

【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23年3月31日(2011.3.31)

【公表番号】特表2010-519206(P2010-519206A)

【公表日】平成22年6月3日(2010.6.3)

【年通号数】公開・登録公報2010-022

【出願番号】特願2009-549637(P2009-549637)

【国際特許分類】

C 07 C 233/64 (2006.01)  
A 61 K 31/196 (2006.01)  
A 61 K 31/216 (2006.01)  
A 61 K 31/5375 (2006.01)  
A 61 K 31/167 (2006.01)  
A 61 P 37/06 (2006.01)  
A 61 P 43/00 (2006.01)  
A 61 P 25/00 (2006.01)  
A 61 P 21/04 (2006.01)  
A 61 P 7/06 (2006.01)  
A 61 P 7/04 (2006.01)  
A 61 P 29/00 (2006.01)  
A 61 P 17/00 (2006.01)  
A 61 P 17/06 (2006.01)  
A 61 P 1/04 (2006.01)  
A 61 P 1/16 (2006.01)  
A 61 P 3/10 (2006.01)  
A 61 P 37/02 (2006.01)  
A 61 P 5/14 (2006.01)  
A 61 P 19/02 (2006.01)  
A 61 P 21/00 (2006.01)  
A 61 P 19/08 (2006.01)  
A 61 P 11/06 (2006.01)  
A 61 P 11/00 (2006.01)  
A 61 P 27/02 (2006.01)  
A 61 P 31/06 (2006.01)  
A 61 P 31/08 (2006.01)  
A 61 P 13/00 (2006.01)  
A 61 P 13/12 (2006.01)  
A 61 P 17/04 (2006.01)  
A 61 P 25/28 (2006.01)  
A 61 P 31/04 (2006.01)  
A 61 P 25/16 (2006.01)  
A 61 P 25/14 (2006.01)  
A 61 P 31/12 (2006.01)  
A 61 P 9/04 (2006.01)  
A 61 P 9/10 (2006.01)  
A 61 P 3/06 (2006.01)  
A 61 P 35/00 (2006.01)  
A 61 P 1/02 (2006.01)  
A 61 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 27/16 (2006.01)  
C 0 7 C 233/81 (2006.01)  
C 0 7 C 233/75 (2006.01)  
C 0 7 C 233/80 (2006.01)

## 【 F I 】

C 0 7 C 233/64  
A 6 1 K 31/196  
A 6 1 K 31/216  
A 6 1 K 31/5375  
A 6 1 K 31/167  
A 6 1 P 37/06  
A 6 1 P 43/00 1 0 5  
A 6 1 P 43/00 1 1 1  
A 6 1 P 25/00  
A 6 1 P 21/04  
A 6 1 P 7/06  
A 6 1 P 7/04  
A 6 1 P 29/00  
A 6 1 P 17/00  
A 6 1 P 17/06  
A 6 1 P 1/04  
A 6 1 P 1/16  
A 6 1 P 3/10  
A 6 1 P 37/02  
A 6 1 P 5/14  
A 6 1 P 29/00 1 0 1  
A 6 1 P 19/02  
A 6 1 P 21/00  
A 6 1 P 19/08  
A 6 1 P 11/06  
A 6 1 P 11/00  
A 6 1 P 27/02  
A 6 1 P 31/06  
A 6 1 P 31/08  
A 6 1 P 13/00  
A 6 1 P 13/12  
A 6 1 P 17/04  
A 6 1 P 25/28  
A 6 1 P 31/04  
A 6 1 P 25/16  
A 6 1 P 25/14  
A 6 1 P 31/12  
A 6 1 P 9/04  
A 6 1 P 9/10  
A 6 1 P 3/06  
A 6 1 P 9/10 1 0 1  
A 6 1 P 35/00  
A 6 1 P 1/02  
A 6 1 P 37/08  
A 6 1 P 27/16

C 0 7 C 233/81 C S P  
 C 0 7 C 233/75  
 C 0 7 C 233/80

## 【手続補正書】

【提出日】平成23年2月10日(2011.2.10)

