

【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21年3月12日(2009.3.12)

【公表番号】特表2007-509114(P2007-509114A)

【公表日】平成19年4月12日(2007.4.12)

【年通号数】公開・登録公報2007-014

【出願番号】特願2006-536158(P2006-536158)

【国際特許分類】

C 07 D 209/30	(2006.01)
A 61 K 31/405	(2006.01)
C 07 D 401/06	(2006.01)
A 61 K 31/4709	(2006.01)
A 61 K 31/498	(2006.01)
C 07 D 417/06	(2006.01)
A 61 K 31/427	(2006.01)
A 61 K 31/428	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 37/08	(2006.01)
A 61 P 27/02	(2006.01)
A 61 P 11/00	(2006.01)
A 61 P 1/04	(2006.01)
A 61 P 17/00	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 37/06	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 19/02	(2006.01)

【F I】

C 07 D 209/30	C S P
A 61 K 31/405	
C 07 D 401/06	
A 61 K 31/4709	
A 61 K 31/498	
C 07 D 417/06	
A 61 K 31/427	
A 61 K 31/428	
A 61 P 43/00	1 2 3
A 61 P 37/08	
A 61 P 27/02	
A 61 P 11/00	
A 61 P 1/04	
A 61 P 17/00	
A 61 P 25/00	
A 61 P 37/06	
A 61 P 9/00	
A 61 P 29/00	1 0 1
A 61 P 19/02	
A 61 P 43/00	1 1 1

【誤訳訂正書】

【提出日】平成21年1月19日(2009.1.19)

【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

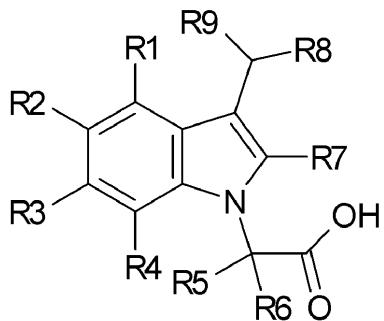
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(I)の化合物あるいはその薬理学的に許容できる塩、水和物または溶媒和化合物。

【化1】



I

[式中、R¹、R³、およびR⁴は水素であり、

R²はハロであり、

R⁵とR⁶はそれぞれ独立して水素、或いは1つ以上のハロ置換基もしくは1つ以上のC₃-C₇シクロアルキル基で置換されてもよいC₁-C₆アルキル又はそれらが結合する炭素原子と共にC₃-C₇シクロアルキル基を形成し、

R⁷は水素或いは1つ以上のハロ置換基もしくは1つ以上のC₃-C₇シクロアルキル基で置換されてもよいC₁-C₆アルキルであり、

R⁸はフェニル、ナフタレニル、チアゾール、ビフェニル、キノリニルまたはキノキサリニル基であり、1つ以上のハロ、1つ以上のハロ置換基もしくは1つ以上のC₃-C₇シクロアルキル基で置換されてもよいC₁-C₆アルキル、1つ以上のハロ置換基もしくは1つ以上のC₃-C₇シクロアルキル基で置換されてもよい-O(C₁-C₆)アルキル、-SO₂R¹またはOH基で置換されてもよく、

各R¹は独立して水素又は1つ以上のハロ置換基もしくは1つ以上のC₃-C₇シクロアルキル基で置換されてもよいC₁-C₆アルキルであり、

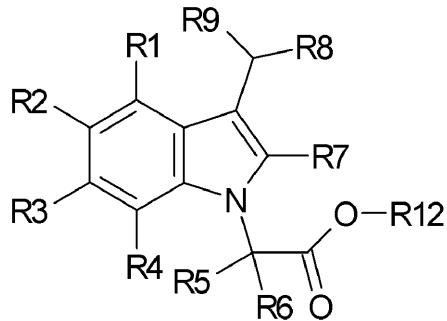
但し、R⁸は非置換のフェニルでなく、

R⁹は水素或いは1つ以上のハロ置換基もしくは1つ以上のC₃-C₇シクロアルキル基で置換されてもよいC₁-C₆アルキルである。]

【請求項2】

一般式(II)の化合物あるいはその薬理学的に許容できる塩、水和物または溶媒和化合物。

【化2】



II

[式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、およびR⁹は、請求項1で定義された通りであり、

R¹²は1つ以上のハロ置換基もしくは1つ以上のC₃-C₇シクロアルキル基で置換されてもよいC₁-C₆アルキル、アリール、(CH₂)_mOOC(=O)C₁-C₆アルキル(但し、C₁-C₆アルキルは1つ以上のハロ置換基もしくは1つ以上のC₃-C₇シクロアルキル基で置換されてもよい)、(CH₂)_mN(R¹³)₂、CH((CH₂)_mO(C=O)R¹⁴)₂であり、

mは1又は2であり、

R¹³は水素又はメチルであり、

R¹⁴は1つ以上のハロ置換基もしくは1つ以上のC₃-C₇シクロアルキル基で置換されてもよいC₁-C₁₈アルキルである。]

