

【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2004-514709(P2004-514709A)

【公表日】平成16年5月20日 (2004.5.20)

【年通号数】公開・登録公報2004-019

【出願番号】特願2002-546511(P2002-546511)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/38 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 31/4545 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/16 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 233/64 (2006.01)

C 0 7 D 401/06 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 403/06 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 213/38

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/4545

A 6 1 K 31/496

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 27/16

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 233/64 1 0 5

C 0 7 D 401/06

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 403/06

【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

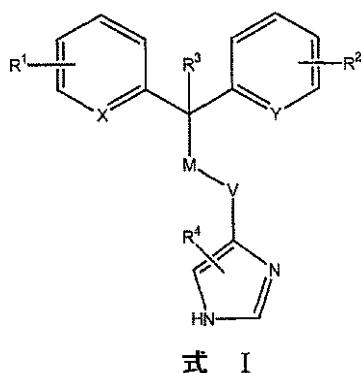
【補正方法】変更

【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、該化合物は、その鏡像異性体、立体異性体、および互変異性体を含み、該化合物が、式 I :

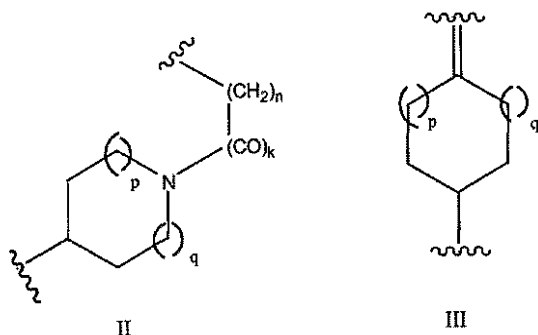
【化 1】



に示される一般構造を有し :

M は、式 I I または I I I に示される一般構造を有する部分であり :

【化 2】



ここで、k は 0 または 1 であり、n は 0 ~ 5 であり、p = q = 0、1 または 2 であり、但し、M が式 I I I である場合、R<sup>3</sup> は存在せず ;

V は、C<sub>1</sub> ~ C<sub>8</sub> アルキル ; - (CH<sub>2</sub>)<sub>x</sub> - A - (CH<sub>2</sub>)<sub>y</sub> - ; および - (CH<sub>2</sub>)<sub>c</sub> - A - (CH<sub>2</sub>)<sub>m</sub> - C(O) - N(R<sup>7</sup>) - (CH<sub>2</sub>)<sub>d</sub> - からなる群から選択される部分であり ; ここで、A は、- O -、- S(O)<sub>r</sub> -、および - NR<sup>7</sup> - であり ;

m は 0、1、2 または 3 であり ;

x は、2 ~ 8 の範囲の整数であり ;

y は、1 ~ 5 の範囲の整数であり ;

c は、2 ~ 4 の範囲の整数であり ; そして

r は、0、1 または 2 であり ;

d は、0 ~ 5 の範囲の数であり ;

X および Y は、独立して、N、CH および N(O) からなる群から選択され ;

Z は、N、CH および N(O) からなる群から選択され ;

R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> は、各々 1 ~ 4 個であり得、そして独立して、水素、低級アルキル、低級アルコキシ、ハロゲン、ポリハロ低級アルキル、ポリハロアルコキシ - OH、CN、NO<sub>2</sub> または COOR<sup>8</sup> からなる群より選択され ;

R<sup>3</sup> は、水素、低級アルキル、低級アルコキシ、ヒドロキシルより選択され、但し、n

および  $k$  がともに 0 の場合、 $R^3$  は -OH でもアルコキシでもなく；

$R^4$  は、水素、低級アルキル、ポリハロ低級アルキルまたは -OH からなる群より選択され；そして

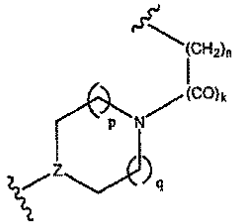
$R^7$  および  $R^8$  は、独立して、水素、低級アルキル、置換フェニルまたは非置換フェニル；および置換ベンジルまたは非置換ベンジルから選択される、化合物。

