

【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2月16日(2006.2.16)

【公表番号】特表2002-508358(P2002-508358A)

【公表日】平成14年3月19日(2002.3.19)

【出願番号】特願2000-538992(P2000-538992)

【国際特許分類】

C 07 D 213/56 (2006.01)  
A 61 K 31/404 (2006.01)  
A 61 K 31/4184 (2006.01)  
A 61 K 31/426 (2006.01)  
A 61 K 31/4406 (2006.01)  
A 61 K 31/4409 (2006.01)  
A 61 K 31/47 (2006.01)  
A 61 K 31/4965 (2006.01)  
A 61 K 31/50 (2006.01)  
A 61 K 31/505 (2006.01)  
A 61 P 35/00 (2006.01)  
C 07 D 209/18 (2006.01)  
C 07 D 215/12 (2006.01)  
C 07 D 235/08 (2006.01)  
C 07 D 237/08 (2006.01)  
C 07 D 239/26 (2006.01)  
C 07 D 241/12 (2006.01)  
C 07 D 257/02 (2006.01)  
C 07 D 277/20 (2006.01)  
C 07 D 277/30 (2006.01)

【F I】

C 07 D 213/56  
A 61 K 31/404  
A 61 K 31/4184  
A 61 K 31/426  
A 61 K 31/4406  
A 61 K 31/4409  
A 61 K 31/47  
A 61 K 31/4965  
A 61 K 31/50  
A 61 K 31/505  
A 61 P 35/00  
C 07 D 209/18  
C 07 D 215/12  
C 07 D 235/08  
C 07 D 237/08  
C 07 D 239/26  
C 07 D 241/12  
C 07 D 257/02  
C 07 D 277/30

【手続補正書】

【提出日】平成17年10月6日(2005.10.6)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

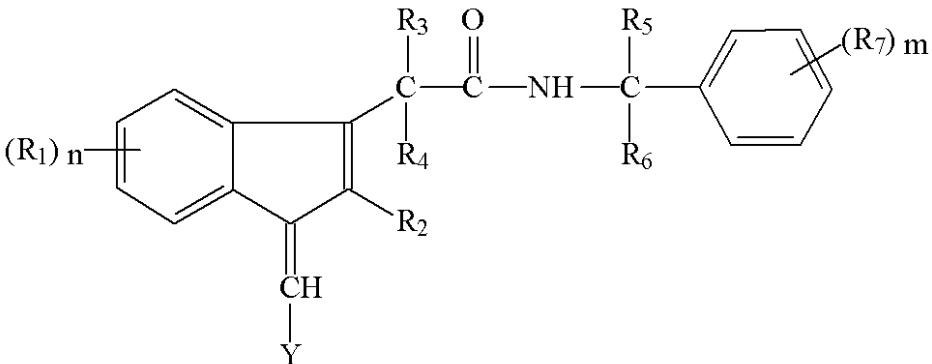
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 下記式の化合物及び薬剤学的に容認できるその塩。

【化1】



式中、R<sub>1</sub>は、水素、ハロゲン、低級アルキル、低級アルコキシ、アミノ、低級アルキルアミノ、ジ-低級アルキルアミノ、低級アルキルメルカブト、低級アルキルスルホニル、シアノ、カルボキサミド、カルボン酸、メルカブト、スルホン酸、キサンテート及びヒドロキシからなる群から各々独立して選択され、

R<sub>2</sub>は、水素及び低級アルキルからなる群から選択され、

R<sub>3</sub>は、水素、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、低級アルキルアミノ及びジ-低級アルキルアミノからなる群から選択され、

R<sub>4</sub>は水素であり、又はR<sub>3</sub>とR<sub>4</sub>はあわせて酸素であり、

R<sub>5</sub>及びR<sub>6</sub>は、水素、低級アルキル、ヒドロキシ置換した低級アルキル、アミノ低級アルキル、低級アルキルアミノ-低級アルキル、低級アルキルアミノジ-低級アルキル、低級アルキルニトリル、-CO<sub>2</sub>H、-C(O)NH<sub>2</sub>、及びC<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アミノ酸からなる群から独立して選択され、

R<sub>7</sub>は、水素、アミノ低級アルキル、低級アルコキシ、低級アルキル、ヒドロキシ、アミノ、低級アルキルアミノ、ジ-低級アルキルアミノ、アミノ低級アルキル、ハロゲン、-CO<sub>2</sub>H、-SO<sub>3</sub>H、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>及びSO<sub>2</sub>(低級アルキル)からなる群から各々独立して選択され、

m及びnは、互いに独立して選択された0~3の整数であり、

Yは、キノリニル、イソキノリニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、イミダゾリル、インドリル、ベンズイミダゾリル、トリアジニル、テトラゾリル、チオフェニル、フラニル、チアゾリル、ピラゾリル又はピロリル、又は置換基がハロゲン、低級アルキル、低級アルコキシ、アミノ、低級アルキルアミノ、ジ-低級アルキルアミノ、ヒドロキシ、-SO<sub>2</sub>(低級アルキル)及び-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>からなる群から選択された一つ又は二つである、それらの置換変異体からなる群から選択される。

