

【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19年11月22日(2007.11.22)

【公表番号】特表2007-507464(P2007-507464A)

【公表日】平成19年3月29日(2007.3.29)

【年通号数】公開・登録公報2007-012

【出願番号】特願2006-530261(P2006-530261)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04 (2006.01)
A 6 1 K 31/444 (2006.01)
A 6 1 K 31/4545 (2006.01)
A 6 1 K 31/496 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
A 6 1 P 29/00 (2006.01)
A 6 1 P 25/00 (2006.01)
A 6 1 P 1/00 (2006.01)
A 6 1 P 11/00 (2006.01)
A 6 1 P 11/06 (2006.01)
A 6 1 P 11/16 (2006.01)
A 6 1 P 19/02 (2006.01)
A 6 1 P 19/06 (2006.01)
A 6 1 P 17/00 (2006.01)
A 6 1 P 17/06 (2006.01)
A 6 1 P 17/04 (2006.01)
A 6 1 P 3/10 (2006.01)
A 6 1 P 13/12 (2006.01)
A 6 1 P 25/28 (2006.01)
A 6 1 P 25/16 (2006.01)
A 6 1 P 21/04 (2006.01)
A 6 1 P 25/04 (2006.01)
A 6 1 P 25/06 (2006.01)
A 6 1 P 9/10 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 471/04 1 0 7 Z
 C 0 7 D 471/04 C S P
 C 0 7 D 471/04 1 0 7 E
 A 6 1 K 31/444
 A 6 1 K 31/4545
 A 6 1 K 31/496
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 1/00
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 11/06
 A 6 1 P 11/16
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 19/06

A 6 1 P 43/00 1 0 1
 A 6 1 P 17/00
 A 6 1 P 17/06
 A 6 1 P 17/04
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 25/16
 A 6 1 P 21/04
 A 6 1 P 25/04
 A 6 1 P 25/06
 A 6 1 P 9/10

【手続補正書】

【提出日】平成19年9月26日(2007.9.26)

【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

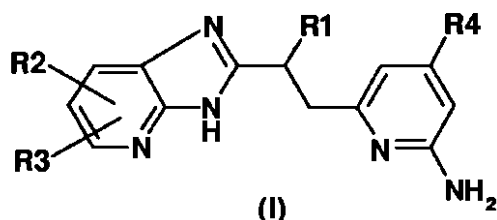
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I

【化1】



[式中、

R 1 は水素又は C₁ ~ C₄ - アルキルであり、

R 2 は水素、ハロゲン、ヒドロキシル、ニトロ、アミノ、C₁ ~ C₇ - アルキル、トリフルオロメチル、C₃ ~ C₇ - シクロアルキル、C₃ ~ C₇ - シクロアルキル - C₁ ~ C₄ - アルキル、C₁ ~ C₄ - アルコキシ、完全にもしくは大部分がフッ素で置換された C₁ ~ C₄ - アルコキシ、C₁ ~ C₄ - アルコキシ - C₁ ~ C₄ - アルキル、C₁ ~ C₄ - アルコキシ - C₁ ~ C₄ - アルコキシ、C₁ ~ C₄ - アルコキシカルボニル、モノ - もしくはジ - C₁ ~ C₄ - アルキルアミノカルボニル、モノ - もしくはジ - C₁ ~ C₄ - アルキルアミノスルホニル、C₁ ~ C₄ - アルキルカルボニルアミノ、C₁ ~ C₄ - アルキルスルホニルアミノ、フェニル、R 2 1 及び / 又は R 2 1 1 で置換されたフェニル、フェニル - C₁ ~ C₄ - アルキル、フェニル部が R 2 2 により置換されているフェニル - C₁ ~ C₄ - アルキル、フェニル - C₁ ~ C₄ - アルコキシ、ピリジル、R 2 3 により置換されたピリジル、ピリジル - C₁ ~ C₄ - アルキル、ピリジル部が R 2 4 により置換されているピリジル - C₁ ~ C₄ - アルキルであり、その際、

