

【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10月12日(2006.10.12)

【公表番号】特表2002-525285(P2002-525285A)

【公表日】平成14年8月13日(2002.8.13)

【出願番号】特願2000-571054(P2000-571054)

【国際特許分類】

C 0 7 D 487/04	(2006.01)
A 6 1 K 31/5517	(2006.01)
A 6 1 P 31/04	(2006.01)
A 6 1 P 31/12	(2006.01)
A 6 1 P 33/00	(2006.01)
A 6 1 P 35/00	(2006.01)
C 0 7 D 519/00	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D 487/04	1 5 2
A 6 1 K 31/5517	
A 6 1 P 31/04	1 7 1
A 6 1 P 31/12	
A 6 1 P 33/00	1 7 1
A 6 1 P 35/00	
C 0 7 D 519/00	3 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成18年8月22日(2006.8.22)

【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

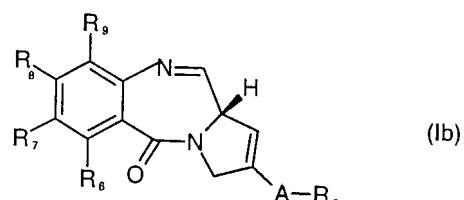
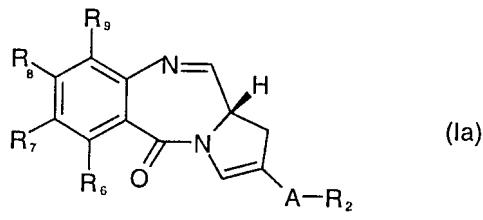
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】式Ia又はIb:

【化1】



[式中、Aは、CH<sub>2</sub>又は単結合であり、

R<sub>2</sub>は、R、OH、OR、CO<sub>2</sub>H、CO<sub>2</sub>R、COH、COR、SO<sub>2</sub>R、CNから選択され、

R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>及びR<sub>9</sub>は、独立に、H、R、OH、OR、ハロ、アミノ、NHR、ニトロ、Me<sub>3</sub>Snから選択され、

{但し、Rは、1~10個の炭素原子を有する低級アルキル基又は12個以下の炭素原子のアラルキル基（そのアルキル基は、任意に、1個又は2個以上の、共役系の一部を形成することができる炭素-炭素二重結合又は三重結合を含有する）又は12個以下の炭素原子のアリール基であり、そして、任意に、1個又は2個以上のハロ、ヒドロキシ、アミ

ノ又はニトロ基によって置換されており、そして任意に、1個又は2個以上の、官能基の一部を形成するか又は官能基であってよいヘテロ原子を含有する}、そして

R<sub>8</sub> は、H、R、OH、OR、ハロ、アミノ、NHR、ニトロ、Me<sub>3</sub>Sn(但し、Rは、上記定義された通りである)から選択される]の化合物、

又は、この化合物は、同じものか又は異なったものであり、式Ia又はIbのものである各单量体による二量体[但し、单量体のR<sub>8</sub>基は、一緒に、单量体を結合する式-X-R'-X-[式中、R'は、3~12個の炭素原子を含有するアルキレン鎖(但し、この鎖は、1個又は2個以上のヘテロ原子及び/又は芳香族環によって遮断されていてよく、そして1個又は2個以上の炭素-炭素二重結合又は三重結合を含有していてよい)であり、各Xは、独立に、O、S又はNから選択される}を有する架橋を形成するか又はR<sub>7</sub>及びR<sub>8</sub>は一緒に、基-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-O-(但し、pは1又は2である)を形成する]である[但し、式Iaの化合物に於いて、Aが単結合であるとき、R<sub>2</sub>はCH=CR<sup>A</sup>R<sup>B</sup>{式中、R<sup>A</sup>及びR<sup>B</sup>は、独立に、H、R<sup>C</sup>、COR<sup>C</sup>、CONH<sub>2</sub>、CONHR<sup>C</sup>、CONR<sup>C</sup><sub>2</sub>、シアノ又はホスホナート(式中、R<sup>C</sup>は、1~4個の炭素原子を有する非置換のアルキル基である)から選択される}ではない]。

【請求項2】 AがCH<sub>2</sub>である、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】 R<sub>2</sub>が、CO<sub>2</sub>H、CO<sub>2</sub>R、CH<sub>2</sub>OH又はCH<sub>2</sub>ORである、請求項2に記載の化合物。

【請求項4】 R<sub>2</sub>が、CO<sub>2</sub>Me、CO<sub>2</sub><sup>t</sup>Bu、CH<sub>2</sub>OH又はCH<sub>2</sub>OAcである、請求項3に記載の化合物。

【請求項5】 Aが単結合であり、そしてR<sub>2</sub>が、アリール基又は少なくとも1個の、C-環の二重結合と共に共役系の一部を形成する二重結合を含有するアルキル若しくはアルカリール基である、請求項1に記載の化合物。

【請求項6】 R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>及びR<sub>9</sub>並びに化合物が二量体でない場合にR<sub>8</sub>が、独立に、H及びORから選択される、請求項1~5の何れか1項に記載の化合物。

