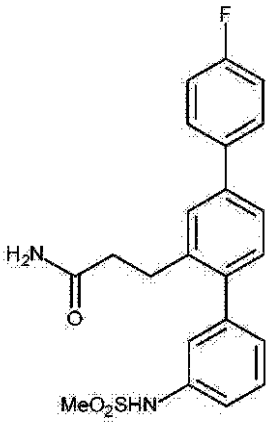

(**D28**),

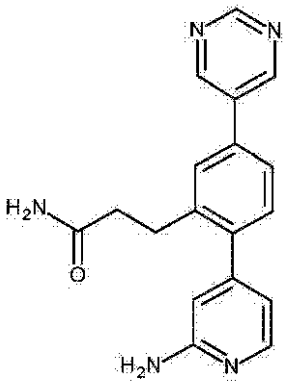

(**D29**),

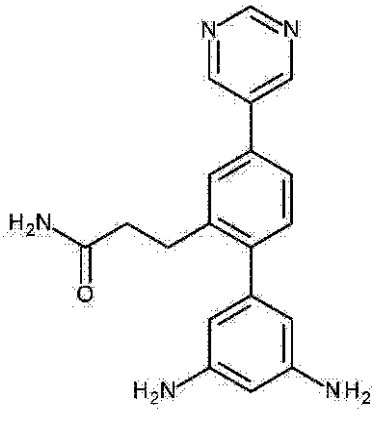

(**D30**),


(**D31**),


(**D32**),


(**D35**),


(**D171**) 及び



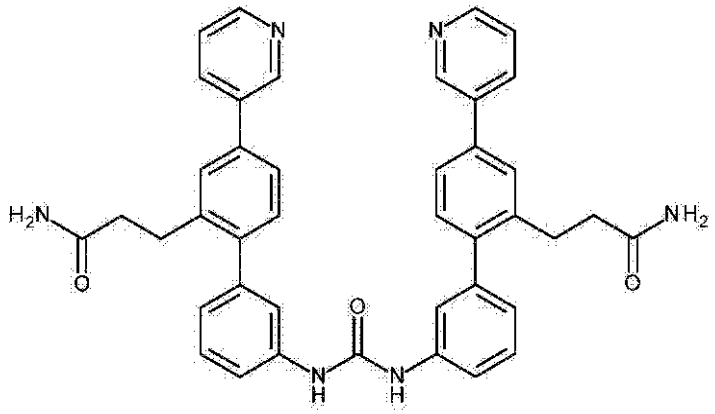
(D172)

からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物、又は薬理学的に許容されるその塩、立体異性体、ジアステレオマー、エナンチオマー、ラセミ体、水和物若しくは溶媒和物。

【請求項３】

式:

【化５】



(D167)

の化合物、又は薬理学的に許容されるその塩、立体異性体、ジアステレオマー、エナンチオマー、ラセミ体、水和物若しくは溶媒和物。

【請求項４】

肺線維症を持つ又は肺線維症を発病するリスクがある対象における肺線維症又は関連状態を予防的に又は治療的に処置するための医薬の製造のための、請求項1から3のいずれか一項に記載の化合物、又は薬理学的に許容されるその塩、立体異性体、ジアステレオマー、エナンチオマー、ラセミ体、水和物若しくは溶媒和物の使用。

【請求項５】

肺線維症を発病するリスクがある対象が、ガス、煙、化学物質、アスベスト繊維又は粉塵に曝露されたことがある、請求項4に記載の使用。

【請求項６】

肺線維症を発病するリスクがある対象が、肺の自己免疫障害、ウイルス感染症又は細菌感染症を有する、請求項4に記載の使用。

【請求項７】

肺線維症を発病するリスクがある対象が、肺又は乳がんのための放射線療法を受けたことがある、請求項4に記載の使用。

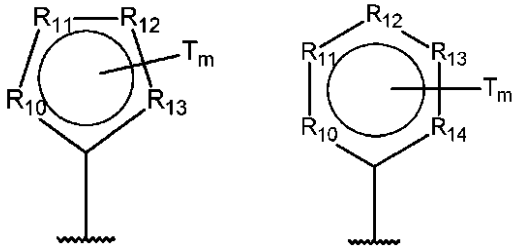
【請求項８】

肺線維症を発病するリスクがある対象が、遺伝的素因を有する、請求項4に記載の使用。

【請求項９】

肺線維症を発病するリスクがある対象が、喫煙者である、請求項4に記載の使用。
【請求項１０】
関連状態が、肺高血圧症、右心不全、呼吸不全、低酸素症、咳、血栓の形成、肺炎及び肺がんから選択される、請求項4から9のいずれか一項に記載の使用。
【請求項１１】
医薬が、肺線維症の進行を予防する、低減させる、又は遅らせる、請求項4から10のいずれか一項に記載の使用。
【請求項１２】
医薬が、確立された肺線維症を低減させる、請求項4から11のいずれか一項に記載の使用。
【請求項１３】
肺線維症を持つ又は肺線維症を発病するリスクがある対象における肺線維症又は関連状態を予防的に又は治療的に処置するための医薬組成物であって、請求項1から3のいずれか一項に記載の化合物、又は薬理学的に許容されるその塩、立体異性体、ジアステレオマー、エナンチオマー、ラセミ体、水和物若しくは溶媒和物を含む、医薬組成物。
【請求項１４】
肺線維症を発病するリスクがある対象が、ガス、煙、化学物質、アスベスト繊維又は粉塵に曝露されたことがある、請求項13に記載の医薬組成物。
【請求項１５】
肺線維症を発病するリスクがある対象が、肺の自己免疫障害、ウイルス感染症又は細菌感染症を有する、請求項13に記載の医薬組成物。
【請求項１６】
肺線維症を発病するリスクがある対象が、肺又は乳がんのための放射線療法を受けたことがある、請求項13に記載の医薬組成物。
【請求項１７】
肺線維症を発病するリスクがある対象が、遺伝的素因を有する、請求項13に記載の医薬組成物。
【請求項１８】
肺線維症を発病するリスクがある対象が、喫煙者である、請求項13に記載の医薬組成物。
【請求項１９】
関連状態が、肺高血圧症、右心不全、呼吸不全、低酸素症、咳、血栓の形成、肺炎及び肺がんから選択される、請求項13から18のいずれか一項に記載の医薬組成物。
【請求項２０】
肺線維症の進行を予防する、低減させる、又は遅らせる、請求項13から19のいずれか一項に記載の医薬組成物。
【請求項２１】
確立された肺線維症を低減させる、請求項13から20のいずれか一項に記載の医薬組成物。
【誤訳訂正２】
【訂正対象書類名】明細書
【訂正対象項目名】００１３
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【００１３】

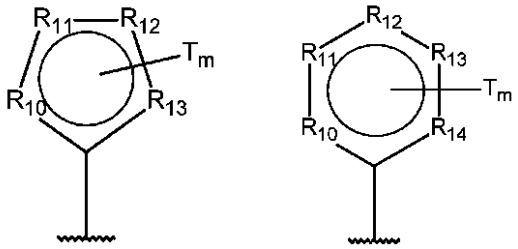
【化３】



又は

であり、
R_{10}からR_{14}は、独立して、C、N、O又はSであり、
Tは、$C_{1\sim6}$アルキル、ハロ、$C_{0\sim6}$アルキルカルボン酸、アミノ、ヒドロキシ及び$C_{1\sim6}$アルコキシから独立して選択され、
mは、0、1、2、3又は4であり、
ここで、Dは、非置換フェニルであることができず、そしてnが1であり、R^5からR^9がすべてCである場合、Qは、ヒドロキシであることができない]
を提供する。

【誤訳訂正３】
【訂正対象書類名】明細書
【訂正対象項目名】００１７
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【００１７】
【化６】

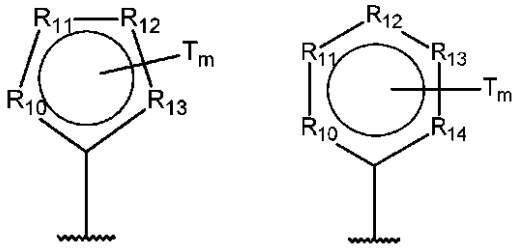


又は

であり、
R_{10}からR_{14}は、独立して、C、N、O又はSであり、
Tは、$C_{1\sim6}$アルキル、ハロ、$C_{0\sim6}$アルキルカルボン酸、アミノ、ヒドロキシ及び$C_{1\sim6}$アルコキシから独立して選択され、
mは、0、1、2、3又は4であり、
ここで、Dは、非置換フェニルであることができず、そしてnが1であり、R^5からR^9がすべてCである場合、Qは、ヒドロキシであることができない]
を投与するステップを含む、方法を提供する。

