

【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

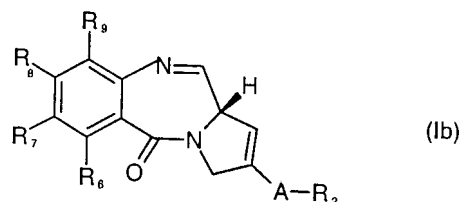
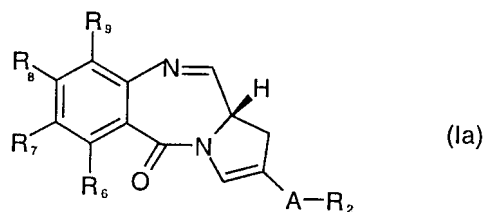
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 式 I a 又は I b :

【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

$R_8$  は、H、R、OH、OR、ハロ、アミノ、NHR、ニトロ、 $Me_3Sn$  (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 I a 又は I b のものである各単量体による二量体 [但し、単量体の  $R_8$  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ノ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  $R_7$  及び  $R_8$  は一緒に、基 - O - ( $CH_2$ )<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 I a の化合物に於いて、A が単結合であるとき、 $R_2$  は  $CH = CR^A R^B$  { 式中、 $R^A$  及び  $R^B$  は、独立に、H、 $R^C$ 、 $COR^C$ 、 $CONH_2$ 、 $CONHR^C$ 、 $CONR^C$ 、シアノ又はホスホナート (式中、 $R^C$  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  $CH_2$  である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】  $R_2$  が、 $CO_2H$ 、 $CO_2R$ 、 $CH_2OH$  又は  $CH_2OR$  である、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】  $R_2$  が、 $CO_2Me$ 、 $CO_2^tBu$ 、 $CH_2OH$  又は  $CH_2OAc$  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  $R_2$  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】  $R_6$ 、 $R_7$  及び  $R_9$  並びに化合物が二量体でない場合に  $R_8$  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】  $R_6$ 、 $R_7$  及び  $R_9$  並びに化合物が二量体でない場合に  $R_8$  が、独立に、H、OMe 及び  $OCH_2Ph$  から選択される、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】  $R_7$  及び化合物が二量体でない場合に  $R_8$  が OR であり、そして  $R_6$  及び  $R_9$  が H である、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 9】  $R_7$  及び化合物が二量体でない場合に  $R_8$  が、独立に OMe 又は  $OCH_2Ph$  である、請求項 8 に記載の化合物。

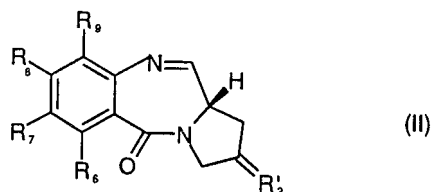
【請求項 10】 式 I a の請求項 1 ~ 9 の何れか1 項に記載の化合物。

【請求項 11】 二量体であり、二量体架橋が、式 - O - ( $CH_2$ )<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 - ピロロ [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 I I :

【化 2】



[ 式中、 $R'_2$  は、 $CH_2$  であり、

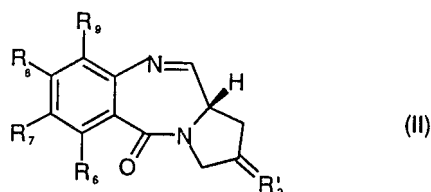
$R_6$ 、 $R_7$ 、 $R_8$  及び  $R_9$  は、独立に、H、R、OH、OR、ハロ、アミノ、NHR、ニトロ、 $Me_3Sn$  から選択され

{ 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アル基であり、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  $R_7$  及び  $R_8$  は一緒に、基 -  $O - (CH_2)_p - O -$ （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 I I :

【化 2】



[ 式中、 $R'_2$  は、 $O$ 、 $CH_2$  から選択され、

$R_6$ 、 $R_7$  及び  $R_9$  は、独立に、 $H$ 、 $R$ 、 $OH$ 、 $OR$ 、ハロ、アミノ、 $NHR$ 、ニトロ、 $Me_3Sn$  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アル基であり、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

$R_8$  は、この化合物が、同じものか又は異なったものであり、式 I I のものである各単量体による二量体（但し、単量体の  $R_8$  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 -  $O - (CH_2)_p - O -$ （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】  $R_6$ 、 $R_7$  及び  $R_9$  並びに化合物が二量体でない場合に  $R_8$  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。

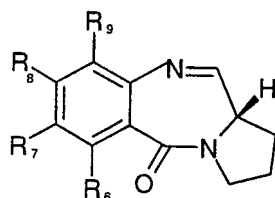
【請求項 17】  $R_6$ 、 $R_7$  及び  $R_9$  並びに化合物が二量体でない場合に  $R_8$  が、独立に、 $H$ 、 $OMe$  及び  $OCH_2Ph$  並びに I から選択される、請求項 16 に記載の化合物。

【請求項 18】  $R_7$  及び化合物が二量体でない場合に  $R_8$  が、独立に、 $OR$  又はハロゲン原子であり、 $R_6$  及び  $R_9$  が  $H$  である、請求項 16 に記載の化合物。

【請求項 19】  $R_7$  及び化合物が二量体でない場合に  $R_8$  が、独立に、 $OMe$ 、 $OCH_2Ph$  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 I I I :

【化 3】



(III)

[ 式中、 $R_6$ 、 $R_7$  及び  $R_9$  は、独立に、 $H$ 、 $R$ 、 $OH$ 、 $OR$ 、ハロ、アミノ、 $NHR$ 、ニトロ、 $Me_3Sn$  から選択され

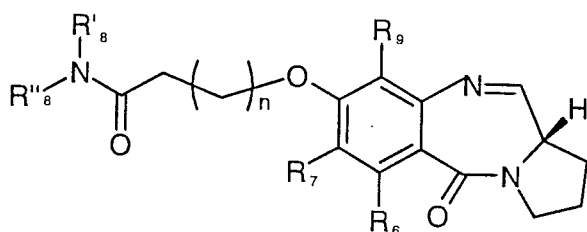
{ 但し、 $R$  は、1 ~ 10 個の炭素原子を有する低級アルキル基又は 12 個以下の炭素原子のアラルキル基 ( そのアルキル基は、任意に、1 個又は 2 個以上の、共役系の一部を形成することができる炭素 - 炭素二重結合又は三重結合を含有する ) 又は 12 個以下の炭素原子のアリール基であり、そして、任意に、1 個又は 2 個以上のハロ、ヒドロキシ、アミノ又はニトロ基によって置換されており、そして任意に、1 個又は 2 個以上の、官能基の一部を形成するか又は官能基であってよいヘテロ原子を含有する } ]

の化合物。

【請求項 21】 ( 11 a S ) - 8 - アミノ - 1, 2, 3, 11 a - テトラヒドロ - 5 H - 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 I V :

【化 4】



(IV)

[ 式中、 $R_6$ 、 $R_7$  及び  $R_9$  は、独立に、 $H$ 、 $R$ 、 $OH$ 、 $OR$ 、ハロ、アミノ、 $NHR$ 、ニトロ、 $Me_3Sn$  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 }、

$R_8'$  及び  $R_8''$  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】  $R_8'$  及び  $R_8''$  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】  $R_7$  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】  $R_6$  及び  $R_9$  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】  $R_6$  及び  $R_9$  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】 ウイルス、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。