【請求項3】

一般式(I)または(II)において、

R⁵およびR⁶は、それぞれ独立して水素または1つ以上のハロ置換基もしくは1つ以上のC₃-C₇シクロアルキル基で置換されてもよいC₁-C₄アルキルであること、

R⁷は、Hまたは1つ以上のハロ置換基もしくは1つ以上のC₃-C₇シクロアルキル基で置換されてもよいC₁-C₆アルキルであること、

R⁹は、水素または1つ以上のハロ置換基もしくは1つ以上のC₃-C₇シクロアルキル基で置換されてもよいC₁-C₄アルキルであることを独立にまたは任意に組み合わせた請求項1または2に記載の化合物あるいはその薬理学的に許容できる塩、水和物または溶媒和化合物。

【請求項4】

R²はフルオロである、請求項1から3の何れかに記載の化合物あるいはその薬理学的に許容できる塩、水和物または溶媒和化合物。

【請求項5】

R⁵およびR⁶の少なくとも1つが水素である、請求項1から4の何れかに記載の化合物あるいはその薬理学的に許容できる塩、水和物または溶媒和化合物。

【請求項6】

R⁷はメチルである、請求項1から5の何れかに記載の化合物あるいはその薬理学的に許容できる塩、水和物または溶媒和化合物。

【請求項7】

R⁵、R⁶およびR⁹は水素であり、R⁷はメチルである、請求項1から6の何れかに記載の化合物あるいはその薬理学的に許容できる塩、水和物または溶媒和化合物。

【請求項8】

R⁸は、ハロ、1つ以上のハロ置換基もしくは1つ以上のC₃-C₇シクロアルキル基で置換されてもよいC₁-C₄アルキル、C₁-C₄ハロアルキル、C₁-C₄アルコキシ、C₁-C₄アルキルスルホニルまたはヒドロキシから選択される1つ以上の置換基で

置換される請求項 1 から 7 の何れかに記載の化合物あるいはその薬理学的に許容できる塩、水和物または溶媒和化合物。

【請求項 9】

R⁸ は、クロロ、フルオロ、メチル、エチル、t - ブチル、トリフロロメチル、メトキシ、メタンスルフォニル、および、ヒドロキシから選択される 1 つ以上の置換基で置換される請求項 8 に記載の化合物あるいはその薬理学的に許容できる塩、水和物または溶媒和化合物。

【請求項 10】

{ 3 - [1 - (4 - クロロ - フェニル) - エチル] - 5 - フルオロ - 2 - メチル - インドール - 1 - イル } - 酢酸、

{ 5 - フルオロ - 2 - メチル - 3 - [1 - (4 - トリフロロメチル - フェニル) - エチル] - インドール - 1 - イル } - 酢酸、

{ 3 - [1 - (4 - t e r t - ブチル - フェニル) - エチル] - 5 - フルオロ - 2 - メチル - インドール - 1 - イル } - 酢酸、

{ 5 - フルオロ - 3 - [1 - (4 - メタンスルfonyl - フェニル) - エチル] - 2 - メチル - インドール - 1 - イル } - 酢酸、

