

【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11日 (2010.3.11)

【公表番号】特表2004-534825(P2004-534825A)

【公表日】平成16年11月18日 (2004.11.18)

【年通号数】公開・登録公報2004-045

【出願番号】特願2003-507087(P2003-507087)

【国際特許分類】

C 07 D 209/12 (2006.01)

A 61 K 31/404 (2006.01)

A 61 K 31/41 (2006.01)

A 61 P 3/04 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 7/02 (2006.01)

A 61 P 9/04 (2006.01)

A 61 P 9/06 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 9/12 (2006.01)

A 61 P 11/06 (2006.01)

A 61 P 13/12 (2006.01)

A 61 P 17/02 (2006.01)

A 61 P 17/06 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 19/10 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 31/04 (2006.01)

A 61 P 31/18 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 37/06 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

C 07 D 403/12 (2006.01)

【 F I 】

C 07 D 209/12

A 61 K 31/404

A 61 K 31/41

A 61 P 3/04

A 61 P 3/10

A 61 P 7/02

A 61 P 9/04

A 61 P 9/06

A 61 P 9/10

A 61 P 9/12

A 61 P 11/06

A 61 P 13/12

A 61 P 17/02

A 61 P 17/06

A 61 P 19/02

A 61 P 19/10

A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 31/04
 A 6 1 P 31/18
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 C 0 7 D 403/12

【誤訳訂正書】

【提出日】平成22年1月14日(2010.1.14)

【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

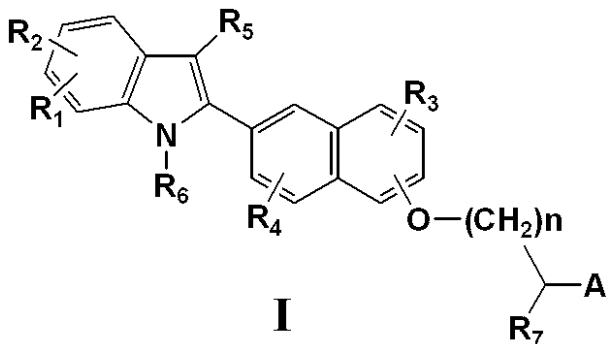
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

【化 1】



(R_1 、 R_2 、 R_3 および R_4 はそれぞれ独立に、水素、1 - 3 個の炭素のアルキル、またはハロゲン；

R_5 は、1 - 6 個の炭素のアルキル、または 1 - 6 個の炭素のペルフルオロアルキル；

R_6 は、水素、1 - 6 個の炭素のアルキル、 R_8 で置換されたベンジル、または 1 - 6 個の炭素のアルカノイル；

R_7 は、水素、または 1 - 6 個の炭素のアルキル；

n は、0；

A は、 COOH 、テトラアゾール、 SO_3H 、 PO_3H_2 、またはテトロン酸；

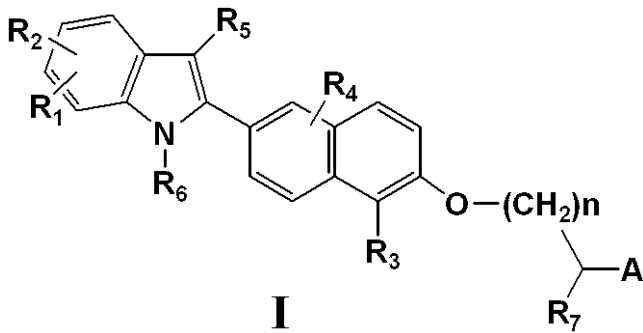
R_8 は、水素、1 - 3 個の炭素のアルキル、または 1 - 3 個の炭素のペルフルオロアルキル、1 - 3 個の炭素のペルフルオロアルコキシ)

の化合物またはその医薬上許容される塩またはメチルエステル形態。

【請求項 2】

式：

【化 2】



(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_7 、 A 、 n 、および R_8 は請求項 1 に規定するものである)を有する請求項 1 記載の化合物またはその医薬上許容される塩またはメチルエステル形態。

【請求項 3】

R_5 が 1 - 6 個の炭素のアルキルである、請求項 1 または 2 記載の化合物。

【請求項 4】

R_1 が水素である、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 5】

R_2 が水素である、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 6】

R_3 が臭素である、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 7】

R_3 が水素である、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 8】

R_4 が水素である、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 9】

R_5 がベンチルである、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 10】

R_6 が、ベンジル、メチル、アシル、または (2 - トリフルオロメチル) ベンジルから選択される、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 11】

R_7 が水素である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 12】

$n = 0$ である、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項記載の化合物。

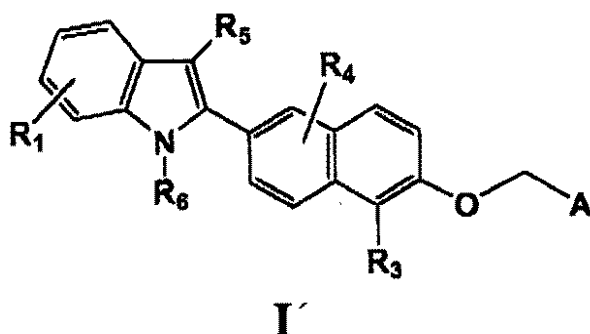
【請求項 13】

A が CO_2H または テトラゾール である、請求項 1 ~ 12 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 14】