【請求項2】 Yがピリジニル又はキノロニルから選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】 R<sub>1</sub>がハロゲン、低級アルコキシ、アミノ、ヒドロキシ、低級アルキルアミノ及びジ-低級アルキルアミノ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4】 R<sub>2</sub>が低級アルキルである請求項1に記載の化合物。

【請求項5】 R<sub>3</sub>が水素、ハロゲン、ヒドロキシ、アミノ、低級アルキルアミノ及びジ-低級アルキルアミノ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 6】  $R_3$  が水素、ヒドロキシ及び低級アルキルアミノからなる群から選択される、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】  $R_5$  及び  $R_6$  が水素、ヒドロキシ置換した低級アルキル、アミノ低級アルキル、低級アルキルアミノ-低級アルキル、低級アルキルアミノジ-低級アルキル、- $CO_2H$  及び  $C(O)NH_2$  からなる群から独立して選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】  $R_5$  及び  $R_6$  が水素、ヒドロキシ置換した低級アルキル、低級アルキルアミノジ-低級アルキル、- $CO_2H$  及び  $C(O)NH_2$  からなる群から独立して選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】  $R_7$  が、水素、低級アルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、低級アルキルアミノ、ジ-低級アルキルアミノ、ハロゲン、- $CO_2H$ 、- $SO_3H$ 、- $SO_2NH_2$ 、アミノ低級アルキル及び- $SO_2$  (低級アルキル) からなる群から各々独立して選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】  $R_7$  が、水素、低級アルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、ハロゲン、- $CO_2H$ 、- $SO_3H$ 、- $SO_2NH_2$ 、アミノ低級アルキル及び- $SO_2$  (低級アルキル) からなる群から各々独立して選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】 少なくとも一つの  $R_7$  置換基がオルト又はパラ位置にある、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】 少なくとも一つの  $R_7$  置換基がオルト位置にある、請求項 11 に記載の化合物。

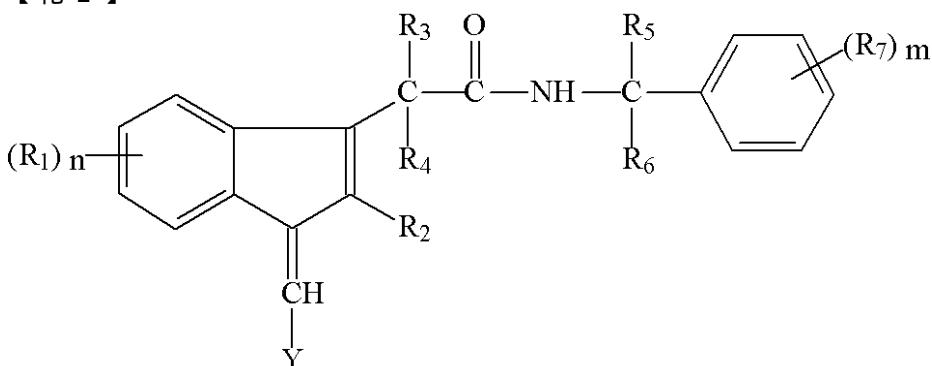
【請求項 13】  $Y$  がキノリニル、イソキノリニル、ピリジニル、ピリミジニル及びピラジニル又はそれらの該置換変異体からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 14】  $Y$  の置換基が低級アルコキシ、アミノ、低級アルキルアミノ、ジ-低級アルキルアミノ、ヒドロキシ、- $SO_2$  (低級アルキル) 及び- $SO_2NH_2$  からなる群から選択された一つ又は二つである、請求項 13 に記載の化合物。

【請求項 15】  $Y$  の置換基が低級アルコキシ、ジ-低級アルキルアミノ、ヒドロキシ、- $SO_2$  (低級アルキル) 及び- $SO_2NH_2$  からなる群から選択された一つ又は二つである、請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 16】 薬剤学的に容認できる担体並びに下記式の化合物及び薬剤学的に容認できるその塩からなる、薬剤組成物。

【化 2】



式中、 $R_1$  は、水素、ハロゲン、低級アルキル、低級アルコキシ、アミノ、低級アルキルアミノ、ジ-低級アルキルアミノ、低級アルキルメルカプト、低級アルキルスルホニル、シアノ、カルボキサミド、カルボン酸、メルカプト、スルホン酸、キサンテート及びヒドロキシからなる群から各々独立して選択され、

$R_2$ は、水素及び低級アルキルからなる群から選択され、

$R_3$ は、水素、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシ、低級アルキルアミノ及びジ-低級アルキルアミノからなる群から選択され、