【誤訳訂正４】
【訂正対象書類名】明細書
【訂正対象項目名】００２１
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【００２１】

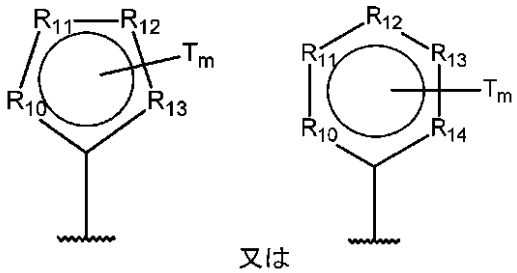
【化９】



又は

であり、
R_{10}からR_{14}は、独立して、C、N、O又はSであり、
Tは、$C_{1\sim6}$アルキル、ハロ、$C_{0\sim6}$アルキルカルボン酸、アミノ、ヒドロキシ及び$C_{1\sim6}$アルコキシから独立して選択され、
mは、0、1、2、3又は4であり、
ここで、Dは、非置換フェニルであることができず、そしてnが1であり、R^5からR^9がすべてCである場合、Qは、ヒドロキシであることができない]
の使用を提供する。

【誤訳訂正５】
【訂正対象書類名】明細書
【訂正対象項目名】００２５
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【００２５】
【化１２】

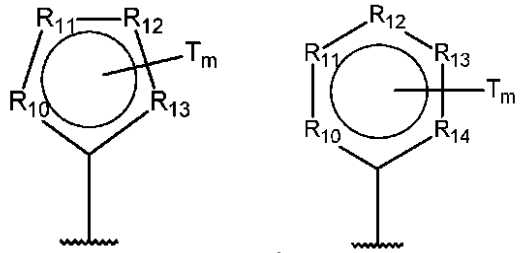


又は

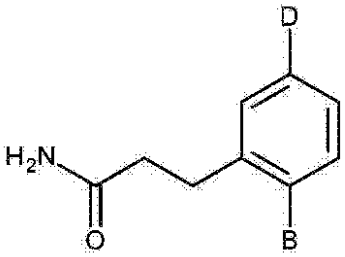
であり、
R_{10}からR_{14}は、独立して、C、N、O又はSであり、
Tは、$C_{1\sim6}$アルキル、ハロ、$C_{0\sim6}$アルキルカルボン酸、アミノ、ヒドロキシ及び$C_{1\sim6}$アルコキシから独立して選択され、
mは、0、1、2、3又は4であり、
ここで、Dは、非置換フェニルであることができず、そしてnが1であり、R^5からR^9がすべてCである場合、Qは、ヒドロキシであることができない]
を提供する。

【誤訳訂正６】
【訂正対象書類名】明細書
【訂正対象項目名】０１２８
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【０１２８】

【化５７】

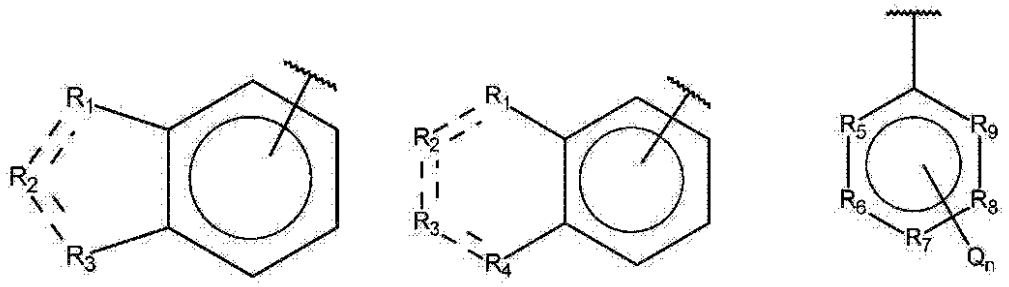


であり、
R_{10}からR_{14}は、独立して、C、N、O又はSであり、
Tは、$C_{1\sim6}$アルキル、ハロ、$C_{0\sim6}$アルキルカルボン酸、アミノ、ヒドロキシ及び$C_{1\sim6}$アルコキシから独立して選択され、
mは、0、1、2、3又は4であり、
ここで、Dは、非置換フェニルであることができず、そしてnが1であり、R^5からR^9がすべてCである場合、Qは、ヒドロキシであることができない]。
【誤訳訂正７】
【訂正対象書類名】明細書
【訂正対象項目名】０３１９
【訂正方法】変更
【訂正の内容】
【０３１９】
ヒト小気道上皮細胞における負性インピーダンス応答を、A6、A26、A27、A30、A32、A35、A56、A79、A81、D4、D5、D6、D10、D11、D12、D16、D17、D18、D28、D30、D31、D32、D35、D167、D171、D172、P13、P14、P25、P42、P43、P44及びVB0004について観察(図5)したところ、これらの化合物が、肺線維症を低減させることを示していた。
本発明は例えば以下の態様を含む。
［項１］
式:
【化８７】



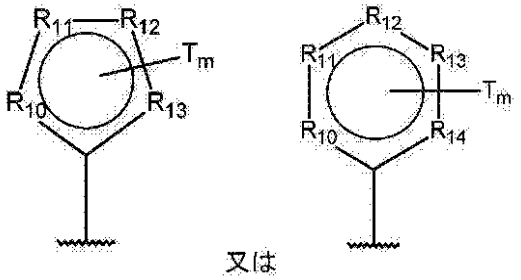
の化合物、
又は薬理学的に許容されるその塩、立体異性体、ジアステレオマー、エナンチオマー、ラセミ体、水和物及び/若しくは溶媒和物
[式中、
Bは、

【化８８】



及び

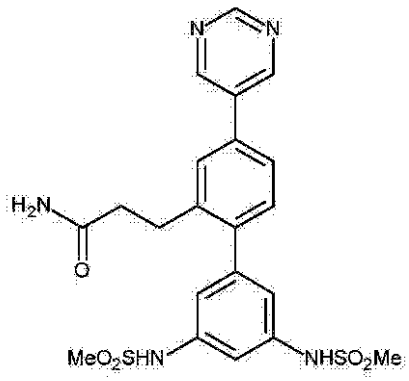
からなる群から選択され、
R_1、R_3及びR_4は、独立して、C、CH、CH_2、O、N、NH又はSであり、
R_2は、C、CH、CH_2、N、NH、C-CF_3、CH-CF_3又はC=Oであり、
R_5からR_9は、独立して、C又はNであり、
Qは、ハロ、アルキル、ヒドロキシ、アミノ及び置換アミノから独立して選択され、
nは、0、1、2、3、4又は5であり、
Dは、
【化８９】



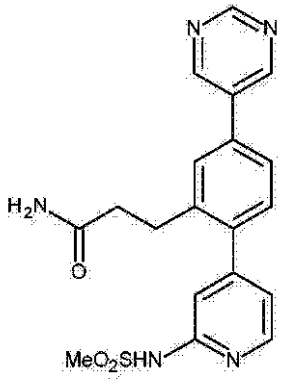
又は

であり、
R_{10}からR_{14}は、独立して、C、N、O又はSであり、
Tは、$C_{1\sim6}$アルキル、ハロ、$C_{0\sim6}$アルキルカルボン酸、アミノ、ヒドロキシ及び$C_{1\sim6}$アルコキシから独立して選択され、
mは、0、1、2、3又は4であり、
ここで、Dは、非置換フェニルであることができず、そしてnが1であり、R^5からR^9がすべてCである場合、Qは、ヒドロキシであることができない]。
［項２］
化合物が、

