

【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 19 年 6 月 14 日 (2007.6.14)

【公表番号】特表 2002-542188 (P2002-542188A)

【公表日】平成 14 年 12 月 10 日 (2002.12.10)

【出願番号】特願 2000-611904 (P2000-611904)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/138 (2006.01)

A 6 1 K 31/4406 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/14 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 33/06 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 213/38 (2006.01)

C 0 7 D 213/65 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/138

A 6 1 K 31/4406

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 1/14

A 6 1 P 3/00

A 6 1 P 17/02

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 31/00

A 6 1 P 31/18

A 6 1 P 33/06

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 213/38

C 0 7 D 213/65

【手続補正書】

【提出日】平成 19 年 4 月 19 日 (2007.4.19)

【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

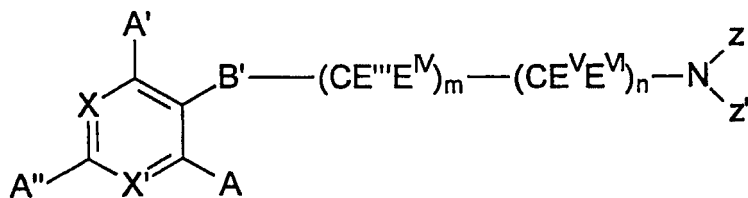
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

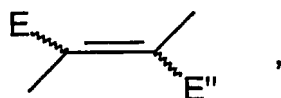
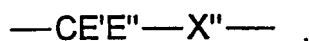
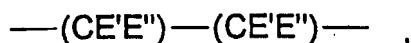
【請求項 1】 サイトカインの産生および / または分泌を阻害するための医薬の調製のための、式、

【化 1】



を有する化合物の使用。(式中、XおよびX'は、個々別々に、シグマm値が0より大きい、0より小さいまたは0であることを特徴とする置換基種に結合する炭素または窒素であり、A、A'およびA''は、個々別々に、シグマm値が0より大きい、0より小さいまたは0であることを特徴とする置換基種であり、B'は、酸素、窒素含有部分、硫黄、

【化 2】



および

【化 3】



から成る一群から選択され、

式中、X'は酸素、窒素含有部分または硫黄であり、mは整数であり、nは整数であり、mとnの和は1、2、3、4、5、6、7または8であり、E^I、E^{II}、E^{III}、E^{IV}、E^VおよびE^{VI}は、個々別々に、水素、低級アルキルまたはハロ置換低級アルキルであり、Z'およびZ''は、個々別々に、水素または低級アルキルであり、構造部分の波線は、化合物がシス(Z)型またはトランス(E)型であってもよいことを示す。)

【請求項 2】 上記X'が、窒素であることを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【請求項 3】 上記mとnの和が、2または3であることを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【請求項 4】 上記Aが、水素であることを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

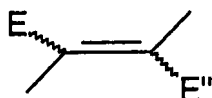
【請求項 5】 上記A、A'およびA''が、全て水素であることを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【請求項 6】 上記E^I、E^{II}、E^{III}、E^{IV}、E^VおよびE^{VI}が水素であり、上記E^{VI}が水素ではないことを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【請求項 7】 上記E^IおよびE^{II}が、水素であることを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【請求項 8】 上記B'が、

【化 4】



であることを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【請求項 9】 上記 B' が、酸素であることを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【請求項 10】 上記化合物が、トランス (E) 型を有する請求項 1 に記載の使用。

【請求項 11】 上記 Z' および Z'' の少なくとも一方が、水素である請求項 1 に記載の使用。

【請求項 12】 上記 Z' が水素であり、Z'' がメチルであることを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【請求項 13】 上記有効量が、約 mg / 24 時間 / 患者を越えず、血漿中の上記化合物の濃度が 500 pg / ml を超えないことを特徴とする請求項 1 に記載の使用。

