

【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5月25日(2006.5.25)

【公表番号】特表2006-511476(P2006-511476A)

【公表日】平成18年4月6日(2006.4.6)

【年通号数】公開・登録公報2006-014

【出願番号】特願2004-538153(P2004-538153)

【国際特許分類】

C 0 7 D 251/44 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/53 (2006.01)

C 0 7 D 251/70 (2006.01)

C 0 7 D 251/52 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/541 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 L 27/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

C 0 7 D 453/02 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

C 1 2 M 1/00 (2006.01)

A 6 1 F 2/82 (2006.01)

A 6 1 M 35/00 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 409/14 (2006.01)

C 0 7 D 407/14 (2006.01)

A 6 1 L 29/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 251/44 C S P C

C 0 7 D 403/12

A 6 1 K 31/53

C 0 7 D 251/70 F

C 0 7 D 251/52 A

C 0 7 D 405/12

A 6 1 K 31/541

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 45/00

A 6 1 L 27/00 P

A 6 1 L 27/00 F

A 6 1 P 29/00

C 0 7 D 453/02

A 6 1 K 31/55

C 1 2 M 1/00 A

A 6 1 M 29/00

A 6 1 M 35/00

C 0 7 D 417/12
 C 0 7 D 401/12
 C 0 7 D 409/14
 C 0 7 D 407/14
 A 6 1 L 29/00

【手続補正書】

【提出日】平成18年3月22日(2006.3.22)

【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

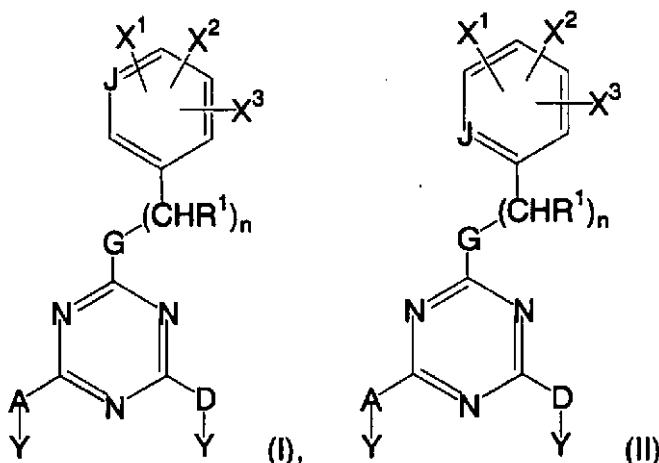
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 I または II の化合物、またはそれらの塩であって；

【化1】



ここで：

R^1 は、各出現例において、別個に、以下から選択される：H；1～10個の炭素原子を有する直鎖または分枝アルキル；1～10個の炭素原子を有するシクロアルキル；1～10個の炭素原子を有するシクロアルケニル；ベンジル； O_2CR 、 $C(O)R$ または $C(O)OR$ であって、ここで、Rは、H、または1～10個の炭素原子を有する直鎖または分枝アルキルである； CH_2NH_2 ； CH_2OH ；またはアリール；

Gは、 NR^1 またはOである；

Jは、CHまたはNである；

nは、0～3の整数である；

X^1 は、以下： $o-R^1$ 、 $m-R^1$ 、 $m-OR^1$ 、 $m-OCF_3$ 、 $o-F$ 、 $o-Cl$ 、 $m-F$ 、 $m-Cl$ 、 $m-Br$ 、 $m-I$ 、 $m-CF_3$ 、 $m-CN$ 、 $m-NO_2$ 、 $m-C(O)OR^1$ 、 $C(O)OLi$ 、 $C(O)ONa$ 、 $m-SO_2R^1$ 、 $m-NC(O)R^1$ または $m-SO_2OR^1$ から選択されるか；または X^1 および X^2 は、一緒になって、縮合ベンゼン、ピリジン、ジオキサソランまたはテトラヒドロピラン環である；

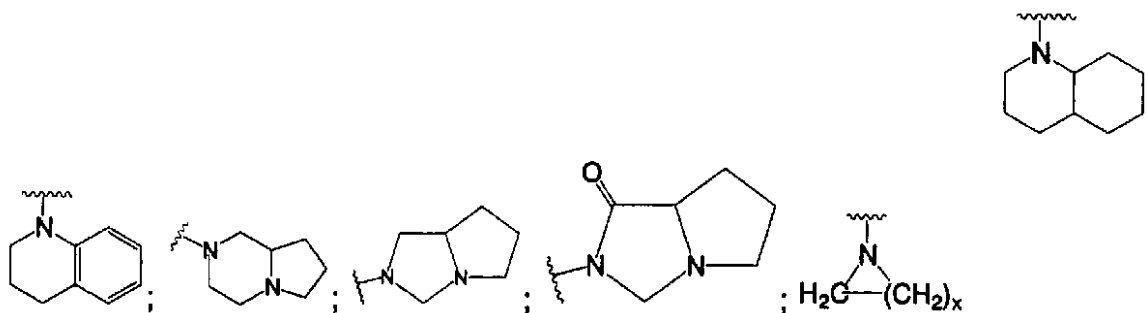
X^2 は、以下から選択される： $o-R^1$ ； $p-R^1$ ； $p-OR^1$ ； $p-OCF_3$ ； $o-F$ ； $o-Cl$ ； $o-Br$ ； $o-I$ ； $o-CF_3$ ； $m-F$ ； $m-Cl$ ； $m-Br$ ； $m-I$ ； $m-CN$ ； $m-CF_3$ ； $m-OCF_3$ ； $p-SR^1$ ； $p-NR^1_2$ ； $p-F$ ； $p-Cl$ ； $p-Br$ ； $p-CF_3$ ； $p-OCF_3$ ； $p-C(O)OR^1$ ； $p-OC(O)R^1$ ； $p-CN$ ； $p-NO_2$ ； $p-NC(O)R^1$ ； $o-C\equiv CC(CH_3)_2OR^1$ ； $p-C\equiv CC(CH_3)_2OR^1$ ； $p-OM$ 、 $p-SM$ 、 $m-C(O)OM$ または $p-C(O)OM$

であって、ここで、Mは、Li、Na、K、MgまたはCaから選択される； $p-O(CH_2)_mZR^1$ であって、ここで、mは、0～3の整数であり、そしてZは、O、S、 $-S(O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-OP(O)(OH)OR^2-$ または $-P(O)(OH)OR^2-$ であって、ここで R^2 はHまたはアルカリ金属であるか、あるいは $-C(O)-$ から選択され； $p-OC(O)(CH_2CH_2O)_rR^1$ または $p-O(CH_2CH_2O)_rR^1$ であって、ここで、rは、0～6である；

X^3 は、 $o-R^1$ 、 $m-R^1$ 、 $p-R^1$ 、 $o-OR^1$ 、 $m-OR^1$ または $p-OR^1$ である；または X^2 および X^3 は、一緒になって、縮合ベンゼン、ピリジン、ジオキサソランまたはテトラヒドロピラン環を形成する；

