

【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27年10月8日 (2015.10.8)

【公開番号】特開2015-155425(P2015-155425A)

【公開日】平成27年8月27日 (2015.8.27)

【年通号数】公開・登録公報2015-054

【出願番号】特願2015-71973(P2015-71973)

【国際特許分類】

C 07D 217/22 (2006.01)

C 07D 217/24 (2006.01)

C 07D 217/26 (2006.01)

A 61K 31/472 (2006.01)

A 61P 19/10 (2006.01)

A 61P 9/00 (2006.01)

A 61P 19/08 (2006.01)

A 61P 15/12 (2006.01)

A 61P 25/28 (2006.01)

A 61P 17/14 (2006.01)

A 61P 29/00 (2006.01)

A 61P 35/00 (2006.01)

A 61P 35/02 (2006.01)

A 61P 9/10 (2006.01)

A 61P 39/06 (2006.01)

A 61P 27/02 (2006.01)

A 61P 3/06 (2006.01)

A 61P 1/16 (2006.01)

A 61P 13/12 (2006.01)

A 61P 3/10 (2006.01)

A 61P 9/12 (2006.01)

A 61P 9/04 (2006.01)

A 61P 13/08 (2006.01)

A 61P 17/16 (2006.01)

A 61P 25/16 (2006.01)

A 61P 25/14 (2006.01)

A 61P 25/00 (2006.01)

A 61P 21/00 (2006.01)

A 61P 19/02 (2006.01)

【F I】

C 07D 217/22 C S P

C 07D 217/24

C 07D 217/26

A 61K 31/472

A 61P 19/10

A 61P 9/00

A 61P 19/08

A 61P 15/12

A 61P 25/28

A 61P 17/14

A 61P 29/00

A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	35/02	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	39/06	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	3/06	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	9/12	
A 6 1 P	9/10	1 0 3
A 6 1 P	9/04	
A 6 1 P	13/08	
A 6 1 P	17/16	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/14	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	19/02	

【手続補正書】

【提出日】平成27年7月28日(2015.7.28)

【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

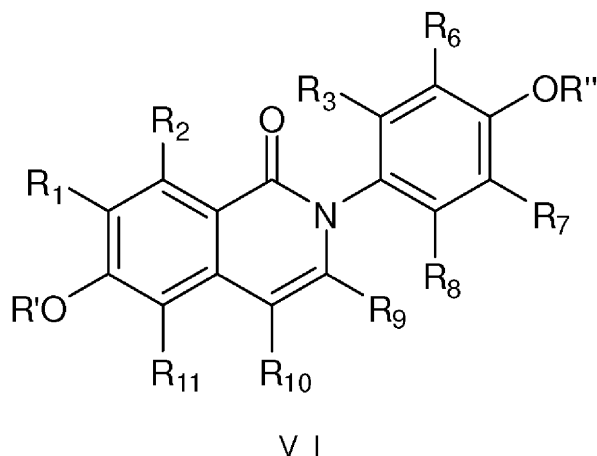
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

肥満を治療、発症遅延、発生率を低下又は重篤度を軽減するための薬剤を製造するための、化学構造式VIで示される化学物質、若しくはその異性体、薬学的に許容される塩、N-酸化物若しくは水和物、又はそれらの組み合わせの使用。



式中、

R_1 、 R_2 及び R_{11} は、互いに独立して、水素、 COOH 、 $-\text{C}(=\text{NH})-\text{OH}$ 、 CHNOH 、 $\text{CH}=\text{CHCO}_2\text{H}$ 、 $\text{CH}=\text{CHCO}_2\text{R}$ 、 $-\text{CH}=\text{CH}_2$ 、ハロゲン、ヒ

ドロキシル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、シアノ、ニトロ、 NH_2 、4 - メトキシフェニル、4 - ヒドロキシフェニル、SH、COR、COOR、OCOR、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 OSO_2CF_3 、 OSO_2CH_3 、NHR、NHCOR、 $N(R)_2$ 、スルホンアミド、 SO_2R 、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、又は保護されたヒドロキシルであり、

R_9 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、シアノ、ニトロ、又は CF_3 であり、

R_{10} は、水素、 $-C(=NH)-OH$ 、 $CHNOH$ 、 $CH=CHCO_2H$ 、 $CH=CHCO_2R$ 、 $CH=CH_2$ 、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、シアノ、ニトロ、 NH_2 、SH、COR、COOR、OCOR、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 OSO_2CF_3 、 OSO_2CH_3 、NHR、NHCOR、 $N(R)_2$ 、スルホンアミド、 SO_2R 、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、アリル、又は保護されたヒドロキシルであり、

