

【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7月31日(2008.7.31)

【公表番号】特表2008-502696(P2008-502696A)

【公表日】平成20年1月31日(2008.1.31)

【年通号数】公開・登録公報2008-004

【出願番号】特願2007-516688(P2007-516688)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/69 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

C 0 7 F 5/02 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/69

A 6 1 P 17/02

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 1/02

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 43/00 1 0 5

C 0 7 F 5/02 C

【手続補正書】

【提出日】平成20年6月12日(2008.6.12)

【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

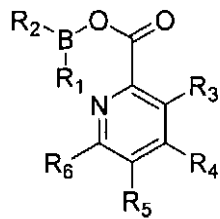
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

動物における表面状態の治療または予防のための医薬組成物であって、

【化 1】



(式中、

R_1 および R_2 は、任意に置換されたアルキルと、任意に置換されたアリールと、アラルキルと、任意に置換されたヘテロアリールとからなる群から独立して選択され；

R_3 および R_4 は、水素と、アルキルと、アリールと、アラルキルと、ヘテロアリールと、ヘテロアラルキルと、シクロアルキルと、ヘテロシクリルと、 $-CO$ アリールと、 $-OCO$ アルキルと、 $-OCH_2CH_2OH$ と、 $O(CH_2)_3CO_2H$ と、2-(モルホリノ)エトキシと、 $-(CH_2)_kOH$ (式中、 $k = 1, 2$ もしくは 3) と、 $-CH_2NH_2$ と、 $-CH_2NH$ アルキルと、 $-CH_2N$ (アルキル) $_2$ と、 $-CO_2H$ と、 $-CO_2$ アルキルと、 $-CONH_2$ と、 $-OH$ と、アルコキシと、アリールオキシと、 $-SH$ と、 $-S$ -アルキルと、 $-S$ -アリールと、 $-SO_2$ アルキルと、 $-SO_2N$ (アルキル) $_2$ と、 $-SO_2NH$ アルキルと、 $-SO_2NH_2$ と、 $-SO_3H$ と、 $-SCF_3$ と、 $-CN$ と、ハロゲンと、 $-CF_3$ と、 $-NO_2$ と、アミノと、置換されたアミノと、 $-NH-SO_2$ アルキルと、 $-CONH$ アルキルとからなる群から選択され、 R_3 および R_4 は任意に置換され；および

R_5 および R_6 は、水素と、アルキルと、アリールと、アラルキルと、ヘテロアリールと、ヘテロアラルキルと、シクロアルキルと、ヘテロシクリルと、 $-(CH_2)_nOH$ ($n = 1 \sim 3$) と、 $-CH_2NH_2$ と、 $-CH_2NH$ アルキルと、 $-CH_2N$ (アルキル) $_2$ と、ハロゲンと、 $-CHO$ と、 $-CH=NOH$ と、 $-CO_2H$ と、 $-CO_2$ -アルキルと、 $-S$ -アルキルと、 $-SO_2$ -アルキルと、 $-SO$ -アルキルと、 $-S$ -アリールと、 $-SO_2N$ (アルキル) $_2$ と、 $-SO_2NH$ アルキルと、 $-SO_2NH_2$ と、アミノと、アルコキシと、 $-CF_3$ と、 $-SCF_3$ と、 $-NO_2$ と、 $-SO_3H$ と、 OH とからなる群から独立して選択され、 R_5 および R_6 は任意に置換され、さらに R_5 および R_6 は、これらに結合する環とともに任意に置換された芳香環を形成する) の構造を有する化合物あるいはその薬学的に許容可能な塩、水和物、または溶媒和物を含み、

前記表面状態が、尋常性座瘡と、酒さと、乾癬と、アトピー性皮膚炎と、歯周病と、喘息と、慢性閉塞性肺疾患と、炎症性腸疾患と、関節炎とからなる群から選択される、医薬組成物。

【請求項 2】

R_1 および R_2 のうちの 1 つが、任意に置換されたアリールである、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 3】

R_1 および R_2 のうちの 1 つが、任意に置換されたヘテロアリールである、請求項 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

前記任意に置換されたヘテロアリールが、任意に置換されたピリジルである、請求項 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 5】

R_1 および R_2 のうちの 1 つが、任意に置換されたフェニルである、請求項 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

前記任意に置換されたフェニルが、水素と、アルキルと、シクロアルキルと、アリールと、置換されたアリールと、アラルキルと、 $-(CH_2)_kOH$ （式中、 $k = 1, 2$ もしくは 3 ）と、 $-CH_2NH_2$ と、 $-CH_2NH$ -アルキルと、 $-CH_2N$ （アルキル）₂と、 $-CO_2H$ と、 $-CO_2$ アルキルと、 $-CONH_2$ と、 $-CONH$ アルキルと、 $-CON$ （アルキル）₂と、 $-OH$ と、アルコキシと、アリールオキシと、 $-SH$ と、 $-S$ -アルキルと、 $-S$ -アリールと、 $-SO_2$ アルキルと、 $-SO_2N$ （アルキル）₂と、 $-SO_2NH$ アルキルと、 $-SO_2NH_2$ と、 $-SO_3H$ と、 $-SCF_3$ と、 $-CN$ と、ハロゲンと、 $-CF_3$ と、 $-NO_2$ と、アミノと、置換されたアミノと、 $-NH SO_2$ アルキルと、 $-OCH_2CH_2NH_2$ と、 $-OCH_2CH_2NH$ アルキルと、 $-OCH_2CH_2N$ （アルキル）₂と、オキサゾリジン-2-イルと、アルキル置換されたオキサゾリジン-2-イルとからなる群から選択される部分によって置換されたフェニルである、請求項5に記載の医薬組成物。

