

【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21年11月26日(2009.11.26)

【公表番号】特表2005-526072(P2005-526072A)

【公表日】平成17年9月2日(2005.9.2)

【年通号数】公開・登録公報2005-034

【出願番号】特願2003-574659(P2003-574659)

【国際特許分類】

| | |
|----------------|-----------|
| C 07 D 487/06 | (2006.01) |
| A 61 K 31/407 | (2006.01) |
| A 61 K 31/4355 | (2006.01) |
| A 61 K 31/4745 | (2006.01) |
| A 61 K 31/55 | (2006.01) |
| A 61 K 31/5513 | (2006.01) |
| A 61 P 3/10 | (2006.01) |
| A 61 P 25/28 | (2006.01) |
| A 61 P 43/00 | (2006.01) |
| C 07 D 498/06 | (2006.01) |
| C 07 D 519/00 | (2006.01) |

【F I】

| | |
|----------------|-------|
| C 07 D 487/06 | C S P |
| A 61 K 31/407 | |
| A 61 K 31/4355 | |
| A 61 K 31/4745 | |
| A 61 K 31/55 | |
| A 61 K 31/5513 | |
| A 61 P 3/10 | |
| A 61 P 25/28 | |
| A 61 P 43/00 | 1 1 1 |
| C 07 D 498/06 | |
| C 07 D 519/00 | 3 0 1 |
| C 07 D 519/00 | 3 1 1 |

【誤訳訂正書】

【提出日】平成21年10月6日(2009.10.6)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

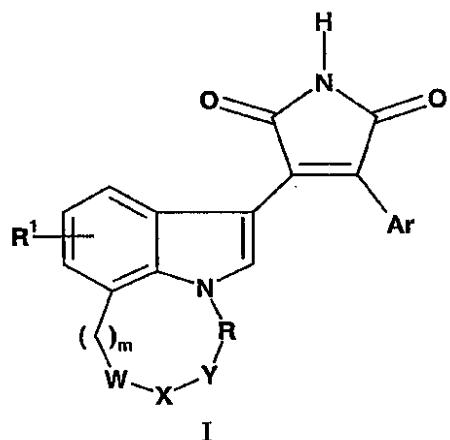
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I:

【化1】



[式中、

R¹は、水素、ハロ、またはC₁-C₄アルキルであり；

mは、0、1、2、3、または4であり；

Rは、-CH₂-、-CH(CH₃)-、-C(CH₃)₂-、-CH₂-Q¹-CH₂-、または-CH(OH)-CH(OH)-CH₂-であり；

Q¹は、CH(OH)またはカルボニルであり；

nは、0、1、2、3、または4であり；

W-X-Yは、-CH₂-CH₂-CH₂-、-CH(R³)-N(R²)-CH(R³)-、-N(R⁴)-C(O)-CH₂-、-C(O)-Q²-CH₂-、-CH(R³)-O-CH₂-、または-CH(R³)-N(R⁴)-C(O)-であり；

Q²は-N(R⁴)-または-CH₂-であり；

R²は水素、-(C₁-C₄アルキレン)-R⁵、C₅-C₇シクロアルキル、テトラヒドロピラン-4-イル、ピリジニル、ピリミジニル、アミノで置換されていることもあるトリアゾリル、ベンゾチアゾール-2-イル、-C(S)-（モルホリン-4-イルまたはC₁-C₄アルコキシ）、-C(NR¹⁶)R¹⁷、-C(O)R⁶、-CO₂R⁷、-CO(NR⁸R⁹)、-SO₂(NR⁸R⁹)、-SO₂(C₁-C₄アルキル)、またはアミノ酸残基であり；

R³およびR^{3'}は、水素およびC₁-C₄アルキルからなる群から独立に選択され、但し、R³およびR^{3'}の1つのみがC₁-C₄アルキルであってよく；

R⁴は水素またはC₁-C₄アルキルであり；

R⁵は水素、ペンタハロエチルまたはトリハロメチル、シアノ、ヒドロキシ、C₁-C₄アルコキシで置換されていることもあるC₁-C₄アルコキシ、C₃-C₆シクロアルキル、ハロおよびC₁-C₄アルコキシからなる群から独立に選択される3個までの置換基で置換されていることもあるフェニル、ピリジニル、場合により窒素原子がC₃-C₆シクロアルキルで置換されたイミダゾリル、モルホリン-4-イル、ピロリジン-1-イル、-CO₂H、-CO(C₁-C₄アルコキシ)、-CO(NR⁸R⁹)、-NR⁸R⁹または-(モルホリン-4-イル)カルボニルであり；