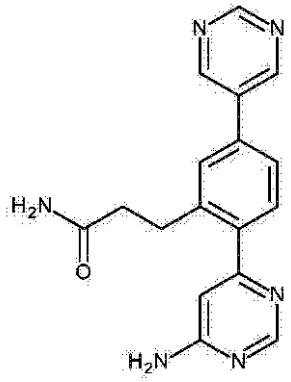
【化９０】



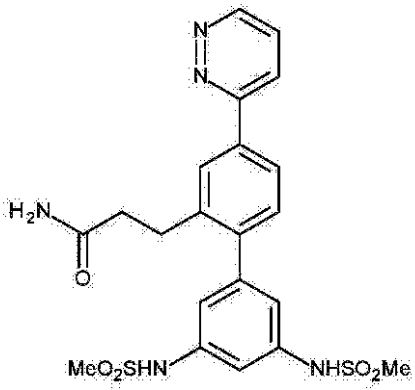
(**D4**),



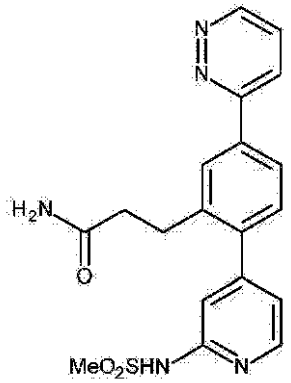
(**D5**),



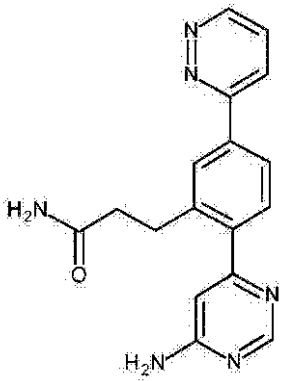
(**D6**),



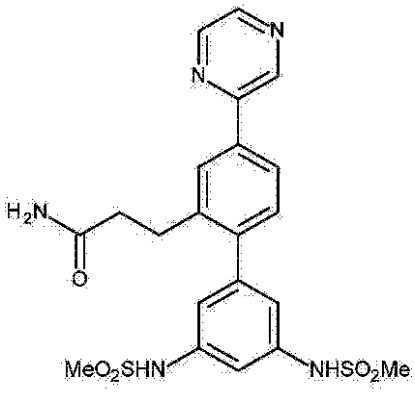
(**D10**),

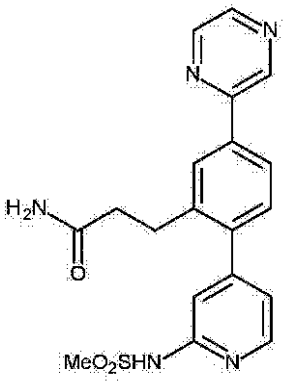


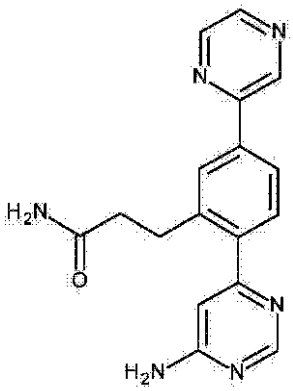
(**D11**),

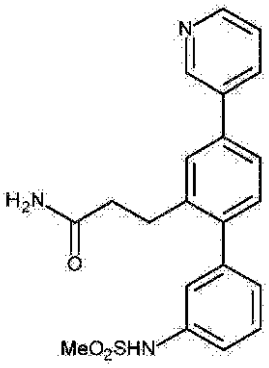


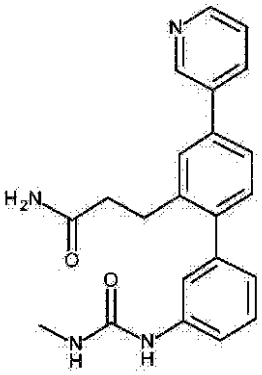
(**D12**),

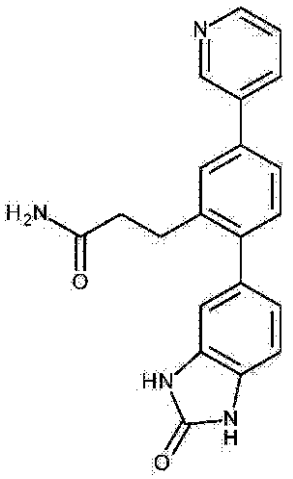

(**D16**),

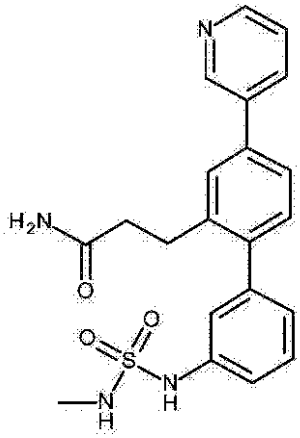

(**D17**),

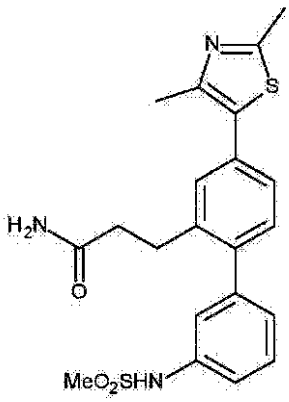

(**D18**),

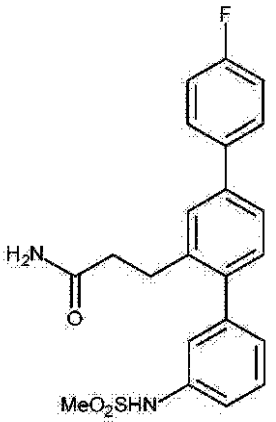

(**D28**),

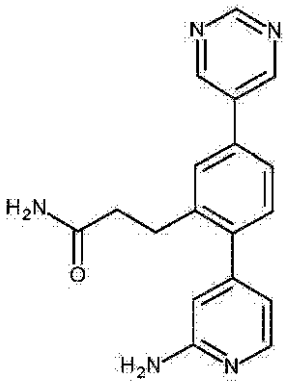

(**D29**),

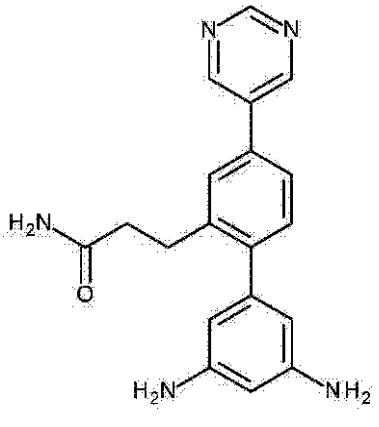

(**D30**),


(**D31**),

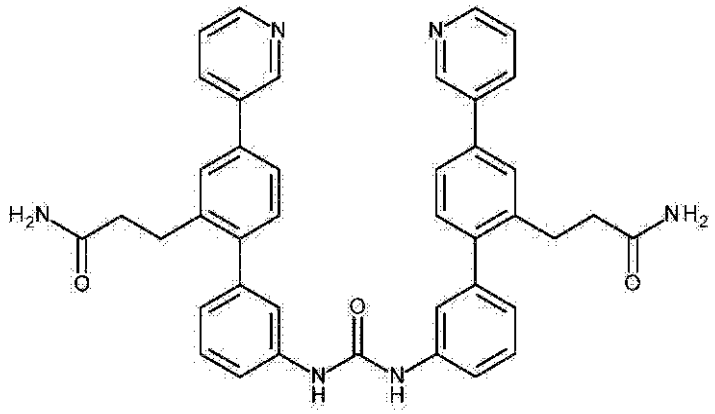

(**D32**),


(**D35**),


(**D171**) 及び

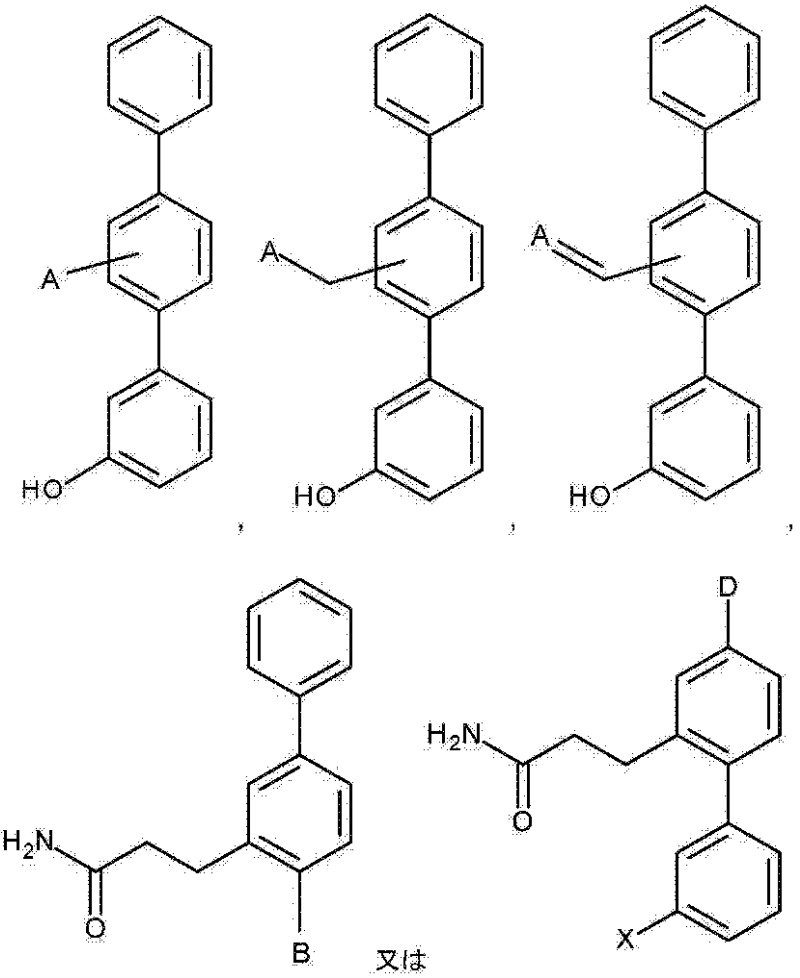

(D172)