【請求項 14】 自己免疫疾患を治療するための請求項 1 に記載の使用。

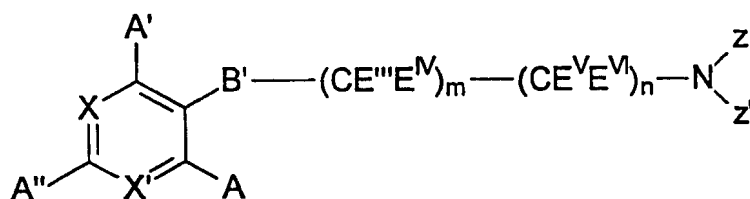
【請求項 15】 前記化合物が、(3E) および (3Z) - N - メチル - 4 - (3 - ピリジル) - 2 - メチル - 3 - ブテン - 1 - アミン、(3E) および (3Z) - N - メチル - 4 - (3 - ピリジル) - 3 - メチル - 3 - ブテン - 1 - アミン、(5E) および (5Z) - N - メチル - 6 - (3 - ピリジル) - 5 - ヘキセン - 3 - アミン、(4E) および (4Z) - N - メチル - 5 - (3 - ピリジル) - 2 - メチル - 4 - ペンテン - 2 - アミン、(4E) および (4Z) - N - メチル - 5 - (3 - ピリジル) - 3 - メチル - 4 - ペンテン - 2 - アミン、(4E) および (4Z) - N - メチル - 5 - (3 - ピリジル) - 4 - ペンテン - 2 - アミン、(4E) および (4Z) - N - メチル - 5 - (3 - ピリジル) - 1, 1, 1 - トリフルオロ - 4 - ペンテン - 2 - アミン、(4E) および (4Z) - N - メチル - 5 - (3 - ピリジル) - 4 - メチル - 4 - ペンテン - 1 - アミン、(4E) および (4Z) - N - メチル - 5 - (3 - ピリジル) - 4 - メチル - 4 - ペンテン - 2 - アミン、(1E) および (1Z) - N - メチル - 1 - (3 - ピリジル) - 1 - オクテン - 4 - アミン、(1E) および (1Z) - N - メチル - 1 - (3 - ピリジル) - 5 - メチル - 1 - ヘプテン - 4 - アミン、(5E) および (5Z) - N - メチル - 6 - (3 - ピリジル) - 5 - メチル - 5 - ヘキセン - 2 - アミン、(5E) および (5Z) - N - メチル - 6 - (3 - ピリジル) - 5 - メチル - 5 - ヘキセン - 3 - アミン、(3E) および (3Z) - 4 - (3 - ピリジル) - 2 - メチル - 3 - ブテン - 1 - アミン、(3E) および (3Z) - 4 - (3 - ピリジル) - 3 - メチル - 3 - ブテン - 1 - アミン、(5E) および (5Z) - 6 - (3 - ピリジル) - 5 - ヘキセン - 3 - アミン、(4E) および (4Z) - 5 - (3 - ピリジル) - 2 - メチル - 4 - ペンテン - 2 - アミン、(4E) および (4Z) - 5 - (3 - ピリジル) - 3 - メチル - 4 - ペンテン - 2 - アミン、(4E) および (4Z) - 5 - (3 - ピリジル) - 4 - ペンテン - 2 - アミン、(4E) および (4Z) - 5 - (3 - ピリジル) - 1, 1, 1 - トリフルオロ - 4 - ペンテン - 2 - アミン、(4E) および (4Z) - 5 - (3 - ピリジル) - 4 - メチル - 4 - ペンテン - 1 - アミン、(4E) および (4Z) - 5 - (3 - ピリジル) - 4 - メチル - 4 - ペンテン - 2 - アミン、(1E) および (1Z) - 1 - (3 - ピリジル) - 1 - オクテン - 4 - アミン、(5E) および (5Z) - 6 - (3 - ピリジル) - 5 - メチル - 5 - ヘキセン - 2 - アミン、(5E) および (5Z) - 6 - (3 - ピリジル) - 5 - ヘキセン - 2 - アミン、(5E) および (5Z) - 6 - (3 - ピリジル) - 5 - メチル - 5 - ヘキセン - 3 - アミン、(3 - (3 - ピリジロキシ) プロピル) メチルアミン、(3 - (3 - ピリジロキシ) プロピル) アミン、(3 - (5 - プロモ - (3 - ピリジロキシ) プロピル) メチルアミン、(1 - メチル - 3 - (3 - ピリジロキシ) プロピル) メチルアミン、(3 - (5 - エトキシ - (3 - ピリジロキシ) プロピル) メチルアミン、(3 - (6 - メチル - (3 - ピリジロキシ) プロピル) メチルアミン、(3 - (5 - クロロ - (3 - ピリジロキシ) プロピル) メチルアミン、(3 - (2 - プロモ (3 - ピリジロキシ) プロピル) メチルアミン、(1 - メチル - 3 - (5 - メトキシ - (3 - ピリジロキシ) プロピル) メチルアミン、(4 - (3 - (ピリジロキシ) ブチル) メチルアミン、(3 - フェノキシプロピル) メチルアミンおよび (3 - (3 - アミノフェノキシ) プロピル) メチルアミン、および (3 - (4 - メトキシフェノキシ) プロピル) メチルアミンから成る一群から選択される

