

【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22年2月12日 (2010.2.12)

【公表番号】特表2009-523140(P2009-523140A)

【公表日】平成21年6月18日 (2009.6.18)

【年通号数】公開・登録公報2009-024

【出願番号】特願2008-549781(P2008-549781)

【国際特許分類】

C 0 7 D 251/10 (2006.01)

C 0 7 D 491/107 (2006.01)

C 0 7 D 487/10 (2006.01)

C 0 7 D 405/04 (2006.01)

C 0 7 J 71/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/53 (2006.01)

A 6 1 K 31/58 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 1/02 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 251/10 C S P

C 0 7 D 491/107

C 0 7 D 487/10

C 0 7 D 405/04

C 0 7 J 71/00

A 6 1 K 31/53

A 6 1 K 31/58

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 17/02

A 6 1 P 1/02

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 17/00

A 6 1 K 45/00

【手続補正書】

【提出日】平成21年12月16日 (2009.12.16)

【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

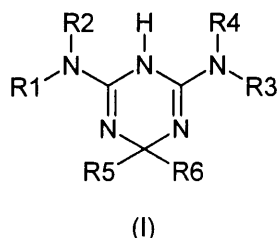
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

癒痕形成および / または血管形成効果を有する医薬の調製のための、以下の一般式 (I) :

【化 1】



[式中、

R 1、R 2、R 3およびR 4は、独立に、次の基：

H、

ハロゲン、(C 1～C 5)アルキル、(C 1～C 5)アルコキシまたは(C 3～C 8)シクロアルキルで場合により置換された(C 1～C 20)アルキル、

ハロゲン、(C 1～C 5)アルキルまたは(C 1～C 5)アルコキシで場合により置換された(C 2～C 20)アルケニル、

ハロゲン、(C 1～C 5)アルキルまたは(C 1～C 5)アルコキシで場合により置換された(C 2～C 20)アルキニル、

(C 1～C 5)アルキルまたは(C 1～C 5)アルコキシで場合により置換された(C 3～C 8)シクロアルキル、

N、OおよびSから選択される1つまたは複数のヘテロ原子を有し、(C 1～C 5)アルキルまたは(C 1～C 5)アルコキシで場合により置換されたヘテロ(C 3～C 8)シクロアルキル、

アミノ、ヒドロキシル、チオ、ハロゲン、(C 1～C 5)アルキル、(C 1～C 5)アルコキシ、(C 1～C 5)アルキルチオ、(C 1～C 5)アルキルアミノ、(C 6～C 14)アリーロキシ、(C 6～C 14)アリール(C 1～C 5)アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、カルボキシル、カルボキシメチルまたはカルボキシエチルで場合により置換された(C 6～C 14)アリール(C 1～C 20)アルキル、

アミノ、ヒドロキシル、チオ、ハロゲン、(C 1～C 5)アルキル、(C 1～C 5)アルコキシ、(C 1～C 5)アルキルチオ、(C 1～C 5)アルキルアミノ、(C 6～C 14)アリーロキシ、(C 6～C 14)アリール(C 1～C 5)アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、カルボキシル、カルボキシメチルまたはカルボキシエチルで場合により置換された(C 6～C 14)アリール、

N、OおよびSから選択される1つまたは複数のヘテロ原子を有し、アミノ、ヒドロキシル、チオ、ハロゲン、(C 1～C 5)アルキル、(C 1～C 5)アルコキシ、(C 1～C 5)アルキルチオ、(C 1～C 5)アルキルアミノ、(C 6～C 14)アリーロキシ、(C 6～C 14)アリール(C 1～C 5)アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、カルボキシル、カルボキシメチルまたはカルボキシエチルで場合により置換された(C 1～C 13)ヘテロアリール

