

【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26年8月21日(2014.8.21)

【公表番号】特表2013-535424(P2013-535424A)

【公表日】平成25年9月12日(2013.9.12)

【年通号数】公開・登録公報2013-050

【出願番号】特願2013-518748(P2013-518748)

【国際特許分類】

C 0 7 D 231/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/415 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 17/04 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 11/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 33/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 231/12 C S P D

A 6 1 K 31/415

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 17/04

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 3/04
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 7/02
 A 6 1 P 1/16
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 11/02
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 33/00
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 37/00
 A 6 1 P 11/00

【手続補正書】

【提出日】平成26年7月1日(2014.7.1)

【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

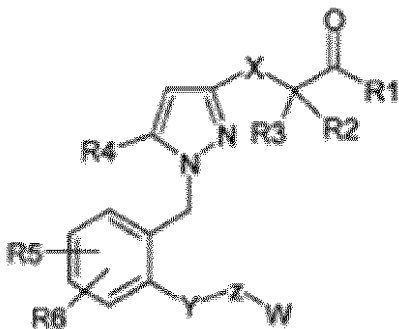
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式

【化 1】



を有する化合物であって、式中、 R_1 は、 OR_7 、 $N(R_7)_2$ 、および $N(R_7)SO_2R_7$ から成る群から選択され、 R_7 は、H、アルキル、およびアリールから成る群から選択され、前記アルキルおよびアリールは、フルオロで置換されてもよく、

R_2 は、Hおよびアルキルから成る群から選択され、

R_3 は、Hおよびアルキルから成る群から選択され、 R_2 および R_3 は、個々に、または一緒になって、シクロアルキル環を形成することができ、

Xは、 $(CH_2)_n$ であり、nは、0または1～3の整数であるが、但し、nが0または1の場合、 R_1 は OR_7 または NR_2 ではないことを条件とし、

R_4 は、H、アルキル、およびフルオロアルキルから成る群から選択され、

R_5 は、H、ヒドロキシ、アルキル、アリール、アルコキシ、アリールオキシ、ハロゲン、ニトロ、アミノ、シアノ、ならびにヒドロキシ、ハロゲン、ニトロ、アミノ、およびシアノ置換されたアルキル、アリール、アルコキシ、またはアリールオキシから成る群から選択され、

R_6 は、H、ヒドロキシ、アルキル、アリール、アルコキシ、アリールオキシ、ハロゲン、ニトロ、アミノ、シアノ、ならびにヒドロキシ、ハロゲン、ニトロ、アミノ、およびシアノ置換されたアルキル、アリール、アルコキシ、およびアリールオキシから成る群から選択され、

Zは、 $(CH_2)_m$ であり、mは0または1～3の整数であり、

Yは、O、S、SO、SO₂、および $(CH_2)_p$ から成る群から選択され、pは0または1～3の整数であり、

Wは、アルキルおよびアリールから成る群から選択される、化合物またはそれらの医薬的に許容できる塩又はプロドラッグ。

【請求項2】

R₁は、OHおよびNH₂SO₂CF₃から成る群から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R₂およびR₃は、Hである、請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

R₄は、アルキルである、請求項3に記載の化合物。

【請求項5】

R₄は、メチルである、請求項4に記載の化合物。

【請求項6】

R₅は、H、ヒドロキシ、アルキル、アリール、アルコキシ、アリールオキシ、ハロゲン、ニトロ、アミノ、シアノ、ならびにヒドロキシ、ハロゲン、ニトロ、アミノ、およびシアノ置換されたアルキル、アリール、アルコキシ、アリールオキシから成る群から選択され、R₆が、Hである、請求項2に記載の化合物。

【請求項7】

R₅は、H、アルキル、アルコキシ、ハロゲン、ならびにフッ化アルキルおよびアルコキシから成る群から選択される、請求項6に記載の化合物。

【請求項8】

R₅は、クロロ、ブロモ、およびトリフルオロメチルから成る群から選択される、請求項7に記載の化合物。

【請求項9】

Zは、 $(CH_2)_2$ である、請求項2に記載の化合物。

【請求項10】

Yは、Oである、請求項2に記載の化合物。

【請求項11】

Wは、アルキル、ベンジルイル、およびハロゲン置換ベンジルから成る群から選択される、請求項2に記載の化合物。

【請求項12】

Wは、4～7個の炭素原子を有するアルキルから成る群から選択される、請求項11に記載の化合物。

【請求項13】

Wは、シクロペンチルである、請求項12に記載の化合物。

【請求項14】

前記化合物は、N - (3 - { 1 - [5 - クロロ - 2 - (4 - クロロ - ベンジルオキシ) - ベンジル] - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル } - プロピオニル) - C , C , C - トリフルオロメタンスルホンアミド、

