

【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16年10月7日(2004.10.7)

【公表番号】特表2000-512614(P2000-512614A)

【公表日】平成12年9月26日(2000.9.26)

【出願番号】特願平9-520159

【国際特許分類第7版】

C 07 D 215/52

A 61 K 31/00

A 61 K 31/47

C 07 D 401/04

C 07 D 401/12

C 07 D 405/04

C 07 D 405/12

C 07 D 409/04

C 07 D 409/12

【F I】

C 07 D 215/52

A 61 K 31/00 6 4 3 D

A 61 K 31/47

A 61 K 31/47 6 0 5

C 07 D 401/04

C 07 D 401/12

C 07 D 405/04

C 07 D 405/12

C 07 D 409/04

C 07 D 409/12

【手続補正書】

【提出日】平成15年9月16日(2003.9.16)

【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】特許請求の範囲

【補正方法】変更

【補正の内容】

手続補正書

平成15年 9月16日

特許庁長官殿



1. 事件の表示

平成09年特許願第520159号

2. 補正をする者

氏名（名称） スミスクライン・ビーチャム・ソシエタ・ベル・
アチオニ

3. 代理人

住所 〒540-0001
大阪府大阪市中央区城見1丁目3番7号 IMPビル
青山特許事務所
電話 06-6949-1261 FAX 06-6949-0361

氏名 弁理士 (6214) 青山 葵



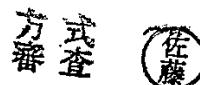
4. 補正により増加する請求項の数 4

5. 補正対象書類名 請求の範囲



6. 補正対象項目名 請求の範囲

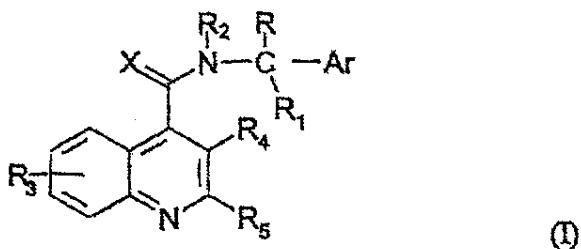
7. 補正の内容
別紙の通り



(別紙)

請求の範囲

1. タチキニンレセプターの過剰刺激により特徴付けられる症状の治療および／または予防方法であって、それを必要とする哺乳動物に有効な非毒性の医薬上許容される量の式(Ⅰ)：



[式中、

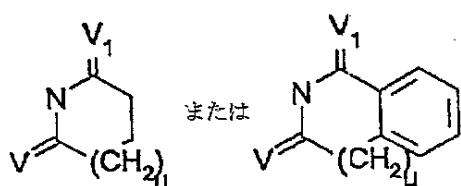
Ar は芳香族特性を有し、5ないし12個の環原子を含有し、各環にてS、OおよびNより選択される4個までのヘテロ原子を有してなる、置換されていてもよいフェニル、ナフチルまたは C_{5-7} シクロアルクジエニル基、または置換されてもよい単環もしくは縮合環式複素環基であり；

R は、直鎖または分岐鎖状 C_{1-8} アルキル、 C_{3-7} シクロアルキル、 C_{4-7} シクロアルキルアルキル、置換されていてもよいフェニルまたはフェニル C_{1-6} アルキル、OおよびNから選択される4個までのヘテロ原子を有してなる置換されていてもよい5員ヘテロ芳香族環、ヒドロキシ C_{1-6} アルキル、アミノ C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルキルアミノアルキル、ジ C_{1-6} アルキルアミノアルキル、 C_{1-6} アシルアミノアルキル、 C_{1-6} アルコキシアルキル、 C_{1-6} アルキルカルボニル、カルボキシ、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、 C_{1-6} アルコキシカルボニル、 C_{1-6} アルキル、アミノカルボニル、 C_{1-6} アルキルアミノカルボニル、ジ C_{1-6} アルキルアミノカルボニル、ハロゲノ C_{1-6} アルキルであるか；または p が2または3の場合に、 Ar と環化する、 $-(\text{CH}_2)_p-$ 基であり；

R_1 および R_2 は、同一または異なっていてもよく、独立して、水素あるいは C_{1-6} の直鎖または分岐鎖状アルキルであるか、または両方が一緒になって n が3、4または5である $-(\text{CH}_2)_n-$ 基を形成するか；あるいは R_1 が R と一緒に