【請求項7】 R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>及びR<sub>9</sub>並びに化合物が二量体でない場合にR<sub>8</sub>が、独立に、H、OME及びOCH<sub>2</sub>Phから選択される、請求項6に記載の化合物。

【請求項8】 R<sub>7</sub>及び化合物が二量体でない場合にR<sub>8</sub>がORであり、そしてR<sub>6</sub>及びR<sub>9</sub>がHである、請求項6に記載の化合物。

【請求項9】 R<sub>7</sub>及び化合物が二量体でない場合にR<sub>8</sub>が、独立にOME又はOC<sub>H<sub>2</sub></sub>Phである、請求項8に記載の化合物。

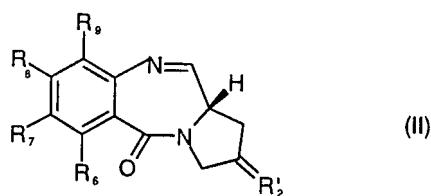
【請求項10】 式Iaの請求項1~9の何れか1項に記載の化合物。

【請求項11】 二量体であり、二量体架橋が、式-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-O-(但し、pは3~12である)のものである、請求項1~10の何れか1項に記載の化合物。

【請求項12】 (11aS)-1,11a-ジヒドロ-7,8-ジメトキシ-2-(4-メトキシフェニル)-5H-ピロ口[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-5-オンである請求項1に記載の化合物。

【請求項13】 式II:

【化2】



[式中、R'<sub>2</sub>は、CH<sub>2</sub>であり、

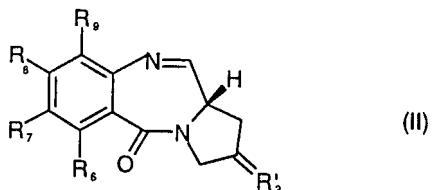
R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>及びR<sub>9</sub>は、独立に、H、R、OH、OR、ハロ、アミノ、NHR、ニトロ、Me<sub>3</sub>Snから選択され

{但し、Rは、1~10個の炭素原子を有する低級アルキル基又は12個以下の炭素原

子のアラルキル基（そのアルキル基は、任意に、1個又は2個以上の、共役系の一部を形成することができる炭素-炭素二重結合又は三重結合を含有する）又は12個以下の炭素原子のアリール基であり、そして、任意に、1個又は2個以上のハロ、ヒドロキシ、アミノ又はニトロ基によって置換されており、そして任意に、1個又は2個以上の、官能基の一部を形成するか又は官能基であってよいヘテロ原子を含有する}、又はR<sub>7</sub>及びR<sub>8</sub>は一緒に、基-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-O-（但し、pは1又は2である）を形成する]の化合物。

【請求項14】式III：

【化2】



[式中、R'2は、O、CH<sub>2</sub>から選択され、

R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>及びR<sub>9</sub>は、独立に、H、R、OH、OR、ハロ、アミノ、NHR、ニトロ、Me<sub>3</sub>Snから選択され

{但し、Rは、1~10個の炭素原子を有する低級アルキル基又は12個以下の炭素原子のアラルキル基（そのアルキル基は、任意に、1個又は2個以上の、共役系の一部を形成することができる炭素-炭素二重結合又は三重結合を含有する）又は12個以下の炭素原子のアリール基であり、そして、任意に、1個又は2個以上のハロ、ヒドロキシ、アミノ又はニトロ基によって置換されており、そして任意に、1個又は2個以上の、官能基の一部を形成するか又は官能基であってよいヘテロ原子を含有する}、及び

R<sub>8</sub>は、この化合物が、同じものか又は異なったものであり、式IIIのものである各単量体による二量体（但し、単量体のR<sub>8</sub>基は、一緒に、単量体を結合する式-X-R'-X-{式中、R'は、3~12個の炭素原子を含有するアルキレン鎖（但し、この鎖は、1個又は2個以上のヘテロ原子及び/又は芳香族環によって遮断されていてよく、そして1個又は2個以上の炭素-炭素二重結合又は三重結合を含有していてよい）であり、各Xは、独立に、O、S又はNから選択される}を有する架橋を形成する）であるように選択される]

の化合物。

【請求項15】二量体であり、二量体架橋が、式-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>-O-（式中、pは3~12である）のものである、請求項14に記載の化合物。

【請求項16】R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>及びR<sub>9</sub>並びに化合物が二量体でない場合にR<sub>8</sub>が、独立に、H、OR又はハロゲン原子から選択される、請求項13、請求項14および請求項15に記載の化合物。

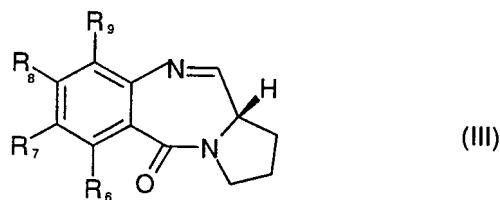
【請求項17】R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>及びR<sub>9</sub>並びに化合物が二量体でない場合にR<sub>8</sub>が、独立に、H、OMe及びOCH<sub>2</sub>Ph並びにIから選択される、請求項16に記載の化合物。