からなる群から選択される、項1に記載の化合物、
又は薬理学的に許容されるその塩、立体異性体、ジアステレオマー、エナンチオマー、ラセミ体、水和物及び/若しくは溶媒和物。
［項３］
式:
【化９１】


(D167)

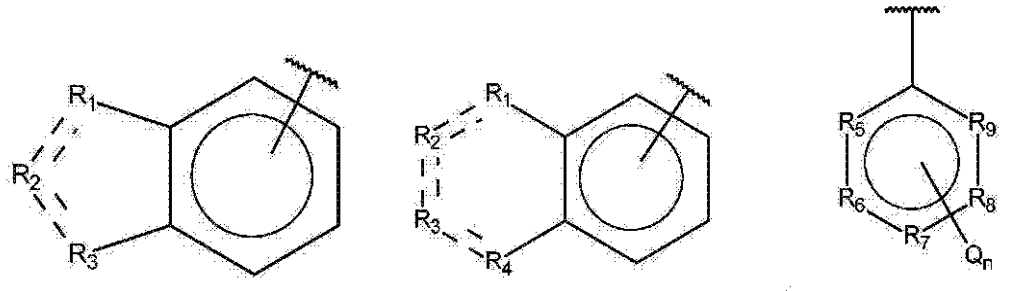
の化合物、
又は薬理学的に許容されるその塩、立体異性体、ジアステレオマー、エナンチオマー、ラセミ体、水和物及び/若しくは溶媒和物。
［項４］
肺線維症を持つ又は肺線維症を発病するリスクがある対象における肺線維症又は関連状態を予防的に又は治療的に処置する方法であって、対象に、有効量の項1から3のいずれか一項に記載の化合物を投与するステップを含む、方法。
［項５］
肺線維症を持つ又は肺線維症を発病するリスクがある対象における肺線維症又は関連状態を予防的に又は治療的に処置する方法であって、対象に、有効量の式:

【化９２】



又は

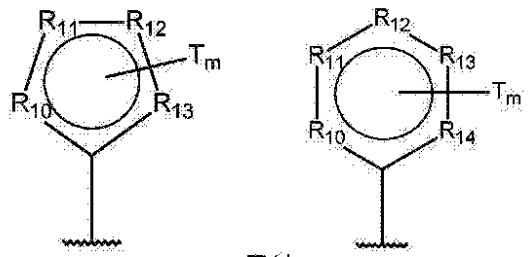
の化合物、
又は薬理学的に許容されるその塩、立体異性体、ジアステレオマー、エナンチオマー、ラセミ体、水和物及び/若しくは溶媒和物
[式中、
Aは、場合により置換されていてもよい飽和、部分飽和又は不飽和5又は6員ヘテロシクリル、場合により置換されていてもよい$C_{1\sim6}$アルコキシルアミン、場合により置換されていてもよい$C_{1\sim6}$アルキルアミン、場合により置換されていてもよい$C_{0\sim6}$アルキルカルボン酸、場合により置換されていてもよい$C_{1\sim6}$アルキルヒドロキシル、場合により置換されていてもよい飽和又は不飽和$C_{0\sim6}$アルキル二環式ヘテロシクリル、及び場合により置換されていてもよい飽和又は不飽和$C_{1\sim6}$アルコキシル二環式ヘテロシクリルから選択され、
Bは、
【化９３】



及び

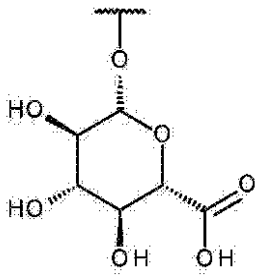
からなる群から選択され、

Qは、ハロ、アルキル、ヒドロキシ、アミノ及び置換アミノから独立して選択され、
nは、0、1、2、3、4又は5であり、
R_1、R_3及びR_4は、独立して、C、CH、CH_2、O、N、NH又はSであり、
R_2は、C、CH、CH_2、N、NH、C-CF_3、CH-CF_3又はC=Oであり、
R_5からR_9は、独立して、C又はNであり、
Dは、
【化９４】

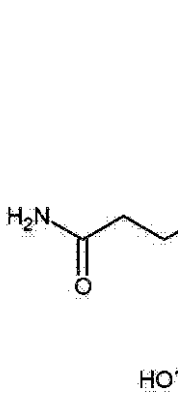


又は

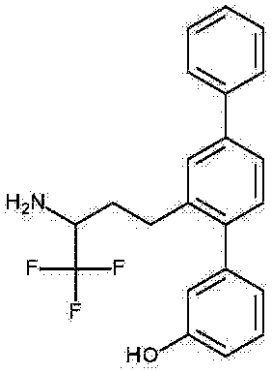
であり、
R_{10}からR_{14}は、独立して、C、N、O又はSであり、
Tは、$C_{1\sim6}$アルキル、ハロ、$C_{0\sim6}$アルキルカルボン酸、アミノ、ヒドロキシ及び$C_{1\sim6}$アルコキシから独立して選択され、
mは、0、1、2、3又は4であり、
Xは、-OH又は
【化９５】