$R_4$ は水素であり、又は $R_3$ と $R_4$ はあわせて酸素であり、

$R_5$ 及び $R_6$ は、水素、低級アルキル、ヒドロキシ置換した低級アルキル、アミノ低級アルキル、低級アルキルアミノ-低級アルキル、低級アルキルアミノジ-低級アルキル、低級アルキルニトリル、-CO<sub>2</sub>H、-C(O)NH<sub>2</sub>、及びC<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>アミノ酸からなる群から独立して選択され、

$R_7$ は、水素、アミノ低級アルキル、低級アルコキシ、低級アルキル、ヒドロキシ、アミノ、低級アルキルアミノ、ジ-低級アルキルアミノ、アミノ低級アルキル、ハロゲン、-CO<sub>2</sub>H、-SO<sub>3</sub>H、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>及び-SO<sub>2</sub>(低級アルキル)からなる群から各々独立して選択され、

$m$ 及び $n$ は、互いに独立して選択された0~3の整数であり、

Yは、キノリニル、イソキノリニル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、イミダゾリル、インドリル、ベンズイミダゾリル、トリアジニル、テトラゾリル、チオフェニル、フラニル、チアゾリル、ピラゾリル又はピロリル、又は置換基がハロゲン、低級アルキル、低級アルコキシ、アミノ、低級アルキルアミノ、ジ-低級アルキルアミノ、ヒドロキシ、-SO<sub>2</sub>(低級アルキル)及び-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>からなる群から選択された一つ又は二つである、それらの置換変異体からなる群から選択される。

【請求項17】 Yがピリジニル又はキノロニルから選択される、請求項16に記載の薬剤組成物。

【請求項18】  $R_1$ がハロゲン、低級アルコキシ、アミノ、ヒドロキシ、低級アルキルアミノ及びジ-低級アルキルアミノからなる群から選択される、請求項16に記載の薬剤組成物。

【請求項19】  $R_2$ が低級アルキルである、請求項16に記載の薬剤組成物。

【請求項20】  $R_3$ が水素、ハロゲン、ヒドロキシ、アミノ、低級アルキルアミノ及びジ-低級アルキルアミノからなる群から選択される、請求項16に記載の薬剤組成物。

【請求項21】  $R_3$ が水素、ヒドロキシ及び低級アルキルアミノからなる群から選択される、請求項20に記載の薬剤組成物。

【請求項22】  $R_5$ 及び $R_6$ が水素、ヒドロキシ置換した低級アルキル、アミノ低級アルキル、低級アルキルアミノ-低級アルキル、低級アルキルアミノジ-低級アルキル、-CO<sub>2</sub>H及び-C(O)NH<sub>2</sub>からなる群から独立して選択される、請求項16に記載の薬剤組成物。

【請求項23】  $R_5$ 及び $R_6$ が水素、ヒドロキシ置換した低級アルキル、低級アルキルアミノジ-低級アルキル、-CO<sub>2</sub>H及び-C(O)NH<sub>2</sub>からなる群から独立して選択される、請求項16に記載の薬剤組成物。

【請求項24】  $R_7$ が、水素、低級アルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、低級アルキルアミノ、ジ-低級アルキルアミノ、ハロゲン、-CO<sub>2</sub>H、-SO<sub>3</sub>H、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、アミノ低級アルキル及び-SO<sub>2</sub>(低級アルキル)からなる群から各々独立して選択される、請求項16に記載の薬剤組成物。

【請求項25】  $R_7$ が、水素、低級アルコキシ、ヒドロキシ、アミノ、ハロゲン、-CO<sub>2</sub>H、-SO<sub>3</sub>H、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、アミノ低級アルキル及び-SO<sub>2</sub>(低級アルキル)からなる群から各々独立して選択される、請求項16に記載の薬剤組成物。

【請求項26】 少なくとも一つの $R_7$ 置換基がオルト又はパラ位置にある、請求項25に記載の薬剤組成物。

【請求項27】 少なくとも一つの $R_7$ 置換基がオルト位置にある、請求項26に記載の薬剤組成物。

【請求項28】 Yがキノリニル、イソキノリニル、ピリジニル、ピリミジニル及びピラジニル又はそれらの該置換変異体からなる群から選択される、請求項16に記載の薬

剤組成物。

【請求項 2\_9】 Yの置換基が低級アルコキシ、アミノ、低級アルキルアミノ、ジ-低級アルキルアミノ、ヒドロキシ、-SO<sub>2</sub>（低級アルキル）及び-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>からなる群から選択された一つ又は二つである、請求項 2\_8 に記載の薬剤組成物。

【請求項 3\_0】 Yの置換基が低級アルコキシ、ジ-低級アルキルアミノ、ヒドロキシ、-SO<sub>2</sub>（低級アルキル）及び-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>からなる群から選択された一つ又は二つである、請求項 2\_8 に記載の薬剤組成物。

【請求項 3\_1】 (Z)-5-フルオロ-2-メチル-(4-ピリジリデン)-3-(N-ベンジル)インデニルアセトアミド塩酸塩。