## 【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】全文

【補正方法】変更

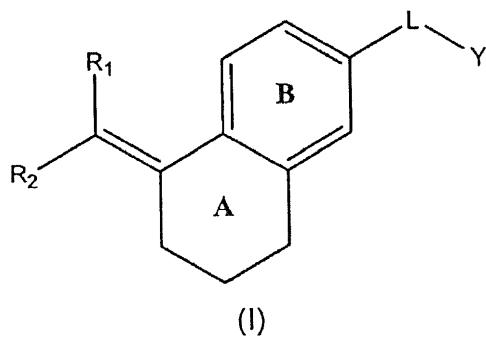
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

構造式(I)の化合物：

## 【化28】



又は、その薬学的に許容される塩であって、式中：

Lは、-NRC(R)2-、-C(R)2NR-、-C(O)-、-NR-C(O)-、-C(O)-NR-、-C(S)-、-C(NR8)-、-NR-C(S)-、-C(S)-NR-、-NR-C(NR8)-、-C(NR8)-NR-、-NRC(O)NR-、-NRC(S)NR-、-NRC(NR8)NR-、-S(O)2NR-、-NRS(O)2-、-NRS(O)2NR-、-NRC(R)2NR-、-CR=CR-、-N=CR-、-CR=N-、-NR-N=CR-、及び-CR=N-NR-からなる群から選択されるリンカーであり；

Yは、置換基を有していてもよいアルキル、置換基を有していてもよいアルケニル、置換基を有していてもよいアルキニル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルケニル、置換基を有していてもよいヘテロシクリル、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいヘテロアリール、置換基を有していてもよいアラルキル、又は置換基を有していてもよいヘテロアラルキルであり；

Rはそれぞれ独立して、H、置換基を有していてもよいアルキル、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいヘテロアリール、置換基を有していてもよいアラルキル、又は置換基を有していてもよいヘテロアラルキルであり；

R1及びR2はそれぞれ独立して、置換基であり；

R8はそれぞれ独立して、-H、ハロ、アルキル、-OR5、-NR6R7、-C(O)R5、-C(O)OR5、又は-C(O)NR6R7であり；

R5はそれぞれ独立して、H、置換基を有していてもよいアルキル、置換基を有していてもよいアルケニル、置換基を有していてもよいアルキニル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルケニル、置換基を有していてもよいヘテロシクリル、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいアラルキル、又は置換基を有していてもよいヘテロアリール、置換基を有していてもよいヘテロアラルキルであり；

ロアラルキルであり；

R<sub>6</sub>及びR<sub>7</sub>はそれぞれ独立して、H、置換基を有していてもよいアルキル、置換基を有していてもよいアルケニル、置換基を有していてもよいアルキニル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルケニル、置換基を有していてもよいヘテロシクリル、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいヘテロアリール、置換基を有していてもよいアラルキル、又は置換基を有していてもよいヘテロアラルキル；又はR<sub>6</sub>及びR<sub>7</sub>は、これらに結合する窒素と共に、置換基を有していてもよいヘテロシクリル又は置換基を有していてもよいヘテロアリールであり；