【請求項7】

R_1 と R_2 の双方が、任意に置換されたアリールである、請求項2に記載の医薬組成物。

【請求項8】

R_1 と R_2 の各々が、任意に置換されたフェニルである、請求項7に記載の医薬組成物。

【請求項9】

R_3 が、水素、 $-OH$ 、アルコキシ、またはカルボキシである請求項8に記載の医薬組成物。

【請求項10】

前記任意に置換されたフェニルが、水素と、アルキルと、シクロアルキルと、アリールと、置換されたアリールと、アラルキルと、 $-(CH_2)_kOH$ （式中、 $k = 1, 2$ もしくは 3 ）と、 $-CH_2NH_2$ と、 $-CH_2NH$ -アルキルと、 $-CH_2N$ （アルキル）₂と、 $-CO_2H$ と、 $-CO_2$ アルキルと、 $-CONH_2$ と、 $-CONH$ アルキルと、 $-CON$ （アルキル）₂と、 $-OH$ と、アルコキシと、アリールオキシと、 $-SH$ と、 $-S$ -アルキルと、 $-S$ -アリールと、 $-SO_2$ アルキルと、 $-SO_2N$ （アルキル）₂と、 $-SO_2NH$ アルキルと、 $-SO_2NH_2$ と、 $-SO_3H$ と、 $-SCF_3$ と、 $-CN$ と、ハロゲンと、 $-CF_3$ と、 $-NO_2$ と、アミノと、置換されたアミノと、 $-NH SO_2$ アルキルと、 $-OCH_2CH_2NH_2$ と、 $-OCH_2CH_2NH$ アルキルと、 $-OCH_2CH_2N$ （アルキル）₂と、オキサゾリジン-2-イルと、アルキル置換されたオキサゾリジン-2-イルとからなる群から選択される部分によって置換されたフェニルである、請求項9に記載の医薬組成物。

【請求項11】

R_3 が、 $-OH$ またはカルボキシである、請求項10に記載の医薬組成物。

【請求項12】

前記化合物が、表1から選択される化合物である、請求項11に記載の医薬組成物。

【請求項13】

R_3 が、 $-OH$ である、請求項11に記載の医薬組成物。

【請求項14】

前記任意に置換されたフェニルが、水素と、ハロゲンと、アルキルとからなる群から選択される部分によって置換されたフェニルである、請求項13に記載の医薬組成物。

【請求項15】

前記ハロゲンが、クロロである、請求項14に記載の医薬組成物。

【請求項16】

前記アルキルが、メチルである、請求項15に記載の医薬組成物。

【請求項17】

前記化合物が、（ビス（3-クロロ-4-メチルフェニル）ポリロキシ）（3-ヒドロキシピリジン-2-イル）メタノンである、請求項16に記載の医薬組成物。

【請求項 18】

前記化合物が、前記（ビス（3 - クロロ - 4 - メチルフェニル）ポリロキシ）（3 - ヒドロキシピリジン - 2 - イル）メタノンの溶媒和物である、請求項 17 に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

前記化合物が、前記（ビス（3 - クロロ - 4 - メチルフェニル）ポリロキシ）（3 - ヒドロキシピリジン - 2 - イル）メタノンの水和物である、請求項 17 に記載の医薬組成物。

【請求項 20】

前記表面状態が、皮膚の炎症である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 21】

前記表面状態が、尋常性座瘡と、酒さと、乾癬と、歯周病と、関節炎と、アトピー性皮膚炎とからなる群から選択される、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 22】

前記表面状態が、尋常性座瘡である、請求項 21 に記載の医薬組成物。

【請求項 23】

前記表面状態が、酒さである、請求項 21 に記載の医薬組成物。

【請求項 24】

前記表面状態が、乾癬である、請求項 21 に記載の医薬組成物。

【請求項 25】

前記表面状態が、アトピー性皮膚炎である、請求項 21 に記載の医薬組成物。

【請求項 26】

動物において炎症誘発性サイトカインの放出を阻害するための医薬組成物であって、請求項 1 に記載の化合物含む、医薬組成物。

【請求項 27】

前記炎症誘発性サイトカインが、IL - 1 と、TNF - と、IL - 6 とからなる群から選択される、請求項 26 に記載の医薬組成物。

【請求項 28】

前記化合物が、請求項 13 に記載の化合物である、請求項 27 に記載の医薬組成物。

【請求項 29】

前記表面状態が、前記動物の口腔内に起こる、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 30】

前記表面状態が、歯周病である、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 31】

前記表面状態が、歯周病である、請求項 17 に記載の医薬組成物。