

【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17年12月22日(2005.12.22)

【公表番号】特表2005-515169(P2005-515169A)

【公表日】平成17年5月26日(2005.5.26)

【年通号数】公開・登録公報2005-020

【出願番号】特願2003-539655(P2003-539655)

【国際特許分類第7版】

A 6 1 K 31/44

A 6 1 K 31/36

A 6 1 K 31/4402

A 6 1 K 31/4409

A 6 1 K 31/47

A 6 1 P 31/14

A 6 1 P 31/18

C 0 7 D 213/70

C 0 7 D 213/71

C 0 7 D 213/89

C 0 7 D 215/36

【F I】

A 6 1 K 31/44

A 6 1 K 31/36

A 6 1 K 31/4402

A 6 1 K 31/4409

A 6 1 K 31/47

A 6 1 P 31/14

A 6 1 P 31/18

C 0 7 D 213/70

C 0 7 D 213/71

C 0 7 D 213/89

C 0 7 D 215/36

【手続補正書】

【提出日】平成16年7月9日(2004.7.9)

【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】

H I V、H C M V及びH H Vからなる群から選択されるレトロウイルスによるレトロウイルス感染を、罹患した宿主において治療するための医薬組成物であって、

治療有効量の下式で表される化合物、又は薬剤として許容されるその酸付加塩若しくは塩基付加塩を含むことを特徴とする、医薬組成物：

【化 1】



[式中、

構成部分 A は、置換又は非置換アリール官能基、置換又は非置換ピペリジル、置換又は非置換チオフェニルであり、

構成部分 L は、スルホニル、スルフィニル又はチオであり、

構成部分 B は、置換又は非置換芳香族含窒素ヘテロアリール官能基である]。

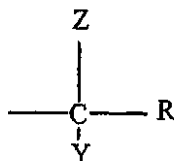
【請求項 2】

治療する前記レトロウイルス感染が、HIV - 1、HIV - 2 及び HHV - 6 からなる群から選択されるレトロウイルスによる感染である、請求項 1 に記載の 医薬組成物。

【請求項 3】

構成部分 A の前記置換又は非置換アリール官能基が、下式の官能基である、請求項 1 に記載の 医薬組成物：

【化 2】

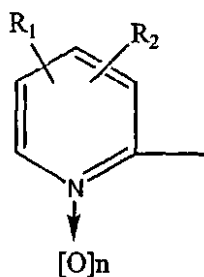


[式中、Z は、H、Cl、シアノ、1 ~ 15 個の炭素原子を有するアルキル、2 又は 3 個の炭素原子を有するアルコキシアルキルであり、Y は、H、又は R に結合している炭素との二重結合であり、R は、フェニル、ピフェニル、ベンジル、ポリシクロアリール、ヘテロアリール、又は同一若しくは異なる 1 ~ 5 個の置換基で置換されたフェニルである（該置換基は、1 ~ 5 個の炭素原子を有する低級アルキル、ハロゲン、ニトロ、メトキシ、エトキシ、ベンジルオキシ、メチレンジオキシ、2, 2 - ジクロロシクロプロピル、トリフルオロメチル、メチルスルホニル、シアノ及びフェノキシからなる群から選択される）]。

【請求項 4】

前記構成部分 B における置換又は非置換芳香族含窒素ヘテロアリール官能基が、4 - メチルキノリル、8 - エチル - 4 - メチルキノリル、又は下式の官能基である、請求項 1 に記載の 医薬組成物：

【化 3】



[式中、 n は 0 又は 1 であり、 R_1 及び R_2 は H、ハロゲン、1 ~ 4 個の炭素原子を有する低級アルキル、ヒドロキシ、又はニトロであり、同じでも異なってもよい]。

