

【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17年12月22日(2005.12.22)

【公表番号】特表2004-517069(P2004-517069A)

【公表日】平成16年6月10日(2004.6.10)

【年通号数】公開・登録公報2004-022

【出願番号】特願2002-543486(P2002-543486)

【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 401/04

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 17/02

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/02

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 41/00

A 6 1 P 43/00

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 417/14

C 0 7 D 471/04

【F I】

C 0 7 D 401/04

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/10 1 0 1

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 17/02

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/02

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 41/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 417/14

C 0 7 D 471/04 1 0 1

【手続補正書】

【提出日】平成16年11月10日(2004.11.10)

【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

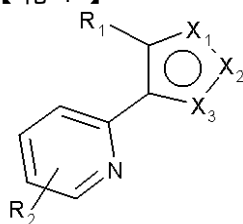
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I):

【化1】



(I)

[式中、 R_1 は、ハロ、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-S-C_{1-6}$ アルキル、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} ハロアルキル、 $-O-(CH_2)_n-Ph$ 、 $-S-(CH_2)_n-Ph$ 、シアノ、フェニル、および CO_2R からなる群から選択される1個またはそれ以上の置換基により置換されていてもよいナフチルまたはフェニルであり、ここで、 R は、水素または C_{1-6} アルキルであり、 n は、0、1、2または3であるか；または R_1 は、 N 、 O および S から独立して選択されるヘテロ原子3個までを含有していてもよく、 N がさらに C_{1-6} アルキルにより置換されていてもよい5~7員の芳香環または非芳香環と縮合しているフェニルであり；

R_2 は、 H 、 C_{1-6} アルキル、 C_{1-6} アルコキシ、フェニル、 $NH(CH_2)_n-Ph$ 、 $NH-C_{1-6}$ アルキル、ハロ、 CN 、 NO_2 、 $CONHR$ および SO_2NHR であり；

X_1 、 X_2 および X_3 のうち2つは、 N であり、残りは、 NR_3 であり、ここで、 R_3 は、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{3-7} シクロアルキル、 $-(CH_2)_p-CN$ 、 $-(CH_2)_p-CO_2H$ 、 $-(CH_2)_p-CONHR_4R_5$ 、 $-(CH_2)_p-COR_4$ 、 $-(CH_2)_q(OR_6)_2$ 、 $-(CH_2)_pOR_4$ 、 $-(CH_2)_q-CH=CH-CN$ 、 $-(CH_2)_q-CH=CH-CO_2H$ 、 $-(CH_2)_p-CH=CH-CONHR_4R_5$ 、 $(CH_2)_pNH-COR_7$ または $(CH_2)_pNR_8R_9$ であり；

R_4 および R_5 は、独立して、水素または C_{1-6} アルキルであり；

R_6 は、 C_{1-6} アルキルであり；

R_7 は、 C_{1-7} アルキル、または置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、アリール C_{1-6} アルキルもしくはヘテロアリール C_{1-6} アルキルであり；

R_8 および R_9 は、独立して、水素、 C_{1-6} アルキル、アリールおよびアリール C_{1-6} アルキルから選択され；

p は、0~4であり；

q は、1~4である；

ただし、化合物は4-フェニル-5-(2-ピリジル)-1,2,3-トリアゾールではない]

で示される化合物またはその医薬上許容される塩。

【請求項2】

R_1 がハロ、 C_{1-6} アルコキシ、 C_{1-6} アルキルチオ、およびフェニルから選択される1

個またはそれ以上の置換基で置換されていてもよいフェニルであるか；またはR₁が、N、OおよびSから独立して選択されるヘテロ原子2個までを含有していてもよく、NがさらにC₁₋₆アルキルにより置換されていてもよい5～7員芳香環または非芳香環と縮合されているフェニルである請求項1記載の化合物。

【請求項3】

R₁が4-メトキシフェニル、3-クロロフェニル、3-フルオロ-4-メトキシフェニルまたは3-クロロ-4-メトキシフェニルを表すか、またはR₁がベンゾ[1,2,5]チアジアゾリル、[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジル、ジヒドロベンゾフラン、2,3-ジヒドロベンゾ[1,4]ジオキシニル、ベンゾイミダゾリルまたはC₁₋₆アルキルベンゾイミダゾリルを表す請求項2記載の化合物。

【請求項4】

R₂がピリジル環の窒素原子に対してオルト位に位置する請求項1～3いずれか1項記載の化合物。

【請求項5】

R₂がメチルである請求項4記載の化合物。

【請求項6】

5-[5-(6-メチルピリジン-2-イル)-1H-[1,2,3]トリアゾール-4-イル]-ベンゾ[1,2,5]チアジアゾール、

5-[2-エチル-5-(6-メチルピリジン-2-イル)-2H-[1,2,3]トリアゾール-4-イル]-ベンゾ[1,2,5]チアジアゾール、

6-[5-(6-メチルピリジン-2-イル)-1H-[1,2,3]トリアゾール-4-イル]-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン、

2-[5-(2,3-ジヒドロベンゾフラン-5-イル)-3H-[1,2,3]トリアゾール-4-イル]-6-メチルピリジン、

2-[5-(2,3-ジヒドロベンゾ[1,4]ジオキシニル-6-イル)-2H-[1,2,3]トリアゾール-4-イル]-6-メチルピリジン、

1-メチル-6-[5-(6-メチルピリジン-2-イル)-2H-[1,2,3]トリアゾール-4-イル]-1H-ベンゾイミダゾール、

6-(2-エチル-5-(6-メチルピリジン-2-イル)-2H-[1,2,3]トリアゾール-4-イル)-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン、

6-(2-メチル-5-(6-メチルピリジン-2-イル)-2H-[1,2,3]トリアゾール-4-イル)-[1,2,4]トリアゾロ[1,5-a]ピリジン、

2-[5-(4-メトキシフェニル)-2H-[1,2,3]トリアゾール-4-イル]-6-メチルピリジン、

2-[5-(3-フルオロ-4-メトキシフェニル)-2H-[1,2,3]トリアゾール-4-イル]-6-メチルピリジン、

2-[5-(3-クロロ-4-メトキシフェニル)-2H-[1,2,3]トリアゾール-4-イル]-6-メチルピリジン、および

それらの医薬上許容される塩

から選択される請求項1記載の化合物。

【請求項7】

請求項1～6いずれか1項記載の化合物またはその医薬上許容される塩、および医薬上許容される担体または希釈剤を含む医薬組成物。

【請求項8】

哺乳類におけるALK5受容体により媒介される疾患の治療用薬物の製造における請求項1～6いずれか1項記載の化合物またはその医薬上許容される塩の使用。

【請求項9】

請求項1～6いずれか1項記載の式(I)で示される化合物またはその医薬上許容される塩を含む、TGF-シグナリング経路を阻害するための医薬組成物。

【請求項10】

請求項 1 ~ 6 いずれか 1 項記載の化合物またはその医薬上許容される塩を含む、慢性腎疾患、急性腎疾患、創傷治癒、関節炎、骨粗鬆症、腎疾患、うっ血性心不全、潰瘍、眼障害、角膜創傷、糖尿病性ネフロパシー、神経学的な機能障害、アルツハイマー病、アテローム性動脈硬化症、腹膜および皮下癒着、肺線維症および肝線維症を含むがそれらに限定されない線維症が主要成分であるいずれもの疾患、ならびに再狭窄から選択される疾患を治療するための医薬組成物。

【請求項 1 1】

請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項記載の化合物またはその医薬上許容される塩を含む、マトリックス形成を阻害するための医薬組成物。