

【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25年10月3日(2013.10.3)

【公表番号】特表2013-503160(P2013-503160A)

【公表日】平成25年1月31日(2013.1.31)

【年通号数】公開・登録公報2013-005

【出願番号】特願2012-526728(P2012-526728)

【国際特許分類】

C 0 7 D 277/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/426 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 P 7/06 (2006.01)

A 6 1 P 39/06 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (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 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 277/12 C S P

A 6 1 K 31/426

A 6 1 K 9/20

A 6 1 P 7/06

A 6 1 P 39/06

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 29/00

【手続補正書】

【提出日】平成25年8月14日(2013.8.14)

【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

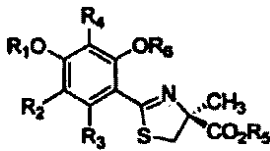
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I):

【化39】



I

[式中、

R_1 は、 $-[(CH_2)_n - O]_x - R'$ であり；

R_2 、 R_3 および R_4 は、それぞれ独立に、 $-H$ 、アルキル基、または $-OR_7$ であり；

；

R_5 は、 $-H$ 、またはアルキル基であり；

R_6 は、 $-H$ 、アルキル基、 O -保護基、またはアシル基であり；

各 R_7 は、独立に、 $-H$ 、アルキル基、 O -保護基、またはアシル基であり；

R' は、 $-H$ 、アルキル基、 O -保護基、またはアシル基であり；

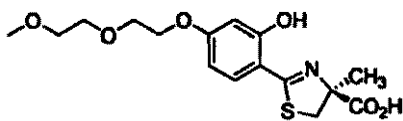
各 n は、2 であり；

x は、1 または 2 である]

の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物であって、

下記式 (II)：

【化40】



II

の化合物でないことを条件とする化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項2】

R_2 、 R_3 および R_4 が、それぞれ独立に、 $-H$ 、 C_{1-6} アルキル基、または $-OR_7$ であり； R_6 が、 $-H$ 、 O -保護基、またはアシル基である、請求項1に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項3】

R_2 、 R_3 および R_4 が、それぞれ独立に、 $-H$ 、 C_{1-4} アルキル基、または $-OR_7$ であり； R_6 が、 $-H$ 、 O -保護基、またはアシル基である、請求項1に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項4】

x が2であり、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_6 が水素である、請求項1に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項5】

R_2 、 R_3 および R_4 がそれぞれ水素である、請求項1に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項6】

R_2 、 R_3 および R_4 が、それぞれ独立に、 $-H$ または C_{1-4} アルキル基である、請求項1に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項7】

R_2 、 R_3 および R_4 が、それぞれ独立に、メチル、エチル、プロピルまたはブチル基である、請求項1に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項8】

R_2 、 R_3 および R_4 が同じである、請求項7に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項9】

R_2 、 R_3 および R_4 が、それぞれ独立に、 $-OR_7$ である、請求項1に記載の化合物

、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 10】

各 R_7 が水素である、請求項 9 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 11】

各 R_7 が C_{1-4} アルキル基である、請求項 9 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 12】

各 R_7 が O -保護基である、請求項 9 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 13】

各 R_7 がアシル基である、請求項 9 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 14】

各 R_7 がアセチル基である、請求項 13 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 15】

R_2 、 R_3 および R_4 が同じである、請求項 10 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 16】

R_2 、 R_3 および R_4 が水素である、請求項 15 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 17】

R_6 が水素である、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 18】

R_6 が O -保護基である、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 19】

R_6 がアシル基である、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 20】

R_6 がアセチル基である、請求項 19 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 21】

R_2 、 R_3 、 R_4 および R_6 が同じである、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 22】

R_2 、 R_3 、 R_4 および R_6 が水素である、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 23】

x が 1 であり、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_6 が水素である、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 24】

R' が C_{1-4} アルキル基である、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 25】

R' が、メチル、エチル、プロピルまたはブチルである、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 26】

