

【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23年11月10日(2011.11.10)

【公表番号】特表2010-540543(P2010-540543A)

【公表日】平成22年12月24日(2010.12.24)

【年通号数】公開・登録公報2010-051

【出願番号】特願2010-527035(P2010-527035)

【国際特許分類】

C 07 D 209/08	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 25/04	(2006.01)
A 61 P 27/06	(2006.01)
A 61 P 27/02	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)
A 61 P 17/02	(2006.01)
C 07 D 417/14	(2006.01)
A 61 K 31/4439	(2006.01)
C 07 D 413/14	(2006.01)
C 07 D 413/06	(2006.01)
A 61 K 31/422	(2006.01)
A 61 K 31/404	(2006.01)
C 07 D 513/04	(2006.01)
A 61 K 31/429	(2006.01)
C 07 D 401/06	(2006.01)
C 07 D 409/06	(2006.01)

【F I】

C 07 D 209/08	C S P
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 P 25/04	
A 61 P 27/06	
A 61 P 27/02	
A 61 P 9/00	
A 61 P 17/02	
C 07 D 417/14	
A 61 K 31/4439	
C 07 D 413/14	
C 07 D 413/06	
A 61 K 31/422	
A 61 K 31/404	
C 07 D 513/04	3 2 5
A 61 K 31/429	
C 07 D 401/06	
C 07 D 409/06	

【手続補正書】

【提出日】平成23年9月20日(2011.9.20)

【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

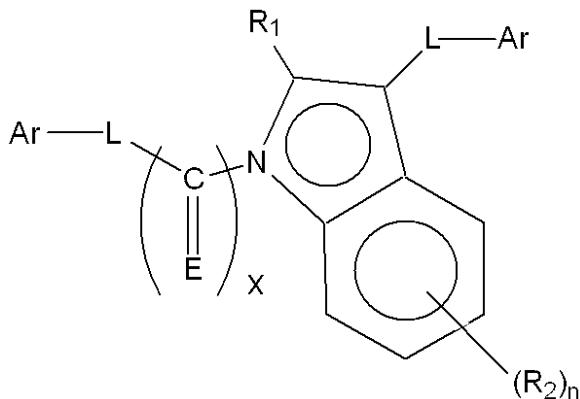
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記の構造を有する化合物またはその製薬上許容し得る塩：

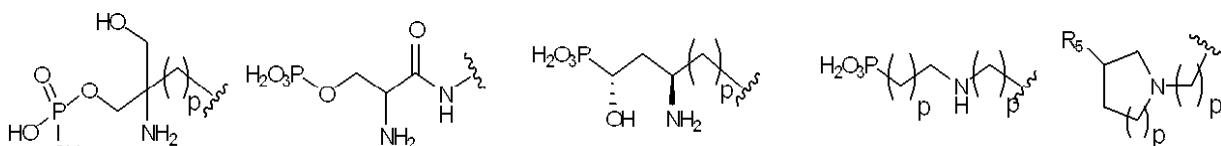
【化1】



(式中、各Arは、個々に、置換または非置換のアリールまたはヘテロアリールであり；各Lは、個々に、アルキレン、アルケニレン、オキシアルキレン、オキシアルケニレン、アミノアルキレンまたはアミノアルケニレンであり；R<sub>1</sub>は、低級アルキルまたはアルキルアシルまたはヒドロキシアルキルであり；各R<sub>2</sub>は、個々に、H、低級アルキル、ハライド、トリフルオロメチル、低級アルケニル、低級アルキニル、シクロアルキル、CN、CH<sub>2</sub>CN、CH<sub>2</sub>SR<sub>3</sub>、CH<sub>2</sub>N(R<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>OR<sub>3</sub>、CH=NOR<sub>3</sub>、OR<sub>3</sub>、SR<sub>3</sub>、N(R<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、C(O)R<sub>4</sub>、複素環、置換複素環、アリール、置換アリール、ヘテロアリール、置換ヘテロアリールであり；或いは、

R<sub>2</sub>は、下記：

【化2】



(式中、R<sub>5</sub>は、CO<sub>2</sub>HまたはPO<sub>3</sub>H<sub>2</sub>であり、pは、0～2である)

であり；或いは、

nが2であるとき、各R<sub>2</sub>は、各R<sub>2</sub>が結合している炭素原子と一緒にになって、アリール、置換アリール、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、シクロアルキルまたは置換シクロアルキルを形成し；