R 2 1 はシアノ、ハロゲン、カルボキシル、C₁ ~ C₄ - アルキル、C₁ ~ C₄ - アルコキシ、アミノカルボニル、モノ - もしくはジ - C₁ ~ C₄ - アルキルアミノカルボニル、C₁ ~ C₄ - アルキルカルボニルアミノ、C₁ ~ C₄ - アルコキシカルボニル、アミノスルホニル、モノ - もしくはジ - C₁ ~ C₄ - アルキルアミノスルホニル、アミノ、モノ -

もしくはジ - $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノ、トリフルオロメチル、ヒドロキシル、フェニル
スルホニルアミノ、フェニル - $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、又は - $S(O)_2$ - H e t で
あり、その際、

H e t は隣接したスルホニル基に環窒素原子を介して結合されており、かつスルホニル基
が結合される1つの窒素原子と、場合によりN (R 2 1 0)、酸素及び硫黄から選択され
るもう1個のヘテロ原子を含む3員～7員の完全飽和の複素環であり、その際、

R 2 1 0 は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R 2 1 1 はハロゲン又は $C_1 \sim C_4$ - アルコキシであり、

R 2 2 はハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は $C_1 \sim C_4$ - アルコキシであり、

R 2 3 はハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は $C_1 \sim C_4$ - アルコキシであり、

R 2 4 はハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は $C_1 \sim C_4$ - アルコキシであり、

R 3 は水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は $C_1 \sim C_4$ - アルコキシであり、

R 4 は $C_1 \sim C_4$ - アルキル又は $C_1 \sim C_4$ - アルコキシである]で示される化合物、及
びそれらの塩、N - オキシド並びにこれらの化合物のN - オキシドの塩。

【請求項2】

式Iで示され、式中、

R 1 は水素又は $C_1 \sim C_2$ - アルキルであり、

R 2 は水素、ハロゲン、フェニル、又はR 2 1 及び/又はR 2 1 1 で置換されたフェニル
であり、その際、

R 2 1 は $C_1 \sim C_4$ - アルキル、シアノ、ハロゲン、モノ - もしくはジ - $C_1 \sim C_4$ - ア
ルキルアミノ、トリフルオロメチル、モノ - もしくはジ - $C_1 \sim C_4$ - アルキルアミノ
スルホニル、ヒドロキシル、フェニル - $C_1 \sim C_4$ - アルコキシ、又は - $S(O)_2$ - H e
t であり、その際、

H e t はアゼチジン - 1 - イル、ピロリジン - 1 - イル、ピペリジン - 1 - イル、又は4
N - (R 2 1 0) - ピペラジン - 1 - イルであり、その際、

R 2 1 0 は $C_1 \sim C_4$ - アルキルであり、

R 2 1 1 はハロゲンであり、

R 3 は水素であり、

R 4 はメチル又はメトキシである、請求項1記載の化合物、及びそれらの塩、N - オキシ
ド並びにこれらの化合物のN - オキシドの塩。

【請求項3】

式Iで示され、式中、

R 1 は水素、メチル又はエチルであり、

R 2 は水素、ヨウ素、臭素、フェニル、又はR 2 1 及び/又はR 2 1 1 で置換されたフェ
ニルであり、その際、

R 2 1 はメチル、シアノ、塩素、フッ素、ジメチルアミノ、トリフルオロメチル、ジメチ
ルアミノスルホニル、ヒドロキシル、ベンジルオキシ、又は - $S(O)_2$ - H e t であり
、その際、

H e t はアゼチジン - 1 - イル、ピロリジン - 1 - イル、ピペリジン - 1 - イル、又は4
N - メチル - ピペラジン - 1 - イルであり、その際、

