

【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11月11日(2010.11.11)

【公表番号】特表2010-505794(P2010-505794A)

【公表日】平成22年2月25日(2010.2.25)

【年通号数】公開・登録公報2010-008

【出願番号】特願2009-530875(P2009-530875)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/497 (2006.01)

A 6 1 P 3/12 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 21/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 13/10 (2006.01)

A 6 1 P 13/02 (2006.01)

A 6 1 P 15/10 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/08 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 21/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/02 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 15/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/14 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 29/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/04 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D	401/04	C S P
C 0 7 D	403/04	
A 6 1 K	31/506	
A 6 1 P	43/00	1 2 3
A 6 1 K	31/517	
A 6 1 K	31/4439	
A 6 1 K	31/497	
A 6 1 P	3/12	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	21/02	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	13/10	
A 6 1 P	13/02	
A 6 1 P	15/10	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	1/10	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/24	
A 6 1 P	25/18	
A 6 1 P	25/22	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	15/00	
A 6 1 P	9/08	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	9/06	
A 6 1 P	9/12	
A 6 1 P	21/04	
A 6 1 P	1/02	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	15/06	
A 6 1 P	17/14	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	25/06	
A 6 1 P	29/02	
A 6 1 P	25/04	
A 6 1 P	11/06	

【手続補正書】

【提出日】平成22年9月21日(2010.9.21)

【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

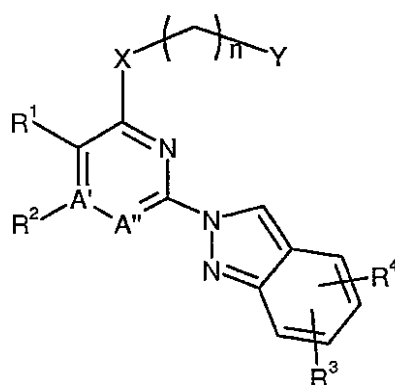
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

(1a)



(1b)

(式中、

X は、O、S、又はNR'を表し、

R' は、水素、アルキル、シクロアルキル、又はシクロアルキル - アルキルを表し、

Yは、アルキル、アルキル - シクロアルキル、シクロアルキル、シクロアルキル - アルキル、アミノ - アルキル、アルキル - アミノ、アルキル - アミノ - アルキル、ヒドロキシ - アルキル、アルコキシ - アルキル、アルケニル、又はフェニルを表し、そのフェニルは、アルキル、アミノ - アルキル、アルキル - アミノ、アルキル - アミノ - アルキル、ヒドロキシ - アルキル、アルコキシ - アルキル、シクロアルキル、シクロアルキル - アルキル、アルケニル、ハロ、ハロアルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、シアノ、ニトロ、及びアミノからなる群から選択される置換基で、1回又は複数回任意選択で置換されていてもよく、

A' は、 N 又は CR^2 を表し、 R^2 は下記定義の通りであり、

A" は、N 又は CH を表し、

但し、 A' 及び A'' の一方のみは N を表し、

R¹、R²、R³、及びR⁴は、互いに独立に、水素、アルキル、アミノ-アルキル、アルキル-アミノ、アルキル-アミノ-アルキル、アルキル-カルボニル-アミノ、ヒドロキシ-アルキル、アルコキシ-アルキル、シクロアルキル、シクロアルキル-アルキル、アルケニル、ハロ、ハロアルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルコキシ-カルボニル、シアノ、ニトロ、及びアミノを表し、又は

R¹ 及び R² は、それらが結合する芳香族複素環と一緒にあってベンゾ縮合環を形成し

R³ 及び R⁴ は、互いに独立に、水素、アルキル、アミノ - アルキル、アルキル - アミノ、アルキル - アミノ - アルキル、アルキル - カルボニル - アミノ、ヒドロキシ - アルキル、アルコキシ - アルキル、シクロアルキル、シクロアルキル - アルキル、アルケニル、ハロ、ハロアルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルコキシ - カルボニル、シアノ、ニトロ、及びアミノを表す）。