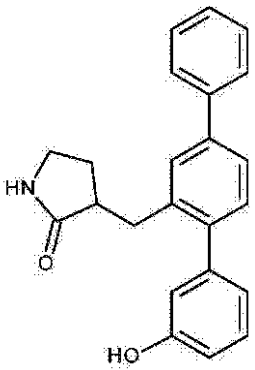
である]
を投与するステップを含む、方法。
［項６］
化合物が、
【化９６】



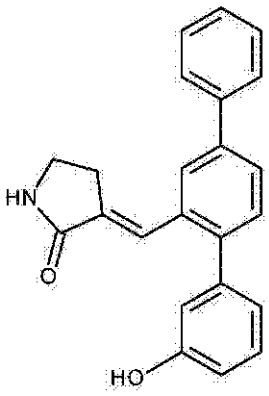
(VB0004),

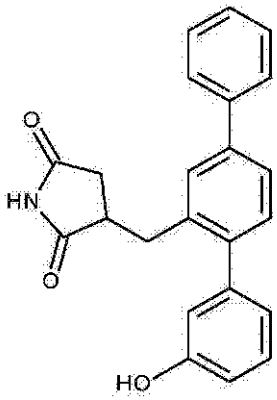


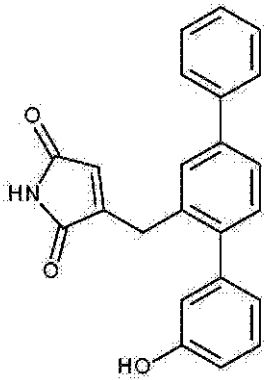
(A6),

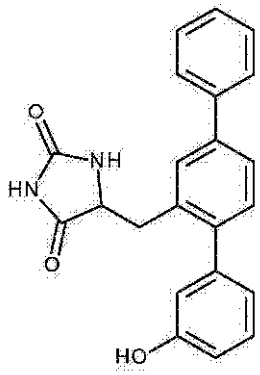


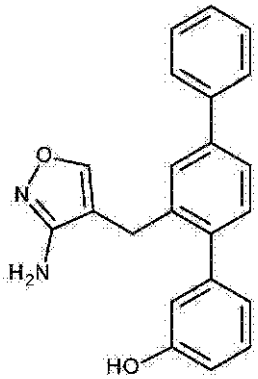
(A26),

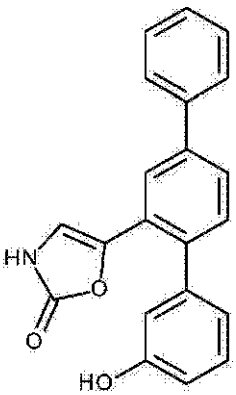

(**A27**),

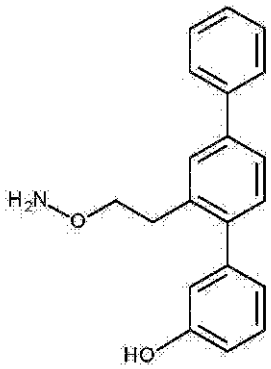

(**A30**),

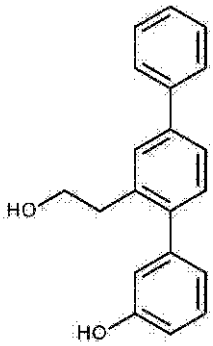

(**A31**),

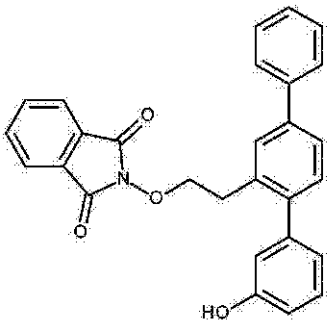

(**A32**),

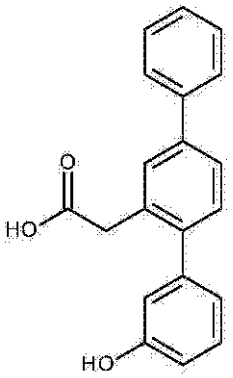

(**A35**),

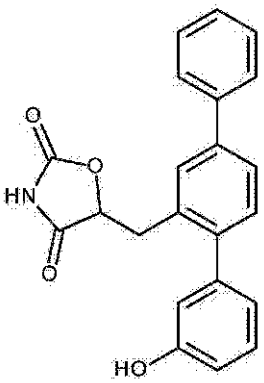

(**A45**),

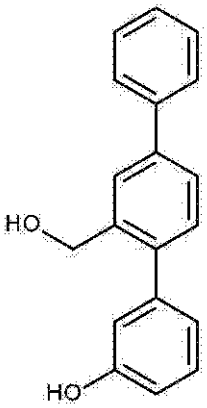

(**A56**),

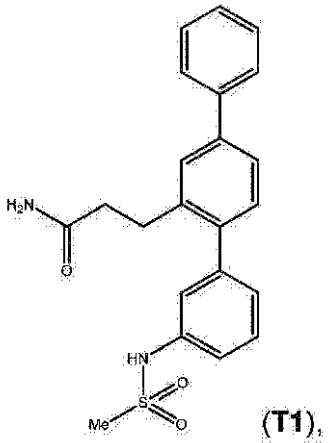

(**A56f**),

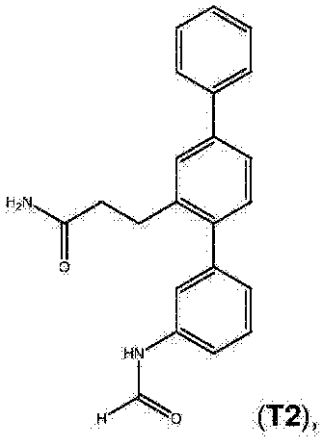

(**A56g**),

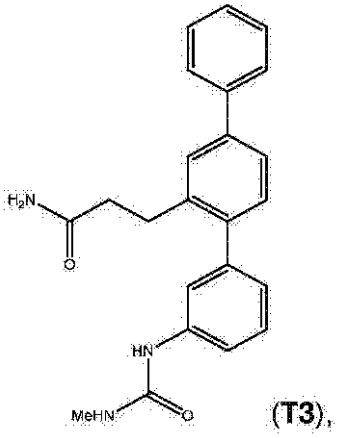

(**A56k**),

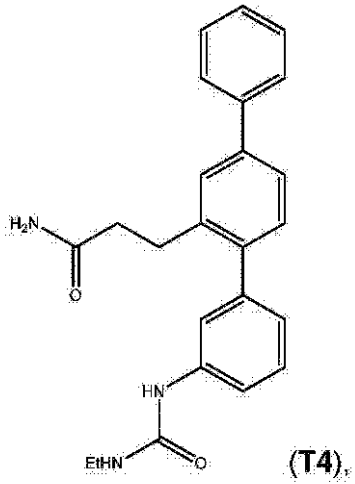

(**A79**),

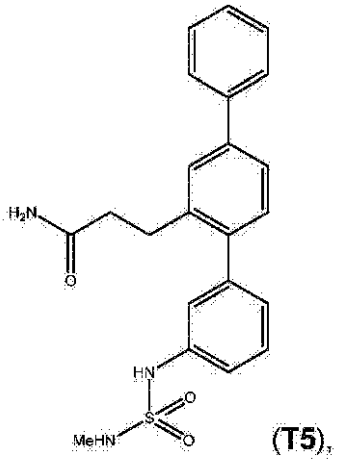

(**A81**),

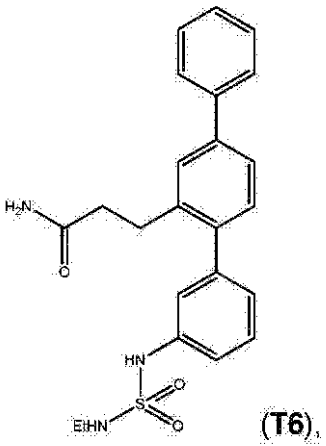

(T1),

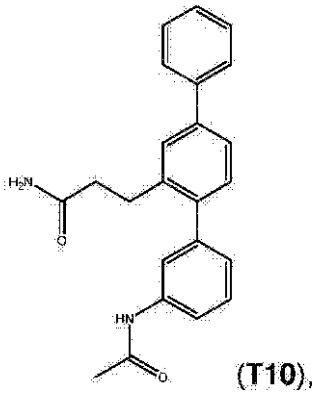

(T2),

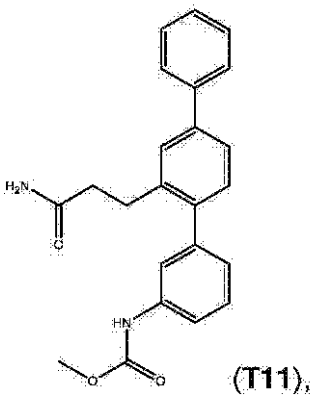

(T3),

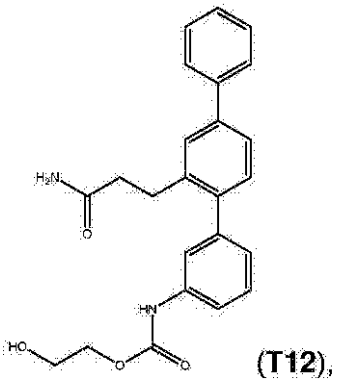

(T4),

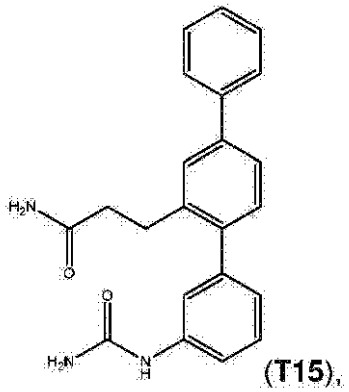

(T5),

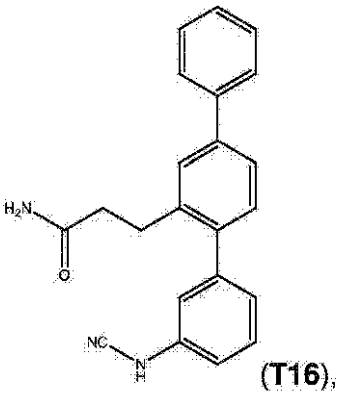