【請求項 2】  $R^4$  が H である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】  $R^1$  および  $R^2$  が、独立して H、ハロゲンまたはポリハロ低級アルキルから選択される、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】 M が、以下：

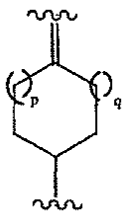
【化 3】



であり、かつ  $p$  および  $q$  は、独立して 0 または 1 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】 M が以下：

【化 4】



であり、かつ  $p = q = 1$  である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】  $R^4$  が、H であり； $R^1 = R^2 = H$ 、ハロゲン、ヒドロキシまたはアルコキシであり；そして  $R^3$  が、H または低級アルキルである、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 7】 V が、 $C_1 \sim C_8$  アルキルである、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】  $R^4$  が、H であり； $R^1 = R^2 = H$ 、ハロゲン、ヒドロキシまたはアルコキシである、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 9】 V が、 $C_1 \sim C_8$  アルキルである、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】 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 11】 炎症、アレルギー、アレルギー性鼻炎、鼻のうっ血、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誘導性気道応答、鼻のうっ血および肥満を処置する際に使用するための、薬学的組成物であって、該組成物が、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 12】 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 13】 炎症、アレルギー、鼻のうっ血、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誘導性気道応答および肥満を処置するための組成物であって、該組成物は、請求項 1 に記載の化合物を含有する、組成物。

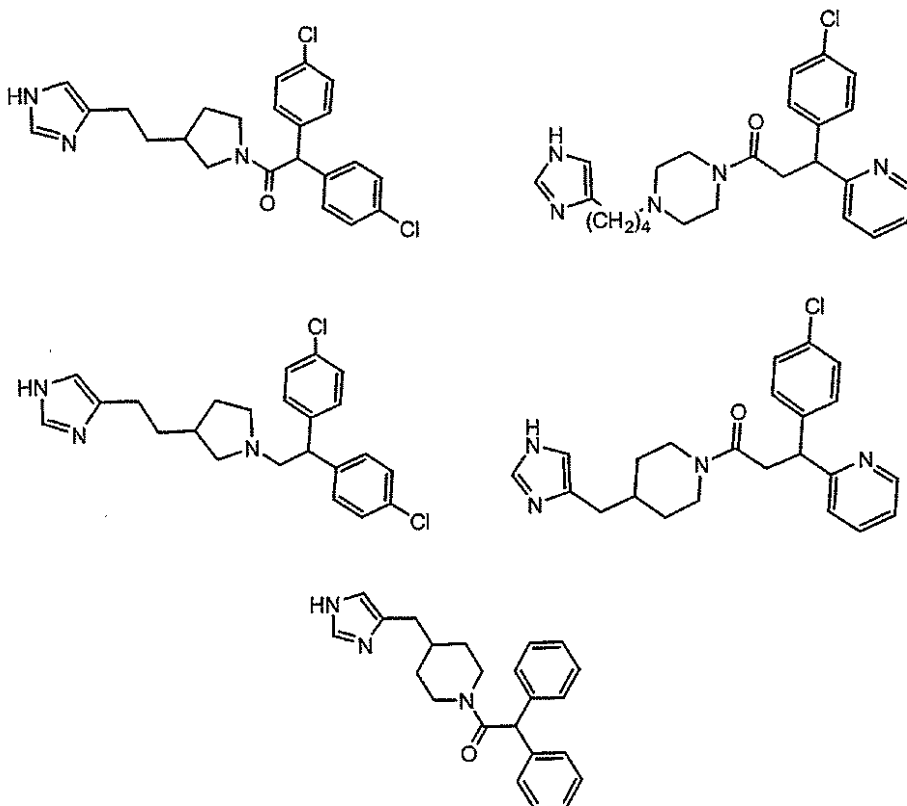
【請求項 14】 炎症、アレルギー、鼻のうっ血、胃腸管の疾患、心臓血管疾患、または中枢神経系の障害、ならびにアレルギー誘導性気道応答および肥満の処置のための医薬の製造のための、請求項 1 に記載の化合物の使用。

【請求項 15】 炎症、アレルギー、鼻のうっ血、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誘導性気道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を、密接に接触させる工程を包含する、方法。