【請求項 2】

式 I a の 1 - インダゾリル誘導体又は式 I b の 2 - インダゾリル誘導体、或いは医薬として許容されるその塩である、請求項 1 に記載のインダゾリル誘導体。

【請求項 3】

n が、0、1、2、又は3である、請求項 1 又は 2 に記載のインダゾリル誘導体又は医薬として許容されるその塩。

【請求項 4】

X が、O、S、又はNR'を表し、R'が、水素、アルキル、シクロアルキル、又はシクロアルキル-アルキルを表す、請求項 1 から 3 までのいずれか一項に記載のインダゾリル誘導体又は医薬として許容されるその塩。

【請求項 5】

Y が、アルキル、アルキル-シクロアルキル、シクロアルキル、シクロアルキル-アルキル、アミノ-アルキル、アルキル-アミノ、アルキル-アミノ-アルキル、ヒドロキシ-アルキル、アルコキシ-アルキル、アルケニル、又はフェニルを表し、そのフェニルが、アルキル、アミノ-アルキル、アルキル-アミノ、アルキル-アミノ-アルキル、ヒドロキシ-アルキル、アルコキシ-アルキル、シクロアルキル、シクロアルキル-アルキル、アルケニル、ハロ、ハロアルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、シアノ、ニトロ、及びアミノからなる群から選択される置換基で、1 回又は複数回任意選択で置換されていてもよい、請求項 1 から 4 までのいずれか一項に記載のインダゾリル誘導体又は医薬として許容されるその塩。

【請求項 6】

A' が、N又はCR²を表し、R²は下記定義の通りであり、

A'' が、N又はCHを表し、

但し、A' 及び A'' の一方のみがNを表す、

請求項 1 から 5 までのいずれか一項に記載のインダゾリル誘導体又は医薬として許容されるその塩。

【請求項 7】

R¹、R²、R³、及びR⁴が、互いに独立に、水素、アルキル、アミノ-アルキル、アルキル-アミノ、アルキル-アミノ-アルキル、アルキル-カルボニル-アミノ、ヒドロキシ-アルキル、アルコキシ-アルキル、シクロアルキル、シクロアルキル-アルキル、アルケニル、ハロ、ハロアルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルコキシ-カルボニル、シアノ、ニトロ、及びアミノを表し、又は

R¹ 及び R² が、それらが結合する芳香族複素環と一緒にあってベンゾ縮合環を形成し、

R³ 及び R⁴ が、互いに独立に、水素、アルキル、アミノ-アルキル、アルキル-アミノ、アルキル-アミノ-アルキル、ヒドロキシ-アルキル、アルコキシ-アルキル、シクロアルキル、シクロアルキル-アルキル、アルケニル、ハロ、ハロアルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロアルコキシ、アルコキシ-カルボニル、シアノ、ニトロ、及びアミノを表す、請求項 1 から 6 までのいずれか一項に記載のインダゾリル誘導体又は医薬として許容されるその塩。

【請求項 8】

(4-クロロ-フェニル)-(2-インダゾール-2-イル-6-メチル-ピリミジン-4-イル)-アミン；

(4-クロロ-フェニル)-(2-インダゾール-1-イル-6-メチル-ピリミジン-4-イル)-アミン；

シクロヘキシル-(2-インダゾール-1-イル-キナゾリン-4-イル)-アミン；

シクロヘキシル-(2-インダゾール-1-イル-ピリミジン-4-イル)-アミン；

シクロヘキシル-(2-インダゾール-1-イル-6-メチル-ピリミジン-4-イル)-アミン；

(4-クロロ-ベンジル)-(2-インダゾール-2-イル-ピリミジン-4-イル)-アミン；

(4-クロロ-ベンジル)-(2-インダゾール-1-イル-ピリミジン-4-イル)-アミン；

(4 - クロロ - フェニル) - [2 - (6 - ニトロ - インダゾール - 2 - イル) - ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;