【請求項 5】

前記化合物が、2 - (フェニルメチルスルホニル)ピリジン - N - オキシド、2 - [1 - (2, 5 - ジメチルフェニル)オクチルスルホニル]ピリジン - N - オキシド、2 - [(2, 5 - ジメチルフェニル)メチルスルホニル]ピリジン - N - オキシド、2 - [[1 - (2, 5 - ジメチルフェニル)エチル]スルホニル] - 3 - メチルピリジン - N - オキシド、2 - [[1 - (2, 5 - ジメチルフェニル)クロロメチル]スルホニル] - 4 - メチルピリジン - N - オキシド、2 - [1 - (2, 5 - ジメチルフェニル)クロロメチル]スルホニルピリジン、2 - [1 - (2, 5 - ジメチルフェニル)メチルチオ] - 3 - クロロピリジン - N - オキシド、2 - [フェニルメチル]チオ - 3 - ヒドロキシピリジン、2 - [(2, 5 - ジメチルフェニル)メチルチオ]ピリジン、2 - [(2, 3, 4, 5, 6 - ペンタクロロフェニル)メチルスルホニル]ピリジン - N - オキシド、2 [1 - (フェニルエチル)スルホニル] - 8 - エチル - 4 - メチルキノリン、2 - [(3, 4 - ジクロロフェニル)メチルスルホニル]ピリジン - N - オキシド、2 - [(4 - (2, 2 - ジクロロシクロプロピル)フェニル)メチルスルホニル]ピリジン - N - オキシド、2 - [(2, 4, 6 - トリメチルフェニル)メチルスルフィニル]ピリジン - N - オキシド、2 - [(3 - ニトロ - 4 - クロロフェニル)メチルスルホニル]ピリジン - N - オキシド、2 - [フェニルメチルスルフィニル]ピリジン - N - オキシド、2 - [[1 - (2, 5 - ジメチルフェニル)プロピル]スルホニル] - 3 - メチルピリジン - N - オキシド、2 - [(9 - アントリル)メチルスルホニル]ピリジン - N - オキシド、2 - [4 - ((1, 1 - ジメチル)プロピル)フェニル)メチルスルホニル]ピリジン - N - オキシド、2 - [1 - (2, 5 - ジメチルフェニル)エチルチオ] - 4 - メチルキノリン、2 - [[(2, 5 - ジメチルフェニル)メチル]スルホニル] - 3 - メチルピリジン - N - オキシド、並びに薬剤として許容されるこれらの酸付加塩及び塩基付加塩からなる群から選択される、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

薬剤として許容される担体を含有する含有する、請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 7】

HIV、HCMV 及び HHV からなる群から選択されるレトロウイルスの複製を阻害するための、医薬組成物であって、

有効量の下式で表される化合物、又は薬剤として許容されるその酸付加塩若しくは塩基付加塩を含むことを特徴とする、医薬組成物：

【化 4】



[式中、

構成部分 A は、置換又は非置換アリール官能基、置換又は非置換ピペリジル、置換又は非置換チオフエニルであり、

構成部分 L は、スルホニル、スルフィニル又はチオであり、

構成部分 B は、置換又は非置換芳香族含窒素ヘテロアリール官能基である]。

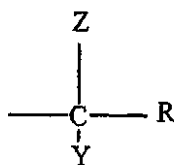
【請求項 8】

複製を阻害される前記レトロウイルスが、HIV - 1、HIV - 2 及び HHV - 6 からなる群から選択されるレトロウイルスである、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

構成部分 A の前記置換又は非置換アリール官能基が、下式の官能基である、請求項 7 に記載の医薬組成物：

【化 5】

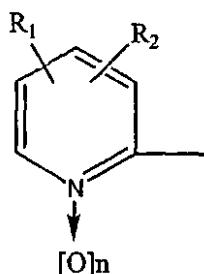


[式中、Z は、H、Cl、シアノ、1～15 個の炭素原子を有するアルキル、2 又は 3 個の炭素原子を有するアルコシアルキルであり、Y は、H、又は R に結合している炭素との二重結合であり、R は、フェニル、ビフェニル、ベンジル、ポリシクロアリール、ヘテロアリール、又は同一若しくは異なる 1～5 個の置換基で置換されたフェニルである（該置換基は、1～5 個の炭素原子を有する低級アルキル、ハロゲン、ニトロ、メトキシ、エトキシ、ベンジルオキシ、メチレンジオキシ、2, 2 - ジクロロシクロプロピル、トリフルオロメチル、メチルスルホニル、シアノ及びフェノキシからなる群から選択される）]。

【請求項 10】

前記構成部分 B における置換又は非置換芳香族含窒素ヘテロアリール官能基が、4 - メチルキノリル、8 - エチル - 4 - メチルキノリル、又は下式の官能基である、請求項 7 に記載の医薬組成物：

【化 6】



[式中、n は 0 又は 1 であり、R₁ 及び R₂ は、H、ハロゲン、1～4 個の炭素原子を有する低級アルキル、ヒドロキシ、又はニトロであり、同じでも異なってもよい]。

【請求項 11】

前記化合物が、2 - (フェニルメチルスルホニル)ピリジン - N - オキシド、2 - [1 - (2, 5 - ジメチルフェニル)オクチルスルホニル]ピリジン - N - オキシド、2 - [(2, 5 - ジメチルフェニル)メチルスルホニル]ピリジン - N - オキシド、2 - [[1 - (2, 5 - ジメチルフェニル)エチル]スルホニル] - 3 - メチルピリジン - N - オキシド、2 - [[1 - (2, 5 - ジメチルフェニル)クロロメチル]スルホニル] - 4 - メチルピリジン - N - オキシド、2 - [1 - (2, 5 - ジメチルフェニル)クロロメチル]スルホニルピリジン、2 - [1 - (2, 5 - ジメチルフェニル)メチルチオ] - 3 - クロロピリジン - N - オキシド、2 - [フェニルメチル]チオ - 3 - ヒドロキシピリジン、2 - [(2, 5 - ジメチルフェニル)メチルチオ]ピリジン、2 - [(2, 3, 4, 5, 6 - ペンタクロロフェニル)メチルスルホニル]ピリジン - N - オキシド、2 [1 - (フェニルエチル)スルホニル] - 8 - エチル - 4 - メチルキノリン、2 - [(3, 4 - ジクロロフェニル)メチルスルホニル]ピリジン - N - オキシド、2 - [(4 - (2, 2 - ジクロロシクロプロピル)フェニル)メチルスルホニル]ピリジン - N - オキシド、2 - [(2, 4, 6 - トリメチルフェニル)メチルスルフィニル]ピリジン - N - オキシド、2 - [(3 - ニトロ - 4 - クロロフェニル)メチルスルホニル]ピリジン - N - オキシド、2