[5 - フルオロ - 2 - メチル - 3 - (1 - ナフタレン - 2 - イル - エチル) - インドール - 1 - イル] - 酢酸、

(5 - フルオロ - 2 - メチル - 3 - キノリン - 2 - イルメチル - インドール - 1 - イル) - 酢酸、

(5 - フルオロ - 2 - メチル - 3 - ナフタレン - 2 - イルメチル - インドール - 1 - イル) - 酢酸、

[5 - フルオロ - 3 - (8 - ヒドロキシ - キノリン - 2 - イルメチル) - 2 - メチル - インドール - 1 - イル] - 酢酸、

(5 - フルオロ - 2 - メチル - 3 - キノキサリン - 2 - イルメチル - インドール - 1 - イル) - 酢酸、

[5 - フルオロ - 3 - (4 - メトキシ - ベンジル) - 2 - メチル - インドール - 1 - イル] - 酢酸、

(5 - フルオロ - 2 - メチル - 3 - チアゾール - 2 - イルメチル - インドール - 1 - イル) - 醋酸エチルエステル、

[3 - (4 - クロロ - ベンジル) - 5 - フルオロ - 2 - メチル - インドール - 1 - イル] - 醋酸、

[5 - フルオロ - 2 - メチル - 3 - (4 - トリフロロメチル - ベンジル) - インドール - 1 - イル] - 醋酸、

[5 - フルオロ - 2 - メチル - 3 - (4 - t e r t - ブチル - ベンジル) - インドール - 1 - イル] - 醋酸、

(3 - ビフェニル - 4 - イルメチル - 5 - フルオロ - 2 - メチル - インドール - 1 - イル) - 醋酸、

[5 - フルオロ - 3 - (4 - メタンスルfonyl - ベンジル) - 2 - メチル - インドール - 1 - イル] - 醋酸、

[5 - フルオロ - 3 - (6 - フルオロ - キノリン - 2 - イルメチル) - 2 - メチル - インドール - 1 - イル] - 醋酸、

(2 - メチル - 3 - キノリン - 2 - イルメチル - インドール - 1 - イル) - 醋酸、

(5 - クロロ - 2 - メチル - 3 - キノリン - 2 - イルメチル - インドール - 1 - イル) - 醋酸である請求項 1 から 9 の何れかに記載の化合物あるいはその薬理学的に許容できる塩、水和物または溶媒和化合物、またはこれらの C₁ - C₆ アルキル、アリール、(C H₂)_m O C (= O) C₁ - C₆ アルキル、(C H₂)_m N (R¹ R³)₂、C H ((C H₂)_m O (C = O) R¹ R⁴)₂ のエステル (式中、m は 1 又は 2 であり、R¹ R³ は水素又はメチルであり、R¹ R⁴ は C₁ - C₁₈ アルキルである)。

【請求項 11】

(5 - フルオロ - 2 - メチル - 3 - キノリン - 2 - イルメチル - インドール - 1 - イル) - 酢酸である請求項 1 から 10 の何れかに記載の化合物あるいはその薬理学的に許容できる塩、水和物または溶媒和化合物。

【請求項 12】

[5 - フルオロ - 3 - (4 - メタンスルフォニル - ベンジル) - 2 - メチル - インドール - 1 - イル] - 酢酸である請求項 1 から 10 の何れかに記載の化合物あるいはその薬理学的に許容できる塩、水和物または溶媒和化合物。

【請求項 13】

請求項 1 から 12 の何れかに記載の一般式(I)の化合物あるいはその薬理学的に許容できる塩、水和物または溶媒和化合物を調製する方法であって、請求項 2 に記載される一般式(II)の化合物の加水分解を含み、R¹⁻²はC₁-C₆アルキルである方法。

【請求項 14】

医学分野で使用される請求項 1 から 12 の何れかに記載の化合物あるいはその薬理学的に許容できる塩、水和物または溶媒和化合物。

【請求項 15】

C R T H 2 受容体で P G D₂ によって媒介される疾患および症状の治療または予防に使用される請求項 1 から 12 の何れかに記載の化合物あるいはその薬理学的に許容できる塩、水和物または溶媒和化合物。

【請求項 16】

アレルギー性喘息、多年性アレルギー性鼻炎、季節性アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、接触過敏症（接触皮膚炎を含む）、結膜炎、特にアレルギー性結膜炎、好酸球性気管支炎、食物アレルギー、好酸球性胃腸炎、炎症性腸疾患、潰瘍性大腸炎及びクローン病、肥満細胞症、高 Ig E 症候群及び全身性エリテマトーデスなどの自己免疫疾患、乾癬、座瘡、再灌流障害、多発性硬化症、同種異系移植片拒否反応、慢性閉塞性肺疾患、慢性関節リウマチ、乾癬性関節炎および変形性関節症の治療又は予防において使用する請求項 1 から 12 の何れかに記載の化合物あるいはその薬理学的に許容できる塩、水和物または溶媒和化合物。

【請求項 17】

C R T H 2 受容体で P G D₂ によって媒介される疾患および症状の治療または予防する薬剤の調製における請求項 1 から 12 の何れかに記載の化合物あるいはその薬理学的に許容できる塩、水和物または溶媒和化合物の使用。

【請求項 18】

アレルギー性喘息、多年性アレルギー性鼻炎、季節性アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、接触過敏症（接触皮膚炎を含む）、結膜炎、特にアレルギー性結膜炎、好酸球性気管支炎、食物アレルギー、好酸球性胃腸炎、炎症性腸疾患、潰瘍性大腸炎及びクローン病、肥満細胞症、高 Ig E 症候群及び全身性エリテマトーデスなどの自己免疫疾患、乾癬、座瘡、再灌流障害、多発性硬化症、同種異系移植片拒否反応、慢性閉塞性肺疾患、慢性関節リウマチ、乾癬性関節炎および変形性関節症の治療または予防する薬剤の調製における請求項 1 から 12 の何れかに記載の化合物あるいはその薬理学的に許容できる塩、水和物または溶媒和化合物の使用。