環Aは1～6個の置換基で任意に置換されていてもよい、但し、環Aは任意に置換された二重結合で置換されておらず、環Aからの炭素原子は二重結合の一部を形成しており；

環Bは、1～3個の置換基で任意に置換されていてもよい。

#### 【請求項2】

Yが置換基を有していてもよいフェニル、置換基を有していてもよいピリジル、置換基を有していてもよいフリル、置換基を有していてもよいチエニル、置換基を有していてもよいピロリル、置換基を有していてもよいオキサゾリル、置換基を有していてもよいイミダゾリル、置換基を有していてもよいインドリジニル、置換基を有していてもよいチアゾリル、置換基を有していてもよいイソオキサゾリル、置換基を有していてもよいピラゾリル、置換基を有していてもよいイソチアゾリル、置換基を有していてもよいピラジニル、置換基を有していてもよいピリミジニル、置換基を有していてもよいピラジニル、置換基を有していてもよいトリアジニル、置換基を有していてもよいトリアゾリル、置換基を有していてもよいチアジアゾリル、置換基を有していてもよいピラジニル、置換基を有していてもよいキノリニル、置換基を有していてもよいイソキノリニル、置換基を有していてもよいインダゾリル、置換基を有していてもよいベンゾオキサゾリル、置換基を有していてもよいベンゾフリル、置換基を有していてもよいベンゾチアゾリル、置換基を有していてもよいインドリジニル、置換基を有していてもよいイミダゾピリジニル、置換基を有していてもよいイソチアゾリル、置換基を有していてもよいテトラゾリル、置換基を有していてもよいベンゾオキサジアゾリル、置換基を有していてもよいインドリル、置換基を有置いてもよいテトラヒドロインドリル、置換基を有置いてもよいアザインドリル、置換基を有置いてもよいイミダゾピリジル、置換基を有置いてもよいキナゾリニル、置換基を有置いてもよいピリニル、置換基を有置いてもよいピロロ[2,3]ピリミジル、置換基を有置いてもよいピリドピリミジル、置換基を有置いてもよいピラゾロ[3,4]ピリミジル、又は置換基を有置いてもよいベンゾ(b)チエニルからなる群から選択される請求項1に記載の化合物。

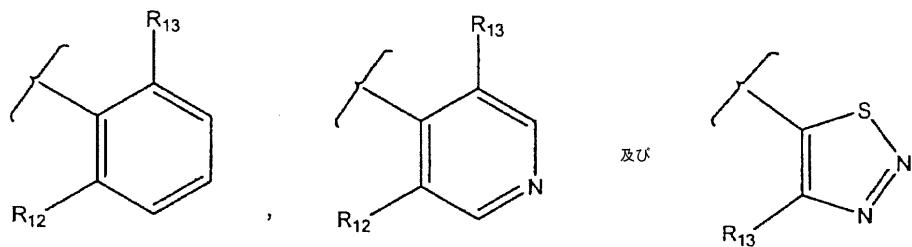
#### 【請求項3】

Yが置換基を有置いてもよいフェニル、置換基を有置いてもよいピリジニル、又は置換基を有置いてもよい[1,2,3]チアジアゾリルである請求項2に記載の化合物。

#### 【請求項4】

Yが：

## 【化29】



からなる群から選択され、

式中：

R<sub>12</sub> がハロ、低級アルキル、低級アルコキシ、ハロアルキル、又は低級ハロアルコキシであり；

R<sub>13</sub> がH、ハロ、低級アルキル、低級アルコキシ、ハロアルキル、又は低級ハロアルコキシである請求項<sub>3</sub>に記載の化合物。

## 【請求項5】

Yが置換基を有していてもよいアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、又は置換基を有していてもよいヘテロシクロアルキルである請求項1に記載の化合物。

## 【請求項6】

R<sub>1</sub> 及び R<sub>2</sub> がそれぞれ独立して、置換基を有していてもよいアルキル、置換基を有していてもよいアルケニル、置換基を有していてもよいアルキニル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルケニル、置換基を有していてもよいヘテロシクリル、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいヘテロアリール、置換基を有していてもよいアラルキル、置換基を有していてもよいヘテロアラルキル、シアノ、ハロアルキル、-C(O)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-C(O)R<sub>5</sub>、-C(O)OR<sub>5</sub>、-C(O)SR<sub>5</sub>、-C(S)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-C(S)R<sub>5</sub>、-C(S)OR<sub>5</sub>、-C(S)SR<sub>5</sub>、-C(NR<sub>8</sub>)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-C(NR<sub>8</sub>)R<sub>5</sub>、-C(NR<sub>8</sub>)OR<sub>5</sub>、-C(NR<sub>8</sub>)SR<sub>5</sub>、-S(O)pR<sub>5</sub>、又は-S(O)pNR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>からなる群から選択され、pが1又は2である請求項1～<sub>5</sub>のいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項7】

