

【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20年12月25日(2008.12.25)

【公表番号】特表2008-518013(P2008-518013A)

【公表日】平成20年5月29日(2008.5.29)

【年通号数】公開・登録公報2008-021

【出願番号】特願2007-539030(P2007-539030)

【国際特許分類】

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/559 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 31/559

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 37/02

【手続補正書】

【提出日】平成20年10月24日(2008.10.24)

【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】

炭水化物のエステル、エーテルもしくはアミド、またはアミノ酸のエステル、エーテルもしくはアミドである、プロスタグランジンEP<sub>4</sub>アゴニストのプロドラッグから成る化合物。

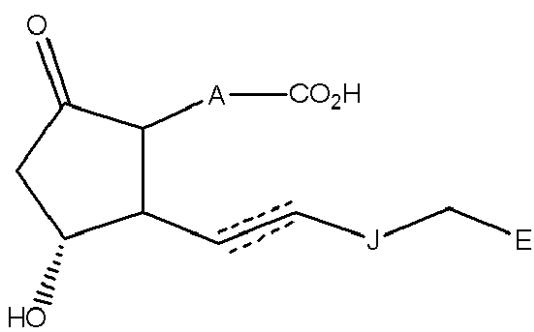
【請求項2】

グルコシドエステル、エーテルもしくはアミド；グルクロニドエステル、エーテルもしくはアミド；シクロデキストリンエステル、エーテルもしくはアミド；またはデキストランエステル、エーテルもしくはアミドから成る請求項1に記載の化合物。

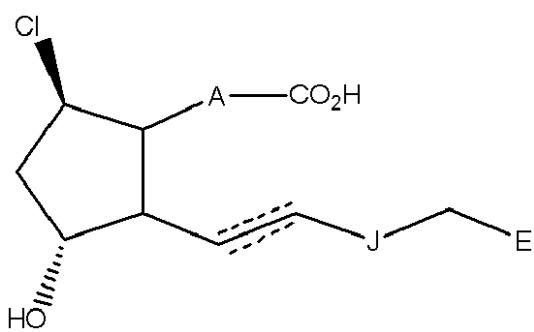
【請求項3】

プロスタグランジンEP<sub>4</sub>アゴニストが、下記式で示される化合物から成る群から選択する化合物または薬学的に許容しうるその塩もしくはプロドラッグである請求項2に記載の化合物：