R' がメチルである、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 27】

x が 1 である、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 28】

x が 2 である、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 29】

x が 1 であり、R' がメチルである、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

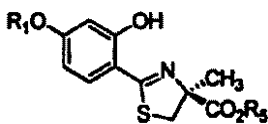
【請求項 30】

x が 2 であり、R' がメチルである、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 31】

前記化合物が、

【化 4 1】

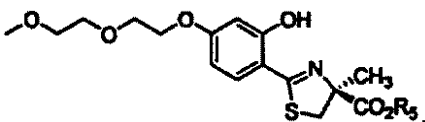


である、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 32】

前記化合物が、

【化 4 2】

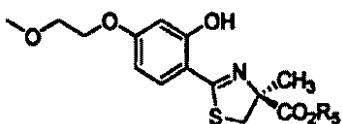


である、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 33】

前記化合物が、

【化 4 3】

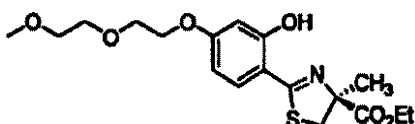


である、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 34】

前記化合物が、

【化 4 4】

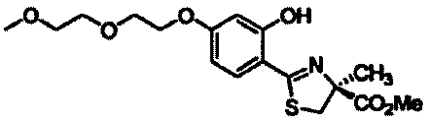


である、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 35】

前記化合物が、

【化 4 5】

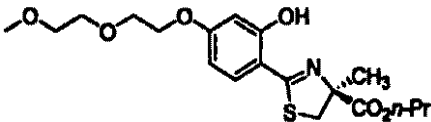


である、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 3 6】

前記化合物が、

【化 4 6】

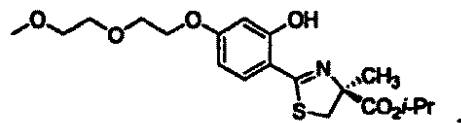


である、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 3 7】

前記化合物が、

【化 4 7】



である、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 3 8】

前記化合物が固体である、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 3 9】

前記化合物が結晶性固体である、請求項 1 ~ 3 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 4 0】

鏡像異性体過剰率が 90% より高い、請求項 1 ~ 3 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 4 1】

鏡像異性体過剰率が 95% より高い、請求項 1 ~ 3 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 4 2】

鏡像異性体過剰率が 98% より高い、請求項 1 ~ 3 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 4 3】

鏡像異性体過剰率が 99% より高い、請求項 1 ~ 3 8 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物。

【請求項 4 4】

請求項 1 ~ 4 3 のいずれか 1 項に記載の塩。

【請求項 4 5】

対イオンがリチウムである、請求項 4 4 に記載の塩。

【請求項 4 6】

対イオンがカリウムである、請求項 4 4 に記載の塩。

【請求項 4 7】

対イオンがナトリウムである、請求項 4 4 に記載の塩。

【請求項 4 8】

対イオンがマグネシウムである、請求項 4 4 に記載の塩。

【請求項 49】

対イオンがバリウムである、請求項 44 に記載の塩。

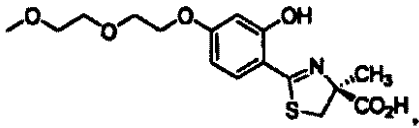
【請求項 50】

対イオンがカルシウムである、請求項 44 に記載の塩。

【請求項 51】

下記式：

【化 48】

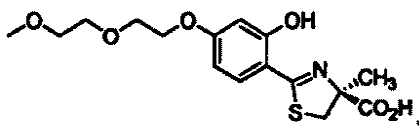


の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物の、固体形態。

【請求項 52】

下記式：

【化 49】



の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物の、結晶形態。

【請求項 53】

鏡像異性体過剰率が 80% より高い、請求項 51 に記載の固体形態もしくは請求項 52 に記載の結晶形態。

【請求項 54】

鏡像異性体過剰率が 90% より高い、請求項 51 に記載の固体形態もしくは請求項 52 に記載の結晶形態。

【請求項 55】

鏡像異性体過剰率が 95% より高い、請求項 51 に記載の固体形態もしくは請求項 52 に記載の結晶形態。

【請求項 56】

鏡像異性体過剰率が 98% より高い、請求項 51 に記載の固体形態もしくは請求項 52 に記載の結晶形態。

【請求項 57】

鏡像異性体過剰率が 99% より高い、請求項 51 に記載の固体形態もしくは請求項 52 に記載の結晶形態。

【請求項 58】

請求項 1 ~ 50 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくはその塩、溶媒和物または水和物、あるいは請求項 51 および請求項 53 ~ 57 のいずれか 1 項に記載の固体形態、あるいは請求項 52 ~ 57 のいずれか 1 項に記載の結晶形態、および薬学的に許容されうる賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 59】