R<sub>1</sub> が置換基を有していてもよいアルキル又は置換基を有していてもよいフェニルであり；

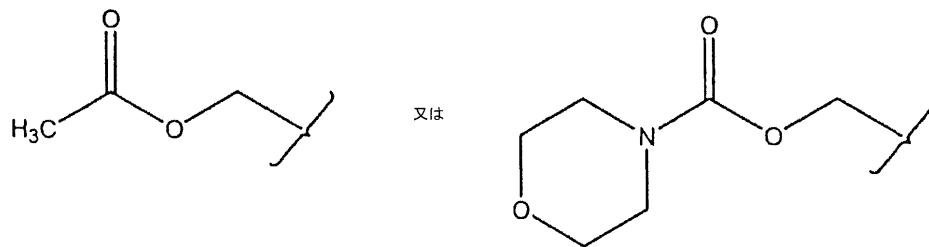
R<sub>2</sub> が-C(O)OR<sub>5</sub>、-C(O)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、又は、-OR<sub>5</sub>若しくは-C(O)R<sub>5</sub>で任意に置換されてもよい低級アルキルである請求項<sub>6</sub>に記載の化合物。

## 【請求項8】

R<sub>1</sub> が低級アルキルであり；

R<sub>2</sub> が-C(O)OH、-C(O)OCH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>OH、

## 【化 3 0】



である請求項7に記載の化合物。

## 【請求項 9】

環 A 及び環 B がそれぞれ独立して置換基を有していてもよいアルキル、置換基を有していてもよいアルケニル、置換基を有していてもよいアルキニル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルケニル、置換基を有していてもよいヘテロシクリル、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいヘテロアリール、置換基を有していてもよいアラルキル、置換基を有していてもよいヘテロアラルキル、シアノ、ニトロ、ハロ、ハロアルキル、-OR<sub>5</sub>、-SR<sub>5</sub>、-NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-C(O)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-NR<sub>5</sub>C(O)R<sub>5</sub>、-C(O)R<sub>5</sub>、-C(O)OR<sub>5</sub>、-OC(O)R<sub>5</sub>、-C(O)SR<sub>5</sub>、-SC(O)R<sub>5</sub>、-C(S)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-NR<sub>5</sub>C(S)R<sub>5</sub>、-C(S)R<sub>5</sub>、-C(S)OR<sub>5</sub>、-OC(S)R<sub>5</sub>、-C(S)SR<sub>5</sub>、-SC(S)R<sub>5</sub>、-C(NR<sub>8</sub>)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-NR<sub>5</sub>C(NR<sub>8</sub>)R<sub>5</sub>、-C(NR<sub>8</sub>)R<sub>5</sub>、-C(NR<sub>8</sub>)OR<sub>5</sub>、-OC(NR<sub>8</sub>)R<sub>5</sub>、-C(NR<sub>8</sub>)SR<sub>5</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)R<sub>5</sub>、-OC(O)OR<sub>5</sub>、-OC(O)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-NR<sub>5</sub>C(O)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-SC(O)OR<sub>5</sub>、-SC(O)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-SC(O)SR<sub>5</sub>、-NR<sub>5</sub>C(O)SR<sub>5</sub>、-OC(O)SR<sub>5</sub>、-OC(S)OR<sub>5</sub>、-OC(S)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-NR<sub>5</sub>C(S)OR<sub>5</sub>、-SC(S)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-SC(S)SR<sub>5</sub>、-NR<sub>5</sub>C(S)SR<sub>5</sub>、-OC(S)SR<sub>5</sub>、-OC(NR<sub>8</sub>)OR<sub>5</sub>、-OC(NR<sub>8</sub>)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-NR<sub>5</sub>C(NR<sub>8</sub>)OR<sub>5</sub>、-NR<sub>5</sub>C(NR<sub>8</sub>)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)R<sub>5</sub>、-SC(NR<sub>8</sub>)SR<sub>5</sub>、-NR<sub>5</sub>C(NR<sub>8</sub>)SR<sub>5</sub>、-OC(NR<sub>8</sub>)SR<sub>5</sub>、-S(O)pR<sub>5</sub>、-S(O)pNR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-NR<sub>5</sub>S(O)pR<sub>5</sub>、-NR<sub>5</sub>S(O)NR<sub>6</sub>R<sub>7</sub>、-S(O)pOR<sub>5</sub>、-OS(O)pR<sub>5</sub>、又は-OS(O)OR<sub>5</sub>、-OP(O)(OR<sub>5</sub>)<sub>2</sub>、-P(O)(OR<sub>5</sub>)<sub>2</sub>、-OP(S)(OR<sub>5</sub>)<sub>2</sub>、及び-P(S)(OR<sub>5</sub>)<sub>2</sub>からなる群から独立して選択された1～3個の置換基で置換され；pが1又は2である請求項1～8に記載の化合物。