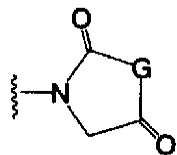
A YおよびD Yは、別個に、以下： OR^1 ；F；Cl；Br；I；

【化2】



(ここで、xは、3～5の整数である)；

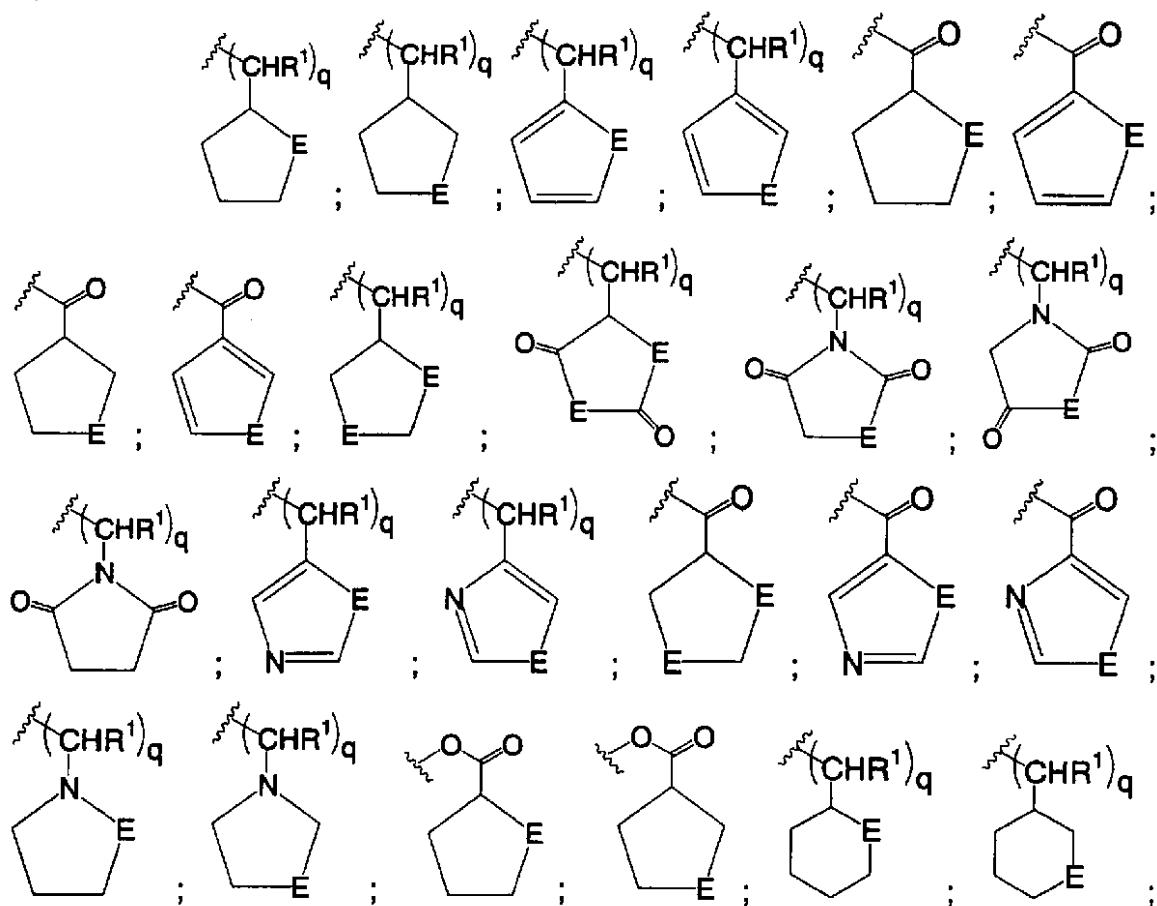
【化3】



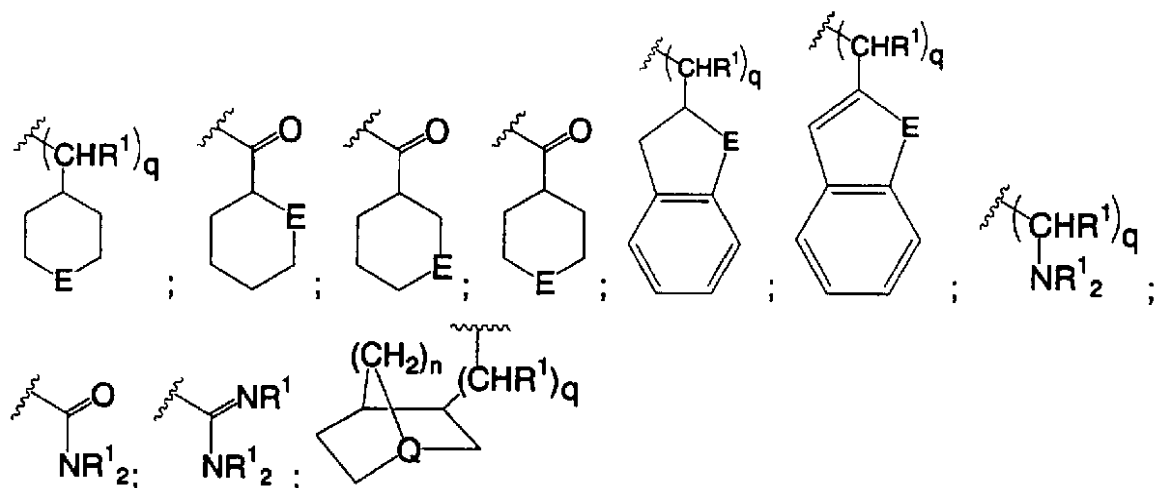
(ここで、Gは、NH、 CH_2 またはSHから選択される)から選択される；あるいは、AおよびDは、別個に、Oまたは NR^1 から選択される；そして

Yは、各出現例において、別個に、以下から選択される： R^1 ； $(CHR^1)_qR^1$ ； $(CHR^1)_qCF_3$ ；

【化 4】

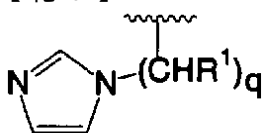


【化 5】



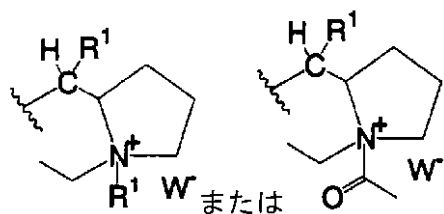
(ここで、 n は、1または2であり、そして Q は、 CH または N から選択される) ; または

【化 6】



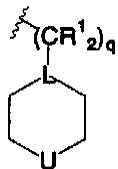
(ここで、 q は、0~3の整数であり、そして E は、各出現例において、別個に、 NR^1 、 O 、 S 、 $C=O$ または $C=NR^1$ から選択される) ;

【化 7】



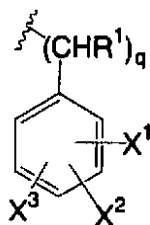
(ここで、 W^- は、 Cl^- 、 Br^- 、 I^- 、 $[O_2CCH_2CH_2CO_2R^1]^-$ 、 $[O_2CCHCHCO_2R^1]^-$ または $[O_2CCF_3]^-$ から選択される)；

【化 8】



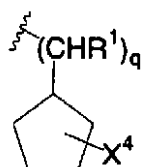
(ここで、 q は、0 ~ 3 の整数であり、 L は、 CH または N から選択される、そして U は、 O 、 NR^1 、 S 、 SO_2 、 CHR^1 または $CHOH$ から選択される)；

【化 9】



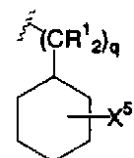
(ここで、 q は、0 ~ 3 の整数であり、そして X^1 、 X^2 および X^3 は、上で規定したようにして選択される)；

【化 10】



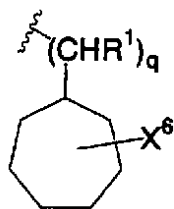
(ここで、 q は、0 ~ 3 の整数であり、そして X^4 は、 H 、2 - R^1 、3 - R^1 、2 - O 、3 - OH 、2 - NH_2 または 3 - NH_2 から選択される)；

【化 11】



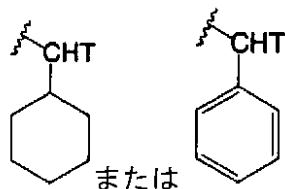
(ここで、 q は、0 ~ 3 の整数であり、そして X^5 は、2 - R^1 、3 - R^1 、4 - R^1 、2 - OH 、3 - OH 、4 - OH 、2 - NH_2 、3 - NH_2 または 4 - NH_2 から選択される)；

【化 1 2】



(ここで、 q は、0 ~ 3 の整数であり、そして X^6 は、H、2 - R^1 、3 - R^1 、4 - R^1 、2 - OH、3 - OH、4 - OH、2 - NH_2 、3 - NH_2 または 4 - NH_2 から選択される) ;

【化 1 3】

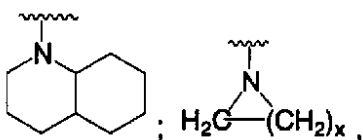


(ここで、 T は、 CO_2H 、 CH_2OH または $(CHR^1)_xNR^1_2$ であって、ここで、 x は、1 ~ 6 の整数である) から選択される ;

CH_2R^1 ; CH_2CF_3 ; $C(O)CHR^1NH_2$; CHR^1CH_2OH ; $(CHR^1)_xNR^1_2$ (ここで、 x は、1 ~ 6 の整数である) ;

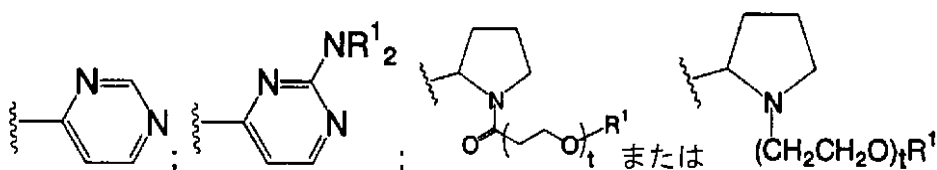
$C(O)Z^1$ または $(CHR^1)_zZ^1$ (ここで、 z は、0 ~ 6 の整数であり、そして Z^1 は、以下から選択される : NR^1_2 ;

【化 1 4】



(ここで、 x は、3 ~ 5 の整数である) ;