R 2 1 1 は塩素であり、

R 3 は水素であり、

R 4 はメチル又はメトキシである、請求項1記載の化合物、及びそれらの塩、N - オキシ
ド並びにこれらの化合物のN - オキシドの塩。

【請求項4】

式Iで示され、式中、

R 1 は水素、又はメチルであり、

R 2 は3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン環の6位に結合されており、かつ水素、ヨ
ウ素、臭素、フェニル、3 - ヒドロキシ - フェニル、4 - (R 2 1) - フェニル、又は3
 , 5 - ジ - クロロ - フェニルであり、その際、

R 2 1 はメチル、シアノ、塩素、フッ素、ジメチルアミノ、トリフルオロメチル、ジメチルアミノスルホニル、ベンジルオキシ、又は - S (O) ₂ - H e t であり、その際、H e t はアゼチジン - 1 - イル、ピロリジン - 1 - イル、ピペリジン - 1 - イル、又は 4 N - メチル - ピペラジン - 1 - イルであり、その際、

R 3 は水素であり、

R 4 はメチル又はメトキシである、請求項 1 記載の化合物、及びそれらの塩、N - オキシド並びにこれらの化合物の N - オキシドの塩。

【請求項 5】

式 I で示され、式中、

R 1 は水素又は C₁ ~ C₄ - アルキルであり、

R 2 は水素、ハロゲン、ヒドロキシル、ニトロ、アミノ、C₁ ~ C₇ - アルキル、トリフルオロメチル、C₃ ~ C₇ - シクロアルキル、C₃ ~ C₇ - シクロアルキル - C₁ ~ C₄ - アルキル、C₁ ~ C₄ - アルコキシ、完全にもしくは大部分がフッ素で置換された C₁ ~ C₄ - アルコキシ、C₁ ~ C₄ - アルコキシ - C₁ ~ C₄ - アルキル、C₁ ~ C₄ - アルコキシ - C₁ ~ C₄ - アルコキシ、C₁ ~ C₄ - アルコキシカルボニル、モノ - もしくはジ - C₁ ~ C₄ - アルキルアミノカルボニル、モノ - もしくはジ - C₁ ~ C₄ - アルキルアミノスルホニル、C₁ ~ C₄ - アルキルカルボニルアミノ、C₁ ~ C₄ - アルキルスルホニルアミノ、フェニル、R 2 1 及び / 又は R 2 1 1 で置換されたフェニル、フェニル - C₁ ~ C₄ - アルキル、フェニル部が R 2 2 により置換されているフェニル - C₁ ~ C₄ - アルキル、フェニル - C₁ ~ C₄ - アルコキシ、ピリジル、R 2 3 により置換されているピリジル、ピリジル - C₁ ~ C₄ - アルキル、ピリジル部が R 2 4 により置換されているピリジル - C₁ ~ C₄ - アルキルであり、その際、

R 2 1 はシアノ、ハロゲン、カルボキシル、C₁ ~ C₄ - アルキル、C₁ ~ C₄ - アルコキシ、アミノカルボニル、モノ - もしくはジ - C₁ ~ C₄ - アルキルアミノカルボニル、C₁ ~ C₄ - アルキルカルボニルアミノ、C₁ ~ C₄ - アルコキシカルボニル、アミノスルホニル、モノ - もしくはジ - C₁ ~ C₄ - アルキルアミノスルホニル、アミノ、モノ - もしくはジ - C₁ ~ C₄ - アルキルアミノ、トリフルオロメチル、ヒドロキシル、フェニルスルホニルアミノ又はフェニル - C₁ ~ C₄ - アルコキシであり、