## 【請求項 10】

環 A 及び環 B がそれぞれ独立してハロ、低級アルキル、低級アルコキシ、低級ハロアルキル、又は低級ハロアルコキシからなる群から独立して選択された1～3個の置換基で置換される請求項9に記載の化合物。

## 【請求項 11】

前記化合物が：

2-[6-(2,6-ジフルオロ-ベンゾイルアミノ)-3,4-ジヒドロ-2H-ナフタレン-1-イリデン]-プロピオン酸；

2-[6-(2,6-ジフルオロ-ベンゾイルアミノ)-3,4-ジヒドロ-2H-ナフタレン-1-イリデン]-プロピオン酸メチルエステル；

2,6-ジフルオロ-N-[5-(1-メチル-2-モルホリン-4-イル-2-オキ

ソ - エチリデン) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ナフタレン - 2 - イル] - ベンズアミド;

酢酸 2 - [ 6 - ( 2 , 5 - ジフルオロ - ベンゾイルアミノ) - 3 , 4 - ジヒドロ - 2 H - ナフタレン - 1 - イリデン] - プロピルエステル;

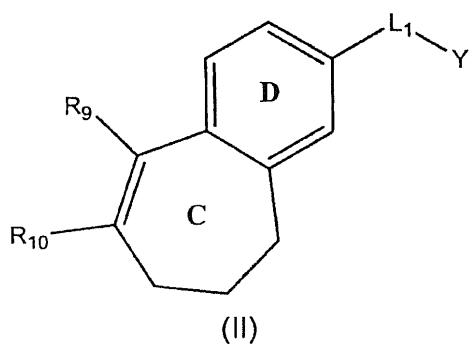
2 , 6 - ジフルオロ - N - [ 5 - ( 2 - ヒドロキシ - 1 - メチル - エチリデン) - 5 , 6 , 7 , 8 - テトラヒドロ - ナフタレン - 2 - イル] - ベンズアミド; 及び

その薬学的に許容される塩、溶媒和物、包接化合物、若しくはプロドラッグからなる群から選択される請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 12】

構造式 (II) の化合物 :

【化 31】



又は、その薬学的に許容される塩であって、式中：

Y は、置換基を有していてもよいアルキル、置換基を有していてもよいアルケニル、置換基を有していてもよいアルキニル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルケニル、置換基を有していてもよいヘテロシクリル、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいヘテロアリール、置換基を有していてもよいアラルキル、又は置換基を有していてもよいヘテロアラルキルであり；

L1 はリンカーアリルであり；

R9 は置換基を有していてもよいアリール又は置換基を有していてもよいヘテロアリールであり；

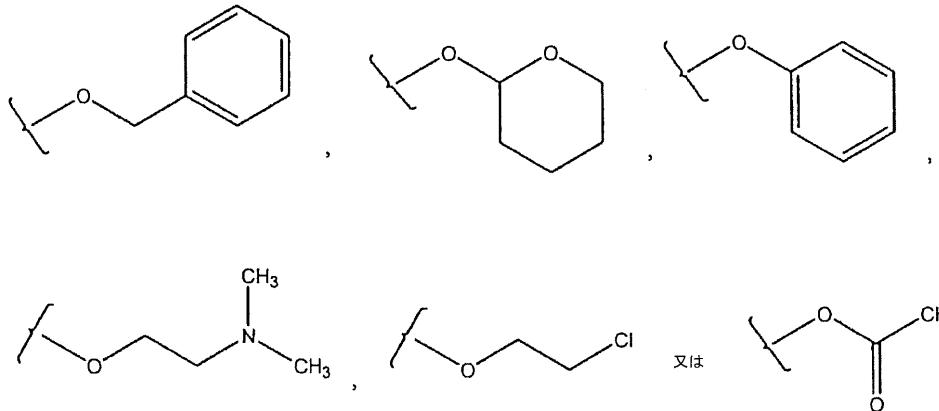
R10 は、H、ハロ、シアノ、-C(O)R5、-C(O)OR5、-C(O)NR6R7、置換基を有していてもよいアルキル、置換基を有していてもよいアルケニル、置換基を有していてもよいアルキニル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルケニル、置換基を有していてもよいヘテロシクリル、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいヘテロアリール、置換基を有していてもよいアラルキル、又は置換基を有していてもよいヘテロアラルキルであり；