前記医薬組成物が固体形態である、請求項 51 に記載の固体形態もしくは請求項 52 に記載の結晶形態を含む、医薬組成物。

【請求項 60】

前記医薬組成物が錠剤である、請求項 59 に記載の医薬組成物。

【請求項 61】

被験体における三価金属のキレート化に反応性の病理学的状態を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 50 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくはその塩、溶媒和物または水和物、あるいは請求項 51 および請求項 53 ~ 57 のいずれか 1 項に記載の固体形態、あるいは請求項 52 ~ 57 のいずれか 1 項に記載の結晶形態を含む組成物。

【請求項 6 2】

前記病理学的状態が、前記被験体の組織における前記三価金属の沈着に関連している、請求項6 1に記載の組成物。

【請求項 6 3】

前記三価金属が鉄である、請求項6 2に記載の組成物。

【請求項 6 4】

前記三価金属がアルミニウムである、請求項6 2に記載の組成物。

【請求項 6 5】

前記三価金属の沈着が、前記被験体において全体的に生じる、請求項6 3に記載の組成物。

【請求項 6 6】

前記三価金属の沈着が、前記被験体において局所的に生じる、請求項6 3に記載の組成物。

【請求項 6 7】

前記病理学的状態が、鉄過負荷状態である、請求項6 3に記載の組成物。

【請求項 6 8】

前記病理学的状態が、過酸化組織損傷である、請求項6 3に記載の組成物。

【請求項 6 9】

前記病理学的状態が、再生不良性貧血である、請求項6 3に記載の組成物。

【請求項 7 0】

前記病理学的状態が、地中海性貧血または鎌状赤血球性貧血である、請求項6 3に記載の組成物。

【請求項 7 1】

前記病理学的状態が、食事性鉄過負荷型である、請求項6 3に記載の組成物。

【請求項 7 2】

前記病理学的状態が、パンツ－鉄沈着症である、請求項6 3に記載の組成物。

【請求項 7 3】

前記病理学的状態が、下記から成る群から選択される新生物性疾患または状態である、請求項6 3に記載の組成物：慢性輸液療法、白血病、ホジキン病、非ホジキンリンパ腫、多発性骨髄腫、マクログロブリン血症、真性赤血球増加症、肺腫瘍、頭頸部腫瘍、脳腫瘍、子宮内膜腫瘍、卵巣腫瘍、子宮頸部腫瘍、乳房腫瘍、絨毛上皮腫、精巣腫瘍、前立腺腫瘍、ウィルムス腫瘍、甲状腺腫瘍、副腎腫瘍、胃腫瘍、膵臓腫瘍、結腸腫瘍、カルチノイド、インスリノーマ、骨腫瘍、肉腫および皮膚癌。

【請求項 7 4】

前記病理学的状態が、下記から成る群から選択される前新生物性疾患または状態である、請求項6 3に記載の組成物：光線皮膚炎、X線皮膚炎、タール皮膚炎、ヒ素皮膚炎、狼瘡性皮膚炎、老年性角化症、パジェット病、コンジローム、火傷瘢痕、梅毒性瘢痕、フィステル瘢痕、下腿潰瘍瘢痕、慢性潰瘍、静脈瘤性潰瘍、骨フィステル、直腸フィステル、バレット食道、胃潰瘍、胃炎、胆石症、外陰萎縮症、色素性母斑、ポーエン皮膚症、色素性乾皮症、紅色肥厚症、白斑症、パジェット骨病、外骨腫症、外軟骨腫、線維性骨炎、骨性獅子面症、神経線維腫症、ポリープ症、胞状奇胎、腺腫様増殖、および結節性甲状腺腫。