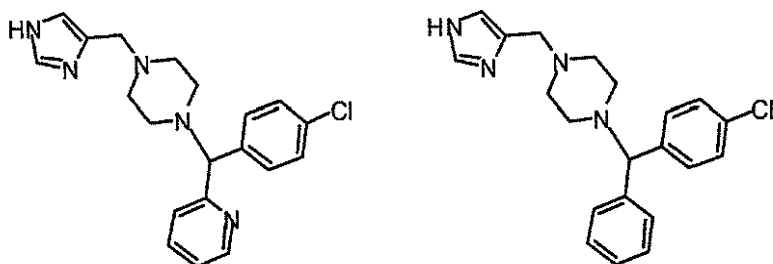
【請求項 16】  $H_3$  アンタゴニスト活性を示す化合物であって、該化合物の鏡像異性体、立体異性体および互変異性体、または該化合物の薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物を含み、該化合物は、以下に列挙される構造を有する化合物から選択される、化合物：

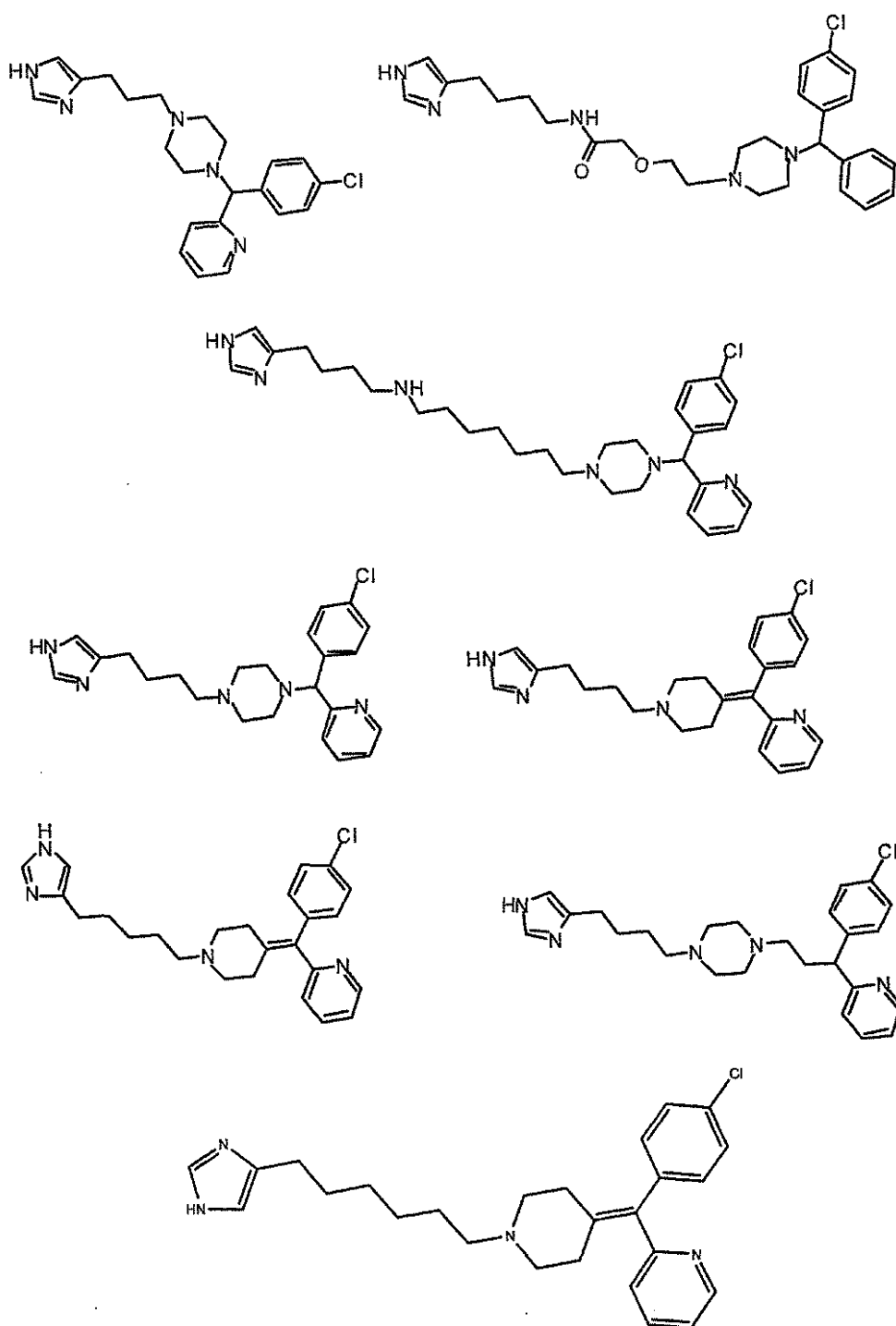
【化 5】

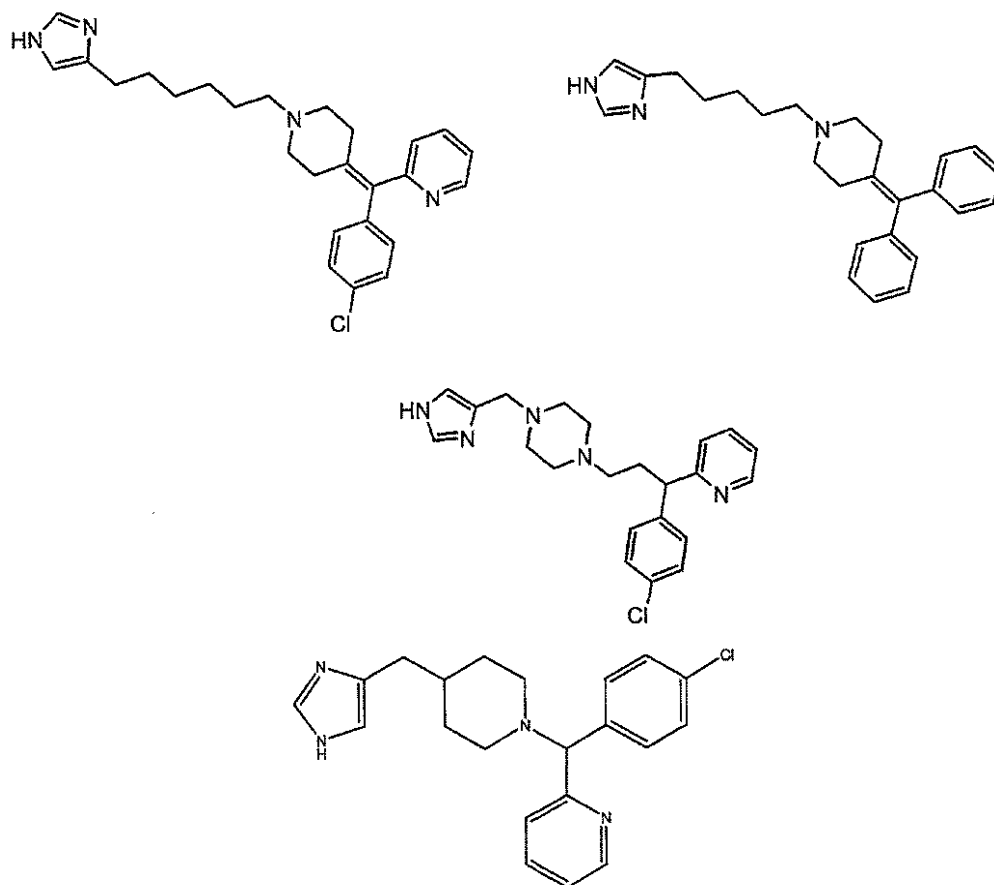


【請求項 17】  $H_1$  アンタゴニスト活性および  $H_3$  アンタゴニスト活性の両方を示す化合物であって、該化合物の鏡像異性体、立体異性体および互変異性体、または該化合物の薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物を含み、該化合物は、以下に列挙される構造を有する化合物から選択される、化合物：

【化 6】







。 【請求項 18】 炎症、アレルギー、鼻のうっ血、胃腸管の疾患、心臓血管障害または中枢神経系の障害、ならびにアレルギー誘導性気道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 16 または請求項 17 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。