【請求項 19】

薬理学的に許容できる賦形剤又は担体とともに請求項 1 から 12 の何れかに記載の化合物あるいはその薬理学的に許容できる塩、水和物または溶媒和化合物を含む医薬組成物。

【請求項 20】

経口、経鼻、気管支或いは局所投与のために製剤化された請求項 19 に記載の医薬組成物。

【請求項 21】

C R T H 2 受容体で P G D₂ が媒介する疾患および症状の治療に使用される 1 つ以上の活性薬剤をさらに含む請求項 19 または 20 に記載の医薬組成物。

【請求項 22】

前記活性薬剤は、
サルメテロールのような 2 アゴニスト、
フルチカゾンのようなコルチコステロイド、
ロラチジンのような抗ヒスタミン剤、
モンテルカストのようなロイコトリエンアンタゴニスト、
オマリズマブのような抗 I g E 抗体治療薬、
フシジン酸のような抗感染薬（特にアトピー性皮膚炎の治療用）、
クロトリマゾールのような抗真菌薬（特にアトピー性皮膚炎の治療用）、
タクロリムス及び炎症性皮膚疾患の場合は特にピメクロリムスのような免疫抑制剤、
D P アンタゴニストのような他の受容体において作用する P G D₂ の他のアンタゴニスト、

シロニラストのような I V 型ホスホジエステラーゼ阻害剤、
T N F 転換酵素（T A C E ）の阻害剤のようなサイトカイン生成を調節する薬物、
プロッキングモノクローナル抗体及び可溶性受容体のように T h 2 サイトカイン I L - 4 及び I L - 5 の活性を調節する薬物、
ジロイトンのような 5 - リポオキシゲナーゼの阻害剤から選択される請求項 2 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 3】

請求項 1 9 から 2 2 の何れかに記載の医薬組成物を調製する方法であって、請求項 1 から 1 2 の何れかに記載の化合物あるいはその薬理学的に許容できる塩、水和物または溶媒和化合物を薬理学または獣医学的に許容できる担体又は賦形剤と結合または会合させることを含む方法。

【請求項 2 4】

C R T H 2 で P G D₂ によって媒介される疾患および症状の治療または予防における同時、分別又は遂次使用のために組合せて調製される、請求項 1 から 1 2 の何れかに記載の化合物あるいはその薬理学的に許容できる塩、水和物または溶媒和化合物と、請求項 2 2 に記載の 1 つ以上の薬剤を含む製品。

【請求項 2 5】

アレルギー性喘息、多年性アレルギー性鼻炎、季節性アレルギー性鼻炎、アトピー性皮膚炎、接触過敏症（接触皮膚炎を含む）、結膜炎、特にアレルギー性結膜炎、好酸球性気管支炎、食物アレルギー、好酸球性胃腸炎、炎症性腸疾患、潰瘍性大腸炎及びクローン病、肥満細胞症、高 I g E 症候群及び全身性エリテマトーデスなどの P G D₂ によって媒介される他の疾患、乾癬、座瘡、再灌流障害、多発性硬化症、同種異系移植片拒否反応、慢性閉塞性肺疾患、慢性関節リウマチ、乾癬性関節炎および変形性関節症の治療又は予防における同時、分別又は遂次使用のために組合せて調製される、請求項 1 から 1 2 の何れかに記載の化合物あるいはその薬理学的に許容できる塩、水和物または溶媒和化合物と、請求項 2 2 に記載の 1 つ以上の薬剤とを含む製品。

【請求項 2 6】

前記薬剤は、C R T H 2 及び D P 受容体またはそのいずれかにおける P G D₂ によって媒介される疾患と症状の治療または予防に使用される活性薬剤をさらに含む、請求項 1 7 または 1 8 に記載の使用。

【請求項 2 7】

前記活性薬剤は請求項 2 2 に記載の薬剤の 1 つである、請求項 2 6 に記載の使用。

【請求項 2 8】

C R T H 2 受容体のアンタゴニストである請求項 1 に記載の化合物。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 7 8

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0078】

C R T H 2 アンタゴニストも又炎症性徴候に対して開発中の治療剤と組み合わせても良く、以下の物質を含む。

D P アンタゴニストのような他の受容体において作用する P G D₂ の他のアンタゴニスト、

シロニラストのような I V 型ホスホジエステラーゼ阻害剤、

T N F 転換酵素 (T A C E) の阻害剤のようなサイトカイン生成を調節する薬物、
ブロッキングモノクローナル抗体及び可溶性受容体のように T h 2 サイトカイン I L - 4 及び I L - 5 の活性を調節する薬物、

ロシグリタゾーンのような P P A R - アゴニスト、

ジロイトンのような 5 - リポオキシゲナーゼの阻害剤。