なってqが2、3、4または5である $-(CH_2)_q-$ 基を形成し；

R_3 および R_4 は、同一または異なっていてもよく、独立して、水素あるいは C_{1-6} の直鎖または分岐鎖状アルキル、 C_{1-6} アルケニル、アリール、 C_{1-6} アルコキシ、ヒドロキシ、ハロゲン、ニトロ、シアノ、カルボキシ、カルボキシアミド、スルホンアミド、 C_{1-6} アルコキカルボニル、トリフルオロメチル、アシルオキシ、フタルイミド、アミノ、モノーおよびジー C_{1-6} アルキルアミノ、 $-O-(CH_2)_r-NT_2$ （ここに、rは2、3または4であり、Tは水素または C_{1-6} アルキルである）であるか、または隣接する窒素と一緒にになって、式：



（式中、Vおよび V_1 は、独立して、水素または酸素であり、uは0、1または2である）で示される基を形成し； $-O(CH_2)_s-OW$ （sは2、3または4であり、Wは水素または C_{1-6} アルキルである）；ヒドロキシアルキル、アミノアルキル、モノーまたはジーアルキルアミノアルキル、アシルアミノ、アルキルスルホニルアミノ、アミノアシルアミノ、モノーまたはジーアルキルアシルアミノ；4個のまでの R_3 置換基がキノリン核中に存在するか；または R_4 は R_5 とアリールのように環化する $-(CH_2)_t-$ 基（tは1、2または3である）であり；

R_5 は直鎖または分岐鎖状 C_{1-6} アルキル、 C_{3-7} シクロアルキル、 C_{4-7} シクロアルキルアルキル、置換されていてもよいアリール、あるいは芳香族特性を有し、5ないし12個の環原子を含有し、各環にてS、OおよびNより選択される4個までのヘテロ原子を有してなる、置換されていてもよい单環もしくは縮合環式複素環基であり；

XはO、Sまたは $N-C\equiv N$ を意味する]

で示される化合物またはその医薬上許容される溶媒和物もしくはその医薬上許容される塩を投与することからなる方法。

2. 症状が、中枢神経系の障害、神経変性障害、脱髓疾患、神経病理学的障害、

AIDS関連ニューロパシー、化学療法誘発のニューロパシーおよび神経痛；気道疾患；炎症性疾患；アレルギー；過敏症；眼の疾患；皮膚疾患、蕁麻疹および他の湿疹様皮膚炎；嗜癖障害；ストレス関連の体性疾患；交感神経反射性ジストロフィー；気分変調障害；免疫亢進または抑制に関する免疫学的副反応障害；潰瘍性大腸炎、クローン病に付随する胃腸（G I）障害およびG I管疾患；膀胱機能障害；纖維症および膠原病；血管拡張により生じる血流障害および血管痙攣性疾患；前記の症状に起因するかまたは付随する疼痛または痛覚からなる群より選択される請求項1記載の方法。

3. 症状が、中枢神経系の障害、神経病理学的障害；気道疾患；炎症性疾患；アレルギー；眼の疾患；皮膚疾患；胃腸（G I）障害およびG I管疾患；膀胱機能障害；前記の症状に起因するかまたは付随する疼痛または痛覚からなる群より選択される請求項1または請求項2記載の方法。

4. 炎症性疾患が炎症性腸疾患である請求項1ないし3のいずれか1つに記載の方法。

5. 眼の疾患が結膜炎である請求項1記載の方法。

6. G I管の障害および疾患が潰瘍性大腸炎のような内臓の神経制御に付随する障害である請求項1記載の方法。

7. 予防および治療するための症状が、気管支肺炎および気管支痙攣を含む気道疾患；炎症性腸疾患を含む炎症性疾患；湿疹および鼻炎を含むアレルギー；結膜炎を含む眼の疾患；接触性皮膚炎および蕁麻疹を含む皮膚疾患；胃腸（G I）障害およびG I管疾患；膀胱機能障害；片頭痛における痛みの伝達を含む疼痛または痛覚である請求項1記載の方法。

8. 式（I）で示される化合物が ((S) - (-) - N - (α -エチルベンジル) - 3-ヒドロキシ-2-フェニルキノリン-4-カルボキシアミドまたはその医薬上許容される溶媒和物もしくはその医薬上許容される塩である請求項1記載の方法。