R5 はそれぞれ独立して、H、置換基を有していてもよいアルキル、置換基を有していてもよいアルケニル、置換基を有していてもよいアルキニル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルケニル、置換基を有していてもよいヘテロシクリル、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいヘテロアリール、置換基を有していてもよいアラルキル、又は置換基を有していてもよいヘテロアラルキルであり；

R6 及び R7 はそれぞれ独立して、H、置換基を有していてもよいアルキル、置換基を有していてもよいアルケニル、置換基を有していてもよいアルキニル、置換基を有していてもよいシクロアルキル、置換基を有していてもよいシクロアルケニル、置換基を有していてもよいヘテロシクリル、置換基を有していてもよいアリール、置換基を有していてもよいヘテロアリール、置換基を有していてもよいアラルキル、又は置換基を有していてもよいヘテロアラルキル；又は R6 及び R7 は、これらに結合する窒素と共に、置換基を有

してもよいヘテロシクリル、又は置換基を有してもよいヘテロアリールであり；  
 環 C は 1 ~ 6 個の置換基で任意に置換されていてもよく；  
 環 D は 1 ~ 3 個の置換基で任意に置換されていてもよく、  
 但し、-L1-Y は共に、-OCH3、

## 【化 3 2】



ではない。

## 【請求項 1 3】

L1 が -NRC(R)2-、-C(R)2NR-、-C(O)-、-NRC(O)-、-C(O)-NR-、-C(S)-、-C(NR8)-、-NR-C(S)-、-C(S)-NR-、-NR-C(NR8)-、-C(NR8)-NR-、-NRC(O)NR-、-NRC(S)NR-、-NRC(NR8)NR-、-S(O)2NR-、-NRS(O)2-、-NRS(O)2NR-、-NRC(R)2NR-、-CR=CR-、-N=CR-、-CR=N-、-NR-N=CR-、及び -CR=N-NR- からなる群から選択されるリンカーであり；

式中、

R はそれぞれ独立して、H、置換基を有してもよいアルキル、置換基を有してもよいアリール、置換基を有してもよいヘテロアリール、置換基を有してもよいアラルキル、又は置換基を有してもよいヘテロアラルキルであり；

R8 はそれぞれ独立して、-H、ハロ、アルキル、-OR5、-NR6R7、-C(O)R5、-C(O)OR5、又は -C(O)NR6R7 である請求項 1 2 に記載の化合物。

## 【請求項 1 4】

Y が置換基を有してもよいフェニル、置換基を有してもよいピリジル、置換基を有してもよいフリル、置換基を有してもよいチエニル、置換基を有してもよいピロリル、置換基を有してもよいオキサゾリル、置換基を有してもよいイミダゾリル、置換基を有してもよいインドリジニル、置換基を有してもよいチアゾリル、置換基を有してもよいイソオキサゾリル、置換基を有してもよいピラゾリル、置換基を有してもよいイソチアゾリル、置換基を有してもよいピラジニル、置換基を有してもよいピリダジニル、置換基を有してもよいピリミジニル、置換基を有してもよいピラジニル、置換基を有してもよいトリアジニル、置換基を有してもよいトリアゾリル、置換基を有してもよいチアジアゾリル、置換基を有してもよいピラジニル、置換基を有してもよいキノリニル、置換基を有してもよいイソキノリニル、置換基を有してもよいインダゾリル、置換基を有してもよいベンゾオキサゾリル、置換基を有してもよいベンゾフリル、置換基を有してもよいベンゾチアゾリル、置換基を有してもよいインドリジニル、置換基を有してもよいイミダゾピリジニル、置換基を有してもよいイソチアゾリル、置換基を有してもよいテトラゾリル、置換基を有してもよいベンゾオキサゾリル、置換基を有してもよいベンゾチアゾリル、置換基

