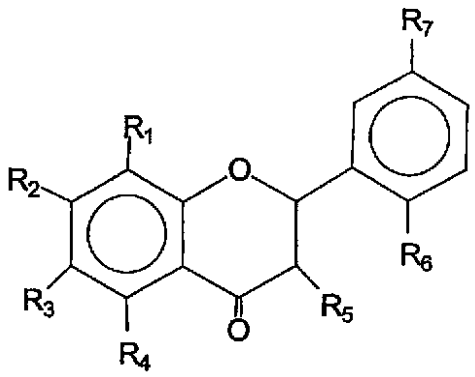
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成21年5月14日(2009.5.14)

【公表番号】特表2008-534520(P2008-534520A)
【公表日】平成20年8月28日(2008.8.28)
【年通号数】公開・登録公報2008-034
【出願番号】特願2008-503326(P2008-503326)
【国際特許分類】
Ａ６１Ｋ　31/353　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　43/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　9/12　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　9/10　(2006.01)
Ａ６１Ｐ　9/00　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/40　(2006.01)
Ａ６１Ｋ　47/34　(2006.01)
【ＦＩ】
Ａ６１Ｋ　31/353
Ａ６１Ｐ　43/00　１１１
Ａ６１Ｐ　9/12
Ａ６１Ｐ　9/10
Ａ６１Ｐ　9/00
Ａ６１Ｋ　47/40
Ａ６１Ｋ　47/34

【手続補正書】
【提出日】平成21年3月30日(2009.3.30)
【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】
ホスホジエステラーゼのタイプ１から５のアイソフォーム（ＰＤＥ１、ＰＤＥ２、ＰＤＥ３、ＰＤＥ４及びＰＤＥ５）の強力で選択的な阻害剤として、下記一般式の化合物を含む、医薬組成物。
【化１】



（式中、R^1、R^2、R^3、R^4、R^5、R^6及びR^7は、同一又は異なってよい官能基であり、水素、ヒドロキシル、メトキシル及びプレニルを含む）
【請求項２】
ａ）ＰＤＥ５に対して阻害活性を有するジオクレイン、フロラノール又は類似体をベースにした、請求項１に記載の一般式の化合物、
ｂ）ジオクレイン、フロラノール又は類似体とシクロデキストリンとの間の包接化合物、
ｃ）薬学的に及び薬理学的に許容される賦形剤、
ｄ）ジオクレイン、フロラノール又は類似体と、それらのシクロデキストリン及びその誘導体との包接化合物、並びにＰＬＧＡ、ＰＧＡ、ＰＬＡ及びそれらの混合物を含む群から選択される生分解性ポリマーからのそれらの誘導体からなる制御放出システムとを含む、医薬組成物。
【請求項３】
前記化合物が、経口経路で活性である、請求項１に記載の医薬組成物。
【請求項４】
筋内、経口、静脈内、皮下、局所、吸入（肺、鼻腔内、口内）経路を経由して、或いは埋め込み又は注入されるデバイスとして送達される、請求項１又は２に記載の医薬組成物。
【請求項５】
ホスホジエステラーゼのタイプ１から５のアイソフォーム（ＰＤＥ１、ＰＤＥ２、ＰＤＥ３、ＰＤＥ４及びＰＤＥ５）の強力で選択的な阻害剤として、請求項１に記載する一般式の化合物を含む、制御放出装置を作製する方法であって、
ａ）ジクロロメタンに溶解したポリ（乳酸－グリコール酸）（ＰＬＧＡ）で構成される有機相と、フラボノイド、ジオクレイン及びフロラノールで構成される水相とで構成されるエマルジョンを調製し、
ｂ）該エマルジョンを、３０秒間超音波処理にかけ、次いで、１％ポリビニルアルコール（ＰＶＡ）溶液を添加して、第２のエマルジョンを形成し、
ｃ）該第２のエマルジョンを、完全に均質化するまで撹拌し、
ｄ）加熱せずに２時間撹拌して溶媒を蒸発し、
ｅ）混合物を２～３回遠心し、
ｆ）上清液を除去し、水で洗浄し、
ｇ）１～２ｍＬの水が残ったままとし、得られた系を２４～４８時間の凍結乾燥にかける、作製方法。
【請求項６】
ジオクレイン及びフロラノール又はそれらの類似体のＰＤＥ１に対する活性及び効能を選択的に抑制するための医薬を製造するための、請求項１に記載の医薬組成物の使用。
【請求項７】
プロテインキナーゼＡ及びプロテインキナーゼＧの活性化を介するヒト動脈及び静脈に対する血管拡張効果を得るための医薬を製造するための、請求項１に記載の医薬組成物の使用。
【請求項８】
プロテインキナーゼＡ及びプロテインキナーゼＧの活性化を介する耐性の動脈に対する血管拡張効果を得るための医薬を製造するための、請求項１に記載の医薬組成物の使用。
【請求項９】
動脈性高血圧、アテローム性動脈硬化症及び再狭窄を試験及び治療するための医薬を製造するための、請求項１に記載の医薬組成物の使用。
【請求項１０】
ジオクレイン及びフロラノール化合物又はそれらの類似体の生物学的利用能を増大するための医薬を製造するための、請求項１に記載の医薬組成物の使用。

【請求項１１】
請求項１に記載の医薬組成物の使用を含む、ジオクレイン及びフロラノール化合物又はそれらの類似体に基づく薬剤及び医薬組成物を開発するための分子モデルを得る方法。