【請求項 7 5】

前記病理学的状態がヘモクロマトーシスである、請求項6 3に記載の組成物。

【請求項 7 6】

前記病理学的状態が、下記から成る群から選択される神経性または神経変性障害である、請求項6 3に記載の組成物：パーキンソン病、アルツハイマー病、ハンティングトン病、ニューロフェリチノパチー、筋萎縮性側索硬化症および多発性硬化症。

【請求項 7 7】

前記病理学的状態が炎症性障害である、請求項6 3に記載の組成物。

【請求項 78】

前記病理学的状態が輸血から生じる、請求項 63 に記載の組成物。

【請求項 79】

被験体における酸化ストレスを減少させるための組成物であって、請求項 1 ~ 50 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくはその塩、溶媒和物または水和物、あるいは請求項 51 および請求項 53 ~ 57 のいずれか 1 項に記載の固体形態、あるいは請求項 52 ~ 57 のいずれか 1 項に記載の結晶形態を含む組成物。

【請求項 80】

新生物性疾患または前新生物性状態に罹患している被験体を処置するための組成物であって、請求項 1 ~ 50 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくはその塩、溶媒和物または水和物、あるいは請求項 51 および請求項 53 ~ 57 のいずれか 1 項に記載の固体形態、あるいは請求項 52 ~ 57 のいずれか 1 項に記載の結晶形態を含む組成物。

【請求項 81】

インビトロで三価金属をキレート化するかまたは封鎖する方法。

【請求項 82】

前記三価金属が鉄である、請求項 81 に記載の方法。

【請求項 83】

前記三価金属がアルミニウムである、請求項 81 に記載の方法。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0047

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0047】

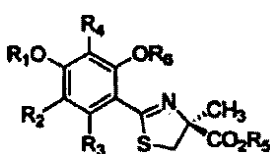
塩基性基を有する化合物から酸付加塩を形成するために一般に使用される酸は、無機酸、例えば、塩酸、臭化水素酸、沃化水素酸、硫酸、磷酸等、および有機酸、例えば、p-トルエンスルホン酸、メタンスルホン酸、萘酸、p-プロモフェニルスルホン酸、炭酸、コハク酸、クエン酸、安息香酸、酢酸等である。そのような塩の例は、下記を包含する：硫酸塩、ピロ硫酸塩、硫酸水素塩、亜硫酸塩、亜硫酸水素塩、磷酸塩、磷酸一水素塩、磷酸二水素塩、メタ磷酸塩、ピロ磷酸塩、塩化物、臭化物、沃化物、酢酸塩、プロピオン酸塩、デカン酸塩、カプリル酸塩、アクリル酸塩、蟻酸塩、イソ酪酸塩、カブロン酸塩、ヘプタン酸塩、プロピオール酸塩、萘酸塩、マロン酸塩、コハク酸塩、スベリン酸塩、セバシン酸塩、フマル酸塩、マレイン酸塩、ブチン-1,4-二酸塩、ヘキシン-1,6-二酸塩、安息香酸塩、クロロ安息香酸塩、メチル安息香酸塩、ジニトロ安息香酸塩、ヒドロキシ安息香酸塩、メトキシ安息香酸塩、フタル酸塩、スルホン酸塩、キシレンスルホン酸塩、フェニル酢酸塩、フェニルプロピオン酸塩、フェニル酪酸塩、クエン酸塩、乳酸塩、ガンマ-ヒドロキシ酪酸塩、グリコール酸塩、酒石酸塩、メタンスルホン酸塩、プロパンスルホン酸塩、ナフタレン-1-スルホン酸塩、ナフタレン-2-スルホン酸塩、マンデル酸塩等。

例えば、本発明は以下の項目を提供する。

(項目 1)

式 (I) :