3 - { 1 - [5 - クロロ - 2 - (2 - エチル - ブトキシ) - ベンジル] - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル } - プロピオン酸、

3 - { 1 - [5 - ブロモ - 2 - (2 - エチル - ブトキシ) - ベンジル] - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル } - プロピオン酸、

3 - [1 - (5 - ブロモ - 2 - シクロペンチルメトキシベンジル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - プロピオン酸、

および

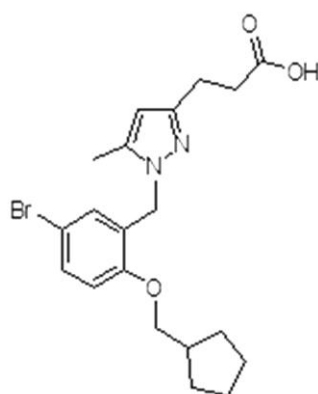
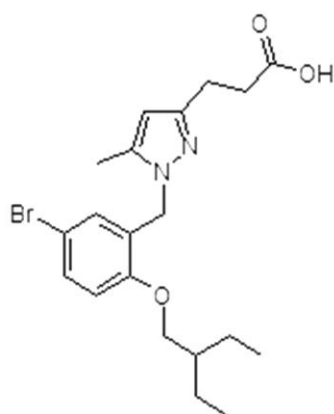
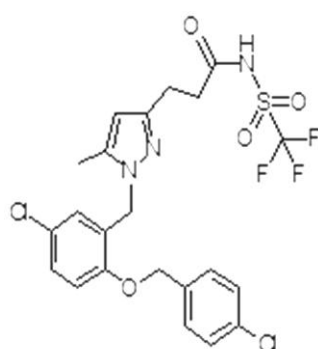
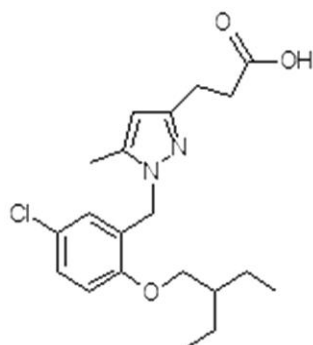
3 - [1 - (2 - シクロペンチルメトキシ - 5 - トリフルオロメチルベンジル) - 5 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - イル] - プロピオン酸から成る群から選択される、請求項

1 に記載の化合物。

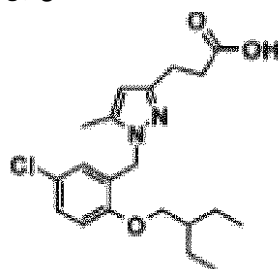
【請求項 1 5】

前記化合物は、

【化 2】



および



から成る群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 1 6】

請求項1に記載の化合物またはそれらの医薬的に許容できる塩もしくはプロドラッグ及び1以上の医薬的に許容可能な賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 17】

アレルギー症状、喘息、アレルギー性喘息、アレルギー性鼻炎、ブドウ膜炎および関連障害、アテローム性動脈硬化、血液凝固障害、骨障害、癌、細胞腫瘍性形質転換、慢性閉塞性肺疾患および肺炎症の他の形態、うっ血性心不全、糖尿病性網膜症、抗凝固治療を要する疾患または症状、骨形成および吸収の制御を要する疾患、生殖能力障害、壊疽、緑内障、超高熱、免疫および自己免疫疾患、炎症症状、転移性腫瘍増殖、偏頭痛、粘液分泌障害、鼻閉、鼻炎、閉塞性血管疾患、高眼圧症、低眼圧症、骨粗鬆症、リウマチ性関節炎、疼痛、通年性鼻炎、肺うっ血、肺低血圧、レイノー病、臓器移植およびバイパス手術における拒絶反応、呼吸器症状、多毛症、鼻漏、ショック、睡眠障害、または睡眠 - 覚醒周期障害の治療の為に医薬の製造の為に請求項1に記載の化合物の使用。

【請求項 18】

R A リウマチ性関節炎、乾癬、およびアテローム性動脈硬化、アトピー性皮膚炎、腎疾患、胸膜炎、アレルギーおよび喘息、大腸炎、子宮内膜症、多発性筋炎および皮膚筋炎、ブドウ膜炎、再狭窄、脳の炎症および肥満症、糖尿病および糖尿病誘発性アテローム性動脈硬化、ならびに MCP - 1 / CCR 2 - 媒介性の多発性炎症性疾患の治療の為に医薬の製造の為に請求項1に記載の化合物の使用。

【請求項 19】

ブドウ膜炎の治療の為に医薬の製造の為に請求項 1 に記載の化合物の使用。

【請求項 20】

炎症またはブドウ膜炎の治療の為に医薬の製造の為に請求項 15 に記載の化合物の使用

。