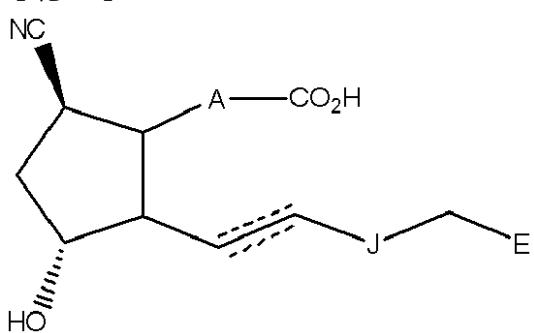
【化 1】



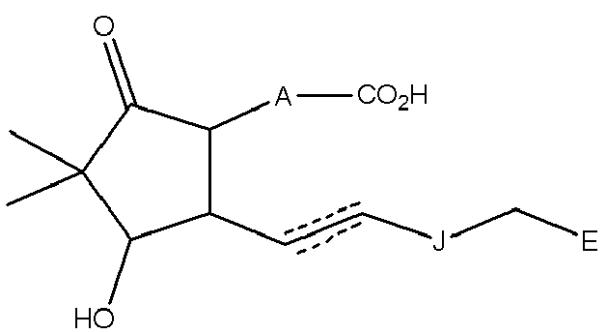
【化 2】



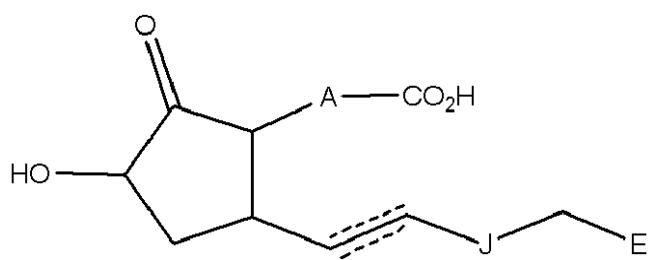
【化 3】



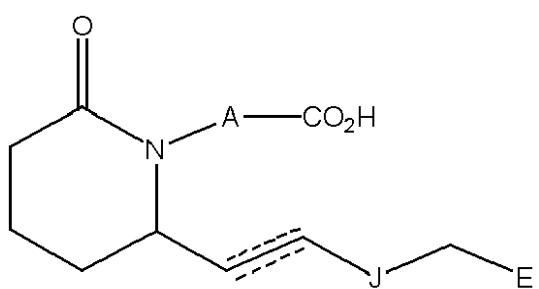
【化 4】



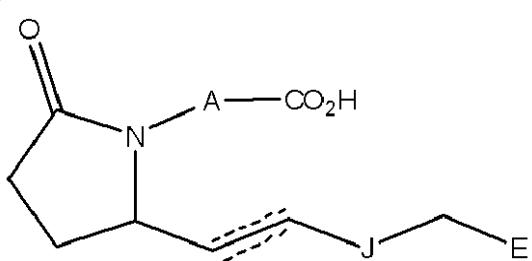
【化 5】



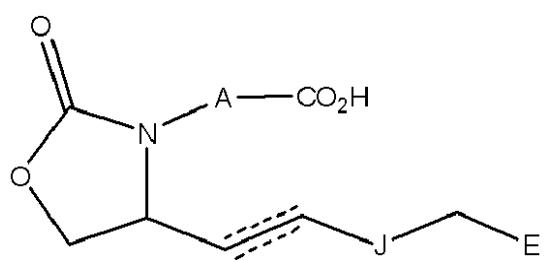
【化 6】



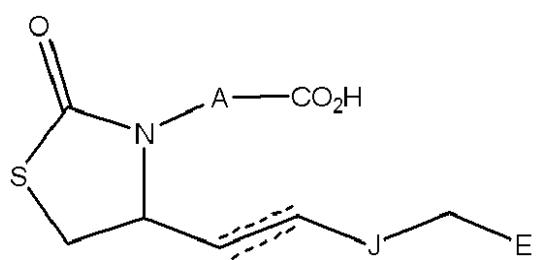
【化 7】



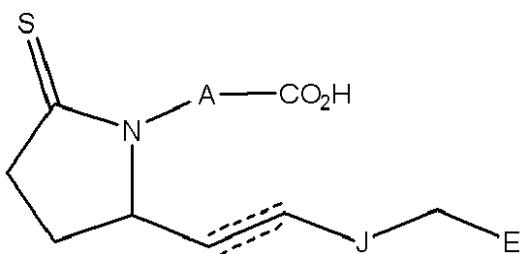
【化 8】



【化 9】

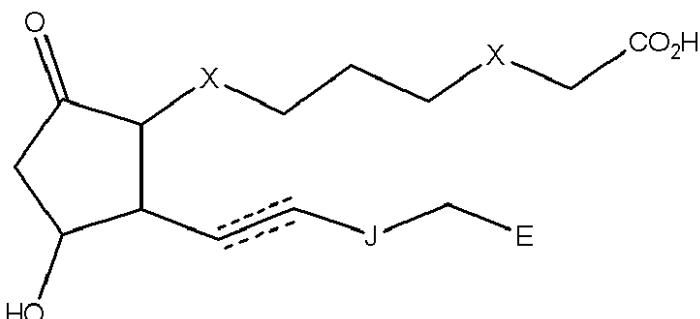


## 【化10】



および

## 【化11】



[式中、破線は結合の存在または不存在を表し；

Aは $-(CH_2)_6-$ 、シス- $CH_2CH=CH-(CH_2)_3-$ 、または $-CH_2C=C-(CH_2)_3-$ であり、ここで、1個または2個の炭素原子がSまたはOで置き換えられてもよく；あるいはAは $-(CH_2)_m-Ar-(CH_2)_n-$ であり、ここで、Arはインターフェニルまたはヘテロインターフェニルであり、mとnの合計は1~4であり、ここで、1個の $CH_2$ がSまたはOで置き換えられてもよく；XはSまたはOであり；