【化 1 5】

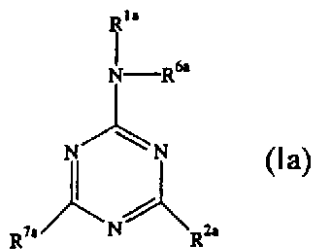


(ここで、 t は、0 ~ 6 の整数である)、
化合物。

【請求項 2】

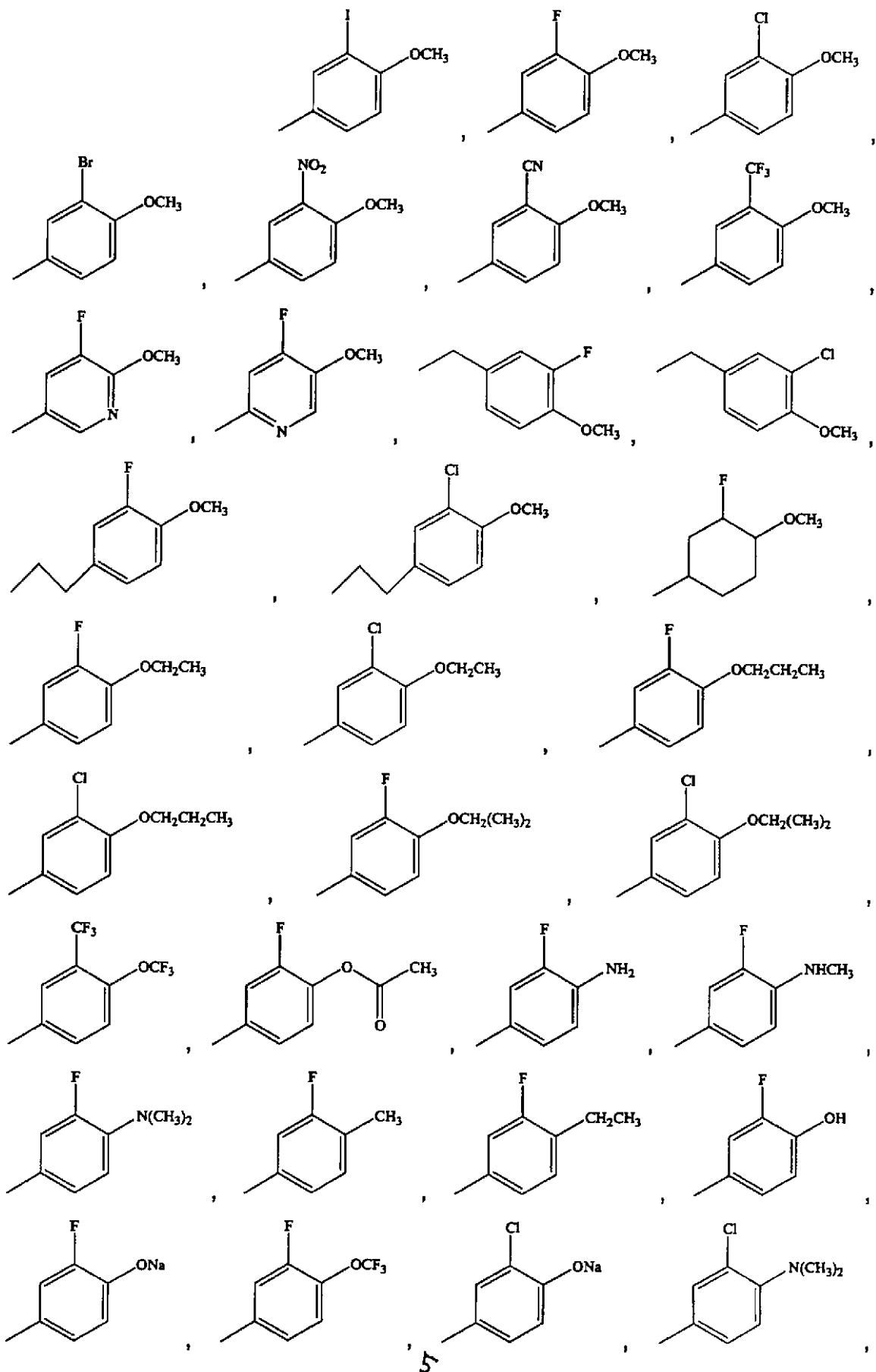
式 I a を有する請求項 1 の化合物、またはそれらの塩であって ;

【化 1 6】

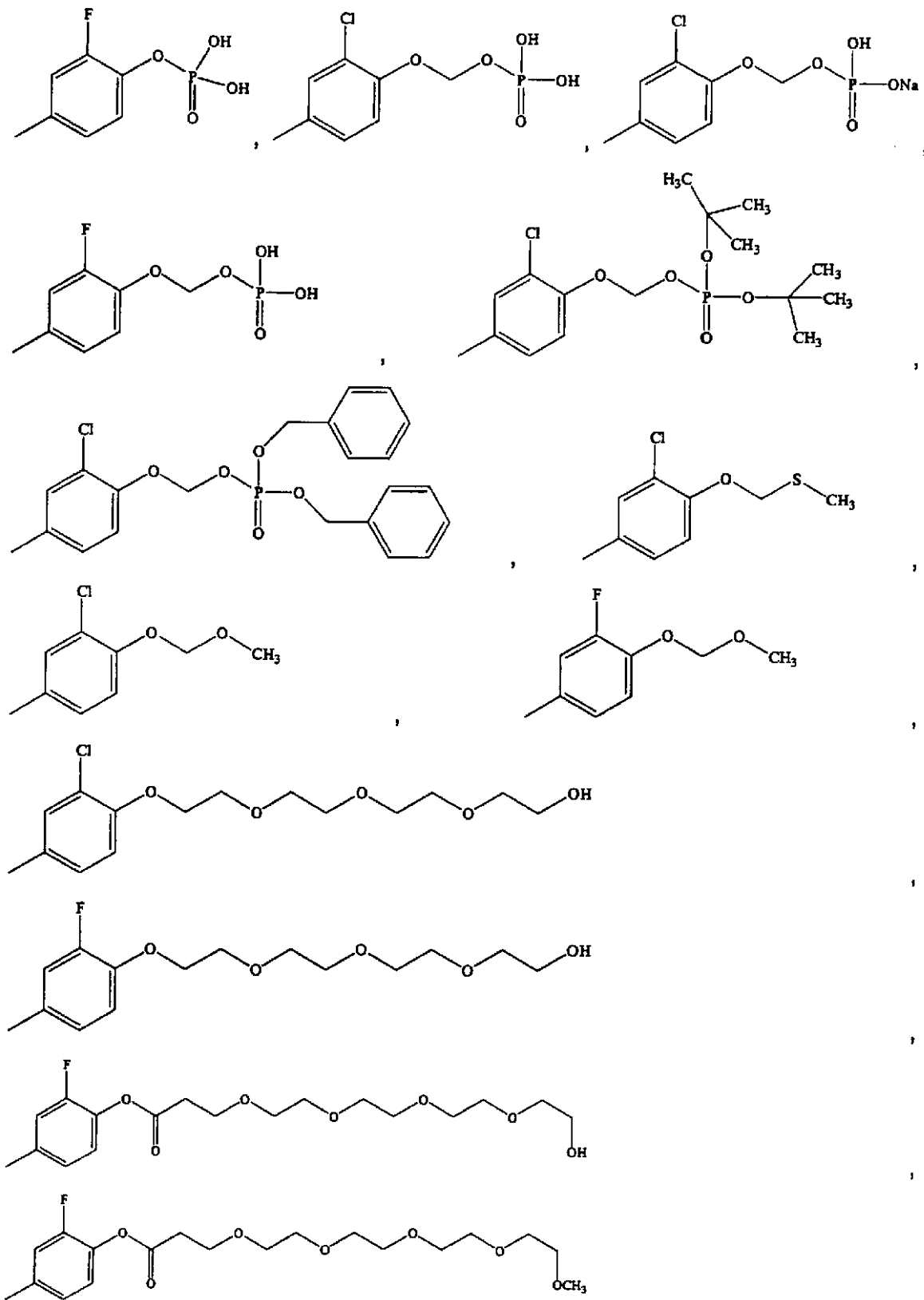


ここで、
 R^{1a} は、

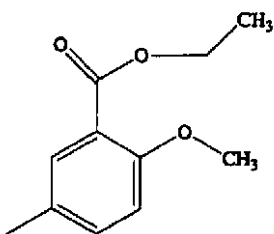
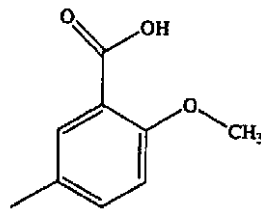
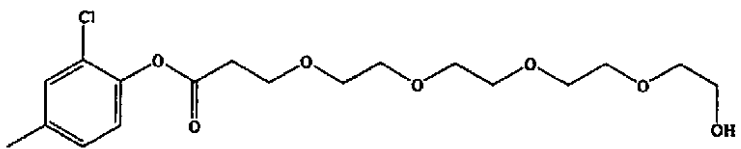
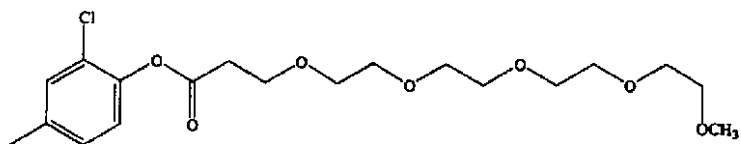
【化 17】



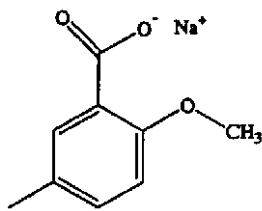
【化 18】



【化19】



, または

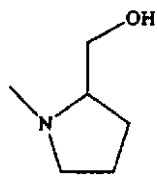
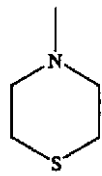
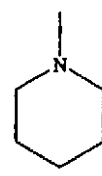
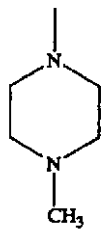
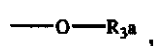
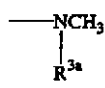