R⁶は、水素、3個までのハロ置換基で置換されているもあるC₁-C₁₀アルキル、1-アミノ-2-メトキシエタ-1-イル、C₃-C₆シクロアルキル、C₁-C₄アルキル、トリフルオロメチル、カルボキシル、または(C₁-C₄アルコキシ)カルボニルで置換されているもあるピリジニル、ピリジニル-N-オキシド、ピラジニル、ピリミジニル、イミダゾリル、2までのC₁-C₄アルキル基で置換されているもあるモルホリン-4-イル、[1,4]オキサゼピン-4-イル、アゼチジン-4-イル、テトラヒドロピラン-4-イル、3-メチル-6,7-ジヒドロピロ口[1,2-a]イミダゾール-6-イル、場合により4位でフェニルまたはC₁-C₄アルキルにより置換されたピペラジン-4-イル、ピロリジン-1-イル、場合により4位でオキソまたはジェミナルなジメチル置換されたピペリジン-1-イル、場合により1位で(C₁-C₄アルコキシ)カルボニ

ルまたはC₁ - C₄アルキルで置換されたピペリジン - 4 - イルまたは - (C₁ - C₄アルキレン) - R¹⁰であり；

R⁷はハロで置換されていることもあるC₁ - C₆アルキル、2 - メトキシエタ - 1 - イル、 - (C₁ - C₂アルキレン) - (モルホリン - 4 - イルまたはピロリジン - 2 - オン - 1 - イル)、またはハロ、C₁ - C₄アルキル、C₁ - C₄アルコキシ、およびトリフルオロメチルからなる群から独立に選択される1または2個の置換基で置換されていることもあるフェニルであり；

R⁸は、水素またはC₁ - C₄アルコキシで置換されていることもあるC₁ - C₆アルキルであり；

R⁹は、水素またはC₁ - C₄アルコキシで置換されているもあるC₁ - C₆アルキルであり；

R¹⁰は、-OCH₂CH₂OCH₃、-NR¹⁴R¹⁵、C₃ - C₆シクロアルキル、モルホリン - 4 - イル、チオモルホリン - 4 - イル、1,1 - ジオキソチオモルホリン - 4 - イル、ピペリジン - 1 - イル、場合により1位でC₁ - C₄アルキルにより置換されたピロリジン - 2 - イル、またはニトロで置換されているもあるイミダゾリルであり；

A_rは、それぞれフェニル環が置換基R¹²およびR¹³で置換されていることもある、ベンゾフラ - 4 - イル、ベンゾフラ - 7 - イル、ベンゾチエン - 4 - イル、ベンゾチエン - 7 - イル、1 - (R¹¹)ベンズイミダゾール - 4 - イル、1 - (R¹¹)インドール - 4 - イル、インドール - 7 - イル、イソキノリン - 5 - イル、2,3 - ジヒドロベンゾ - フラ - 4 - イル、2,3 - ジヒドロベンゾフラ - 7 - イル、1,3 - ジヒドロイソベンゾフラ - 4 - イル、1,3 - ジヒドロイソベンゾフラ - 5 - イル、ベンゾ[1,3]ジオキソール - 4 - イル、ベンゾ[1,3]ジオキソール - 5 - イル、2,3 - ジヒドロベンゾ[1,4]ダイオキシン - 6 - イル、2'、2' - ジフルオロベンゾ[1,3]ジオキソール - 4 - イル、または2'、2' - ジフルオロ - ベンゾ[1,3]ジオキソール - 5 - イルであるか、またはA_rは、ハロ、アミノ、C₁ - C₄アルキル、C₁ - C₄アルコキシ、ベンジルオキシ、シアノ、およびトリフルオロメチルからなる群から独立に選択される1または2個の置換基で置換されているもあるイミダゾ[1,2-a]ピリジン - 3 - イル、5,6,7,8 - テトラヒドロイミダゾ[1,2-a]ピリジン - 3 - イル、イミダゾ[1,2-a]ピリジン - 5 - イル、アミノで置換されているもあるイミダゾ[1,2-a]ピリミジン - 3 - イル、イミダゾ[1,2-c]ピリミジン - 3 - イル、イミダゾ[1,2-a]ピラジン - 3 - イル、イミダゾ[1,2-b]ピリダジン - 3 - イル、イミダゾ[2,1-b]チアゾール - 3 - イル、チアゾロ[3,2-b][1,2,4]トリアゾール - 6 - イル、ハロまたは-NR¹⁴R¹⁵で置換されているもあるフロ[3,2-c]ピリジン - 7 - イル、チエノ[3,2-b]ピリジン - 7 - イル、ピラゾロ[2,3-a]ピリジン - 3 - イル、ピラゾロ[1,5-a]ピリジン - 3 - イル、または4,5,6,7 - テトラヒドロピラゾロ[1,5-a]ピリジン - 3 - イルから選択される基であり；

