

【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18年7月6日(2006.7.6)

【公表番号】特表2005-529182(P2005-529182A)

【公表日】平成17年9月29日(2005.9.29)

【年通号数】公開・登録公報2005-038

【出願番号】特願2004-513243(P2004-513243)

【国際特許分類】

C 0 7 C 317/46 (2006.01)

A 6 1 K 31/166 (2006.01)

A 6 1 P 3/06 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 5/00 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 33/00 (2006.01)

A 6 1 P 33/02 (2006.01)

A 6 1 P 33/06 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C 317/46 C S P

A 6 1 K 31/166

A 6 1 P 3/06

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 5/00

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 9/06

A 6 1 P 9/08

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 13/08

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 25/02
 A 6 1 P 25/08
 A 6 1 P 25/18
 A 6 1 P 25/22
 A 6 1 P 25/24
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 33/00
 A 6 1 P 33/02 1 7 3
 A 6 1 P 33/06
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 35/04

【手続補正書】

【提出日】平成18年5月19日(2006.5.19)

【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

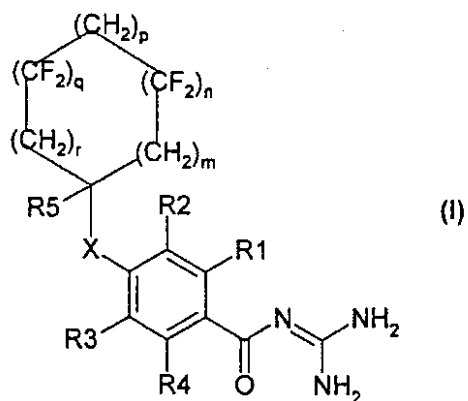
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I

【化1】



のフッ素化シクロアルキル誘導体化ベンゾイルグアニジン、及びそれらの薬理学的に許容される塩。

上記式中、

Xは酸素、硫黄又はNR₆であり；

R₆は水素、1、2、3又は4個の炭素原子を有するアルキル、又は(CH₂)_k-CF₃であり；

kは0、1、2又は3であり；

mは0、1、2又は3であり；

nは0、1、2又は3であり；

pは0、1、2又は3であり；

qは1、2又は3であり；

rは0、1、2又は3であり；

この場合、m、n、p、q及びrの合計は少なくとも2であり；

R₁は水素、1、2、3又は4個の炭素原子を有するアルキル、F、Cl、-OR(7)、

- N R (8) R (9)又は - C_s F_{2s+1}であり；

R (7)、R (8)及びR (9)は互いに独立して水素、1、2又は3個の炭素原子を有するアルキル又は (C H₂)_t - C F₃であり；

s は 1、2、3又は4であり；

t は 0、1、2、3又は4であり；

R 2は水素、F、C 1、1、2、3又は4個の炭素原子を有するアルキル、又はC F₃であり；

R 3は水素、F、C 1、1、2、3又は4個の炭素原子を有するアルキル、C F₃又はS O_u R 10であり；

u は 0、1又は2であり；

R 10は 1、2、3又は4個の炭素原子を有するアルキル、又はN R 11R 12であり；

R 11及びR 12は互いに独立して水素又は 1、2、3又は4個の炭素原子を有するアルキルであり；

R 4は水素、1、2、3又は4個の炭素原子を有するアルキル、F、C 1、- O R (13)、- N R (14) R (15)又は - C_v F_{2v+1}であり；