;

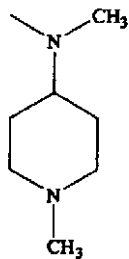
から選択される ;

R^{2a} は、

【化20】



, または

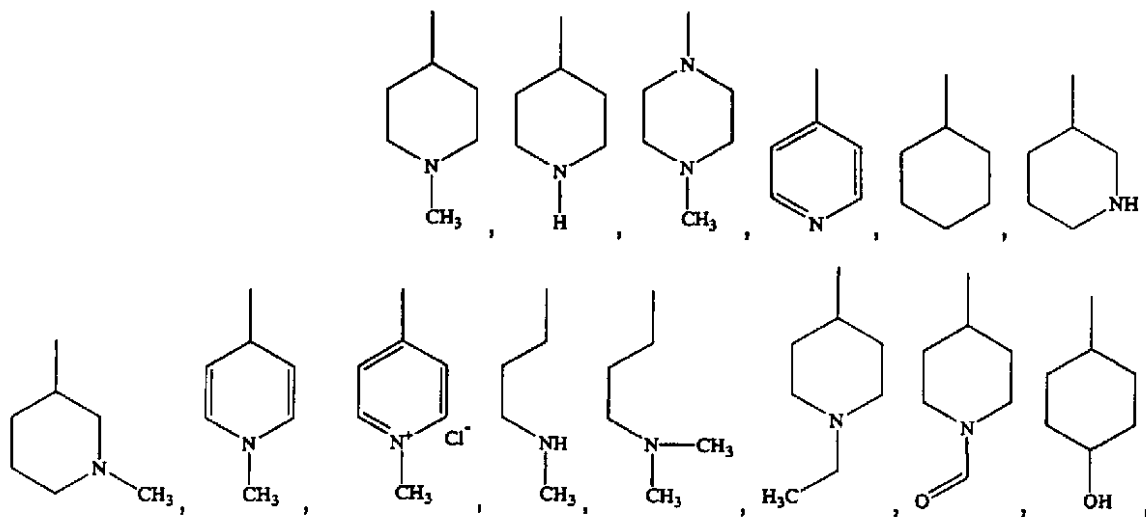


;

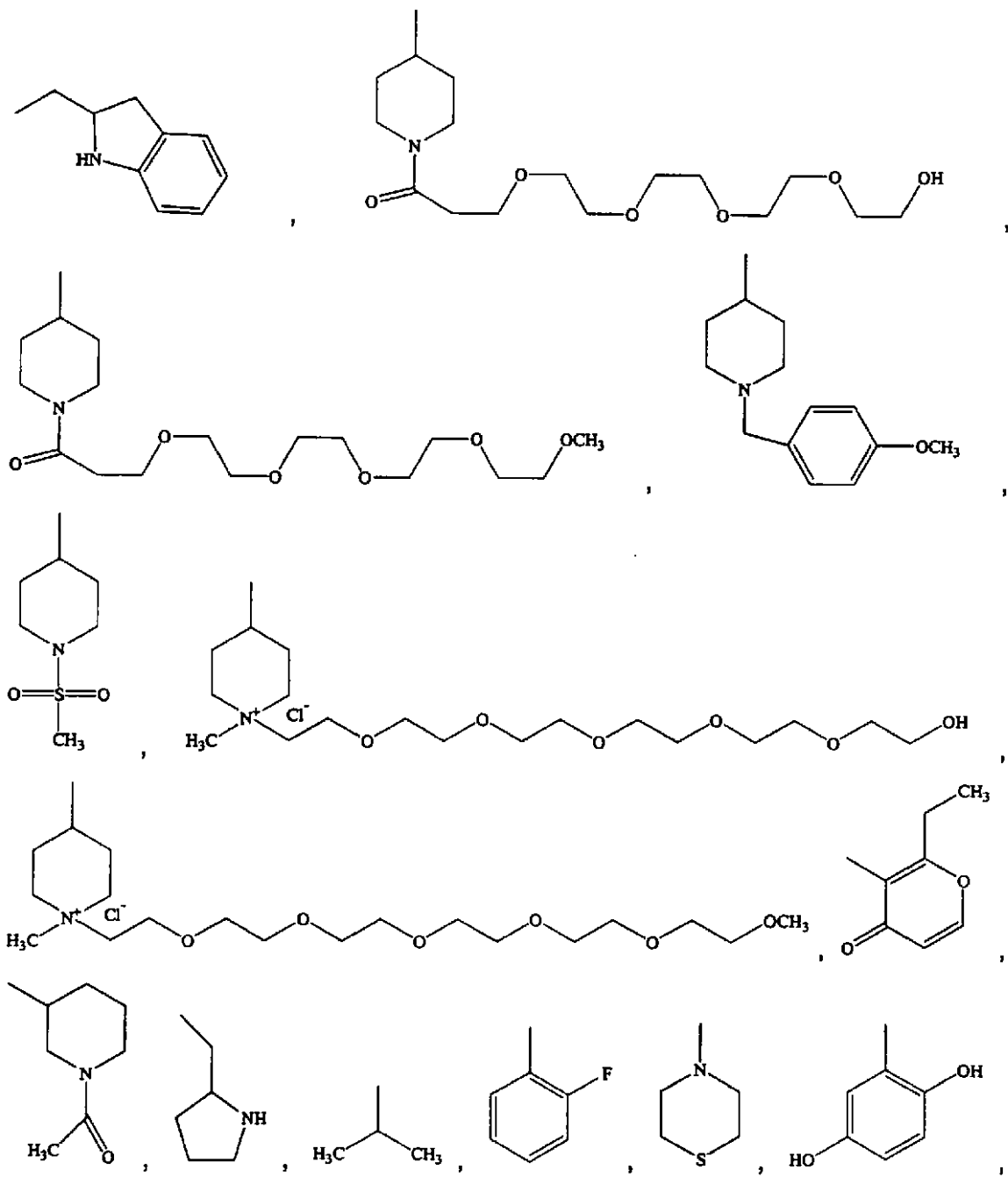
から選択される ;

R^{3a} は、- H、

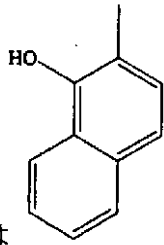
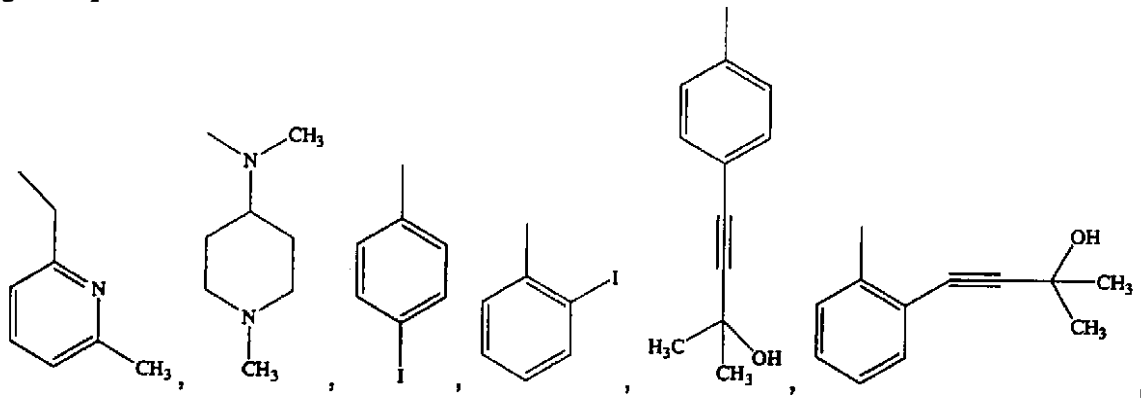
【化 2 1】



【化 2 3】



【化 2 4】



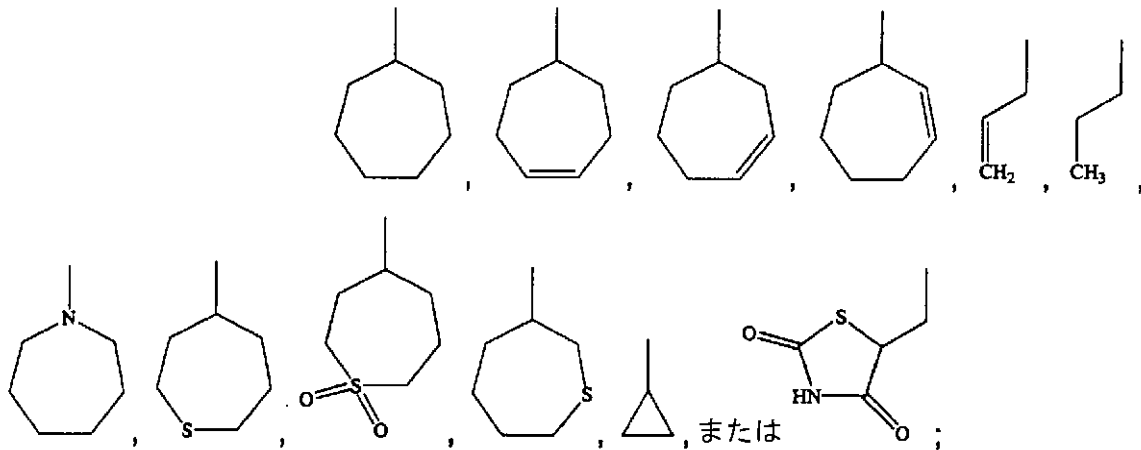
または ;