Jは $C=O$ 、 $CHOH$ 、または $CH_2CHOH$ であり；

Eは $C_{1-12}$ アルキル、 $R^2$ 、または $-Y-R^2$ であり、ここで、Yは $CH_2$ 、SまたはOであり、 $R^2$ はアリールまたはヘテロアリールである。]。

## 【請求項4】

Aが $-(CH_2)_6-$ 、シス- $CH_2CH=CH-(CH_2)_3-$ 、または $-CH_2C=C-(CH_2)_3-$ であり、ここで、1個または2個の炭素原子がSまたはOで置き換えられてもよく；Eが $C_{1-6}$ アルキル、 $R^2$ 、または $-Y-R^2$ であり、ここで、Yが $CH_2$ 、SまたはOであり、 $R^2$ がアリールまたはヘテロアリールである請求項3に記載の化合物。

## 【請求項5】

$R^2$ がフェニル、ナフチル、ビフェニル、チエニルまたはベンゾチエニルで、F、Cl、Br、メチル、メトキシおよび $CF_3$ から成る群から選択する置換基を0~2個有する請求項4に記載の化合物。

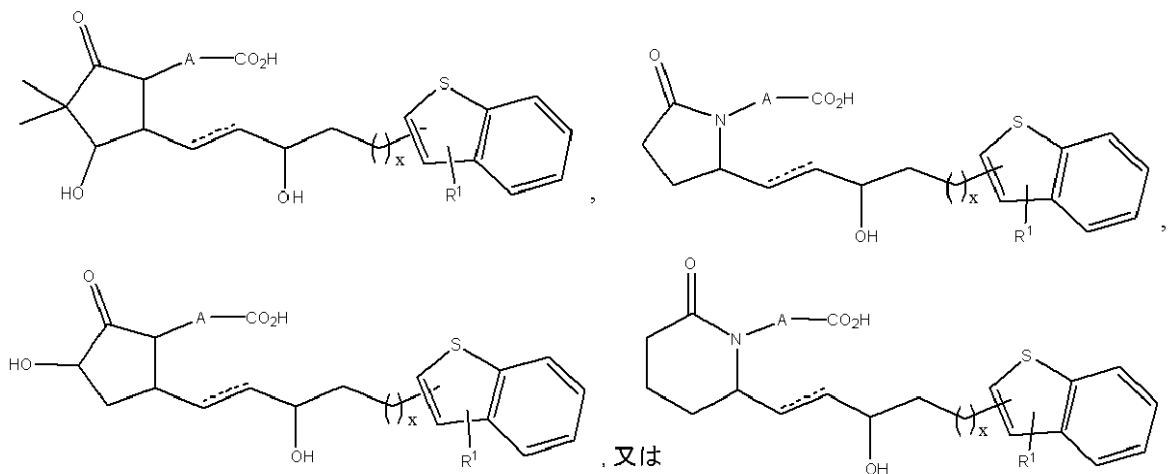
## 【請求項6】

$R^2$ が $CH_2$ -ナフチル、 $CH_2$ -ビフェニル、 $CH_2$ -(2-チエニル)、 $CH_2$ -(3-チエニル)、ナフチル、ビフェニル、2-チエニル、3-チエニル、 $CH_2$ -(2-(3-クロロベンゾチエニル))、 $CH_2$ -(3-ベンゾチエニル)、2-(3-クロロベンゾチエニル)、または3-ベンゾチエニルである請求項5に記載の化合物。

