

【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 9 月 7 日 (2006.9.7)

【公表番号】特表 2002-524392 (P2002-524392A)

【公表日】平成 14 年 8 月 6 日 (2002.8.6)

【出願番号】特願 2000-562377 (P2000-562377)

【国際特許分類】

C 0 7 D 498/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4375 (2006.01)

A 6 1 K 31/4738 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

C 0 7 D 498/14 (2006.01)

C 0 7 D 513/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 498/04 1 0 5

A 6 1 K 31/4375

A 6 1 K 31/4738

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 37/02

C 0 7 D 498/14

C 0 7 D 513/04 3 4 3

【手続補正書】

【提出日】平成 18 年 7 月 7 日 (2006.7.7)

【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

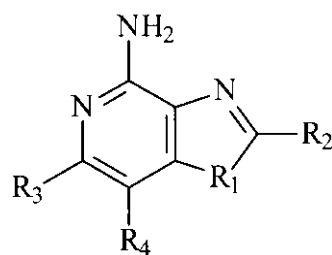
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 式 I

【化 1】



(I)

(式中、 R_1 は、酸素、硫黄、およびセレンからなる群から選択され；

R_2 は、

- 水素；
- アルキル；
- アルキル - OH；
- ハロアルキル；
- アルケニル；
- アルキル - X - アルキル；
- アルキル - X - アルケニル；
- アルケニル - X - アルキル；
- アルケニル - X - アルケニル；
- アルキル - $N(R_5)_2$ ；
- アルキル - N_3 ；
- アルキル - O - C(O) - $N(R_5)_2$ ；
- ヘテロシクリル；
- アルキル - X - ヘテロシクリル；
- アルケニル - X - ヘテロシクリル；
- アリール；
- アルキル - X - アリール；
- アルケニル - X - アリール；
- ヘテロアリール；
- アルキル - X - ヘテロアリール；および
- アルケニル - X - ヘテロアリール

からなる群から選択され；

R_3 および R_4 は、それぞれ独立して、

- 水素；
- X - アルキル；
- ハロ；
- ハロアルキル；
- $N(R_5)_2$

であるか；あるいは、 R_3 および R_4 をひとまとめにして、 R_3 および R_4 が、縮

合芳香環、ヘテロ芳香環、シクロアルキル環、またはヘテロ環式環を形成し；Xは、-

O -、- S -、- NR_5 -、- C(O) -、- C(O)O -、- OC(O) -、および単結合からなる群から選択され；ならびに

各 R_5 は、独立してHまたは C_{1-8} アルキルであり；

但し R_1 が硫黄の場合、 R_3 は $-NH_2$ ではない。) の化合物あるいはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項 2】 R_1 が酸素または硫黄である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】 R_1 が硫黄である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】 R_3 および R_4 をひとまとめにして、 R_3 および R_4 が置換されているまたは置換されていないベンゼン環を形成する、請求項 1、2 または 3 に記載の化合物。

【請求項 5】 R_3 および R_4 をひとまとめにして、 R_3 および R_4 が置換されているまたは置換されていないピリジン環を形成する、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 6】 R_2 が C_{1-4} アルキルである、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 7】 2 - n - プロピルチアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン、またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項 8】 2 - メチルチアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
チアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
2 - エチルチアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
2 - プロピルチアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
2 - ペンチルチアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
2 - ブチルチアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
2 - (1 - メチルエチル) チアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
2 - (2 - フェニル - 1 - エテニル) チアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
2 - (2 - フェニル - 1 - エチル) チアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
2 - (4 - アミノチアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 2 - イル) - 1 , 1 - ジメチルエチルカルバメート；

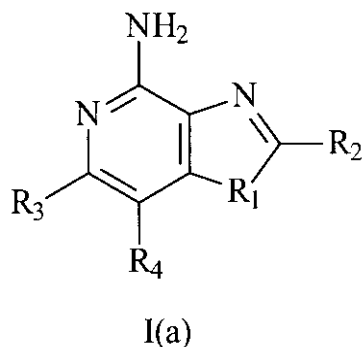
2 - (エトキシメチル) チアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
2 - (メトキシメチル) チアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
2 - (2 - メチルプロピル) チアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
2 - ベンジルチアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
8 - メチル - 2 - プロピルチアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
(4 - アミノチアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 2 - イル) メタノール；
2 - メチルオキサゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
2 - エチルオキサゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
2 - ブチルオキサゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
2 - プロピルチアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 , 8 - ジアミン；
2 - プロピルオキサゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
8 - プロモ - 2 - プロピルチアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
7 - メチル - 2 - プロピルチアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
2 - ブチル - 7 - メチルオキサゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
7 - メチル - 2 - プロピルオキサゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
7 - フルオロ - 2 - プロピルオキサゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
7 - フルオロ - 2 - プロピルチアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
2 - プロピル - 7 - (トリフルオロメチル) チアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；

2 - (4 - モルホリノ) チアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
2 - (1 - ピロリジノ) チアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
2 - ブチルチアゾロ [4 , 5 - c] [1 , 5] ナフチリジン - 4 - アミン；
2 - プロピルチアゾロ [4 , 5 - c] [1 , 5] ナフチリジン - 4 - アミン；
7 - クロロ - 2 - プロピルチアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；
7 - メトキシ - 2 - プロピルチアゾロ [4 , 5 - c] キノリン - 4 - アミン；

およびその薬学的に受容可能な塩、
からなる群から選択される化合物。

【請求項 9】 治療有効量の式 I (a)

【化 2】



(式中、 R_1 は、酸素、硫黄、およびセレンからなる群から選択され；
 R_2 は、

- 水素；
- アルキル；
- アルキル - OH；
- ハロアルキル；
- アルケニル；
- アルキル - X - アルキル；
- アルキル - X - アルケニル；
- アルケニル - X - アルキル；
- アルケニル - X - アルケニル；
- アルキル - $N(R_5)_2$ ；
- アルキル - N_3 ；
- アルキル - O - C(O) - $N(R_5)_2$ ；
- ヘテロシクリル；
- アルキル - X - ヘテロシクリル；
- アルケニル - X - ヘテロシクリル；
- アリール；
- アルキル - X - アリール；
- アルケニル - X - アリール；
- ヘテロアリール；
- アルキル - X - ヘテロアリール；および
- アルケニル - X - ヘテロアリール；

からなる群から選択され；

R_3 および R_4 は、それぞれ独立して：

- 水素；
- X - アルキル；
- ハロ；
- ハロアルキル；
- $N(R_5)_2$

であるか；あるいは、 R_3 および R_4 をひとまとめにして、 R_3 および R_4 が、縮

合芳香環、ヘテロ芳香環、シクロアルキル環、またはヘテロ環式環を形成し；Xは、-

O -、- S -、- NR_5 -、- C(O) -、- C(O)O -、- OC(O) -、および単結合からなる群から選択され；ならびに

各 R_5 は、独立してHまたは C_{1-8} アルキルである。)

の化合物あるいはその薬学的に受容可能な塩と、薬学的に受容可能なキャリアを含む薬学的組成物。

【請求項 10】 請求項 9 に記載の組成物を哺乳動物に投与することを含む、哺乳動物のサイトカイン生合成を誘導する方法。