R (13)、R (14)及びR (15)は互いに独立して水素、1、2又は3個の炭素原子を有するアルキル又は (C H₂)_w - C F₃であり；

v は 1、2、3又は4であり；

w は 0、1、2、3又は4であり；

R 5は水素又はFである。

【請求項 2】

X は酸素、硫黄又はN R 6であり；

R 6は水素、メチル又はC H₂ - C F₃であり；

m は 0、1又は2であり；

n は 0、1又は2であり；

p は 0、1又は2であり；

q は 1又は2であり；

r は 0、1又は2であり；

この場合、m、n、p、q及びrの合計は少なくとも2であり；

R 1は水素、メチル、F、C 1、- O R (7)、- N R (8) R (9)又は - C F₃であり；

R (7)、R (8)及びR (9)は互いに独立して水素、メチル、C F₃又はC H₂ - C F₃であり；

R 2は水素、F、C 1、メチル又はC F₃であり；

R 3は水素、F、C 1、1、2、3又は4個の炭素原子を有するアルキル、C F₃、S O₂ C H₃又はS O₂ N H₂であり；

R 4は水素、メチル、F、C 1、- O R (13)、- N R (14) R (15)又は - C F₃であり；

R (13)、R (14)及びR (15)は互いに独立して水素、メチル、C F₃又はC H₂ - C F₃であり；

R 5は水素又はFである、請求項 1 に記載の式 I の化合物、及びそれらの薬理学的に許容される塩。

【請求項 3】

X は酸素、硫黄又はN R 6であり；

R 6は水素、メチル又はC H₂ - C F₃であり；

m は 0又は1であり；

n は 0、1又は2であり；

p は 0又は1であり；

q は 1又は2であり；

r は 0又は1であり；

この場合、m、n、p、q及びrの合計は少なくとも2であり；

R 1は水素、メチル、F、C 1、- O R (7)、- N R (8) R (9)又は - C F₃であり；

R (7) はメチル、 CF_3 又は $\text{CH}_2 - \text{CF}_3$ であり；

R (8) 及び R (9) は互いに独立して水素、メチル又は $\text{CH}_2 - \text{CF}_3$ であり；

R 2 は水素、F 又は Cl であり；

R 3 は CF_3 、 SO_2CH_3 又は SO_2NH_2 であり；

R 4 は水素であり；

R 5 は水素又は F である、請求項 1 又は 2 に記載の式 I の化合物、及びそれらの薬理的に許容される塩。

【請求項 4】

薬物としての使用のための請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物又はそれらの医薬的に許容される塩。

【請求項 5】

虚血事象又は再灌流事象により引き起こされる臓器及び組織の急性又は慢性の損傷、障害又は間接的続発症の治療又は予防のための、不整脈の、生命を脅かす心臓の心室細動の、心筋梗塞の、狭心症の治療又は予防のための、心臓の虚血状態の、末梢及び中枢神経系の虚血状態の又は卒中の又は末梢器官及び組織の虚血状態の治療又は予防のための、ショック状態の、又は細胞増殖が一次的若しくは二次的原因を表す病気の、癌の、転移の、前立腺肥大の若しくは前立腺過形成の、アテローム性動脈硬化症の又は脂質代謝の欠陥の、高血圧、特に本態性高血圧症の、中枢神経系の障害の、特に癲癇若しくは中枢誘発けいれんのような CNS (中枢神経系) 過興奮性により発生する障害の、中枢神経系の障害の、特に不安状態、鬱病若しくは精神病の治療又は予防のための、インシュリン非依存性糖尿病 (NIDDM) 若しくは糖尿病の後期障害の、血栓症の、内皮機能障害により発生する障害の、間欠性跛行症の治療又は予防のための、内部器官の線維障害、肝臓の線維障害、腎臓の線維障害、血管の線維障害及び心臓の線維障害の治療又は予防のための、心不全の若しくは鬱血性心不全、急性若しくは慢性炎症障害の、原生動物により引き起こされる障害の、マラリアの及び家禽のコクシジウム症の治療又は予防のための並びに外科手術及び臓器移植における使用のための、外科的処置のための移植臓器の保存及び回復のための、加齢性組織変化を防ぐための薬物の製造における、老化防止又は生命を延長するための、甲状腺中毒症における心臓毒性作用の治療及び軽減のための薬物の製造における又は診断補助薬の製造における請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物又はそれらの医薬的に許容される塩の使用。

