

【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9月3日 (2009.9.3)

【公表番号】特表2006-515004(P2006-515004A)

【公表日】平成18年5月18日 (2006.5.18)

【年通号数】公開・登録公報2006-019

【出願番号】特願2005-518422(P2005-518422)

【国際特許分類】

C 07 D 401/14 (2006.01)

C 07 D 403/14 (2006.01)

A 61 K 31/496 (2006.01)

A 61 K 31/404 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 3/04 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 9/12 (2006.01)

A 61 P 9/04 (2006.01)

A 61 P 11/00 (2006.01)

A 61 P 13/12 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 31/18 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 37/00 (2006.01)

A 61 P 37/02 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 P 1/18 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 17/02 (2006.01)

A 61 P 17/06 (2006.01)

A 61 P 21/04 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 27/02 (2006.01)

A 61 P 37/08 (2006.01)

【 F I 】

C 07 D 401/14 C S P

C 07 D 403/14

A 61 K 31/496

A 61 K 31/404

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 3/04

A 61 P 9/00

A 61 P 9/10 1 0 1

A 61 P 9/12

A 61 P 9/04

A 61 P 11/00

A 61 P 13/12

A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 31/18
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 37/00
 A 6 1 P 37/02
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 1/18
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 17/02
 A 6 1 P 17/06
 A 6 1 P 21/04
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 37/08

【誤訳訂正書】

【提出日】平成21年7月17日(2009.7.17)

【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

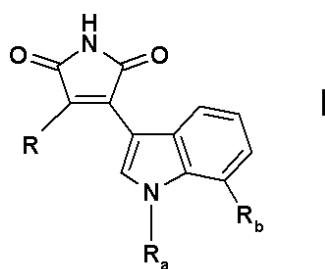
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I

【化 1】



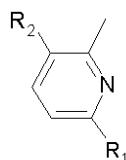
[式中、

R_a は、H ; C_{1-4} アルキル ; または OH、 NH_2 、 NHC_{1-4} アルキルまたは $N(C_{1-4}$ アルキル) $_2$ により置換された C_{1-4} アルキルであり ;

R_b は、H ; ハロゲン ; C_{1-6} アルキル ; または C_{1-6} アルコキシであり、そして、

R は、式 (a)

【化 2】

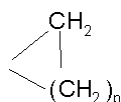


(a)

[式中、

R_1 は、非置換か、または環窒素もしくは環炭素上で置換基により置換されたピペラジン - 1 - イル（ここで、環窒素上の該置換基は、 C_{1-6} アルキルであり；そして環炭素上の該置換基は、 C_{1-4} アルキル、または

【化 3】



{ 式中、 p は、1、2 または 3 である。 }

である。) であり；そして、

R_2 は、H；ハロゲン； C_{1-4} アルキル； C_{1-4} アルコキシ； CF_3 ；ニトリル；ニトロまたはアミノである]

で示される基である]

で示される化合物、またはその塩。

【請求項 2】

R_a が、H、メチル、エチルまたはイソプロピルである、請求項 1 記載の化合物、またはその塩。

【請求項 3】

R_b が、H、Cl、メチルまたはエチルである、請求項 1 または 2 記載の化合物、またはその塩。

【請求項 4】

R_2 が、H；Cl、F； CF_3 ；ニトリル；ニトロまたはアミノである、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項記載の化合物、またはその塩。

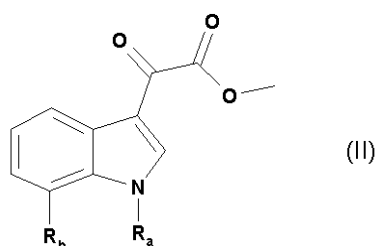
【請求項 5】

3 - (1H - インドール - 3 - イル) - 4 - [6 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - イル) - 3 - トリフルオロメチル - ピリジン - 2 - イル] - ピロール - 2, 5 - ジオン、またはその薬学的に許容される塩である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 6】

式 I I

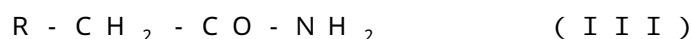
【化 4】



[式中、 R_a および R_b は、請求項 1 に定義のとおりである]

で示される化合物と、

式 I I I



[式中、 R は、請求項 1 に定義のとおりである]

で示される化合物を反応させることを特徴とする、

請求項 1 記載の式 I の化合物、またはその塩を製造する方法。

【請求項 7】

医薬品として用いるための、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項記載の式 I の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 8】

請求項 1 ~ 5 のいずれか一項記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩を、薬学

的に許容される希釈剤またはその担体と一緒に含む、医薬組成物。

【請求項 9】

Tリンパ球および/またはPKC、またはGSK-3 を介する障害または疾患の処置または予防における使用を目的とした医薬組成物の製造における使用のための、請求項1～5のいずれか一項記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 10】

有効量の請求項1～5のいずれか一項記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩を含む、Tリンパ球および/またはPKC、またはGSK-3 を介する障害または疾患の予防または処置のための、医薬組成物。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0013

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0013】

式Iの化合物は、遊離型または塩形態、例えば、有機酸または無機酸、例えば塩酸、酢酸またはトリフルオロ酢酸との付加塩で存在し得る。

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0039

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0039】

4. プロテインキナーゼC 1 検定

ヒト組換えPKC 1を、Oxford Biomedical Researchから入手し、上記セクションA.1に記載のような検定条件下で用いる。本検定にて、式Iの化合物は、 $IC_{50} \leq 1 \mu M$ でPKC 1を阻害する。例えば、実施例1の化合物は、 $5.9 nM$ の IC_{50} でPKC 1を阻害し、実施例39の化合物は、 $13.2 nM$ の IC_{50} でPKC 1を阻害し、そして実施例41の化合物は、 $14.9 nM$ の IC_{50} でPKC 1を阻害する。

【誤訳訂正 4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0041

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0041】

6. プロテインキナーゼC 検定

ヒト組換えPKC を、Oxford Biomedical Researchから入手し、上記セクションA.1に記載のような検定条件下で用いる。本検定にて、式Iの化合物は、 $IC_{50} \leq 1 \mu M$ でPKC を阻害する。例えば、実施例1の化合物は、 $14.7 nM$ の IC_{50} でPKC を阻害し、そして実施例41の化合物は、 $7.6 nM$ の IC_{50} でPKC を阻害する。

【誤訳訂正 5】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0052

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0052】

式Iの化合物を、慣用の経路、特に経腸的、例えば、錠剤またはカプセルの形状で経口的に、または例えば注射可能溶液もしくは懸濁液の形態で非経腸的に、例えばローション、ゲル、軟膏またはクリーム^{の形態}または経鼻形態もしくは座剤で局所的に投与すること

ができる。少なくとも 1 個の薬学的に許容される担体または希釈剤とともに遊離型または薬学的に許容される塩形態の式 I の化合物を包含する医薬組成物を、薬学的に許容される担体または希釈剤と混合することによる慣用の方法で製造することができる。経口投与のための単位投与形態には、例えば、約 0 . 1 m g から約 5 0 0 m g の活性物質が含まれる。