(T6),

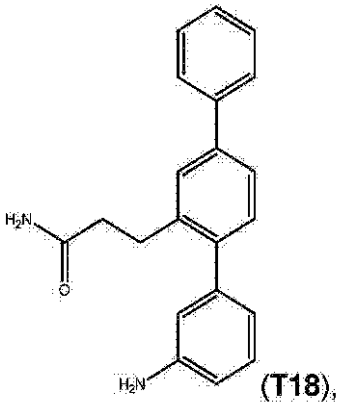

(T10),

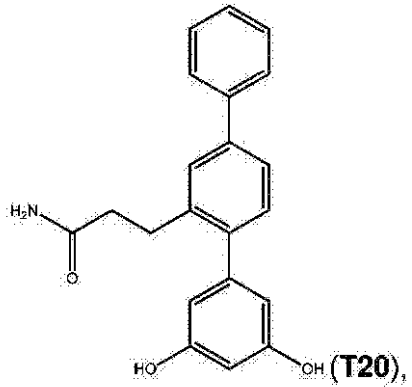

(T11),

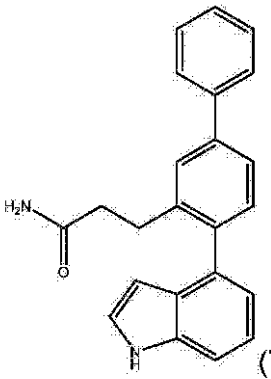

(T12),

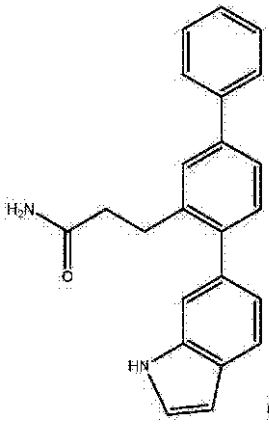

(T15),

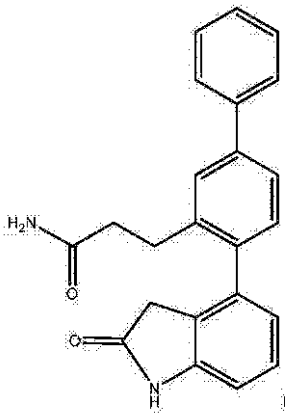

(T16),

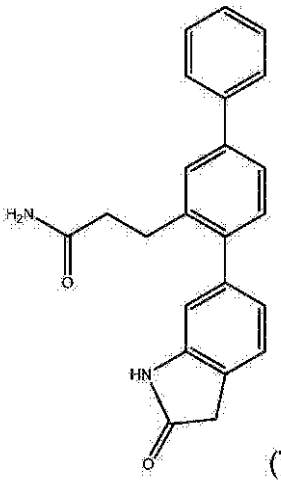

(T18),

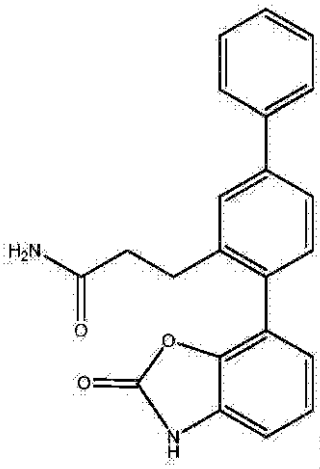

(**T20**),

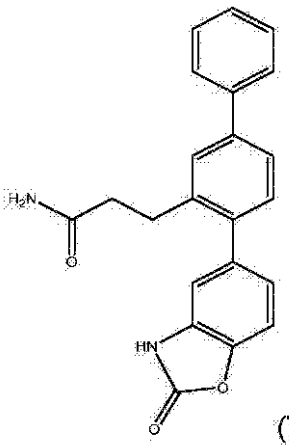

(**T22**),

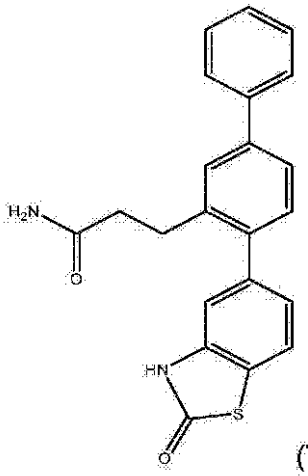

(**T23**),

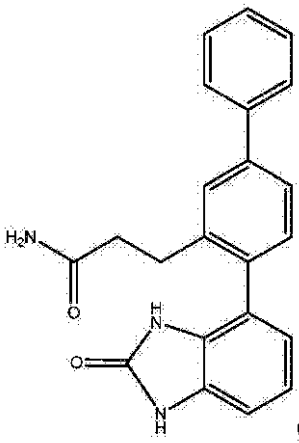

(**T24**),

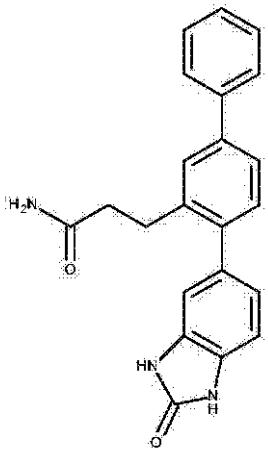

(**T25**),

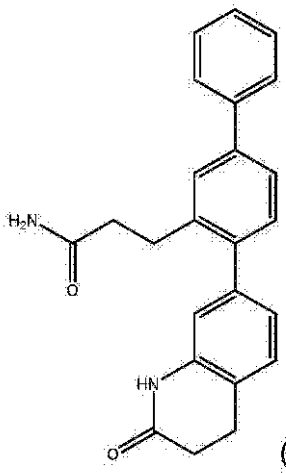

(**T26**),

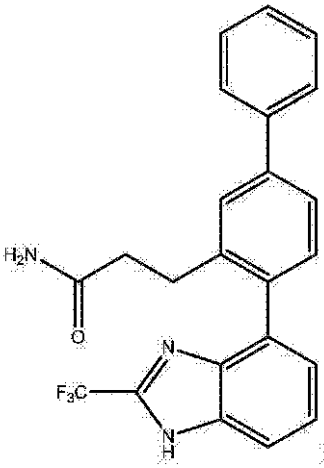

(**T27**),

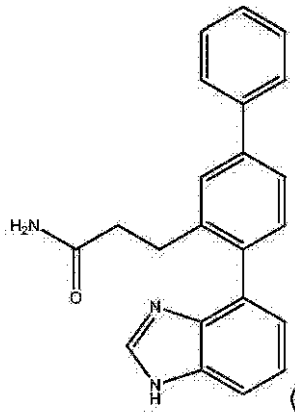

(**T29**),

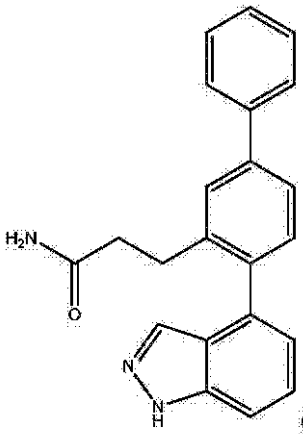

(**T30**),

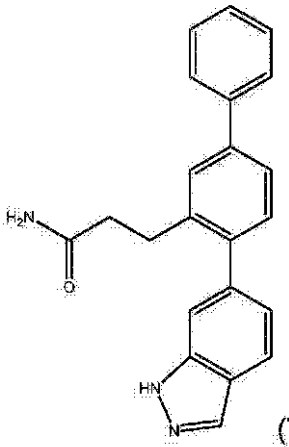

(**T31**),

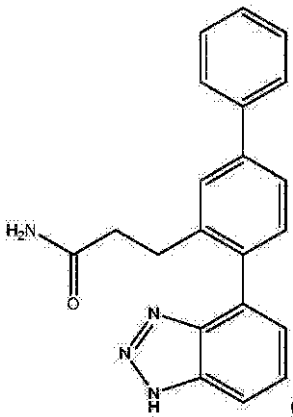

(**T32**),

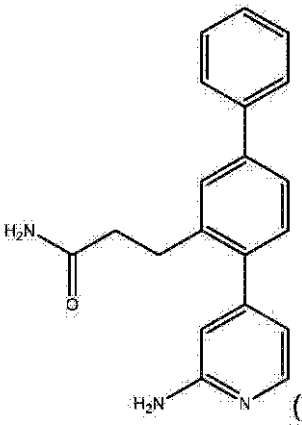

(**T33**),

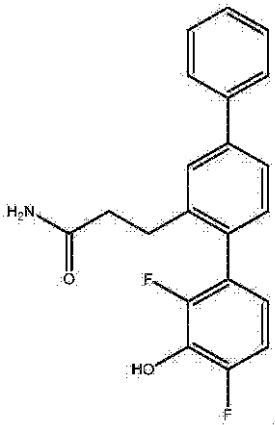

(**T35**),

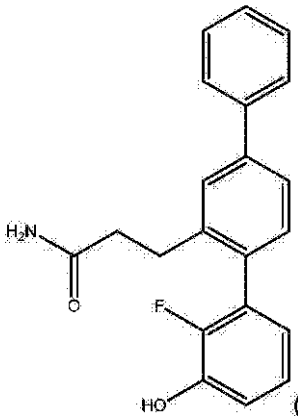

(**T37**),

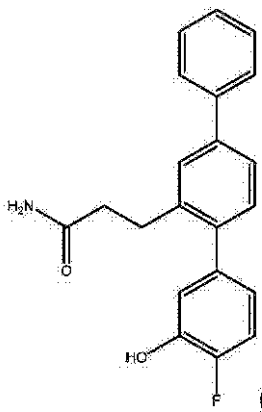

(**T38**),

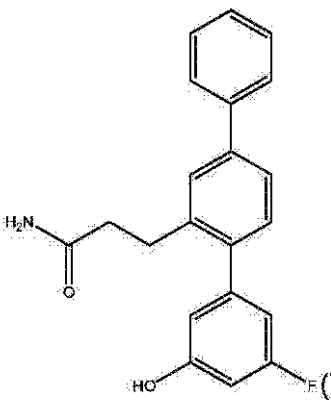

(**T39**),

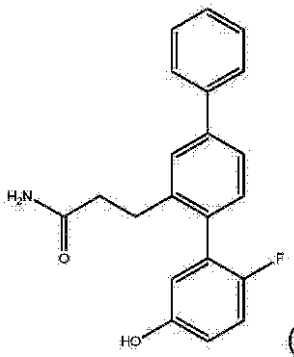