R¹¹は、水素、C₁ - C₄アルキル、または-(CH₂)_p-Gであり；

R¹²は、ハロ、ヒドロキシ、アミノ、C₁ - C₄アルコキシ、-NHCO(O)(C₁ - C₄アルキル)または-O-(CH₂)_p-Gであり；

R¹³は、ハロであり；

pは、2、3、4、または5であり；

Gは、ヒドロキシまたはNR¹⁴R¹⁵であり；

R¹⁴およびR¹⁵は水素およびC₁ - C₅アルキルからなる群から独立に選択され；

R¹⁶は、水素またはシアノであり、

R¹⁷は、-NR⁸R⁹、C₁ - C₄アルキル、モルホリン - 4 - イル、またはピペリジン - 1 - イルである；

但し、nが0であるとき、W-X-Yは-CH(R³)-N(R²)-C(O)-でない】

で示される化合物、またはその製薬的に許容し得る塩。

【請求項2】

A_rが、フェニル環において置換基 R¹²およびR¹³で場合により置換されているベンゾフラ - 4 - イル、ベンゾフラ - 7 - イル、または 2, 3 - ジヒドロベンゾフラ - 7 - イルである、請求項 1 記載の化合物。

【請求項3】

Arが、ハロ、C₁-C₄アルキル、またはC₁-C₄アルコキシからなる群から独立に選択される1または2個の基で置換されていることもあるイミダゾ[1,2-a]ピリジン-3-イルである、請求項1記載の化合物。

【請求項4】

W - X - Y が - C H (R³,) - N (R²) - C H (R³) - である、請求項 1, 2 または 3 のいずれかに記載の化合物。

【請求項5】

R²が-C(=O)R⁶である、請求項4記載の化合物。

【請求項6】

製薬的に許容し得る担体、希釈剤または賦形剤とともに請求項1～5のいずれかに記載の化合物を含有する医薬組成物。

【請求項 7】

有効量の請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の化合物を含有する、糖尿病の処置のための医薬組成物。

【請求項 8】

有効量の請求項1～5のいずれかに記載の化合物を含有する、アルツハイマー病の処置のための医薬組成物。

【請求項 9】

有効量の請求項 1～5 のいずれかに記載の化合物を含有する、哺乳類における GSK-3 の阻害のための医薬組成物。

【請求項 10】

有効量の請求項1～5のいずれかに記載の化合物を含有する、哺乳類における骨形成の促進のための医薬組成物。

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】 0 0 0 5

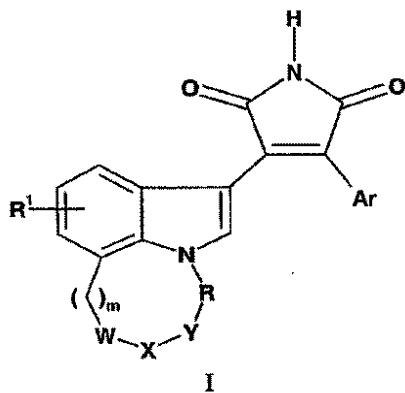
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【 0 0 0 5 】

木登明は式

【化 1】



[式中、

R^1 は、水素、ハロ、または $C_1 - C_4$ アルキルであり；

m は、0、1、2、3、または4であり；

R は、 - (C H₂)_n - 、 - C H (C H₃) - 、 - C (C H₃)₂ - 、 - C H₂ - Q¹ - C H₂ - 、 または - C H (O H) - C H (O H) - C H₂ - であり；

Q¹ は、 C H (O H) またはカルボニルであり；

n は、 0、 1、 2、 3、 または 4 であり；

W - X - Y は、 - C H₂ - C H₂ - C H₂ - 、 - C H (R³) - N (R²) - C H (R³) - 、 - N (R⁴) - C (O) - C H₂ - 、 - C (O) - Q² - C H₂ - 、 - C H (R³) - O - C H₂ - 、 または - C H (R³) - N (R⁴) - C (O) - であり；

Q² は - N (R⁴) - または - C H₂ - であり；

R² は水素、 - (C₁ - C₄ アルキレン) - R⁵、 C₅ - C₇ シクロアルキル、 テトラヒドロピラン - 4 - イル、 ピリジニル、 ピリミジニル、 アミノで置換されていることもあるトリアゾリル、 ベンゾチアゾール - 2 - イル、 - C (S) - (モルホリン - 4 - イルまたは C₁ - C₄ アルコキシ)、 - C (N R¹⁶) R¹⁷、 - C (O) R⁶、 - C O₂ R⁷、 - C O (N R⁸ R⁹)、 - S O₂ (N R⁸ R⁹)、 - S O₂ (C₁ - C₄ アルキル)、 またはアミノ酸残基であり；