【請求項18】R<sub>7</sub>及び化合物が二量体でない場合にR<sub>8</sub>が、独立に、OR又はハロゲン原子であり、R<sub>6</sub>及びR<sub>9</sub>がHである、請求項16に記載の化合物。

【請求項19】R<sub>7</sub>及び化合物が二量体でない場合にR<sub>8</sub>が、独立に、OMe、OCH<sub>2</sub>Ph又はIから選択される、請求項18に記載の化合物。

【請求項20】式III：

【化3】



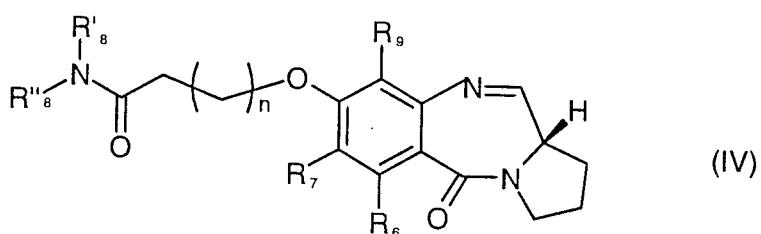
[式中、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>及びR<sub>9</sub>は、独立に、H、R、OH、OR、ハロ、アミノ、NHR、ニトロ、Me<sub>3</sub>Snから選択され]

{但し、Rは、1～10個の炭素原子を有する低級アルキル基又は12個以下の炭素原子のアラルキル基（そのアルキル基は、任意に、1個又は2個以上の、共役系の一部を形成することができる炭素-炭素二重結合又は三重結合を含有する）又は12個以下の炭素原子のアリール基であり、そして、任意に、1個又は2個以上のハロ、ヒドロキシ、アミノ又はニトロ基によって置換されており、そして任意に、1個又は2個以上の、官能基の一部を形成するか又は官能基であってよいヘテロ原子を含有する}】の化合物。

【請求項21】 (11aS)-8-アミノ-1,2,3,11a-テトラヒドロ-5H-ピロロ[2,1-c][1,4]ベンゾジアゼピン-5-オンである請求項20に記載の化合物。

【請求項22】 式IV：

【化4】



[式中、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>及びR<sub>9</sub>は、独立に、H、R、OH、OR、ハロ、アミノ、NHR、ニトロ、Me<sub>3</sub>Snから選択され]

{但し、Rは、1～10個の炭素原子を有する低級アルキル基又は12個以下の炭素原子のアラルキル基（そのアルキル基は、任意に、1個又は2個以上の、共役系の一部を形成することができる炭素-炭素二重結合又は三重結合を含有する）又は12個以下の炭素原子のアリール基であり、そして、任意に、1個又は2個以上のハロ、ヒドロキシ、アミノ又はニトロ基によって置換されており、そして任意に、1個又は2個以上の、官能基の一部を形成するか又は官能基であってよいヘテロ原子を含有する}】

R<sub>8</sub>'及びR<sub>8</sub>"は、独立にH、Rから選択されるか又は一緒に環式アミンを形成し、そして

nは1～7である】の化合物。

【請求項23】 R'<sub>8</sub>及びR"<sub>8</sub>の一方が窒素保護基である、請求項22に記載の化合物。

【請求項24】 R<sub>7</sub>が電子求引性基である、請求項22又は請求項23に記載の化合物。

【請求項25】 R<sub>6</sub>及びR<sub>9</sub>がH及びORから選択される、請求項22～請求項24の何れか1項に記載の化合物。

【請求項26】 R<sub>6</sub>及びR<sub>9</sub>が、OMe、OEt及びOBnから選択される、請求項25に記載の化合物。

【請求項27】 nが1～3である、請求項22～請求項26の何れか1項に記載の化合物。

【請求項28】 Rが、任意に、1個又は2個以上のハロ、ヒドロキシ、アミノ又は

ニトロ基によって置換された、1～10個の炭素原子を有する低級アルキル基又は12個以下の炭素原子のアラルキル基又は12個以下の炭素原子のアリール基から選択される、請求項1～27の何れか1項に記載の化合物。

【請求項29】 Rが、任意に、1個又は2個以上のハロ、ヒドロキシ、アミノ又はニトロ基によって置換された、1～10個の炭素原子を有する低級アルキル基から選択される、請求項28に記載の化合物。

【請求項30】 Rが、1～10個の炭素原子を有する非置換の直鎖又は分枝鎖アルキルである、請求項29に記載の化合物。

【請求項31】 請求項1～請求項30の何れか1項に記載の化合物及び薬物的に許容される担体又は希釈剤を含有する薬物組成物。

【請求項32】 増殖性疾患の治療のための医薬を製剤するための、請求項1～請求項30の何れか1項に記載の化合物の使用。

【請求項33】 ウィルス、寄生虫又は細菌感染の治療のための医薬を製剤するための、請求項1～請求項30の何れか1項に記載の化合物の使用。

【請求項34】 請求項1～請求項30の何れか1項に記載の化合物の製造方法。

【請求項35】 治療方法に使用するための、請求項1～30の何れか1項に記載の化合物。