

【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22年3月18日 (2010.3.18)

【公表番号】特表2005-527627(P2005-527627A)

【公表日】平成17年9月15日 (2005.9.15)

【年通号数】公開・登録公報2005-036

【出願番号】特願2004-507464(P2004-507464)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/16 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/04 C S P

A 6 1 K 31/454

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 27/16

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【誤訳訂正書】

【提出日】平成22年1月29日 (2010.1.29)

【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

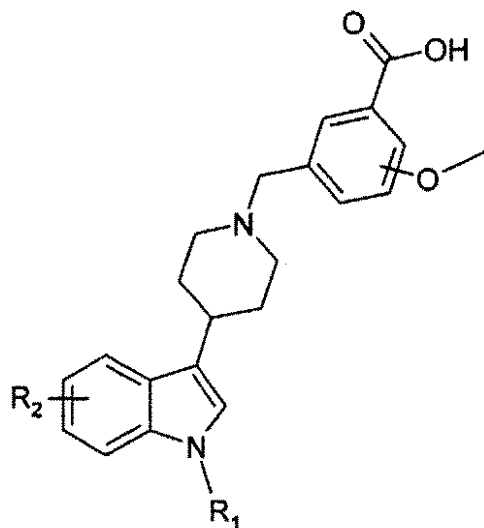
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I

## 【化 1】



式 I

( 式中、

$R_1$  は、アルキル、アルケニル、アルコキシアルキル、またはシクロアルキルアルキル基を表し；

$R_2$  は、水素、またはハロゲン原子を表し；

安息香酸を置換するメトキシ基は、カルボキシ基に対してオルトの位置にある ) の化合物、およびその医薬的に許容される塩。

## 【請求項 2】

安息香酸を置換するメトキシ基が、カルボキシ基に対してオルトの位置にあり、かつ分子のインドリルピペリジン部分と結合する炭素原子に対してパラの位置にある、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 3】

$R_1$  が、エチル、 $n$ -プロピル、 $n$ -ブチル、メトキシメチル、メトキシエチル、エトキシエチル、シクロプロピルメチル、シクロペンチルメチル、シクロヘキシルメチル、シクロプロピルエチル、アリル、2-プロペニル、2-プロポキシエチル、および 3-メトキシプロピルから選択される、請求項 1 および 2 のいずれか 1 項に記載の化合物。

## 【請求項 4】

$R_1$  が、メトキシエチル、エトキシエチル、ブチル、シクロプロピルメチル、またはアリルである、請求項 3 に記載の化合物。

## 【請求項 5】

$R_2$  が、水素、フッ素、または塩素である、請求項 1 から 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

## 【請求項 6】

$R_2$  が、水素またはフッ素である、請求項 5 に記載の化合物。

## 【請求項 7】

5 - { 4 - [ 1 - ( 2 - エトキシエチル ) - 1 H - インドール - 3 - イル ] ピペリジン - 1 - イルメチル } - 2 - メトキシ安息香酸

2 - メトキシ - 5 - { 4 - [ 1 - ( 2 - メトキシエチル ) - 1 H - インドール - 3 - イル ] ピペリジン - 1 - イルメチル } - 安息香酸

5 - [ 4 - ( 1 - ブチル - 1 H - インドール - 3 - イル ) - ピペリジン - 1 - イルメチル ] - 2 - メトキシ安息香酸

5 - { 4 - [ 1 - ( 2 - エトキシエチル ) - 6 - フルオロ - 1 H - インドール - 3 - イル ] ピペリジン - 1 - イルメチル } - 2 - メトキシ安息香酸

5 - { 4 - [ 6 - フルオロ - 1 - ( 2 - メトキシエチル ) - 1 H - インドール - 3 - イル ] ピペリジン - 1 - イルメチル } - 2 - メトキシ安息香酸

5 - [ 4 - ( 1 - ブチル - 6 - フルオロ - 1 H - インドール - 3 - イル ) - ピペリジン - 1 - イルメチル ] - 2 - メトキシ安息香酸

の 1 つである、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 8】

H<sub>1</sub> ヒスタミン受容体の拮抗作用により改善可能な病的状態または疾病の処置で使用するための、請求項 1 から 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 9】

医薬的に許容される希釈剤または担体と混合された請求項 1 から 7 のいずれか 1 項で定義された化合物を含む、医薬組成物。

【請求項 10】

ヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体の拮抗作用により改善可能な病的状態または疾病の処置のための医薬の製造での、請求項 1 から 7 のいずれか 1 項で定義された化合物の使用。

【請求項 11】

病的状態または疾病が、気管支喘息、アレルギー性鼻炎、結膜炎、皮膚炎、蕁麻疹、または他のアレルギー疾病である、請求項 10 に記載の使用。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0019

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0019】

式 I V ( 式中、R<sub>2</sub> は、上で定義されたものであり、そして X は、塩素または臭素原子、またはメタンスルホネート、p - トルエンスルホネート、またはベンゼンスルホネート基の様な脱離基である ) の反応性中間体を用いる、化合物 I I I のアルキル化により、式 V ( 式中、R<sub>1</sub>、および R<sub>2</sub> は、上で定義されたものである ) の化合物を得る。該反応は、好ましくは、ジメチルホルムアミド、テトラヒドロフラン、またはエチルエーテルの様な不活性溶媒中、0 から 80 の温度で、水素化ナトリウムまたはナトリウムアミドの様な無機塩基の存在下で行われる。

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0054

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0054】

表 1 の結果は、本発明の化合物が、オルト位置のメトキシ基を有さない構造上類似のインドリルピペリジンの IC<sub>50</sub> と同等であるかまたは若干高い、H<sub>1</sub> 結合 IC<sub>50</sub> を有することを示す。これは、生体外でのヒスタミン H<sub>1</sub> 受容体に対する同等な親和性を意味する。結果として、当該技術分野の技術者は、両種類のインドリルピペリジンが、生体内での同等な抗アレルギー効果を有すると予測したであろう。