から選択される ;

R^{4a} は、-H または -CH₃ から選択される ;

R^{5a} は、

【化 2 5】

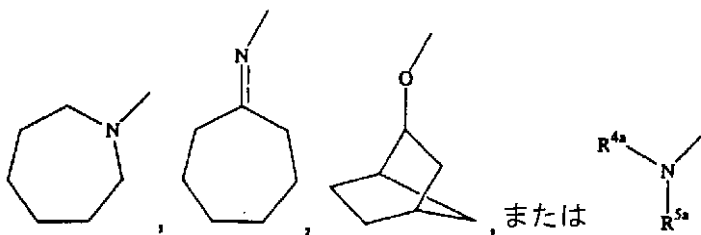


から選択される ;

R^{6a} は、-H または -CH₃ から選択される ; そして

R^{7a} は、

【化 2 6】

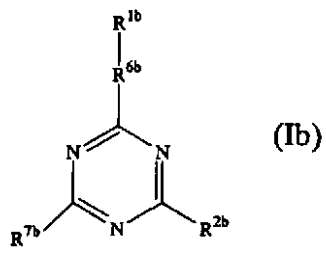


から選択される、
化合物。

【請求項 3】

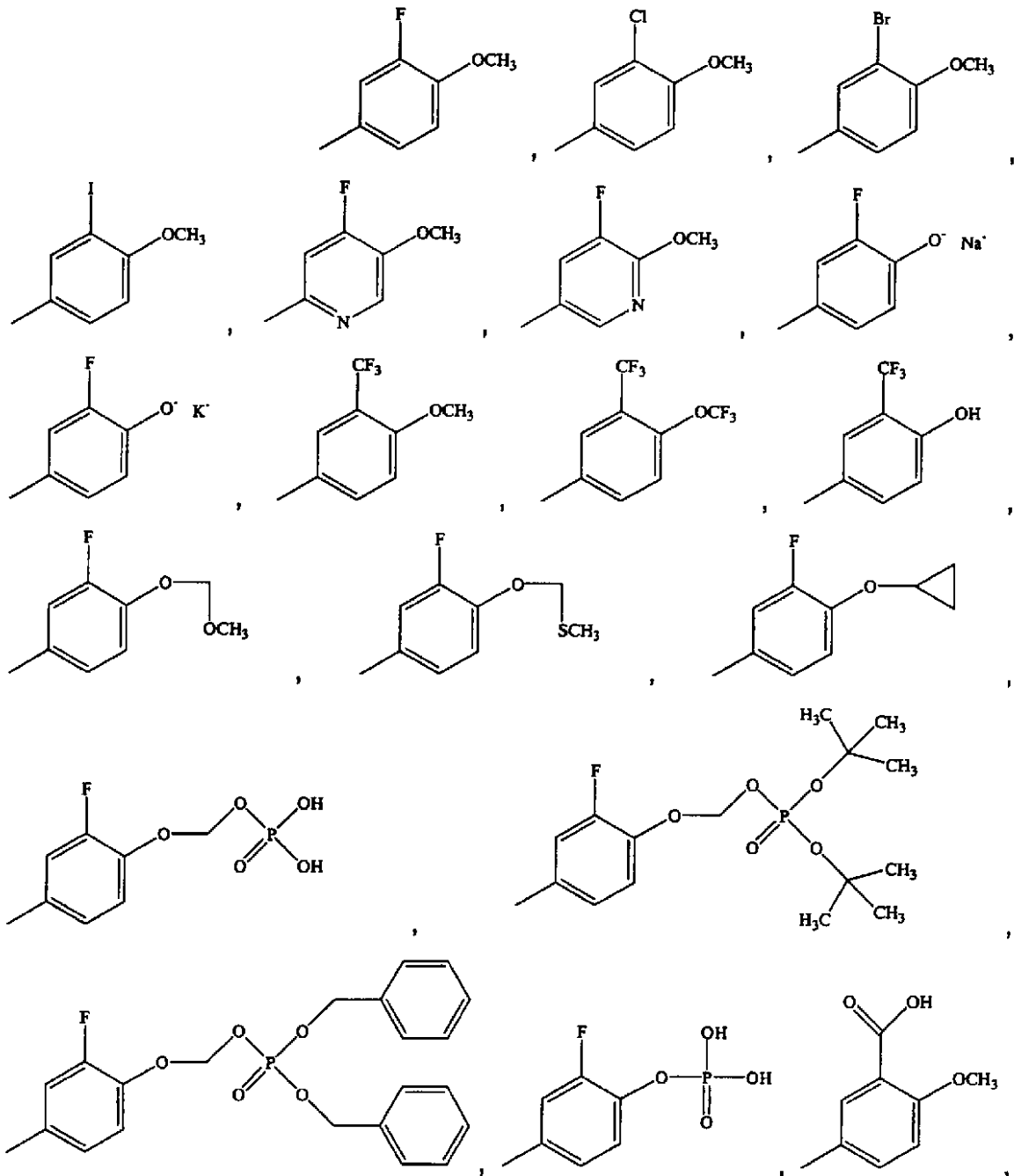
式 I b を有する請求項 1 の化合物、またはそれらの塩であって；

【化 27】

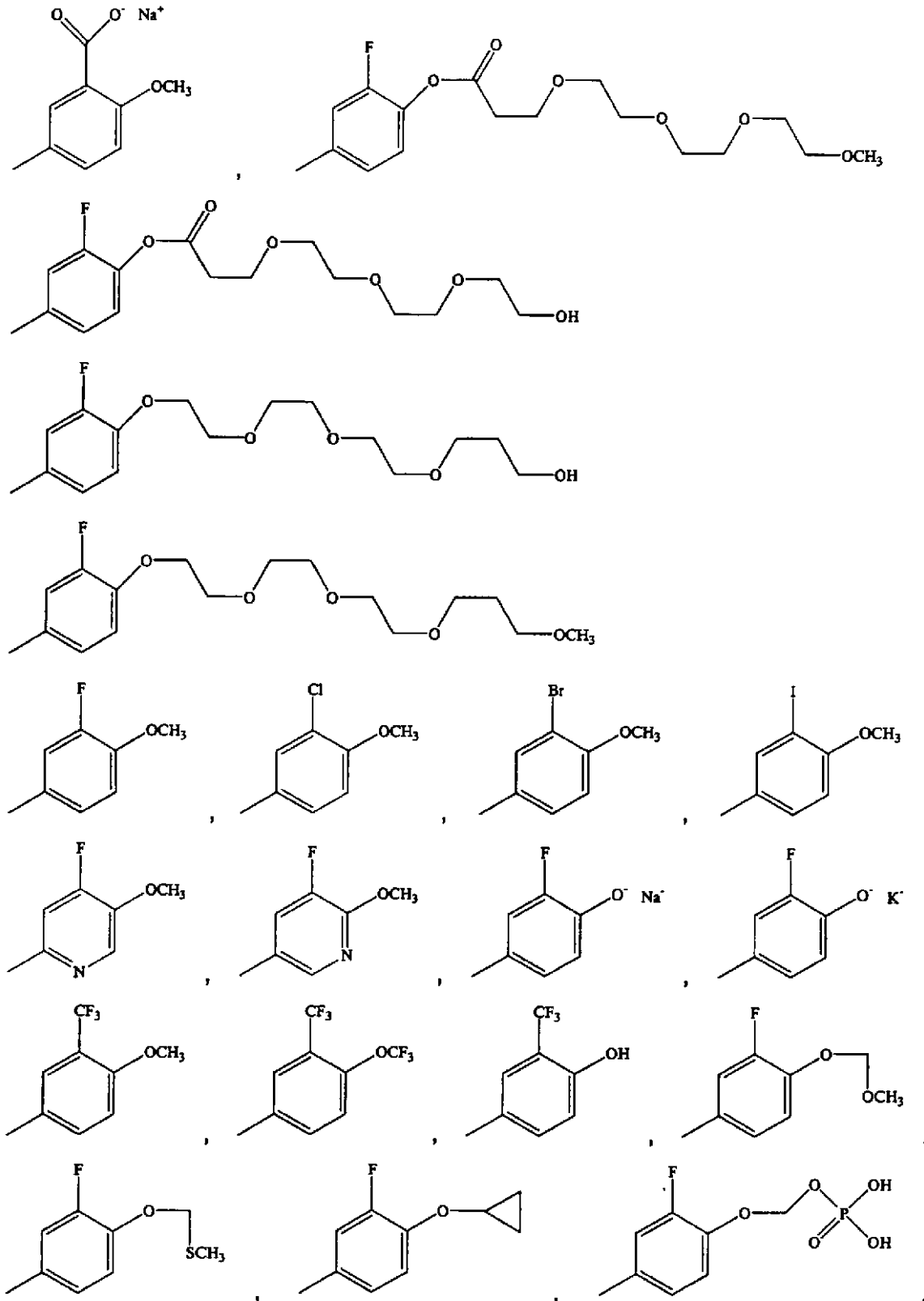


ここで、
R^{1b} は、

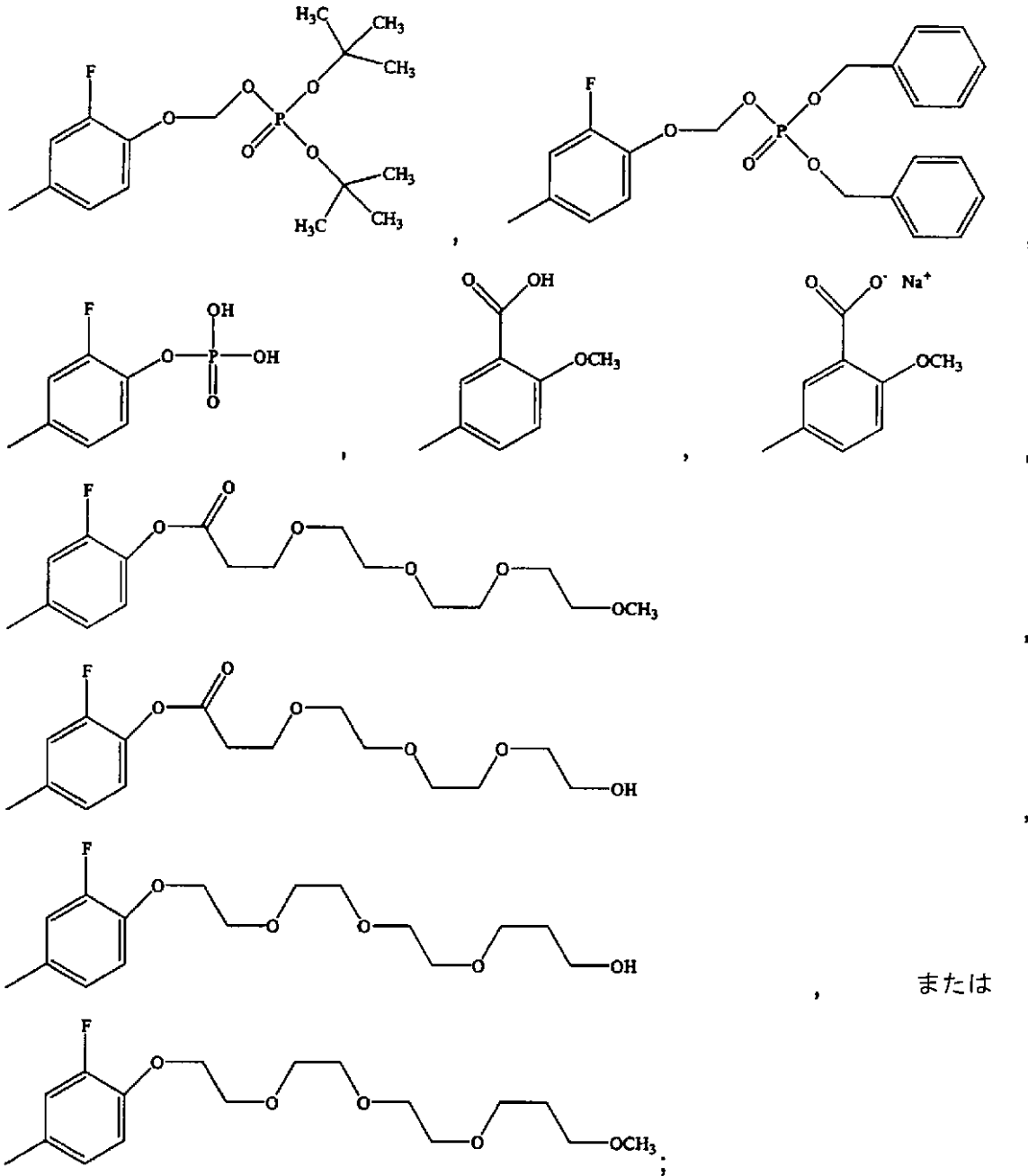
【化 28】



【化 29】



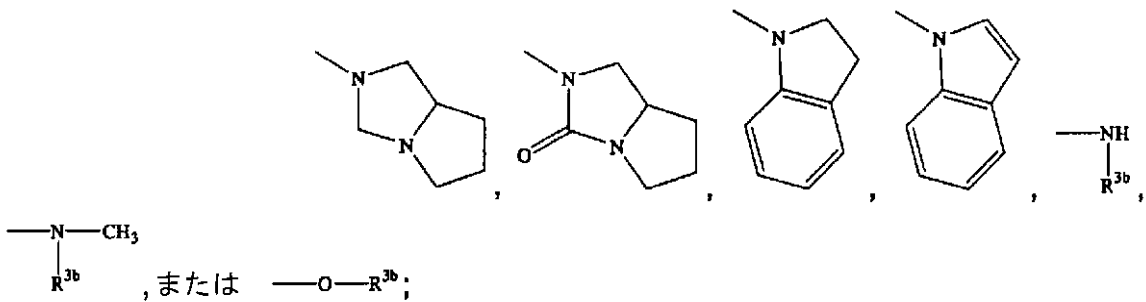
【化30-1】



から選択される；

R^{2b} は、

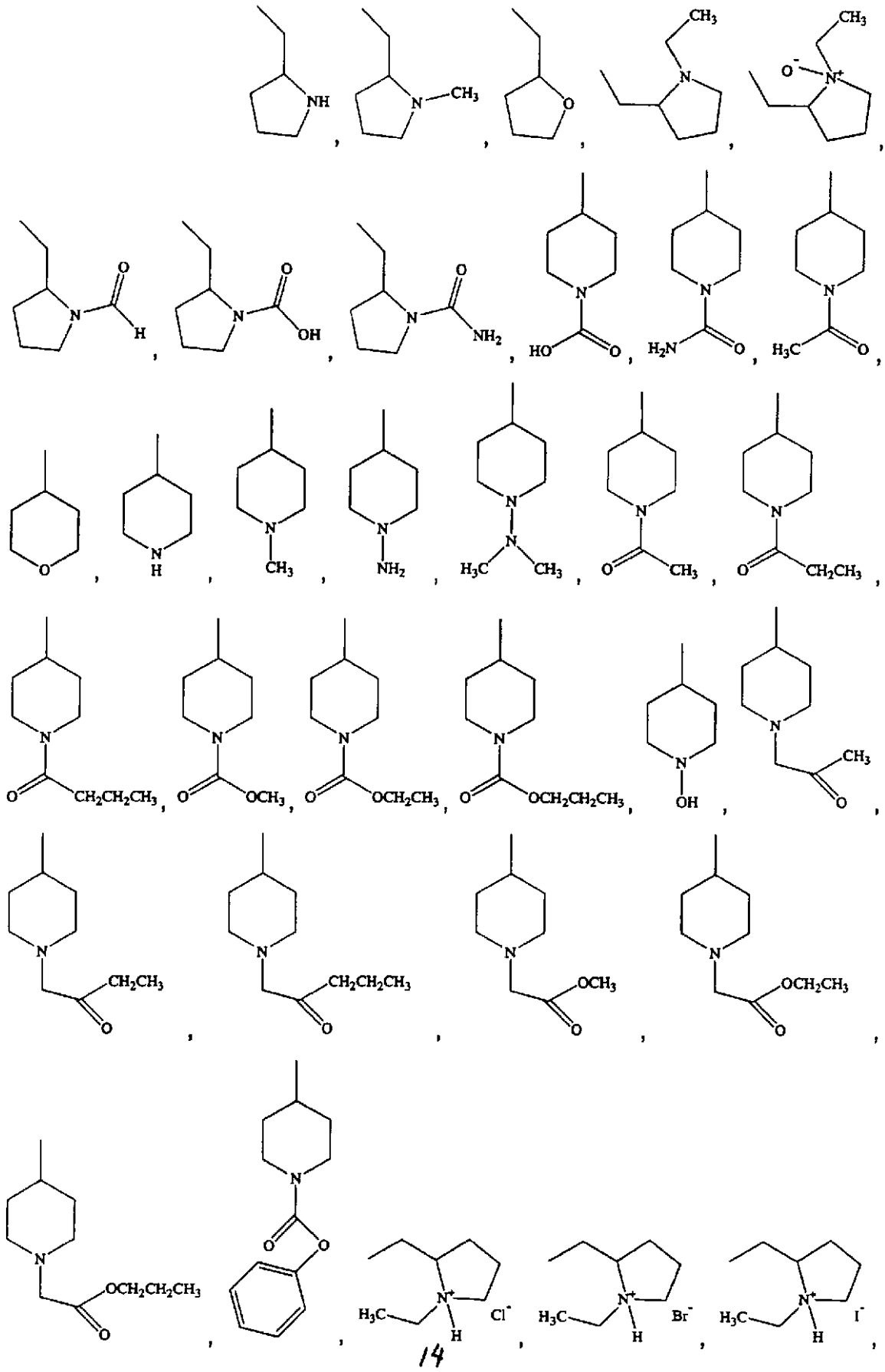
【化30-2】



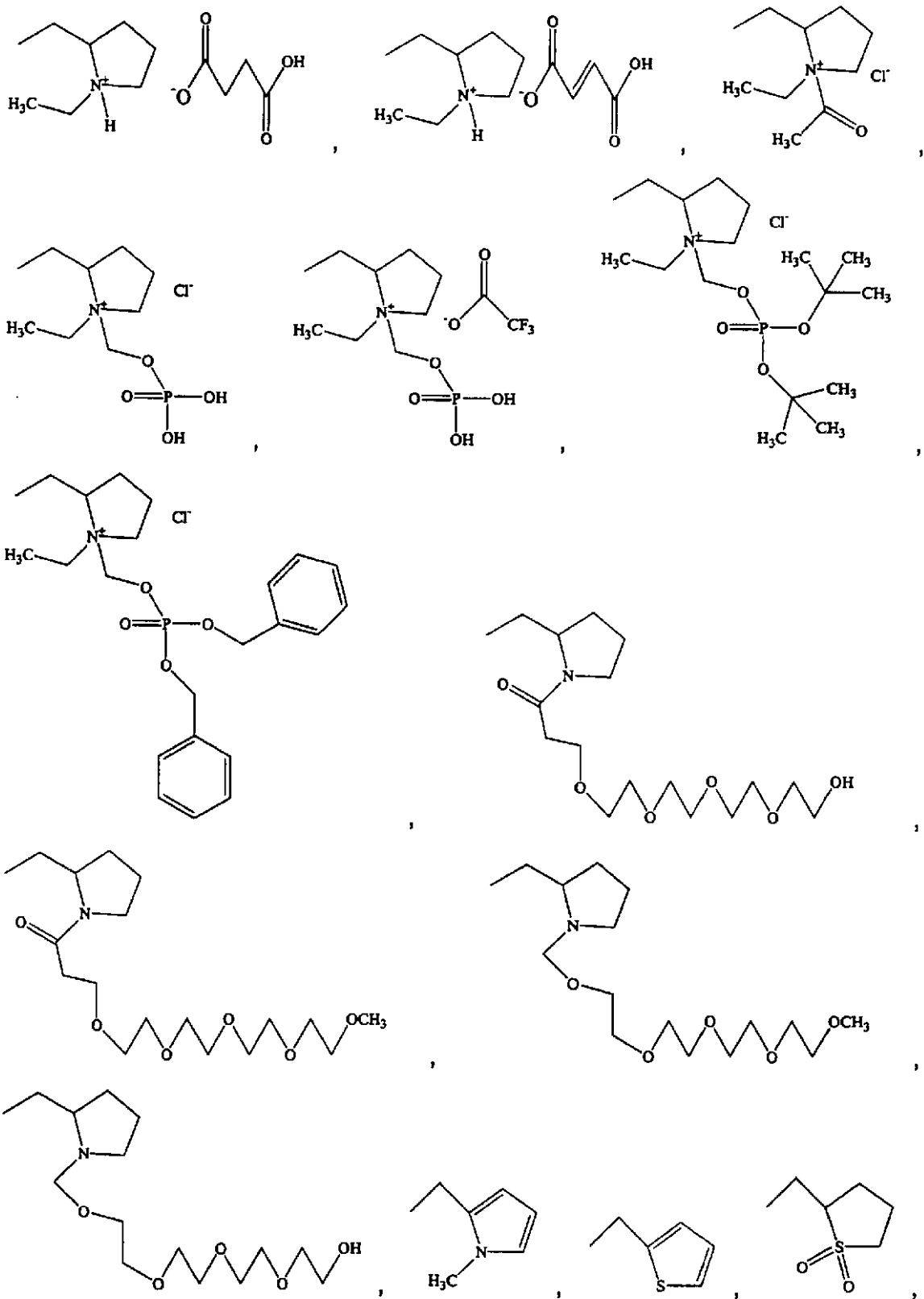
から選択される；

R^{3b} は、

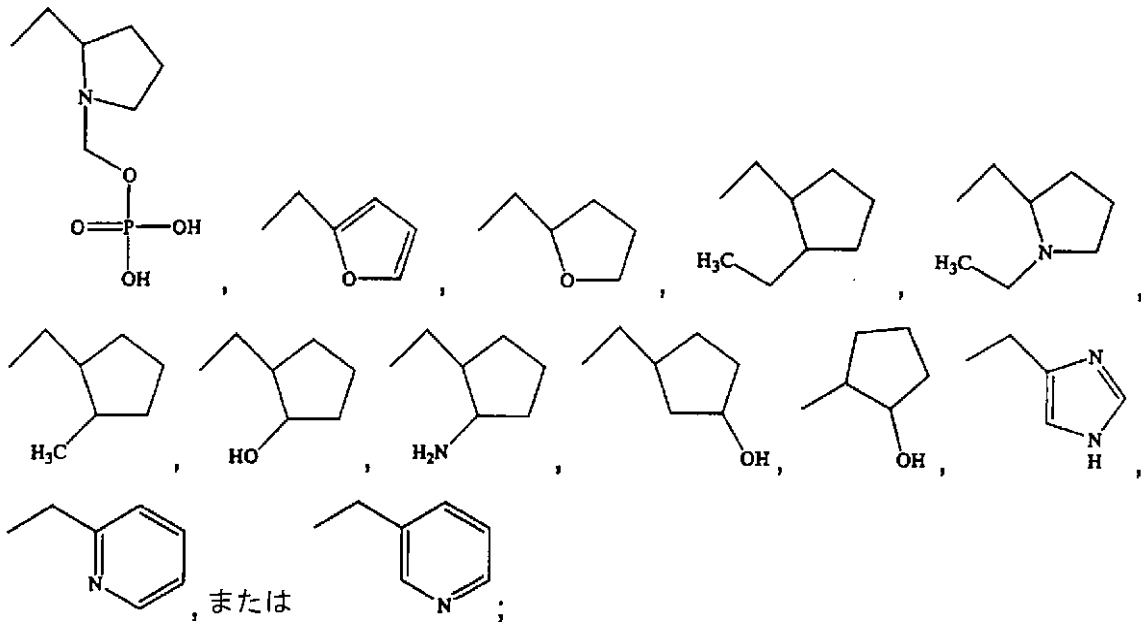
【化 3 1】



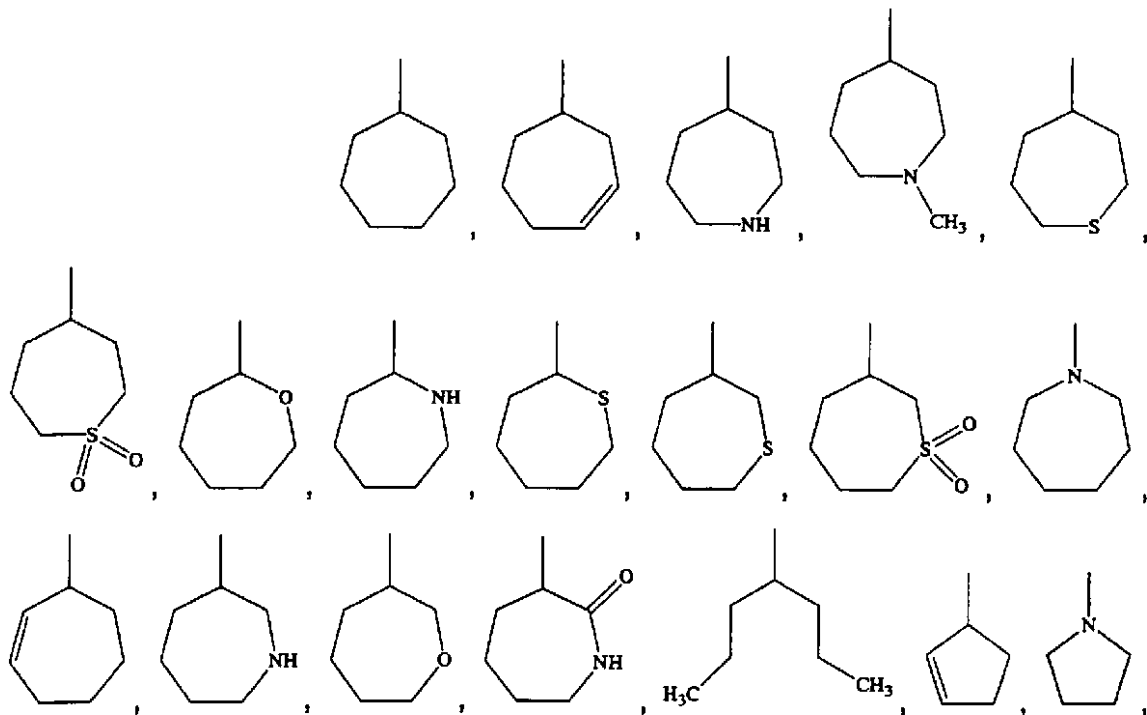
【化 3 2】



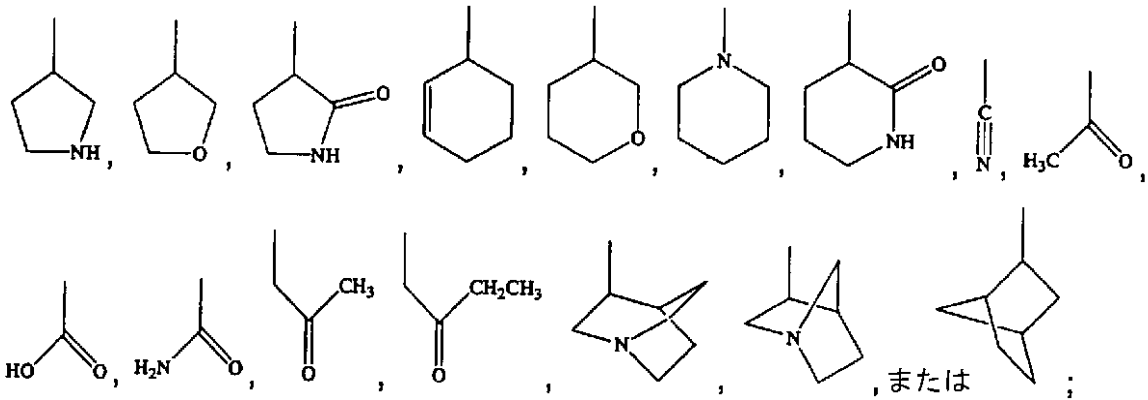
【化 3 3】



【化 3 4】



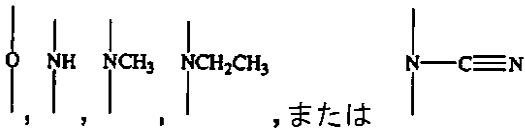
【化 3 5】



から選択される；

R^{6b} は、

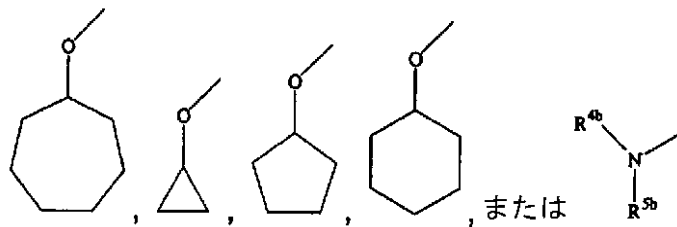
【化 3 6】



から選択される；そして

R^{7b} は、

【化 3 7】



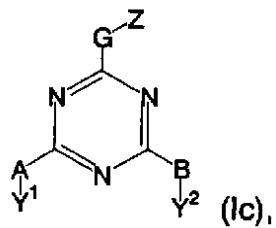
から選択される、

化合物。

【請求項 4】

式 I c を有する請求項 1 の化合物、またはそれらの塩であって；

【化 3 8】

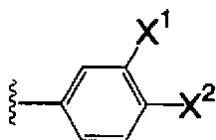


ここで、

G は、NH または O から選択される；

Z は、H または