各R<sub>3</sub>は、個々に、H、低級アルキル、シクロアルキル、アリル、フェニル、置換フェニル、ヘテロアリールまたは置換ヘテロアリールであり；

各R<sub>4</sub>は、個々に、H、低級アルキル、シクロアルキル、アルコキシ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、フェニル、置換フェニル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリールまたはトリフルオロメチルであり；

E = OまたはSであり；

xは、0または1であり；そして、

nは、0～5である)。

【請求項2】

xが1である、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

Eが0である、請求項1または2記載の化合物。

【請求項4】

各Arが、個々に、フェニル、ピリジン、ピラジン、ピリダジン、ピリミジン、トリアジン、チオフェン、フラン、チアゾール、チアジアゾール、イソチアゾール、オキサゾール、オキサジアゾール、イソオキサゾール、ナフタレン、キノリン、テトラリン、クロマン、チオクロマン、テトラヒドロキノリン、ジヒドロナフタレン、テトラヒドロナフタレン、クロメン、チオクロメン、ジヒドロキノリン、インダン、ジヒドロベンゾフラン、ジヒドロベンゾチオフェン、インデン、ベンゾフラン、ベンゾチオフェン、クマリンまたはクマリノンから選ばれる、請求項1～3のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項5】

各置換アリールまたは置換ヘテロアリールが、アルキル、アルケニル、アルキニル、ヒドロキシ、オキソ、アルコキシ、メルカプト、シクロアルキル、複素環、アリール、ヘテロアリール、アリールオキシ、ハロゲン、ハロアルキル、シアノ、ニトロ、ニトロン、アミノ、低級アルキルアミノ、低級ジアルキルアミノ、アミド、アジド、アシリル( $C(O)R_6$ )、アルコキシメチル、メルカプト( $S R_6$ )、スルホキシ( $S(O) R_6$ )、スルホニル( $S(O)_2 R_6$ )、スルホンアミド( $S(O)_2N(R_6)_2$ )、カルボネート( $OC(O) O R_6$ )、オキシアシル( $OC(O) R_6$ )、カルボキシル( $C(O)OH$ )、エステル( $C(O)OR_6$ )、カルバメート( $O C(O) N(R_6)_2$ )から選ばれる置換基を担持し、 $R_6$ が、Hまたは低級アルキル、低級アルケニル、低級アルキニル、アリール、ヘテロアリールまたは複素環である、請求項1～4のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項6】

前記置換基が、アルキル、ハロゲンまたはハロアルキルから選ばれる、請求項5記載の化合物。

【請求項7】

前記置換基が、フルオロまたはトリフルオロメチルである、請求項6記載の化合物。

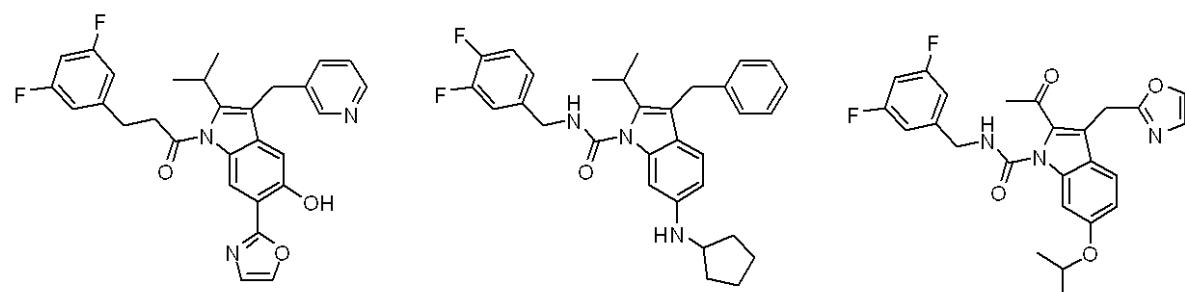
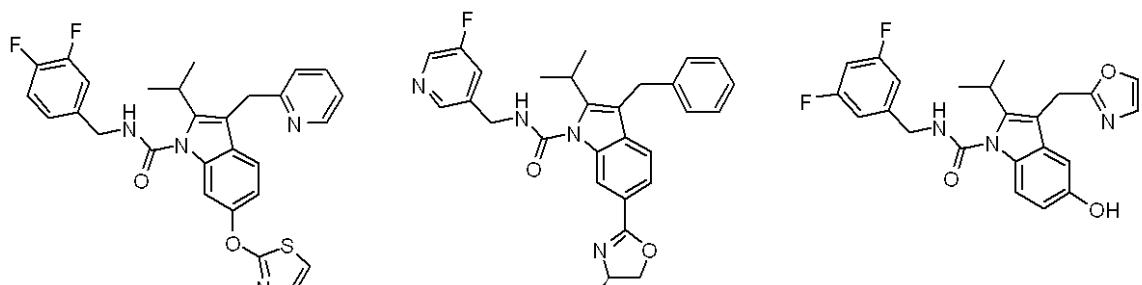
【請求項8】