から選択され、

一方のR 1とR 2、および他方のR 3とR 4は、窒素原子と一緒にあって、N、OおよびSから選択される1つまたは複数のヘテロ原子を場合により含むn員環(nは3～8)を形成することができ、次の基：アミノ、ヒドロキシル、チオ、ハロゲン、(C 1～C 5)アルキル、(C 1～C 5)アルコキシ、(C 1～C 5)アルキルチオ、(C 1～C 5)アルキルアミノ、(C 6～C 14)アリーロキシ、(C 6～C 14)アリール(C 1～C 5)アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、カルボキシル、カルボキシメチルまたはカルボキシエチルの1つまたは複数で置換されていることができ、

R 5およびR 6は、独立に、次の基：

H、

アミノ、ヒドロキシル、チオ、ハロゲン、(C 1～C 5)アルキル、(C 1～C 5)

アルコキシ、(C 1 ~ C 5) アルキルチオ、(C 1 ~ C 5) アルキルアミノ、(C 6 ~ C 1 4) アリールオキシ、(C 6 ~ C 1 4) アリール(C 1 ~ C 5) アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、カルボキシル、カルボキシメチルまたはカルボキシエチルで場合により置換された(C 1 ~ C 2 0) アルキル、

アミノ、ヒドロキシル、チオ、ハロゲン、(C 1 ~ C 5) アルキル、(C 1 ~ C 5) アルコキシ、(C 1 ~ C 5) アルキルチオ、(C 1 ~ C 5) アルキルアミノ、(C 6 ~ C 1 4) アリールオキシ、(C 6 ~ C 1 4) アリール(C 1 ~ C 5) アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、カルボキシル、カルボキシメチルまたはカルボキシエチルで場合により置換された(C 2 ~ C 2 0) アルケニル、

アミノ、ヒドロキシル、チオ、ハロゲン、(C 1 ~ C 5) アルキル、(C 1 ~ C 5) アルコキシ、(C 1 ~ C 5) アルキルチオ、(C 1 ~ C 5) アルキルアミノ、(C 6 ~ C 1 4) アリールオキシ、(C 6 ~ C 1 4) アリール(C 1 ~ C 5) アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、カルボキシル、カルボキシメチルまたはカルボキシエチルで場合により置換された(C 2 ~ C 2 0) アルキニル、

アミノ、ヒドロキシル、チオ、ハロゲン、(C 1 ~ C 5) アルキル、(C 1 ~ C 5) アルコキシ、(C 1 ~ C 5) アルキルチオ、(C 1 ~ C 5) アルキルアミノ、(C 6 ~ C 1 4) アリールオキシ、(C 6 ~ C 1 4) アリール(C 1 ~ C 5) アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、カルボキシル、カルボキシメチルまたはカルボキシエチルで場合により置換された(C 3 ~ C 8) シクロアルキル、

N、OおよびSから選択される1つまたは複数のヘテロ原子を有し、アミノ、ヒドロキシル、チオ、ハロゲン、(C 1 ~ C 5) アルキル、(C 1 ~ C 5) アルコキシ、(C 1 ~ C 5) アルキルチオ、(C 1 ~ C 5) アルキルアミノ、(C 6 ~ C 1 4) アリールオキシ、(C 6 ~ C 1 4) アリール(C 1 ~ C 5) アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、カルボキシル、カルボキシメチルまたはカルボキシエチルで場合により置換されたヘテロ(C 3 ~ C 8) シクロアルキル、

アミノ、ヒドロキシル、チオ、ハロゲン、(C 1 ~ C 5) アルキル、(C 1 ~ C 5) アルコキシ、(C 1 ~ C 5) アルキルチオ、(C 1 ~ C 5) アルキルアミノ、(C 6 ~ C 1 4) アリールオキシ、(C 6 ~ C 1 4) アリール(C 1 ~ C 5) アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、カルボキシル、カルボキシメチルまたはカルボキシエチルで場合により置換された(C 6 ~ C 1 4) アリール、