R 2 1 1 はハロゲン又は C₁ ~ C₄ - アルコキシであり、

R 2 2 はハロゲン、C₁ ~ C₄ - アルキル又は C₁ ~ C₄ - アルコキシであり、

R 2 3 はハロゲン、C₁ ~ C₄ - アルキル又は C₁ ~ C₄ - アルコキシであり、

R 2 4 はハロゲン、C₁ ~ C₄ - アルキル又は C₁ ~ C₄ - アルコキシであり、

R 3 は水素、ハロゲン、C₁ ~ C₄ - アルキル又は C₁ ~ C₄ - アルコキシであり、

R 4 は C₁ ~ C₄ - アルキルである、請求項 1 記載の化合物、それらの塩、N - オキシド並びにこれらの化合物の N - オキシドの塩。

【請求項 6】

式 I で示され、式中、

R 1 は水素、メチル又はエチルであり、

R 2 は水素、ヨウ素、臭素、フェニル、又は R 2 1 で置換されたフェニルであり、その際、

R 2 1 はメチル、シアノ、塩素、フッ素、ジメチルアミノ又はトリフルオロメチルであり、

R 3 は水素であり、

R 4 はメチルである、請求項 1 記載の化合物、及びそれらの塩、N - オキシド並びにこれらの化合物の N - オキシドの塩。

【請求項 7】

式 I で示され、式中、

R 1 は水素又はメチルであり、

R 2 は R 2 1 で置換されたフェニルであり、その際、

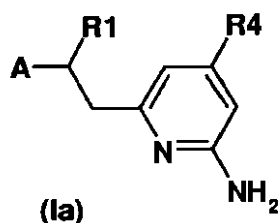
R 2 1 はアミノスルホニル、モノ - もしくはジ - C₁ ~ C₄ - アルキルアミノスルホニル

、又は - S (O)₂ - H e t であり、その際、
 H e t はアゼチジン - 1 - イル、ピロリジン - 1 - イル、ピペリジン - 1 - イル、又は 4
 N - (C₁ ~ C₄ - アルキル) - ピペラジン - 1 - イルであり、
 R₃ は水素であり、
 R₄ はメチル、又はメトキシである、請求項 1 記載の化合物、及びそれらの塩、N - オキ
 シド並びにこれらの化合物の N - オキシドの塩。

【請求項 8】

式 I で示され、式 I a

【化 2】



[式中、

R₁ は水素であり、

R₄ はメチル又はメトキシであり、かつ

A は 6 - (4 - ジメチルアミノスルホニル - フェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b]
 ピリジン - 2 - イル、6 - (4 - ジエチルアミノスルホニル - フェニル) - 3 H - イミダ
 ズ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル、6 - (4 - メチルアミノスルホニル - フェニル)
 - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル、6 - (4 - アミノスルホニル - フ
 ェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル、6 - (4 - エチルアミ
 ノスルホニル - フェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル、6 - [4
 - (アゼチジン - 1 - スルホニル) - フェニル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジ
 ン - 2 - イル、6 - [4 - (ピロリジン - 1 - スルホニル) - フェニル] - 3 H - イミダ
 ズ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル、6 - [4 - (ピペリジン - 1 - スルホニル) - フ
 ェニル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル、又は 6 - [4 - (4 - メ
 チル - ピペラジン - 1 - スルホニル) - フェニル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリ
 ジン - 2 - イルである] に基づく、請求項 1 記載の化合物、及びそれらの塩、N - オキシ
 ド並びにこれらの化合物の N - オキシドの塩。

【請求項 9】

式 I で示され、

R₁ は水素である、

R₂ は 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン環の 6 位に結合されている、

R₃ は水素である、及び

R₄ はメチルである

の 1 つ以上を含む、請求項 1 から 8 までのいずれか 1 項記載の化合物、及びそれらの塩、
 N - オキシド並びにこれらの化合物の N - オキシドの塩。

【請求項 10】

以下の群：

- 1 . 2 - [2 - (2 - アミノ - 4 - メチルピリジン - 6 - イル) エチル] - 3 H - イミ
 ダゾ [4 , 5 - b] ピリジン
- 2 . (R , S) - 2 - [3 - (2 - アミノ - 4 - メチルピリジン - 6 - イル) プロプ -
 2 - イル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン
- 3 . (R , S) - 2 - [4 - (2 - アミノ - 4 - メチルピリジン - 6 - イル) ブト - 2
 - イル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン
- 4 . 2 - [2 - (2 - アミノ - 4 - メチルピリジン - 6 - イル) エチル] - 6 - プロモ