【請求項 6】

虚血事象又は再灌流事象により引き起こされる臓器及び組織の急性又は慢性の損傷、障害又は間接的続発症の治療又は予防のための、不整脈の、生命を脅かす心臓の心室細動の、心筋梗塞の、狭心症の治療又は予防のための、心臓の虚血状態の、末梢及び中枢神経系の虚血状態の又は卒中の又は末梢器官及び組織の虚血状態の治療又は予防のための、ショック状態の、又は細胞増殖が一次的若しくは二次的原因を表す病気の、癌の、転移の、前立腺肥大の若しくは前立腺過形成の、アテローム性動脈硬化症の又は脂質代謝の欠陥の、高血圧、特に本態性高血圧症の、中枢神経系の障害の、特に癲癇若しくは中枢誘発けいれんのような CNS (中枢神経系) 過興奮性により発生する障害の、中枢神経系の障害の、特に不安状態、鬱病若しくは精神病の治療又は予防のための、インシュリン非依存性糖尿病 (NIDDM) 若しくは糖尿病の後期障害の、血栓症の、内皮機能障害により発生する障害の、間欠性跛行症の治療又は予防のための、内部器官の線維障害、肝臓の線維障害、腎臓の線維障害、血管の線維障害及び心臓の線維障害の治療又は予防のための、心不全の若しくは鬱血性心不全、急性若しくは慢性炎症障害の、原生動物により引き起こされる障害の、マラリアの及び家禽のコクシジウム症の治療又は予防のための並びに外科手術及び臓器移植における使用のための、外科的処置のための移植臓器の保存及び回復のための、加齢性組織変化を防ぐための薬物の製造における、老化防止又は生命を延長するための、甲状腺中毒症における心臓毒性作用の治療及び軽減のための薬物の製造における又は診断補助薬の製造における他の薬物又は活性成分と組み合わせた請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物又はそれらの医薬的に許容される塩の使用。

【請求項 7】

軽減された心臓毒性及び細胞毒性の性質を有する薬物の製造における心臓毒性及び細胞毒性薬物又は活性成分と組み合わせた請求項 6 に記載の式 I の化合物又はそれらの医薬的に許容される塩の使用。

【請求項 8】

虚血事象により又は再灌流事象により引き起こされる臓器及び肢の急性及び慢性の欠陥、障害又は間接的二次的障害の治療又は予防のための薬物の製造における、単独で又は他の薬物又は活性成分と組み合わせた、請求項 5 又は 6 に記載の式 I の化合物又はそれらの医薬的に許容される塩の使用。

【請求項 9】

生命を脅かす心臓の心室細動の治療のための薬物の製造における、単独で又は他の薬物又は活性成分と組み合わせた、請求項 5 又は 6 に記載の式 I の化合物又はそれらの医薬的に許容される塩の使用。

【請求項 10】

転移の治療又は予防のための薬物の製造における、単独で又は他の薬物又は活性成分と組み合わせた、請求項 5 又は 6 に記載の式 I の化合物又はそれらの医薬的に許容される塩の使用。

【請求項 11】

線維性心疾患の、心不全の又は鬱血性心不全の治療又は予防のための薬物の製造における、単独で又は他の薬物又は活性成分と組み合わせた、請求項 5 又は 6 に記載の式 I の化合物又はそれらの医薬的に許容される塩の使用。

【請求項 12】

医薬的に許容される担体及び添加剤と共に、請求項 1 ～ 3 のいずれか 1 項に記載の少なくとも 1 つの式 I の化合物又はそれらの医薬的に許容される塩の有効量から成る、ヒト、動物又は植物防護に使用するための薬剤。

【請求項 13】

他の薬理学的に活性の成分又は薬物と組み合わせた、医薬的に許容される担体及び添加剤と共に、請求項 1 ～ 3 のいずれか 1 項に記載の少なくとも 1 つの式 I の化合物又はそれらの医薬的に許容される塩の有効量から成る、ヒト、動物又は植物防護に使用するための薬剤。