N、OおよびSから選択される1つまたは複数のヘテロ原子を有し、アミノ、ヒドロキシル、チオ、ハロゲン、(C 1 ~ C 5) アルキル、(C 1 ~ C 5) アルコキシ、(C 1 ~ C 5) アルキルチオ、(C 1 ~ C 5) アルキルアミノ、(C 6 ~ C 1 4) アリールオキシ、(C 6 ~ C 1 4) アリール(C 1 ~ C 5) アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、カルボキシル、カルボキシメチルまたはカルボキシエチルで場合により置換された(C 1 ~ C 1 3) ヘテロアリール、

アミノ、ヒドロキシル、チオ、ハロゲン、(C 1 ~ C 5) アルキル、(C 1 ~ C 5) アルコキシ、(C 1 ~ C 5) アルキルチオ、(C 1 ~ C 5) アルキルアミノ、(C 6 ~ C 1 4) アリールオキシ、(C 6 ~ C 1 4) アリール(C 1 ~ C 5) アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、カルボキシル、カルボキシメチルまたはカルボキシエチルで場合により置換された(C 6 ~ C 1 4) アリール(C 1 ~ C 5) アルキル

から選択され、

R 5 および R 6 は、これらが結合した炭素原子と一緒にあって、N、OおよびSから選択される1つまたは複数のヘテロ原子を場合により含むm員環(mは3 ~ 8)を形成することができ、アミノ、ヒドロキシル、チオ、ハロゲン、(C 1 ~ C 5) アルキル、(C 1 ~ C 5) アルコキシ、(C 1 ~ C 5) アルキルチオ、(C 1 ~ C 5) アルキルアミノ、(C 6 ~ C 1 4) アリールオキシ、(C 6 ~ C 1 4) アリール(C 1 ~ C 5) アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、カルボキシル、カルボキシメチルまたはカルボキシエチルで置換されていることができ、

または、炭素原子と一緒にあって、アミノ、ヒドロキシル、チオ、ハロゲン、(C 1 ~

C 5) アルキル、(C 1 ~ C 5) アルコキシ、(C 1 ~ C 5) アルキルチオ、(C 1 ~ C 5) アルキルアミノ、(C 6 ~ C 14) アリールオキシ、(C 6 ~ C 14) アリール(C 1 ~ C 5) アルコキシ、シアノ、トリフルオロメチル、カルボキシル、カルボキシメチルまたはカルボキシエチルで場合により置換された C 10 ~ C 30 多環式残基を形成することができ、

R 5 および R 6 は一緒になって、また、= O 基または = S 基を表すことができ、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロアリール基の窒素原子は、(C 1 ~ C 5) アルキル、(C 3 ~ C 8) シクロアルキル、(C 6 ~ C 14) アリール、(C 6 ~ C 14) アリール(C 1 ~ C 5) アルキルまたは(C 1 ~ C 6) アシル基で置換されていることができる] のトリアジン誘導体、およびまたこのラセミ体、互変異性体、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、エピマーおよび多形体、およびこれらの混合物、ならびに薬剤として許容されるこの塩の使用。

【請求項 2】

式(I)の化合物が、2 - アミノ - 3 , 6 - ジヒドロ - 4 - ジメチルアミノ - 6 - メチル - 1 , 3 , 5 - トリアジン、またはこのラセミ体、互変異性体、鏡像異性体、ジアステレオ異性体、エピマーおよび多形体、およびこれらの混合物、または薬剤として許容されるこの塩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】

式(I)の化合物が、(-) - 2 - アミノ - 3 , 6 - ジヒドロ - 4 - ジメチルアミノ - 6 - メチル - 1 , 3 , 5 - トリアジン、またはその薬剤として許容される塩であることを特徴とする、請求項 2 に記載の使用。

【請求項 4】

使用される式(I)の化合物が、(+) - 2 - アミノ - 3 , 6 - ジヒドロ - 4 - ジメチルアミノ - 6 - メチル - 1 , 3 , 5 - トリアジン、またはその薬剤として許容される塩であることを特徴とする、請求項 2 に記載の使用。