化合物であることを特徴とする請求項 1 に記載の 使用。

【請求項 16】

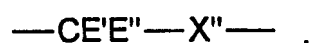
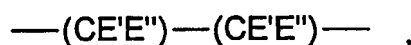
式、

【化 5】



を有する化合物を含む、サイトカインの産生および / または分泌を阻害するための製薬学的組成物。(式中、B'は、

【化 6】



および

【化 7】



から成る一群から選択され、

式中、X'は酸素、窒素含有部分または硫黄であり、mは整数であり、nは整数であり、mとnの和は1、2、3、4、5、6、7または8であり、E^I、E^{II}、E^{III}、E^{IV}、E^VおよびE^{VI}は、個々別々に、水素、低級アルキルまたはハロ置換低級アルキルであり、E^I、E^{II}、E^{III}、E^{IV}、E^VおよびE^{VI}の少なくとも1つは水素ではなく、Z'およびZ''は、個々別々に、水素または低級アルキルであり、構造部分の波線は、化合物がシス(Z)型またはトランス(E)型であってもよいことを示す。)

【請求項 17】 上記X'が、窒素であることを特徴とする請求項 16 に記載の製薬学的組成物。

【請求項 18】 上記mとnの和が、2または3であることを特徴とする請求項 16 に記載の製薬学的組成物。

【請求項 19】 上記Aが、水素であることを特徴とする請求項 16 に記載の製薬学的組成物。

【請求項 20】 上記A、A'およびA''が、全て水素であることを特徴とする請求項 16 に記載の製薬学的組成物。

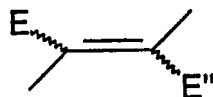
【請求項 21】 上記E^I、E^{II}、E^{III}、E^{IV}、E^VおよびE^{VI}が水素であり、E^{VI}が水素ではないことを特徴とする請求項 16 に記載の製薬学的組成物。