を有していてもよいベンゾチアジアゾリル、置換基を有していてもよいベンゾオキサジアゾリル、置換基を有していてもよいインドリル、置換基を有していてもよいテトラヒドロインドリル、置換基を有していてもよいアザインドリル、置換基を有していてもよいイミダゾピリジル、置換基を有していてもよいキナゾリニル、置換基を有していてもよいブリニル、置換基を有していてもよいピロロ[2,3]ピリミジル、置換基を有していてもよいピリドピリミジル、置換基を有していてもよいピラゾロ[3,4]ピリミジル、又は置換基を有していてもよいベンゾ(b)チエニルからなる群から選択される請求項12に記載の化合物。

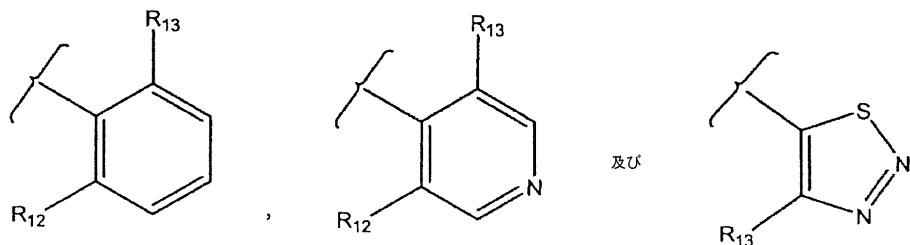
【請求項15】

Yが置換基を有していてもよいフェニル、置換基を有していてもよいピリジニル、又は置換基を有していてもよい[1,2,3]チアジアゾリルである請求項14に記載の化合物。

【請求項16】

Yが：

【化33】



からなる群から選択され、

式中：

R12がハロ、低級アルキル、低級アルコキシ、ハロアルキル、又は低級ハロアルコキシであり；

R13がH、ハロ、低級アルキル、低級アルコキシ、ハロアルキル、又は低級ハロアルコキシである請求項15に記載の化合物。

【請求項17】

前記化合物が：

2,6-ジフルオロ-N-(5-フェニル-8,9-ジヒドロ-7H-ベンゾシクロヘプテン-2-イル)-ベンズアミド；

2,6-ジフルオロ-N-(5-フェニル-6-メチル-8,9-ジヒドロ-7H-ベンゾシクロヘプテン-2-イル)-ベンズアミド；

2,6-ジフルオロ-N-[5-(4-アミノ-フェニル)-8,9-ジヒドロ-7H-ベンゾシクロヘプテン-2-イル]-ベンズアミド；

2,6-ジフルオロ-N-[5-(4-アセチルアミノ-フェニル)-8,9-ジヒドロ-7H-ベンゾシクロヘプテン-2-イル]-ベンズアミド；及び

その薬学的に許容される塩、溶媒和物、包接化合物、若しくはプロドラッグからなる群から選択される請求項12に記載の化合物。

【請求項18】

請求項1～17のいずれか1項に記載の化合物、又は、その薬学的に許容される塩を細胞に投与する工程を含む、免疫細胞活性化を阻害する方法。

【請求項19】

請求項1～17のいずれか1項に記載の化合物、又は、その薬学的に許容される塩を細胞に投与する工程を含む、前記細胞内のサイトカイン産生を阻害する方法。

【請求項20】

前記サイトカインが、IL-2、IL-4、IL-5、IL-13、GM-CSF、I

F N - 、 T N F - 、 及びその組み合わせからなる群から選択される請求項1 9に記載の方法。

【請求項 2 1】

請求項1 ~ 1 7のいずれか1項に記載の化合物、又は、その薬学的に許容される塩を細胞に投与する工程を含む、前記細胞内で免疫細胞活性化に関与するイオンチャネルを調節する方法。