- 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン
- 5 . 2 - [2 - (2 - アミノ - 4 - メチルピリジン - 6 - イル) エチル] - 6 - フェニル - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン
- 6 . 2 - [2 - (2 - アミノ - 4 - メチルピリジン - 6 - イル) エチル] - 6 - (4 - シアノ - フェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン
- 7 . 2 - [2 - (2 - アミノ - 4 - メチルピリジン - 6 - イル) エチル] - 6 - p - トリル - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン
- 8 . 2 - [2 - (2 - アミノ - 4 - メチルピリジン - 6 - イル) エチル] - 6 - (4 - フルオロ - フェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン
- 9 . 2 - [2 - (2 - アミノ - 4 - メチルピリジン - 6 - イル) エチル] - 6 - (4 - ジメチルアミノ - フェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン
- 10 . 2 - [2 - (2 - アミノ - 4 - メチルピリジン - 6 - イル) エチル] - 6 - (4 - クロロ - フェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン
- 11 . 2 - [2 - (2 - アミノ - 4 - メチルピリジン - 6 - イル) エチル] - 6 - (4 - ヨード - フェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン
- 12 . 2 - [2 - (2 - アミノ - 4 - メチルピリジン - 6 - イル) エチル] - 6 - (4 - トリフルオロメチル - フェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン
- 13 . 6 - { 2 - [6 - (3 - ベンジルオキシ - フェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル] - エチル } - 4 - メチル - ピリジン - 2 - イルアミン
- 14 . 6 - { 2 - [6 - (3 , 5 - ジクロロ - フェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル] - エチル } - 4 - メチル - ピリジン - 2 - イルアミン
- 15 . 6 - { 2 - [6 - (4 - ベンジルオキシ - フェニル) - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル] - エチル } - 4 - メチル - ピリジン - 2 - イルアミン
- 16 . 3 - { 2 - [2 - (6 - アミノ - 4 - メチル - ピリジン - 2 - イル) - エチル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 6 - イル } - フェノール
- 17 . 6 - (2 - { 6 - [4 - (アゼチジン - 1 - スルホニル) - フェニル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル } - エチル) - 4 - メチル - ピリジン - 2 - イルアミン
- 18 . 4 - メチル - 6 - (2 - { 6 - [4 - (ピロリジン - 1 - スルホニル) - フェニル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル } - エチル) - ピリジン - 2 - イルアミン
- 19 . 4 - メチル - 6 - (2 - { 6 - [4 - (ピペリジン - 1 - スルホニル) - フェニル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル } - エチル) - ピリジン - 2 - イルアミン
- 20 . 4 - { 2 - [2 - (6 - アミノ - 4 - メチル - ピリジン - 2 - イル) - エチル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 6 - イル } - N , N - ジメチル - ベンゼンスルホンアミド
- 21 . 4 - メチル - 6 - (2 - { 6 - [4 - (4 - メチル - ピペラジン - 1 - スルホニル) - フェニル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン - 2 - イル } - エチル) - ピリジン - 2 - イルアミン、及び
- 22 . 2 - [2 - (2 - アミノ - 4 - メトキシピリジン - 6 - イル) エチル] - 3 H - イミダゾ [4 , 5 - b] ピリジン

から選択される、請求項 1 記載の化合物又はその塩、N - オキシド又はそれらの N - オキシドの塩。

【請求項 11】

請求項 1 記載の式 I の 1 種以上の化合物と一緒に通常の医薬品助剤及び / 又は賦形剤を含有する急性炎症性疾患の治療のための医薬品組成物。

【請求項 12】

請求項 1 記載の式 I の 1 種以上の化合物と一緒に通常の医薬品助剤及び / 又は賦形剤を含有する末梢器官及び CNS の慢性炎症性疾患の治療のための医薬品組成物。