【化 3 9】

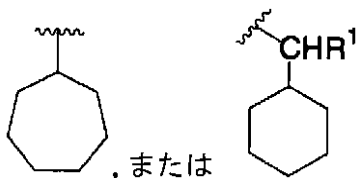


から選択され、ここで、 X^1 は、F または Cl から選択され、かつ X^2 は、 OCH_3 、 NH_2 、 $OC(O)CH_3$ または OH から選択される；

A は、 NR^1 または O から選択される；

Y^1 は、 R^1 、

【化 4 0】

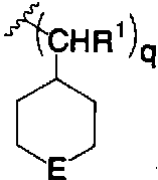


から選択される；

B は、 NR^1 または O から選択される；そして

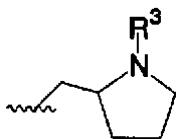
Y^2 は、

【化 4 1】



から選択され、ここで、 q は、0 または 1 であり、 E は、 O または NR^2 から選択され、ここで、 R^2 は、 R^1 、 OR^1 、 $C(O)R^1$ 、 $C(O)OR^1$ 、 $C(O)NH_2$ または CH_2NH_2 あるいは

【化 4 2】



(ここで、 R^3 は R^1 、 $C(O)R^1$ 、 $C(O)OR^1$ または $C(O)NH_2$ から選択される)

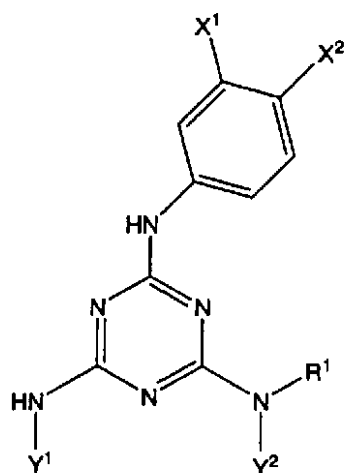
から選択され；

ここで、 R^1 は、各出現例において、別個に、H または 1 ~ 10 個の炭素原子を有する直鎖または分枝アルキルから選択される、化合物。

【請求項 5】

以下の式を有する請求項 1 の化合物、またはそれらの塩であって；

【化 4 3】

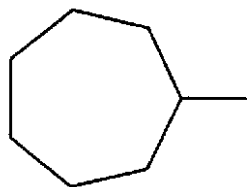


ここで、

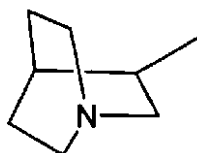
R^1 は、各出現例において、別個に、Hまたは1～10個の炭素原子を有する直鎖または分枝アルキルである；

Y^1 は、

【化 4 4】



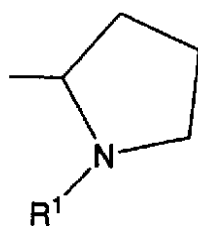
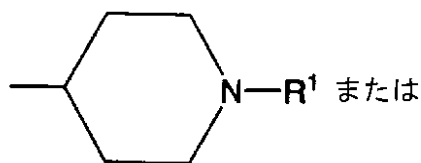
または



であり、

Y^2 は、

【化 4 5】



であり、

X^1 は、ハロゲンであり；そして

X^2 は、 OR^1 である、

化合物。

【請求項 6】

X^1 がフッ素または塩素である、請求項 5 に記載の化合物または塩。

【請求項 7】

X^2 が OH または メトキシである、請求項 5 に記載の化合物または塩。

【請求項 8】