## 【請求項7】

プロスタグランジンEP<sub>4</sub>アゴニストが、式：

## 【化12】



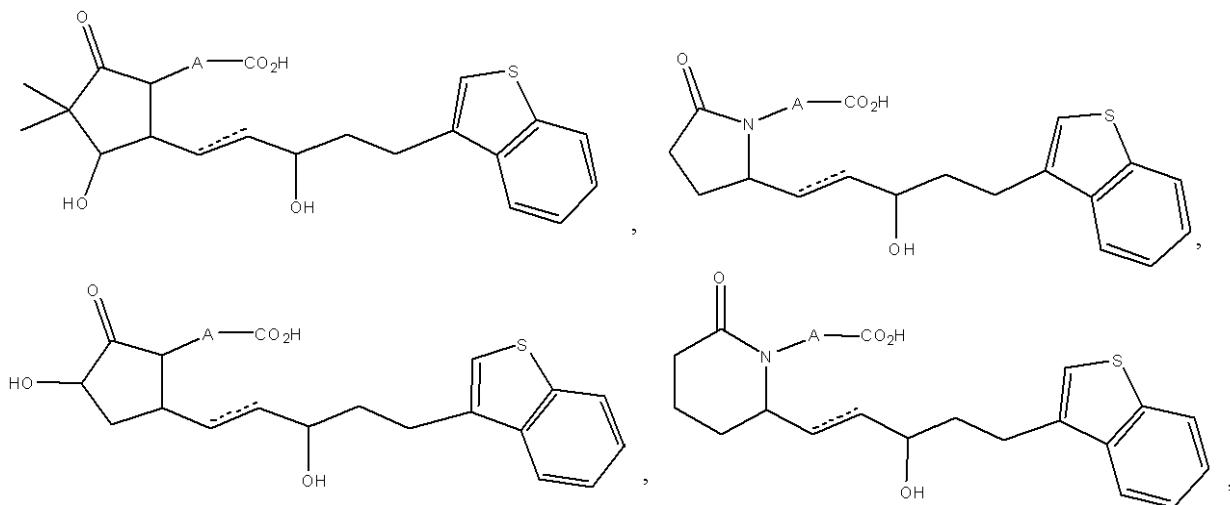
[式中、xは0または1であり、R<sup>1</sup>はH、クロロ、フルオロ、ブロモ、メチル、メトキシまたはCF<sub>3</sub>である。]