【請求項 2 2】

前記イオンチャネルが  $Ca^{2+}$  遊離活性化  $Ca^{2+}$  チャネル (C R A C) である請求項2 1に記載の方法。

【請求項 2 3】

免疫疾患の治療又は予防のための薬物の製造における、請求項1 ~ 1 7のいずれか1項に記載の化合物、又は、その薬学的に許容される塩の使用。

【請求項 2 4】

前記疾患が、多発性硬化症、重症筋無力症、ギラン・バレー症候群、自己免疫性ブドウ膜炎、自己免疫性溶血性貧血、悪性貧血、自己免疫性血小板減少症、側頭動脈炎、抗リン脂質抗体症候群、ウェゲル肉芽腫症などの脈管炎、ベーチェット病、乾癬、疱疹状皮膚炎、尋常性天疱瘡、白斑、クローン病、潰瘍性大腸炎、原発性胆汁性肝硬変、自己免疫性肝炎、1型又は免疫介在性糖尿病、グレーブズ病、橋本甲状腺炎、自己免疫性卵巣炎及び睾丸炎、副腎の自己免疫疾患、関節リウマチ、全身性エリテマトーデス、強皮症、多発筋炎、皮膚筋炎、強直性脊椎炎、及びシェーグレン症候群からなる群から選択される請求項2 3に記載の使用。

【請求項 2 5】

炎症状態の治療又は予防のための薬物の製造における、請求項1 ~ 1 7のいずれか1項に記載の化合物、又は、その薬学的に許容される塩の使用。

【請求項 2 6】

前記疾患が、移植拒絶反応、植皮拒絶反応、関節炎、関節リウマチ、変形性関節症、骨吸収の増加を伴う骨疾患；炎症性腸疾患、回腸炎、潰瘍性大腸炎、バレット症候群、クローン病；喘息、成人呼吸窮迫症候群、慢性閉塞性気道疾患；角膜異常養症、トラコーマ、オノコセルカ症、ブドウ膜炎、交感性眼炎、眼内炎；歯肉炎、歯根膜炎；結核症；癲病；尿毒症の合併症、糸球体腎炎、ネフローゼ；硬化性皮膚炎、乾癬、湿疹；神経系の慢性脱髓疾患、多発性硬化症、エイズ関連神経変性、アルツハイマー病、感染性髄膜炎、脳脊髄炎、パーキンソン病、ハンチントン病、筋萎縮性側索硬化症、ウィルス性又は自己免疫性脳炎；自己免疫疾患、免疫複合体性血管炎、全身性狼瘡及び紅斑性狼瘡；全身性エリテマトーデス (SLE)；心筋症、虚血性心疾患、高コレステロール血症、アテローム性動脈硬化症、子癇前症；慢性肝不全、脳及び脊髄損傷、及び癌から選択される請求項2 5に記載の使用。

【請求項 2 7】

アレルギー疾患の治療又は予防のための薬物の製造における、請求項1 ~ 1 7のいずれか1項に記載の化合物、又は、その薬学的に許容される塩の使用。

【請求項 2 8】

前記疾患が、アレルギー性鼻炎、副鼻腔炎、鼻副鼻腔炎、慢性中耳炎、再発性中耳炎、薬物反応、虫刺反応、ラテックス反応、結膜炎、蕁麻疹、アナフィラキシー反応、アナフィラキシー様反応、アトピー性皮膚炎、喘息、又は食物アレルギーである請求項2 7に記載の使用。

【請求項 2 9】

薬学的に許容される担体、及び請求項1 ~ 1 7のいずれか1項に記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 3 0】

免疫抑制剤、抗炎症剤、ステロイド、非ステロイド系抗炎症剤、抗ヒスタミン剤、鎮痛剤、及びその適切な混合物からなる群から選択される1つ以上の追加の治療薬をさらに含

む請求項2\_9に記載の医薬組成物。