

【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9月11日 (2008.9.11)

【公表番号】特表2004-509869(P2004-509869A)

【公表日】平成16年4月2日 (2004.4.2)

【年通号数】公開・登録公報2004-013

【出願番号】特願2002-529069(P2002-529069)

【国際特許分類】

C 07 D 401/12 (2006.01)

A 61 K 31/435 (2006.01)

A 61 P 1/00 (2006.01)

A 61 P 3/04 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

A 61 P 11/00 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 27/16 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 37/06 (2006.01)

C 07 D 401/14 (2006.01)

【 F I 】

C 07 D 401/12

A 61 K 31/435

A 61 P 1/00

A 61 P 3/04

A 61 P 9/00

A 61 P 11/00

A 61 P 25/00

A 61 P 27/16

A 61 P 29/00

A 61 P 37/06

C 07 D 401/14

C 07 M 7:00

C 07 M 9:00

【手続補正書】

【提出日】平成20年7月15日 (2008.7.15)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

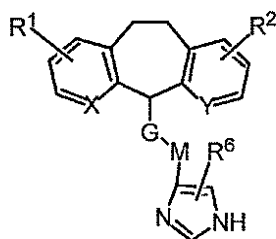
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 化合物または該化合物の薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物であって、該化合物には、該化合物の鏡像異性体、立体異性体および互変異性体が含まれ、該化合物は、式 I :

【化 1】



式 1

に示される一般構造を有し、ここで、

Gは、 $-(CH_2)_v-NR^3-$ 、 $-(CH_2)_v-O-$ 、 $-(CH_2)_v-S(O)_z-$ 、 $-(CH_2)_v-NR^3-C(NR^4)-NR^3-$ 、 $-(CH_2)_v-O-C(O)NR^3-$ 、 $-(CH_2)_v-NR^3-C(O)NR^3-$ 、 $-(CH_2)_v-NR^3-C(O)O-$ 、 $-(CH_2)_v-NR^3-C(O)-$ 、 $-(CH_2)_v-C(O)NR^3-$  からなる群より選択され；

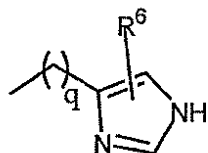
Mは、1～6個の炭素原子からなる分枝もしくは非分枝のアルキル基、または2～6個の炭素原子からなる分枝もしくは非分枝のアルケニル基であり；

XおよびYは、N、CHまたはN-オキシドからなる群より独立して選択され；

R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>は、各々、1～4の数であり得、そしてH、ハロゲン、低級アルキル、低級アルコキシ、ポリハロ低級アルコキシ、OH、CF<sub>3</sub>、NH<sub>2</sub>、NHC(O)アルキル、CNもしくはNO<sub>2</sub>からなる群より独立して選択され；

R<sup>3</sup>は、H、低級アルキル、置換もしくは非置換のフェニル、置換もしくは非置換のベンジルまたは以下の式：

【化2】



の基からなる群より独立して選択され；

R<sup>4</sup>は、H、CN、CO<sub>2</sub>R<sup>5</sup>からなる群より選択され；

R<sup>5</sup>は、低級アルキルおよび置換もしくは非置換のベンジルからなる群より選択され；

R<sup>6</sup>は、Hもしくは低級アルキルからなる群より選択され；

qは2～5であり；

vは0～6であり；そして

zは0、1または2である、化合物。

【請求項2】 R<sup>1</sup>およびR<sup>2</sup>が、H、ハロゲン、ヒドロキシまたは低級アルコキシから独立して選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】 R<sup>6</sup>がHである、請求項2に記載の化合物。

【請求項4】 XがNであり、かつYがCHである、請求項1に記載の化合物。

【請求項5】 Gが $-(CH_2)_v-NR^3-$ であり、ここでvおよびR<sup>3</sup>が、規定されたとおりである、請求項3に記載の化合物。

【請求項6】 Mが、1～6個の炭素原子を含有するアルキル基である、請求項1に記載の化合物。

【請求項7】 Gが $-(CH_2)_v-NR^3-$ であり、かつMが、1～6個の炭素原子を含有するアルキル基であり、ここでR<sup>3</sup>およびvが、規定されたとおりである、請求項3に記載の化合物。

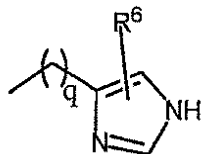
【請求項8】 XがNであり、YがCHであり、R<sup>1</sup>がHであり、R<sup>2</sup>がClであり

、そして  $R^6$  が H である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】  $G$  が  $-(CH_2)_v-NR^3-$  であり、 $M$  が、1～6 個の炭素原子を含有するアルキル基であり、 $R^1$  が H であり、 $R^2$  が Cl であり、そして  $R^6$  が H であり、ここで、 $R^3$  および  $v$  は規定されたとおりである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】  $R^3$  が、H または

【化 3】



である、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】  $V$  が O である、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】 活性成分として、請求項 1 に記載の化合物を含有する、薬学的組成物。

【請求項 13】 炎症、アレルギー、アレルギー性鼻炎、うっ血、胃腸管の疾患、心臓血管疾患、または中枢神経系の障害ならびにアレルギーが誘導する気道の応答および肥満を処置する際の使用のための薬学的組成物であって、該組成物は、活性成分として、請求項 1 に記載の化合物を含有する、薬学的組成物。