R_3 、 R_6 、 R_7 及び R_8 は、互いに独立して、水素、 $-C(=NH)-OH$ 、 $CHNOH$ 、 $CH=CHCO_2H$ 、 $CH=CHCO_2R$ 、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、シアノ、ニトロ、 NH_2 、4 - メトキシフェニル、4 - ヒドロキシフェニル、SH、COR、COOR、OCOR、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 OSO_2CF_3 、 OSO_2CH_3 、NHR、NHCOR、 $N(R)_2$ 、スルホンアミド、 SO_2R 、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、又は保護されたヒドロキシルであり、

R' は、水素、Alk 又は COR であり、

R'' は、水素、Alk 又は COR であり、

R は、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ - ジハロアルキル、 $C_1 - C_6$ - トリハロアルキル、アリル、ベンジル、ハロゲン、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、CN、又は NO_2 であり、

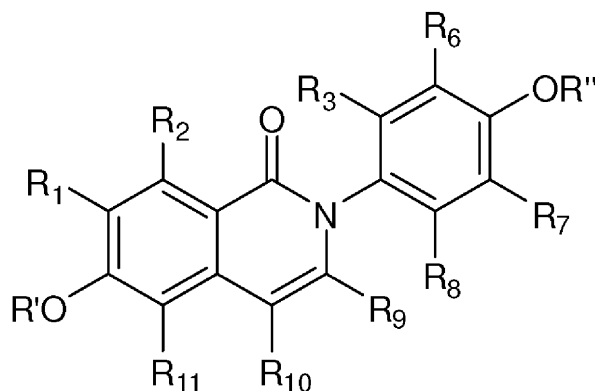
Alk は、炭素数 1 ~ 7 の直鎖アルキル、炭素数 1 ~ 7 の分枝アルキル、又は炭素数 3 ~ 8 の環状アルキルである。

【請求項 2】

前記肥満は、糖尿病に関連していることを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【請求項 3】

線維症を治療、発症遅延、発生率を低下又は重篤度を軽減するための薬剤を製造するための、化学構造式 VI で示される化学物質、若しくはその異性体、薬学的に許容される塩、N - 酸化物若しくは水和物、又はそれらの組み合わせの使用。



VI

式中、

R_1 、 R_2 及び R_{11} は、互いに独立して、水素、 $COOH$ 、 $-C(=NH)-OH$ 、 $CHNOH$ 、 $CH=CHCO_2H$ 、 $CH=CHCO_2R$ 、 $-CH=CH_2$ 、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、シアノ、ニトロ、 NH_2 、4 - メトキシフェニル

、4 - ヒドロキシフェニル、SH、COR、COOR、OCOR、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 OSO_2CF_3 、 OSO_2CH_3 、NHR、NHCOR、 $N(R)_2$ 、スルホンアミド、 SO_2R 、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、又は保護されたヒドロキシルであり、

R_9 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、シアノ、ニトロ、又は CF_3 であり、

R_{10} は、水素、 $-C(=NH)-OH$ 、 $CHNOH$ 、 $CH=CHCO_2H$ 、 $CH=CHCO_2R$ 、 $CH=CH_2$ 、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、シアノ、ニトロ、 NH_2 、SH、COR、COOR、OCOR、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 OSO_2CF_3 、 OSO_2CH_3 、NHR、NHCOR、 $N(R)_2$ 、スルホンアミド、 SO_2R 、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、アリル、又は保護されたヒドロキシルであり、

R_3 、 R_6 、 R_7 及び R_8 は、互いに独立して、水素、 $-C(=NH)-OH$ 、 $CHNOH$ 、 $CH=CHCO_2H$ 、 $CH=CHCO_2R$ 、ハロゲン、ヒドロキシル、 $C_1 - C_6$ - アルコキシ、シアノ、ニトロ、 NH_2 、4 - メトキシフェニル、4 - ヒドロキシフェニル、SH、COR、COOR、OCOR、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、 OSO_2CF_3 、 OSO_2CH_3 、NHR、NHCOR、 $N(R)_2$ 、スルホンアミド、 SO_2R 、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、又は保護されたヒドロキシルであり、

R' は、水素、Alk 又は COR であり、

R'' は、水素、Alk 又は COR であり、

R は、 $C_1 - C_6$ - アルキル、 $C_1 - C_6$ - ハロアルキル、 $C_1 - C_6$ - ジハロアルキル、 $C_1 - C_6$ - トリハロアルキル、アリル、ベンジル、ハロゲン、 $C_2 - C_6$ - アルケニル、CN、又は NO_2 であり、