(4 - クロロ - フェニル) - [2 - (5 - ニトロ - インダゾール - 2 - イル) - ピリミジン - 4 - イル] - アミン ;

(4 - クロロ - フェニル) - (2 - インダゾール - 2 - イル - 6 - メチル - ピリミジン - 4 - イル) - アミン ;

(4 - クロロ - フェニル) - (6 - インダゾール - 1 - イル - ピリジン - 2 - イル) - アミン ;

[6 - (3 - クロロ - インダゾール - 1 - イル) - ピリジン - 2 - イル] - (4 - クロロ - フェニル) - アミン ;

(4 - クロロ - フェニル) - (6 - インダゾール - 2 - イル - ピラジン - 2 - イル) - アミン ;

(4 - クロロ - フェニル) - (6 - インダゾール - 1 - イル - ピラジン - 2 - イル) - アミン ;

N - (4 - クロロ - フェニル) - 2 - インダゾール - 2 - イル - ピリミジン - 4 , 5 - ジアミン ;

2 - [4 - (4 - クロロ - フェニルアミノ) - ピリミジン - 2 - イル] - 2 H - インダゾール - 6 - イルアミン ;

N - { 2 - [4 - (4 - クロロ - フェニルアミノ) - ピリミジン - 2 - イル] - 2 H - インダゾール - 6 - イル } - アセトアミド ; 又は

N - { 2 - [4 - (4 - クロロ - フェニルアミノ) - ピリミジン - 2 - イル] - 2 H - インダゾール - 5 - イル } - アセトアミド ;

或いは医薬として許容されるその塩である、請求項 1 に記載のインダゾリル誘導体。

【請求項 9】

請求項 1 から 8 までのいずれか一項に記載の治療有効量のインダゾリル誘導体、又は医薬として許容されるその付加塩、又はそのプロドラッグを、少なくとも 1 つの医薬として許容される担体又は希釈剤と一緒に含む、医薬組成物。

【請求項 10】

ヒトを含む哺乳動物の、カリウムチャネルの活性に関連する疾患、又は障害、又は状態を治療、予防、又は緩和するための、請求項 1 から 8 までのいずれか一項に記載のインダゾリル誘導体を含む医薬。

【請求項 11】

前記カリウムチャネルの活性に関連する疾患又は障害が、呼吸器系疾患、てんかん、痙攣、発作、欠神発作、血管痙攣、冠動脈痙攣、腎障害、多発性嚢胞腎、膀胱痙攣、尿失禁、膀胱出口部閉塞、勃起機能不全、胃腸機能不全、分泌性下痢、虚血、脳虚血、虚血心疾患、狭心症、冠状動脈性心疾患、自閉症、運動失調、外傷性脳損傷、パーキンソン病、双極性障害、精神病、統合失調症、不安症、うつ病、躁病、気分障害、認知症、記憶及び注意欠陥、アルツハイマー病、筋萎縮性側索硬化症 (ALS)、月経困難症、ナルコレプシー、レイノー病、間欠性跛行、シェーグレン症候群、不整脈、高血圧、筋緊張性ジストロフィー、痙性、口内乾燥、ⅠⅡ型糖尿病、高インスリン血症、早期分娩、脱毛症、癌、過敏性腸症候群、免疫抑制、片頭痛、又は疼痛である、請求項 10 に記載の医薬。

【請求項 12】

医薬品としての使用のための、請求項 1 から 8 までのいずれか一項に記載のインダゾリル誘導体。

【請求項 13】

ヒトを含む哺乳動物の、カリウムチャネルの活性に関連する疾患、又は障害、又は状態を治療、予防、又は緩和する医薬品として使用するための、請求項 1 から 8 までのいずれか一項に記載のインダゾリル誘導体。