(**T48**),

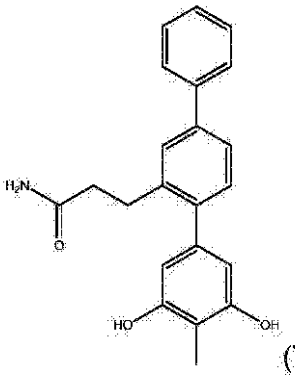

(**T58**),

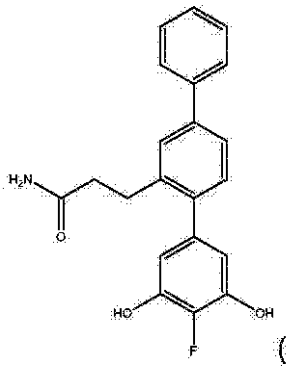

(**T63**),

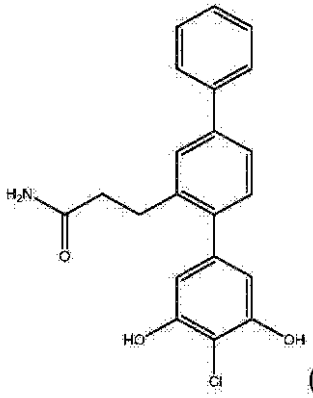

(**T64**),

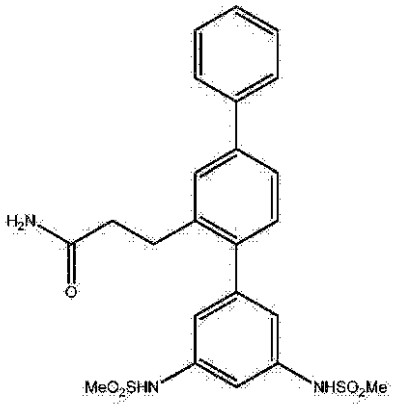

(**T65**),

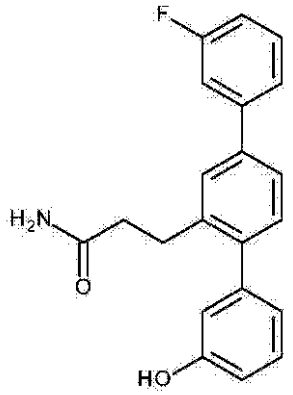

(**T66**),

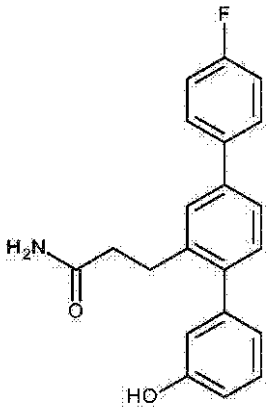

(**T67**),

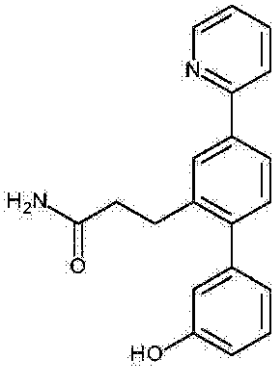

(**T68**),

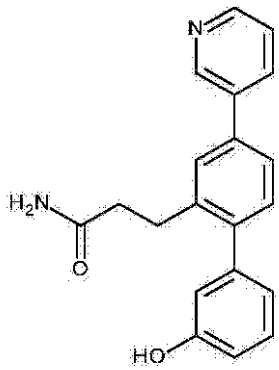

(**T69**),

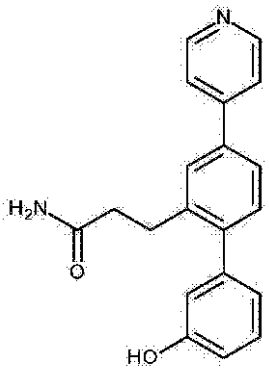

(**T70**),

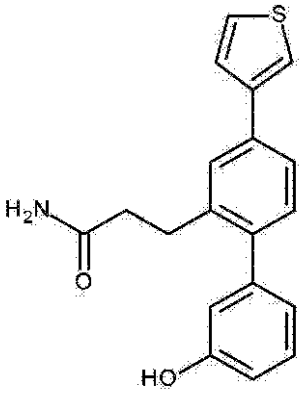

(**P1**),

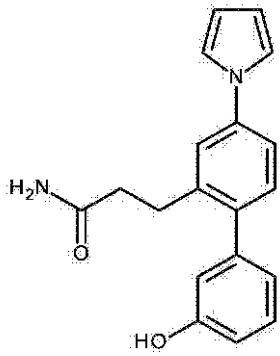

(**P3**),

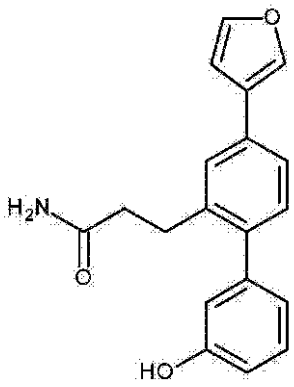

(**P4**),

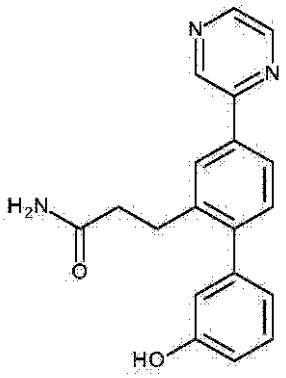

(**P5**),

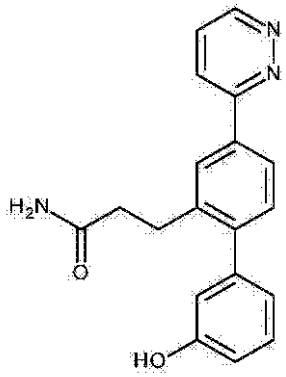

(**P6**),

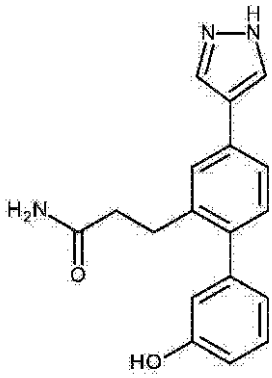

(**P8**),

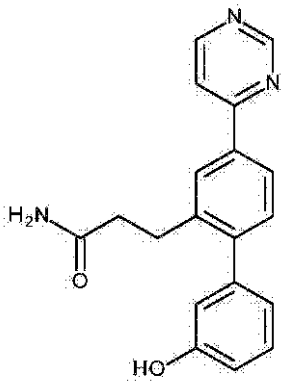

(**P9**),

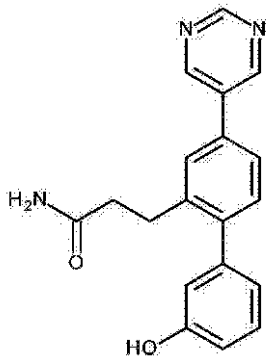

(**P11**),

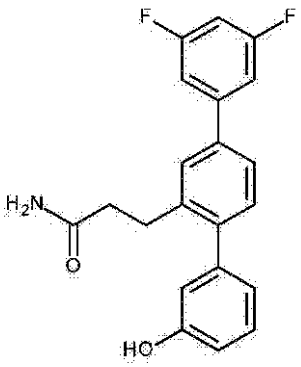

(**P13**),

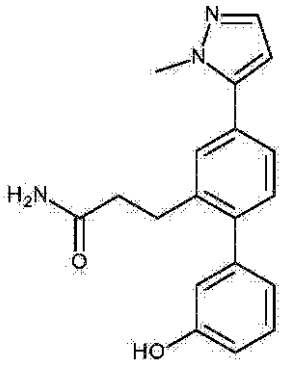

(**P14**),

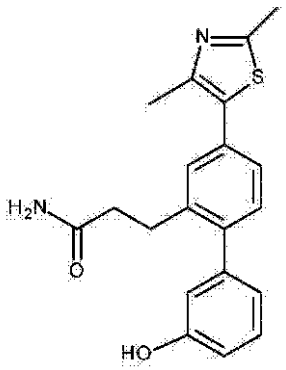

(**P22**),

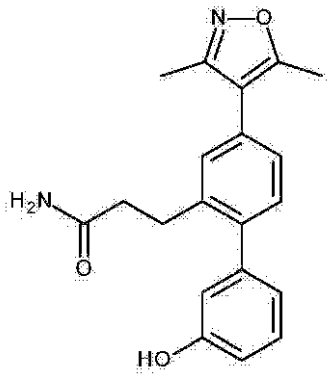

(**P25**),

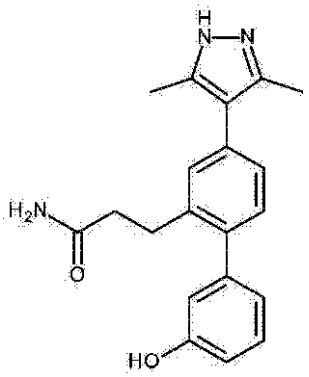

(**P26**),

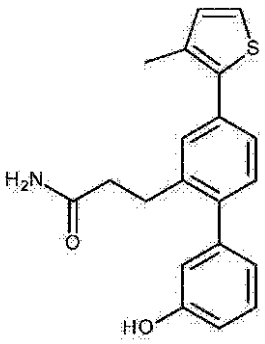