【請求項 22】 上記E^IおよびE^{II}が、水素であることを特徴とする請求項 16 に記載の製薬学的組成物。

【請求項 23】

上記B'が、

【化 8】



であり、上記化合物が、トランス（E）型を有することを特徴とする請求項16に記載の製薬学的組成物。

【請求項24】 上記B'が、酸素であることを特徴とする請求項16に記載の製薬学的組成物。

【請求項25】 上記Z'および上記Z''の少なくとも1つが、水素であることを特徴とする請求項16に記載の製薬学的組成物。

【請求項26】 上記Z'が水素であり、上記Z''がメチルであることを特徴とする請求項16に記載の製薬学的組成物。

【請求項27】 自己免疫疾患を治療するために使用されることを特徴とする請求項16に記載の製薬学的組成物。

【請求項28】 上記化合物が、（3E）および（3Z）-N-メチル-4-（3-ピリジル）-2-メチル-3-ブテン-1-アミン、（3E）および（3Z）-N-メチル-4-（3-ピリジル）-3-メチル-3-ブテン-1-アミン、（5E）および（5Z）-N-メチル-6-（3-ピリジル）-5-ヘキセン-3-アミン、（4E）および（4Z）-N-メチル-5-（3-ピリジル）-2-メチル-4-ペンテン-2-アミン、（4E）および（4Z）-N-メチル-5-（3-ピリジル）-3-メチル-4-ペンテン-2-アミン、（4E）および（4Z）-N-メチル-5-（3-ピリジル）-4-ペンテン-2-アミン、（4E）および（4Z）-N-メチル-5-（3-ピリジル）-1,1,1-トリフルオロ-4-ペンテン-2-アミン、（4E）および（4Z）-N-メチル-5-（3-ピリジル）-4-メチル-4-ペンテン-1-アミン、（4E）および（4Z）-N-メチル-5-（3-ピリジル）-4-メチル-4-ペンテン-2-アミン、（1E）および（1Z）-N-メチル-1-（3-ピリジル）-1-オクテン-4-アミン、（1E）および（1Z）-N-メチル-1-（3-ピリジル）-5-メチル-1-ヘプテン-4-アミン、（5E）および（5Z）-N-メチル-6-（3-ピリジル）-5-メチル-5-ヘキセン-2-アミン、（5E）および（5Z）-N-メチル-6-（3-ピリジル）-5-ヘキセン-2-アミン、（5E）および（5Z）-N-メチル-6-（3-ピリジル）-5-メチル-5-ヘキセン-3-アミン、（3E）および（3Z）-4-（3-ピリジル）-2-メチル-3-ブテン-1-アミン、（3E）および（3Z）-4-（3-ピリジル）-3-メチル-3-ブテン-1-アミン、（5E）および（5Z）-6-（3-ピリジル）-5-ヘキセン-3-アミン、（4E）および（4Z）-5-（3-ピリジル）-2-メチル-4-ペンテン-2-アミン、（4E）および（4Z）-5-（3-ピリジル）-3-メチル-4-ペンテン-2-アミン、（4E）および（4Z）-5-（3-ピリジル）-4-ペンテン-2-アミン、（4E）および（4Z）-5-（3-ピリジル）-1,1,1-トリフルオロ-4-ペンテン-2-アミン、（4E）および（4Z）-5-（3-ピリジル）-4-メチル-4-ペンテン-1-アミン、（4E）および（4Z）-5-（3-ピリジル）-4-メチル-4-ペンテン-2-アミン、（1E）および（1Z）-1-（3-ピリジル）-1-オクテン-4-アミン、（5E）および（5Z）-6-（3-ピリジル）-5-メチル-5-ヘキセン-2-アミン、（5E）および（5Z）-6-（3-ピリジル）-5-ヘキセン-2-アミン、（5E）および（5Z）-6-（3-ピリジル）-5-メチル-5-ヘキセン-3-アミン、（3-（3-ピリジロキシ）プロピル）メチルアミン、（3-（3-ピリジロキシ）プロピル）メチルアミン、（1-メチル-3-（3-ピリジロキシ）プロピル）メチルアミン、（3-（5-エトキシ-（3-ピリジロキシ）プロピル）メチルアミン、（3-（6-メチル-（3-ピリジロキシ）プロピル）メチルアミン、（3-（5-クロロ-（3-ピリジロキシ）プロピル）メチルアミン、（3-（2-ブロモ（3-ピリジロキシ）プロピル）メチルア

ミン、(1 - メチル - 3 - (5 - メトキシ - (3 - ピリジルオキシ) プロピル) メチルアミン、(4 - (3 - (ピリジルオキシ) ブチル) メチルアミン、(3 - フェノキシプロピル) メチルアミンおよび(3 - (3 - アミノフェノキシ) プロピル) メチルアミン、(3 - (4 - メトキシフェノキシ) プロピル) メチルアミンからなる一群から選択されることを特徴とする請求項 1 6 に記載の製薬学的組成物。