式：

【化 3】



(式中、 R_1 、 R_3 、および R_4 はそれぞれ独立に、水素、1 - 3個の炭素のアルキル、またはハロゲン；

R_5 は、1 - 6個の炭素のアルキル、または1 - 6個の炭素のペルフルオロアルキル；

R_6 は、水素、1 - 6個の炭素のアルキル、アルキルアリール、 R_8 で置換されたベンジル、または1 - 6個の炭素のアルカノイル；

AはCOOHまたはテトラアゾールである；

R_8 は、水素、1 - 3個の炭素のアルキル、1 - 3個の炭素のペルフルオロアルキル、または1 - 3個の炭素のペルフルオロアルコキシである)を有する請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩またはメチルエステル形態。

【請求項15】

1 - ベンジル - 3 - ペンチル - 2 - [6 - (1H - テトラアゾール - 5 - イルメトキシ) - 2 - ナフチル] - 1H - インドールである請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項16】

1 - ベンジル - 2 - [5 - ブロモ - 6 - (1H - テトラアゾール - 5 - イルメトキシ) - 2 - ナフチル] - 3 - ペンチル - 1H - インドールである請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項17】

1 - メチル - 3 - ペンチル - 2 - [6 - (1H - テトラアゾール - 5 - イルメトキシ) - 2 - ナフチル] - 1H - インドールである請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項18】

2 - [5 - ブロモ - 6 - (1H - テトラアゾール - 5 - イルメトキシ) - 2 - ナフチル] - 1 - メチル - 3 - ペンチル - 1H - インドールである請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項19】

3 - ペンチル - 2 - [6 - (1H - テトラアゾール - 5 - イルメトキシ) - 2 - ナフチル] - 1 - [2 - (トリフルオロメチル)ベンジル] - 1H - インドールである請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項20】

2 - [5 - ブロモ - 6 - (1H - テトラアゾール - 5 - イルメトキシ) - 2 - ナフチル] - 3 - ペンチル - 1 - [2 - (トリフルオロメチル)ベンジル] - 1H - インドールである請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項21】

{[1 - ブロモ - 6 - (1 - メチル - 3 - ペンチル - 1H - インドール - 2 - イル) - 2 - ナフチル]オキシ}酢酸である請求項1記載の化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項22】

請求項1～21のいずれか1項記載の化合物またはその医薬上許容される塩またはメチルエステルと、医薬上許容される賦形剤またはキャリアとを含む、血栓症またはフィブリン溶解性傷害の治療用医薬組成物。

【請求項23】

請求項1～21のいずれか1項記載の化合物またはその医薬上許容される塩またはメチルエステルと、医薬上許容される賦形剤またはキャリアとを含む、アテローム動脈硬化プラークの形成、静脈および動脈血栓症、心筋虚血、心房細動、深部静脈血栓症、凝固症候群、肺繊維症、脳血栓症、手術の血栓閉塞合併症または末梢動脈閉塞症に伴う、血栓症またはフィブリン溶解性傷害の治療用医薬組成物。

【請求項24】

請求項1～21のいずれか1項記載の化合物またはその医薬上許容される塩またはメチルエステルと、医薬上許容される賦形剤またはキャリアとを含む、心房細動に付随する卒中または心房細動から由来の卒中の治療用医薬組成物。

【請求項 25】

請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 項記載の化合物またはその医薬上許容される塩またはメチルエステルと、医薬上許容される賦形剤またはキャリアとを含む、深部静脈血栓症の治療用医薬組成物。

【請求項 26】

請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 項記載の化合物またはその医薬上許容される塩またはメチルエステルと、医薬上許容される賦形剤またはキャリアとを含む、心筋虚血の治療用医薬組成物。

【請求項 27】

請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 項記載の化合物またはその医薬上許容される塩またはメチルエステルと、医薬上許容される賦形剤またはキャリアとを含む、心血管疾患の治療用医薬組成物。

【請求項 28】

請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 項記載の化合物またはその医薬上許容される塩またはメチルエステルと、医薬上許容される賦形剤またはキャリアとを含む、アテローム動脈硬化プラークの形成の治療用医薬組成物。

【請求項 29】

請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 項記載の化合物またはその医薬上許容される塩またはメチルエステルと、医薬上許容される賦形剤またはキャリアとを含む、アルツハイマー病の治療用医薬組成物。

【請求項 30】

医薬の製造に使用する請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 31】

哺乳動物における血栓症またはフィブリン溶解性傷害の治療のための医薬の調製における、請求項 1 ~ 21 のいずれか 1 項記載の化合物の使用。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0033

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0033】

本発明の化合物は、セリン プロテアーゼ インヒビター PAI - 1 のインヒビターであり、およびそれゆえ PAI - 1 の産生および / または活性が関与するこれらのプロセスの治療または予防に有用である。つまり、本発明の化合物は、そのような疾患により引き起こされる非インシュリン依存性真性糖尿病および心血管疾患の治療または予防、および冠動脈および脳血管疾患に伴う血栓症現象の予防に有用である。これらの化合物は、制限されるものではないが、アテローム性動脈硬化プラークの形成、静脈および動脈の血栓、心筋虚血、心房細動、深部静脈血栓症、凝固系疾患、肺動脈血栓症、脳血栓症、手術（間接の置換など）の血栓塞栓合併症、および末梢動脈閉塞を含む血栓およびプロトロンビン状態を含む疾患プロセスを阻害するのにも有用である。これらの化合物は、心房細動に伴うまたはそれから生じる卒中を治療するのにも有用である。