X^1 が塩素であり、かつ X^2 が メトキシである、請求項 5 に記載の化合物または塩。

【請求項 9】

N^2 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシ - フェニル) - N^4 - シクロヘプチル - N^6 - メチル - N^6 - (1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル) - 1, 3, 5 - トリアジン - 2, 4, 6 - トリアミンまたはその塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

N^2 - シクロヘブチル - N^4 - ((S) - 1 - エチル - ピロリジン - 2 - イル - メチル) - N^6 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシ - フェニル) - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 , 4 , 6 - トリアミンまたはその塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

N^2 - シクロヘブチル - N^4 - ((R) - 1 - エチル - ピロリジン - 2 - イル - メチル) - N^6 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシ - フェニル) - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 , 4 , 6 - トリアミンまたはその塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 12】

N^2 - (3 - クロロ - 4 - メトキシ - フェニル) - N^4 - シクロヘブチル - N^6 - メチル - N^6 - (1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル) - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 , 4 , 6 - トリアミンまたはその塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 13】

N^2 - (1 - アザ - ビシクロ [2 . 2 . 2] オクタ - 3 - イル) - N^4 - (3 - クロロ - 4 - メトキシ - フェニル) - N^4 - (1 - エチル - ピロリジン - 2 - イル - メチル) - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 , 4 , 6 - トリアミンまたはその塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 14】

N^2 - (3 - クロロ - 4 - メトキシ - フェニル) - N^4 - シクロヘブチル - N^6 - メチル - N^6 - (ピペリジン - 4 - イル) - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 , 4 , 6 - トリアミンまたはその塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 15】

2 - クロロ - 4 - { 4 - シクロヘブチルアミノ - 6 - [メチル - (1 - メチル - ピペリジン - 4 - イル) アミノ] - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 - イル } - アミノフェノールまたはその塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 16】

N^2 - (3 - クロロ - 4 - メトキシ - フェニル) - N^4 - シクロヘブチル - N^6 - (ピペリジン - 4 - イル) - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 , 4 , 6 - トリアミンまたはその塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 17】

N^2 - シクロヘブチル - N^4 - (3 - フルオロ - 4 - メトキシ - フェニル) - N^6 - メチル - N^6 - (ピペリジン - 4 - イル) - 1 , 3 , 5 - トリアジン - 2 , 4 , 6 - トリアミン、またはその塩である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 18】

請求項 1 ~ 17 のいずれかに記載の化合物またはその塩、薬学的に受容可能なキャリア、ならびに、必要に応じて、1 種以上の薬学的に受容可能な補助剤、保存剤または賦形剤を含む、薬学的組成物。