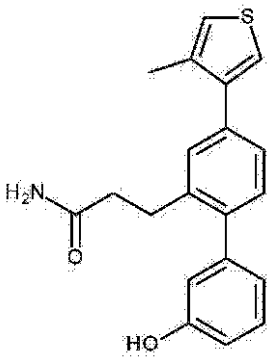
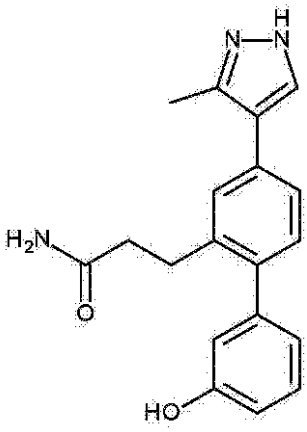
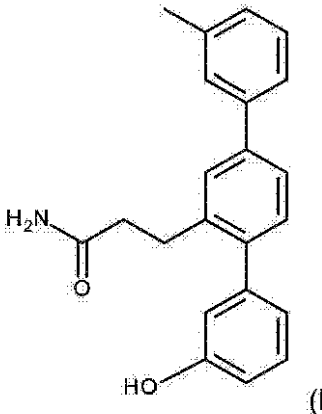
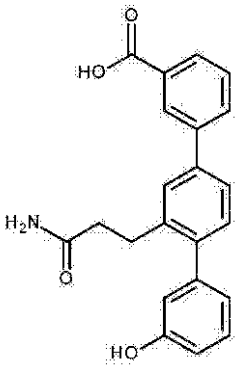
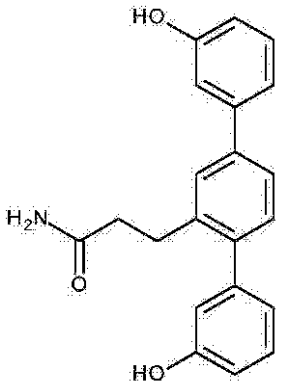
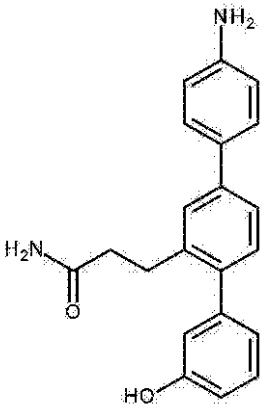
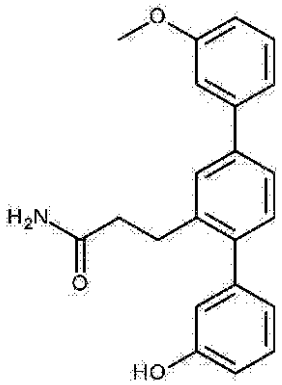
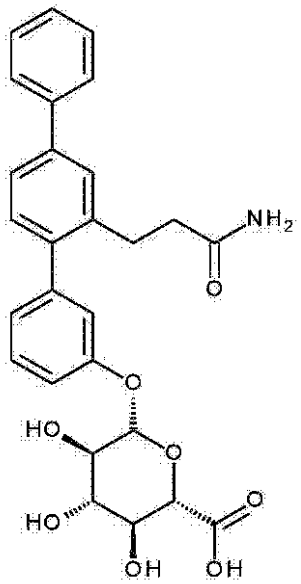

(**P33**),


(**P38**),


(**P40**),


(**P41**),


(**P42**),


(**P43**),

(**P44**),

(**P45**),

(**P46**),

(**P47**),

(**P48**),

(**P49**),

(**P50**) 及び

(**P104**)

からなる群から選択される、又は薬理学的に許容されるその塩、立体異性体、ジアステレオマー、エナンチオマー、ラセミ体、水和物及び/若しくは溶媒和物である、項5に記載の方法。

［項７］

肺線維症を発病するリスクがある対象が、ガス、煙、化学物質、アスベスト繊維又は粉塵に曝露されたことがある、項4から6のいずれか一項に記載の方法。

［項８］

肺線維症を発病するリスクがある対象が、肺の自己免疫障害、ウイルス感染症又は細菌感染症を有する、項4から6のいずれか一項に記載の方法。

［項９］

肺線維症を発病するリスクがある対象が、肺又は乳がんのための放射線療法を受けたことがある、項4から6のいずれか一項に記載の方法。

［項１０］

肺線維症を発病するリスクがある対象が、遺伝的素因を有する、項4から6のいずれか一項に記載の方法。

［項１１］

肺線維症を発病するリスクがある対象が、喫煙者である、項4から6のいずれか一項に記載の方法。

［項１２］

関連状態が、肺高血圧症、右心不全、呼吸不全、低酸素症、咳、血栓の形成、肺炎及び肺がんから選択される、項4から11のいずれか一項に記載の方法。

［項１３］

処置が、肺線維症の進行を予防する、低減させる、又は遅らせる、項4から12のいずれか一項に記載の方法。

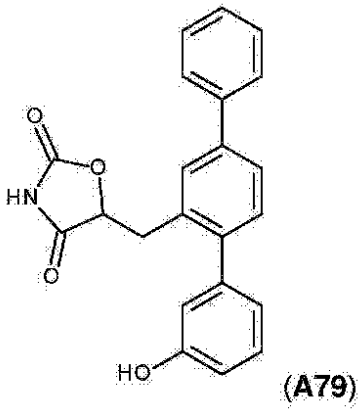
［項１４］

処置が、確立された肺線維症を低減させる、項4から13のいずれか一項に記載の方法。

［項１５］

式

【化９７】



(A79)

の化合物、

又は薬理学的に許容されるその塩、立体異性体、ジアステレオマー、エナンチオマー、ラセミ体、水和物及び/若しくは溶媒和物。