Alk は、炭素数 1 ~ 7 の直鎖アルキル、炭素数 1 ~ 7 の分枝アルキル、又は炭素数 3 ~ 8 の環状アルキルである。

【請求項 4】

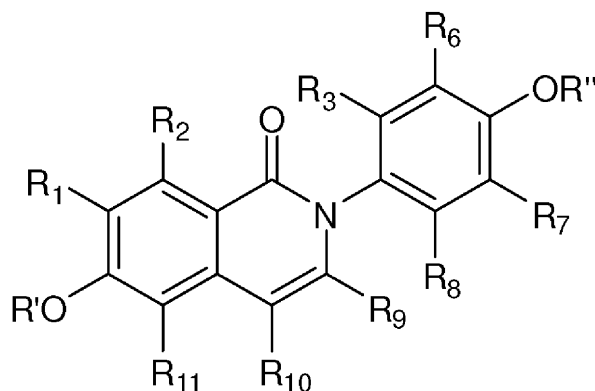
前記線維症は、血管線維症、アテローム性動脈硬化症、肺線維症、嚢胞性線維症、肝臓の疵痕及び硬変、原発性硬化性胆管炎、原発性胆汁性肝硬変、筋萎縮性側索硬化症、一般的な線維症症候群、黄斑線維症、皮膚線維腫、硬皮症、又は多発性硬化症であることを特徴とする請求項 3 に記載の使用。

【請求項 5】

前記肺線維症は特発性肺線維症であることを特徴とする請求項 4 に記載の使用。

【請求項 6】

心血管疾患を治療、発症遅延、発生率を低下又は重篤度を軽減するための薬剤を製造するための、化学構造式 VI で示される化学物質、若しくはその異性体、薬学的に許容される塩、N - 酸化物若しくは水和物、又はそれらの組み合わせの使用。



VI

式中、

R_1 、 R_2 及び R_{11} は、互いに独立して、水素、 COOH 、 $-\text{C}(=\text{NH})-\text{OH}$ 、 CHNOH 、 $\text{CH}=\text{CHCO}_2\text{H}$ 、 $\text{CH}=\text{CHCO}_2\text{R}$ 、 $-\text{CH}=\text{CH}_2$ 、ハロゲン、ヒドロキシル、 C_1-C_6 -アルコキシ、シアノ、ニトロ、 NH_2 、4-メトキシフェニル、4-ヒドロキシフェニル、 SH 、 COR 、 COOR 、 OCOR 、 C_2-C_6 -アルケニル、 OSO_2CF_3 、 OSO_2CH_3 、 NHR 、 NHCOR 、 $\text{N}(\text{R})_2$ 、スルホンアミド、 SO_2R 、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、又は保護されたヒドロキシルであり、

R_9 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、 C_1-C_6 -アルコキシ、シアノ、ニトロ、又は CF_3 であり、

R_{10} は、水素、 $-\text{C}(=\text{NH})-\text{OH}$ 、 CHNOH 、 $\text{CH}=\text{CHCO}_2\text{H}$ 、 $\text{CH}=\text{CHCO}_2\text{R}$ 、 $\text{CH}=\text{CH}_2$ 、ハロゲン、ヒドロキシル、 C_1-C_6 -アルコキシ、シアノ、ニトロ、 NH_2 、 SH 、 COR 、 COOR 、 OCOR 、 C_2-C_6 -アルケニル、 OSO_2CF_3 、 OSO_2CH_3 、 NHR 、 NHCOR 、 $\text{N}(\text{R})_2$ 、スルホンアミド、 SO_2R 、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、アリル、又は保護されたヒドロキシルであり、

R_3 、 R_6 、 R_7 及び R_8 は、互いに独立して、水素、 $-\text{C}(=\text{NH})-\text{OH}$ 、 CHNOH 、 $\text{CH}=\text{CHCO}_2\text{H}$ 、 $\text{CH}=\text{CHCO}_2\text{R}$ 、ハロゲン、ヒドロキシル、 C_1-C_6 -アルコキシ、シアノ、ニトロ、 NH_2 、4-メトキシフェニル、4-ヒドロキシフェニル、 SH 、 COR 、 COOR 、 OCOR 、 C_2-C_6 -アルケニル、 OSO_2CF_3 、 OSO_2CH_3 、 NHR 、 NHCOR 、 $\text{N}(\text{R})_2$ 、スルホンアミド、 SO_2R 、 C_1-C_6 -アルキル、 C_1-C_6 -ハロアルキル、又は保護されたヒドロキシルであり、

R' は、水素、 Alk 又は COR であり、

R'' は、水素、 Alk 又は COR であり、

R は、アルキル、ハロアルキル、ジハロアルキル、トリハロアルキル、アリル、ベンジル、ハロゲン、アルケニル、 CN 、又は NO_2 であり、

Alk は、炭素数 1～7 の直鎖アルキル、炭素数 1～7 の分枝アルキル、又は炭素数 3～8 の環状アルキルである。

【請求項 7】

前記心血管疾患は、心臓線維症であることを特徴とする請求項 6 に記載の使用。

【請求項 8】

前記化学物質は、4-プロモ-6, 8-ジヒドロキシ-2-(4-ヒドロキシフェニル)イソキノリン-1(2H)-オン、又は 6, 8-ジヒドロキシ-2-(4-ヒドロキシフェニル)-1-オキソ-1, 2-ジヒドロイソキノリン-4-カルボニトリルであることを特徴とする請求項 1、3 又は 6 に記載の使用。