各Arが、個々に、フェニル、ピリジン、チオフェン、チアゾールまたはオキサゾールである、請求項1～7のいずれか一項に記載の化合物。

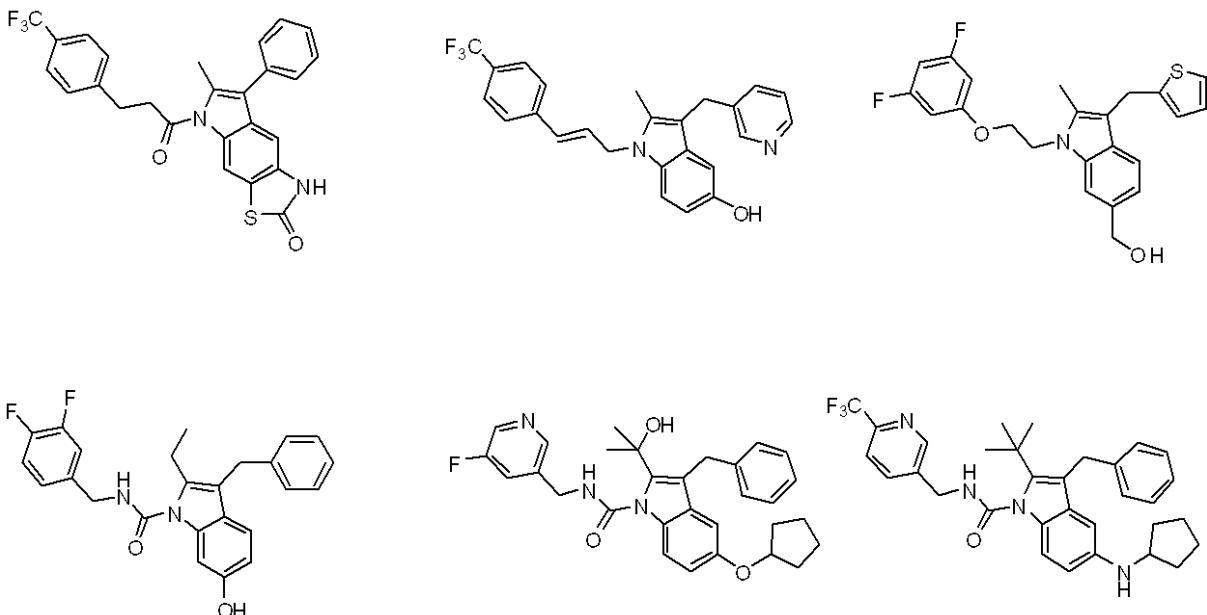
【請求項9】

下記の構造のいずれか1つを有する、請求項1記載の化合物：

【化3】



## 【化4】



## 【請求項 10】

請求項1～9のいずれか一項に記載の少なくとも1種の化合物を、製薬上許容し得る担体中に含む、製薬組成物。

## 【請求項 11】

スフィンゴシン 1 リン酸レセプターの調節に関連する疾患の治療用組成物の製造のための、請求項1～9のいずれか一項に記載の少なくとも1種の化合物の使用。

## 【請求項 12】

前記疾患が、疼痛、眼内障、ドライアイ、血管形成障害、循環器疾患または創傷治癒である、請求項11記載の使用。

## 【請求項 13】

前記疾患が、慢性疼痛である、請求項11記載の使用。

## 【請求項 14】

前記疾患が、急性疼痛である、請求項11記載の使用。

## 【請求項 15】

前記治療用組成物が、経口投与用である、請求項11～14のいずれか一項に記載の使用。

## 【請求項 16】

スフィンゴシン 1 リン酸レセプターの調節に関連する疾患の治療用組成物の製造のための、請求項1～9のいずれか一項に記載の少なくとも1種の化合物またはそれらの任意の組合せ、または製薬上許容し得るそれらの塩、水和物、溶媒和物、結晶形および個々の異性体、鏡像体およびジアステレオマーの使用。

## 【請求項 17】

前記疾患が、疼痛、眼内障、ドライアイ、血管形成障害、循環器疾患または創傷治癒である、請求項16記載の使用。

## 【請求項 18】

前記疾患が、慢性疼痛である、請求項16記載の使用。

## 【請求項 19】

前記疾患が、急性疼痛である、請求項16記載の使用。