- [フェニルメチルスルフィニル]ピリジン - N - オキシド、2 - [[1 - (2 , 5 - ジメチルフェニル) プロピル] スルホニル] - 3 - メチルピリジン - N - オキシド、2 - [(9 - アントリル) メチルスルホニル] ピリジン - N - オキシド、2 - [4 - ((1 , 1 - ジメチル) プロピル) フェニル) メチルスルホニル] ピリジン - N - オキシド、2 - [1 - (2 , 5 - ジメチルフェニル) エチルチオ] - 4 - メチルキノリン、2 - [[(2 , 5 - ジメチルフェニル) メチル] スルホニル] - 3 - メチルピリジン - N - オキシド、並びに薬剤として許容されるこれらの酸付加塩及び塩基付加塩からなる群から選択される、請求項 7 に記載の 医薬組成物。

【請求項 1 2】

薬剤として許容される担体を含む、請求項 7 に記載の 医薬組成物。

【請求項 1 3】

H I V 感染を、罹患した宿主において治療するための 医薬組成物 であって

2 - [[1 - (2 , 5 - ジメチルフェニル) エチル] スルホニル] - 3 - メチルピリジン - N - オキシド、2 - [[1 - (2 , 5 - ジメチルフェニル) クロロメチル] スルホニル] - 4 - メチルピリジン - N - オキシド、2 - [1 - (2 , 5 - ジメチルフェニル) クロロメチル] スルホニル] ピリジン、2 - [1 - (2 , 5 - ジメチルフェニル) メチルチオ] - 3 - クロロピリジン - N - オキシド、2 - [フェニルメチル] チオ - 3 - ヒドロキシピリジン、2 - [(2 , 3 , 4 , 5 , 6 - ペンタクロロフェニル) メチルスルホニル] ピリジン - N - オキシド、2 [1 - (フェニルエチル) スルホニル] - 8 - エチル - 4 - メチルキノリン、2 - [(3 , 4 - ジクロロフェニル) メチルスルホニル] ピリジン - N - オキシド、2 - [(4 - (2 , 2 - ジクロロシクロプロピル) フェニル) メチルスルホニル] ピリジン - N - オキシド、2 - [(2 , 4 , 6 - トリメチルフェニル) メチルスルフィニル] ピリジン - N - オキシド、2 - [(3 - ニトロ - 4 - クロロフェニル) メチルスルホニル] ピリジン - N - オキシド、2 - [フェニルメチルスルフィニル] ピリジン - N - オキシド、2 - [[(2 , 5 - ジメチルフェニル) メチル] スルホニル] - 3 - メチルピリジン - N - オキシド、並びに薬剤として許容されるこれらの酸付加塩及び塩基付加塩からなる群から選択される治療有効量の化合物を含むことを特徴とする、医薬組成物。

【請求項 1 4】

H C M V 感染を、罹患した宿主において治療するための 医薬組成物 であって、

2 - [(2 , 5 - ジメチルフェニル) メチルチオ] ピリジン、2 - [1 - (2 , 5 - ジメチルフェニル) オクチルスルホニル] ピリジン - N - オキシド、2 - [[1 - (2 , 5 - ジメチルフェニル) プロピル] スルホニル] - 3 - メチルピリジン - N - オキシド、2 - [(9 - アントリル) メチルスルホニル] ピリジン - N - オキシド、2 - [4 - ((1 , 1 - ジメチル) プロピル) フェニル) メチルスルホニル] ピリジン - N - オキシド、2 - [1 - (2 , 5 - ジメチルフェニル) エチルチオ] - 4 - メチルキノリン、並びに薬剤として許容されるこれらの酸付加塩及び塩基付加塩からなる群から選択される治療有効量の化合物を含むことを特徴とする、医薬組成物。

【請求項 1 5】

H H V - 6 感染を、罹患した宿主において治療するための 医薬組成物 であって、

2 - [(2 , 5 - ジメチルフェニル) メチルスルホニル] ピリジン - N - オキシド、及び 2 - (フェニルメチルスルホニル) ピリジン - N - オキシド、並びに薬剤として許容されるこれらの酸付加塩及び塩基付加塩からなる群から選択される治療有効量の化合物を含むことを特徴とする、医薬組成物。