【請求項 14】 薬学的に受容可能なキャリアをさらに含有する、請求項 10 に記載の薬学的組成物。

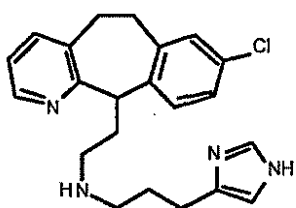
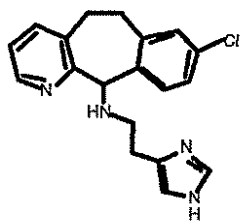
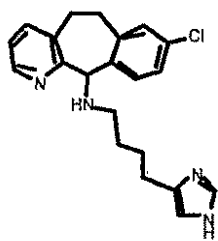
【請求項 15】 炎症、アレルギー、うっ血、胃腸管の疾患、心臓血管疾患、または中枢神経系の障害ならびにアレルギーが誘導する気道の応答および肥満を処置するための組成物であって、治療有効量の請求項 1 に記載の化合物を含有する、組成物。

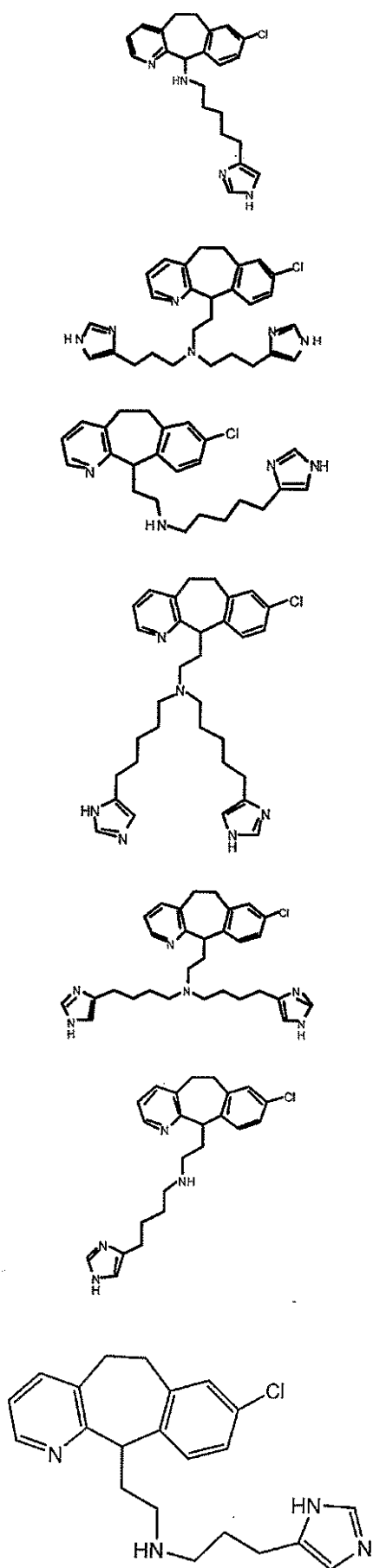
【請求項 16】 炎症、アレルギー、うっ血、胃腸管の疾患、心臓血管疾患、または中枢神経系の障害ならびにアレルギーが誘導する気道の応答および肥満の処置のための医薬の製造のための、請求項 1 に記載の化合物の使用。

【請求項 17】 炎症、アレルギー、うっ血、胃腸管の疾患、心臓血管疾患、または中枢神経系の障害ならびにアレルギーが誘導する気道の応答および肥満を処置するための薬学的組成物を調製する方法であって、該方法は、請求項 1 に記載の化合物および薬学的に受容可能なキャリアの密接な接触をもたらす工程を包含する、方法。

【請求項 18】  $H_3$  アンタゴニスト活性を示す化合物または該化合物の薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物であって、該化合物には、該化合物の鏡像異性体、立体異性体および互変異性体が含まれ、該化合物は、以下に列挙される構造：

【化 4】



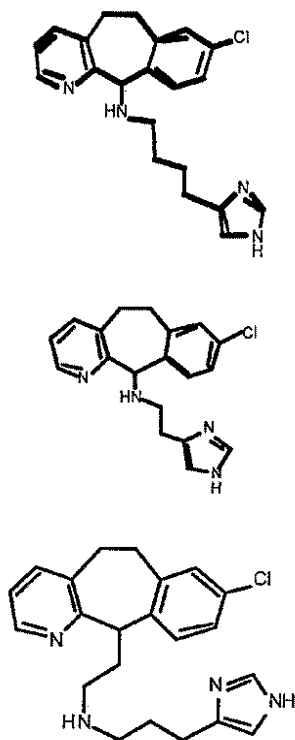


の化合物から選択される、化合物。

【請求項 19】  $H_1$  アンタゴニスト活性および  $H_3$  アンタゴニスト活性の両方を示

す化合物または該化合物の薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物であって、該化合物には、該化合物の鏡像異性体、立体異性体および互変異性体が含まれ、該化合物は、以下に列挙される構造：

【化 5】



の化合物から選択される、化合物。

【請求項 20】 炎症、アレルギー、うっ血、胃腸管の疾患、心臓血管疾患、または中枢神経系の障害ならびにアレルギーが誘導する気道の応答および肥満を処置するための薬学的組成物であって、該組成物は、治療有効量の請求項 18 または 19 に記載の化合物および薬学的に受容可能なキャリアを含有する、薬学的組成物。