【化 39】



I

[式中、

R_1 は、 $-[(CH_2)_n - O]_x - R'$ であり；

R_2 、 R_3 および R_4 は、それぞれ独立に、 $-H$ 、アルキル基、または $-OR_7$ であり

；

R_5 は、 $-H$ 、またはアルキル基であり；

R_6 は、 $-H$ 、アルキル基、 O -保護基、またはアシル基であり；

各 R_7 は、独立に、 $-H$ 、アルキル基、 O -保護基、またはアシル基であり；

R' は、 $-H$ 、アルキル基、 O -保護基、またはアシル基であり；

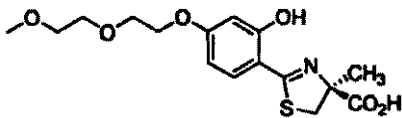
各 n は、2 であり；

x は、1 または 2 である]

の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物であって、

下記式 (II)：

【化 40】



II

の化合物でないことを条件とする化合物。

(項目 2)

R_2 、 R_3 および R_4 が、それぞれ独立に、 $-H$ 、 C_{1-6} アルキル基、または $-OR_7$ であり； R_6 が、 $-H$ 、 O -保護基、またはアシル基である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 3)

R_2 、 R_3 および R_4 が、それぞれ独立に、 $-H$ 、 C_{1-4} アルキル基、または $-OR_7$ であり； R_6 が、 $-H$ 、 O -保護基、またはアシル基である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 4)

x が 2 であり、 R_2 、 R_3 、 R_4 および R_6 が水素である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 5)

R_2 、 R_3 および R_4 がそれぞれ水素である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 6)

R_2 、 R_3 および R_4 が、それぞれ独立に、 $-H$ または C_{1-4} アルキル基である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 7)

R_2 、 R_3 および R_4 が、それぞれ独立に、メチル、エチル、プロピルまたはブチル基である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 8)

R_2 、 R_3 および R_4 が同じである、項目 7 に記載の化合物。

(項目 9)

R_2 、 R_3 および R_4 が、それぞれ独立に、 $-OR_7$ である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 10)

各 R_7 が水素である、項目 9 に記載の化合物。

(項目 11)

各 R_7 が C_{1-4} アルキル基である、項目 9 に記載の化合物。

(項目 12)

各 R_7 が O -保護基である、項目 9 に記載の化合物。

(項目 13)

各 R_7 がアシル基である、項目 9 に記載の化合物。

(項目 14)

各 R_7 がアセチル基である、項目 13 に記載の化合物。

(項目 15)

R₂、R₃ および R₄ が同じである、項目 10 ~ 14 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 16)

R₂、R₃ および R₄ が水素である、項目 15 に記載の化合物。

(項目 17)

R₆ が水素である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 18)

R₆ が O - 保護基である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 19)

R₆ がアシル基である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 20)

R₆ がアセチル基である、項目 19 に記載の化合物。

(項目 21)

R₂、R₃、R₄ および R₆ が同じである、項目 1 に記載の化合物。

(項目 22)

R₂、R₃、R₄ および R₆ が水素である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 23)

x が 1 であり、R₂、R₃、R₄ および R₆ が水素である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 24)

R' が C₁ - 4 アルキル基である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 25)

R' が、メチル、エチル、プロピルまたはブチルである、項目 1 に記載の化合物。

(項目 26)

R' がメチルである、項目 1 に記載の化合物。

(項目 27)

x が 1 である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 28)

x が 2 である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 29)

x が 1 であり、R' がメチルである、項目 1 に記載の化合物。

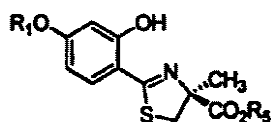
(項目 30)

x が 2 であり、R' がメチルである、項目 1 に記載の化合物。

(項目 31)

前記化合物が、

【化 4 1】

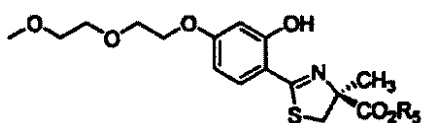


である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 32)

前記化合物が、

【化 4 2】

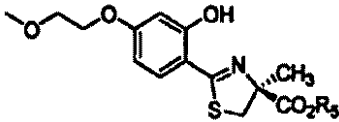


である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 33)