で示される化合物から成る請求項5に記載の化合物。

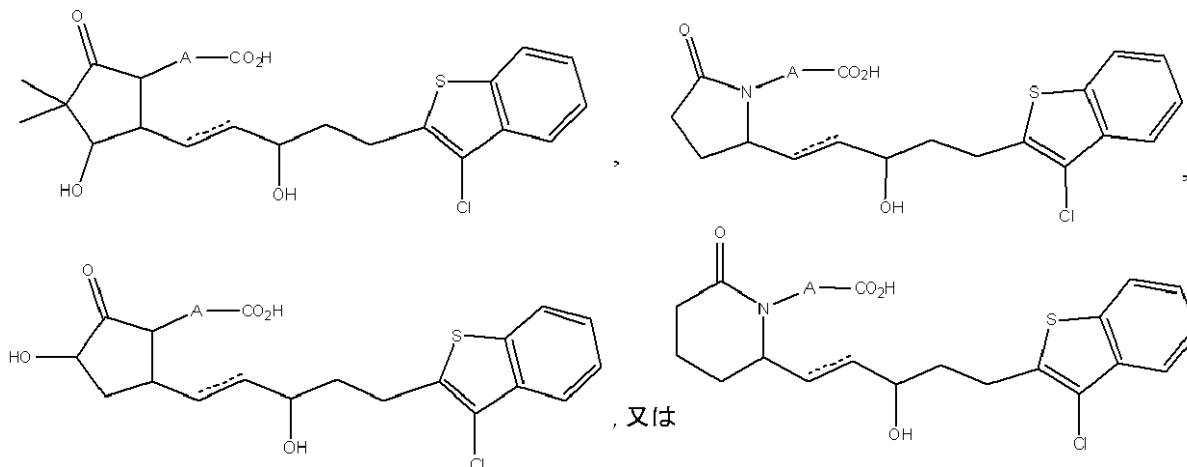
## 【請求項8】

プロスタグランジンEP<sub>4</sub>アゴニストが、式：

## 【化13】



## 【化14】



で示される化合物から成る請求項7に記載の化合物。

## 【請求項9】

哺乳動物の大腸粘膜バリアの保全のための医薬組成物を製造するための、プロスタグランジンEP<sub>4</sub>アゴニストの使用。

## 【請求項10】

該医薬組成物が、大腸炎、アメーバ性大腸炎、コラーゲン蓄積大腸炎、深在性囊胞性大腸炎、表在性囊胞性大腸炎、肉芽腫性大腸炎、出血性大腸炎、粘液性大腸炎、クローン病および潰瘍性大腸炎から成る群から選択する一つまたはそれ以上の疾患または状態を治療または予防するのに有効な組成物である、請求項9に記載の使用。

## 【請求項11】

前記疾患または状態がクローン病である請求項10に記載の使用。

## 【請求項12】

前記疾患または状態が潰瘍性大腸炎である請求項10に記載の使用。

## 【請求項13】

大腸炎、アメーバ性大腸炎、コラーゲン蓄積大腸炎、深在性囊胞性大腸炎、表在性囊胞性大腸炎、肉芽腫性大腸炎、出血性大腸炎、粘液性大腸炎、クローン病および潰瘍性大腸炎から成る群から選択する一つまたはそれ以上の疾患または状態を治療または予防するための医薬組成物を製造するための、プロスタグランジンEP<sub>4</sub>アゴニストの使用。

## 【請求項14】

前記疾患または状態がクローン病である請求項13に記載の使用。

## 【請求項15】

前記疾患または状態が潰瘍性大腸炎である請求項13に記載の使用。

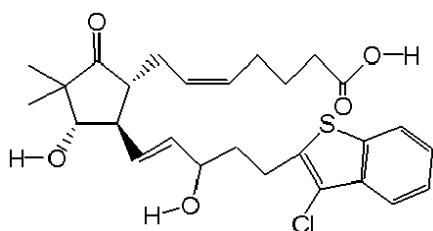
## 【請求項16】

プロドラッグがアミノ酸のアミド、エステルまたはエーテルである請求項1に記載の化合物。

## 【請求項17】

式：

## 【化15】

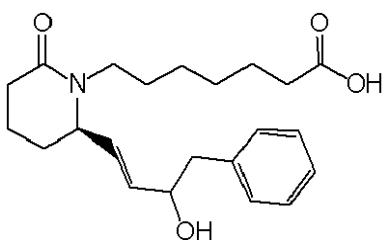


で示される化合物または薬学的に許容しうるその塩のプロドラッグである請求項1に記載の化合物。

## 【請求項18】

式：

## 【化16】

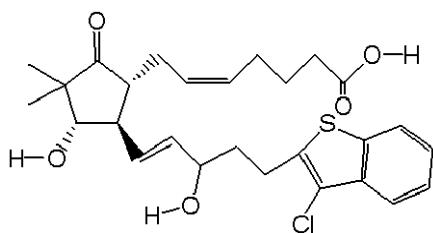


で示される化合物または薬学的に許容しうるその塩のプロドラッグである請求項1に記載の化合物。

## 【請求項19】

プロスタグランジンEP<sub>4</sub>アゴニストが、式：

## 【化17】

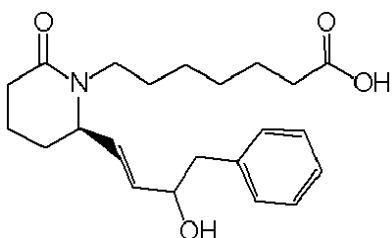


で示される化合物、薬学的に許容しうるその塩、およびそのプロドラッグの少なくとも一つである請求項13に記載の使用。

## 【請求項20】

プロスタグランジンEP<sub>4</sub>アゴニストが、式：

## 【化18】



で示される化合物、薬学的に許容しうるその塩、およびそのプロドラッグの少なくとも一つである請求項13に記載の使用。