前記化合物が、

【化 4 3】

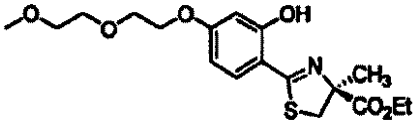


である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 3 4)

前記化合物が、

【化 4 4】

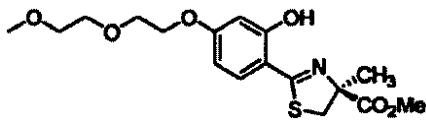


である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 3 5)

前記化合物が、

【化 4 5】

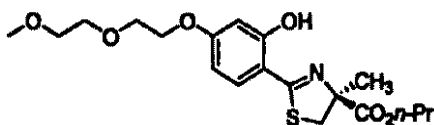


である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 3 6)

前記化合物が、

【化 4 6】

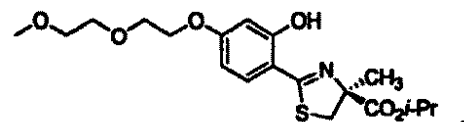


である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 3 7)

前記化合物が、

【化 4 7】



である、項目 1 に記載の化合物。

(項目 3 8)

前記化合物が固体である、項目 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 3 9)

前記化合物が結晶性固体である、項目 1 ~ 3 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 4 0)

鏡像異性体過剰率が 90% より高い、項目 1 ~ 3 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 4 1)

鏡像異性体過剰率が 95% より高い、項目 1 ~ 38 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 42)

鏡像異性体過剰率が 98% より高い、項目 1 ~ 38 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 43)

鏡像異性体過剰率が 99% より高い、項目 1 ~ 38 のいずれか 1 項に記載の化合物。

(項目 44)

項目 1 ~ 43 のいずれか 1 項に記載の塩。

(項目 45)

対イオンがリチウムである、項目 44 に記載の塩。

(項目 46)

対イオンがカリウムである、項目 44 に記載の塩。

(項目 47)

対イオンがナトリウムである、項目 44 に記載の塩。

(項目 48)

対イオンがマグネシウムである、項目 44 に記載の塩。

(項目 49)

対イオンがバリウムである、項目 44 に記載の塩。

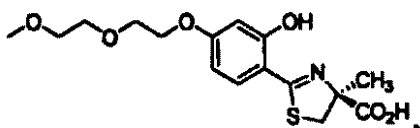
(項目 50)

対イオンがカルシウムである、項目 44 に記載の塩。

(項目 51)

下記式：

【化 48】

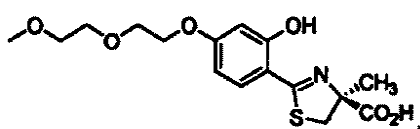


の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物の、固体形態。

(項目 52)

下記式：

【化 49】



の化合物、またはその塩、溶媒和物あるいは水和物の、結晶形態。

(項目 53)

鏡像異性体過剰率が 80% より高い、項目 51 または 52 に記載の化合物。

(項目 54)

鏡像異性体過剰率が 90% より高い、項目 51 または 52 に記載の化合物。

(項目 55)

鏡像異性体過剰率が 95% より高い、項目 51 または 52 に記載の化合物。

(項目 56)

鏡像異性体過剰率が 98% より高い、項目 51 または 52 に記載の化合物。

(項目 57)

鏡像異性体過剰率が 99% より高い、項目 51 または 52 に記載の化合物。

(項目 58)

項目 1 ~ 57 のいずれか 1 項に記載の化合物、および薬学的に許容されうる賦形剤を含む医薬組成物。

(項目59)

前記医薬組成物が固体形態、例えば錠剤である、項目51または52のいずれか1項に記載の医薬組成物。

(項目60)

被験体における三価金属のキレート化に反応性の病理学的状態を処置する方法であって、治療的または予防的有効量の項目1～57のいずれか1項に記載の化合物を、該被験体に投与することを含む方法。

(項目61)

前記病理学的状態が、前記被験体の組織における前記三価金属の沈着に関連している、項目60に記載の方法。

(項目62)

前記三価金属が鉄である、項目61に記載の方法。

(項目63)

前記三価金属がアルミニウムである、項目61に記載の方法。

(項目64)

前記三価金属の沈着が、前記被験体において全体的に生じる、項目62に記載の方法。

(項目65)

前記三価金属の沈着が、前記被験体において局所的に生じる、項目62に記載の方法。

(項目66)

前記病理学的状態が、鉄過負荷状態である、項目62に記載の方法。

(項目67)

前記病理学的状態が、過酸化組織損傷である、項目62に記載の方法。

(項目68)

前記病理学的状態が、再生不良性貧血である、項目62に記載の方法。

(項目69)

前記病理学的状態が、地中海性貧血または鎌状赤血球性貧血である、項目62に記載の方法。

(項目70)

前記病理学的状態が、食事性鉄過負荷型である、項目62に記載の方法。

(項目71)

前記病理学的状態が、パンツ－鉄沈着症である、項目62に記載の方法。

(項目72)

前記病理学的状態が、下記から成る群から選択される新生物性疾患または状態である、項目62に記載の方法：慢性輸液療法、白血病、ホジキン病、非ホジキンリンパ腫、多発性骨髄腫、マクログロブリン血症、真性赤血球増加症、肺腫瘍、頭頸部腫瘍、脳腫瘍、子宮内膜腫瘍、卵巣腫瘍、子宮頸部腫瘍、乳房腫瘍、絨毛上皮腫、精巣腫瘍、前立腺腫瘍、ウィルムス腫瘍、甲状腺腫瘍、副腎腫瘍、胃腫瘍、膵臓腫瘍、結腸腫瘍、カルチノイド、インスリノーマ、骨腫瘍、肉腫および皮膚癌。

(項目73)

前記病理学的状態が、下記から成る群から選択される前新生物性疾患または状態である、項目62に記載の方法：光線皮膚炎、X線皮膚炎、タール皮膚炎、ヒ素皮膚炎、狼瘡性皮膚炎、老年性角化症、パジェット病、コンジローム、火傷瘢痕、梅毒性瘢痕、フィステル瘢痕、下腿潰瘍瘢痕、慢性潰瘍、静脈瘤性潰瘍、骨フィステル、直腸フィステル、バレット食道、胃潰瘍、胃炎、胆石症、外陰萎縮症、色素性母斑、ポーエン皮膚症、色素性乾皮症、紅色肥厚症、白斑症、パジェット骨病、外骨腫症、外軟骨腫、線維性骨炎、骨性獅子面症、神経線維腫症、ポリープ症、胞状奇胎、腺腫様増殖、および結節性甲状腺腫。

(項目74)

前記病理学的状態がヘモクロマトーシスである、項目62に記載の方法。

(項目75)

前記病理学的状態が、下記から成る群から選択される神経性または神経変性障害である

、項目 6 2 に記載の方法：パーキンソン病、アルツハイマー病、ハンティングトン病、ニューロフェリチノパチー、筋萎縮性側索硬化症および多発性硬化症。

(項目 7 6)

前記病理学的状態が炎症性障害である、項目 6 2 に記載の方法。

(項目 7 7)

前記病理学的状態が輸血から生じる、項目 6 2 に記載の方法。

(項目 7 8)

処置を必要とする被験体における酸化ストレスを減少させる方法であって、治療有効量の項目 1 ~ 5 7 のいずれか 1 項に記載の化合物を、該被験体に投与することを含む方法

。

(項目 7 9)

新生物性疾患または前新生物性状態に罹患している被験体を処置する方法であって、治療有効量の項目 1 ~ 5 7 のいずれか 1 項に記載の化合物を、該被験体に投与することを含む方法。

(項目 8 0)

インビトロで三価金属をキレート化するかまたは封鎖する方法。

(項目 8 1)

前記三価金属が鉄である、項目 8 0 に記載の方法。

(項目 8 2)

前記三価金属がアルミニウムである、項目 8 0 に記載の方法。