R³ および R^{3'} は、 水素および C₁ - C₄ アルキルからなる群から独立に選択され、 但し、 R³ および R^{3'} の 1 つのみが C₁ - C₄ アルキルであってよく；

R⁴ は水素または C₁ - C₄ アルキルであり；

R⁵ は水素、 ペンタハロエチルまたはトリハロメチル、 シアノ、 ヒドロキシ、 C₁ - C₄ アルコキシで置換されていることもある C₁ - C₄ アルコキシ、 C₃ - C₆ シクロアルキル、 ハロおよび C₁ - C₄ アルコキシからなる群から独立に選択される 3 個までの置換基で置換されていることもあるフェニル、 ピリジニル、 場合により窒素原子が C₃ - C₆ シクロアルキルで置換されたイミダゾリル、 モルホリン - 4 - イル、 ピロリジン - 1 - イル、 - C O₂ H、 - C O (C₁ - C₄ アルコキシ)、 - C O (N R⁸ R⁹)、 - N R⁸ R⁹ または - (モルホリン - 4 - イル) カルボニルであり；

R⁶ は、 水素、 3 個までのハロ置換基で置換されているもある C₁ - C₁₀ アルキル、 1 - アミノ - 2 - メトキシエタ - 1 - イル、 C₃ - C₆ シクロアルキル、 C₁ - C₄ アルキル、 トリフルオロメチル、 カルボキシル、 または (C₁ - C₄ アルコキシ) カルボニルで置換されているもあるピリジニル、 ピリジニル - N - オキシド、 ピラジニル、 ピリミジニル、 イミダゾリル、 2 までの C₁ - C₄ アルキル基で置換されているもあるモルホリン - 4 - イル、 [1, 4] オキサゼピン - 4 - イル、 アゼチジン - 4 - イル、 テトラヒドロピラン - 4 - イル、 3 - メチル - 6, 7 - ジヒドロピロ口 [1, 2 - a] イミダゾール - 6 - イル、 場合により 4 位でフェニルまたは C₁ - C₄ アルキルにより置換されたピペラジン - 4 - イル、 ピロリジン - 1 - イル、 場合により 4 位でオキソまたはジェミナルなジメチル置換されたピペリジン - 1 - イル、 場合により 1 位で (C₁ - C₄ アルコキシ) カルボニルまたは C₁ - C₄ アルキルで置換されたピペリジン - 4 - イルまたは - (C₁ - C₄ アルキレン) - R¹⁰ であり；

R⁷ は ハロ で置換されているもある C₁ - C₆ アルキル、 2 - メトキシエタ - 1 - イル、 - (C₁ - C₂ アルキレン) - (モルホリン - 4 - イルまたはピロリジン - 2 - オン - 1 - イル)、 またはハロ、 C₁ - C₄ アルキル、 C₁ - C₄ アルコキシ、 およびトリフルオロメチルからなる群から独立に選択される 1 または 2 個の置換基で置換されているもあるフェニルであり；

R⁸ は、 水素または C₁ - C₄ アルコキシで置換されているもある C₁ - C₆ アルキルであり；

R⁹ は、 水素または C₁ - C₄ アルコキシで置換されているもある C₁ - C₆ アルキルであり；

R¹⁰ は、 - O C H₂ C H₂ O C H₃、 - N R¹⁴ R¹⁵、 C₃ - C₆ シクロアルキル、 モルホリン - 4 - イル、 チオモルホリン - 4 - イル、 1, 1 - ジオキソチオモルホリン - 4 - イル、 ピペリジン - 1 - イル、 場合により 1 位で C₁ - C₄ アルキルにより置換されたピロリジン - 2 - イル、 またはニトロで置換されているもあるイミダゾリルであり；

A_r は、 それぞれフェニル環が置換基 R¹² および R¹³ で置換されていることもある、 ベ

ンゾフラ - 4 - イル、ベンゾフラ - 7 - イル、ベンゾチエン - 4 - イル、ベンゾチエン - 7 - イル、1 - (R¹¹)ベンズイミダゾール - 4 - イル、1 - (R¹¹)インドール - 4 - イル、インドール - 7 - イル、イソキノリン - 5 - イル、2,3 - ジヒドロベンゾ - フラ - 4 - イル、2,3 - ジヒドロベンゾフラ - 7 - イル、1,3 - ジヒドロイソベンゾフラ - 4 - イル、1,3 - ジヒドロイソベンゾフラ - 5 - イル、ベンゾ [1,3]ジオキソール - 4 - イル、ベンゾ [1,3]ジオキソール - 5 - イル、2,3 - ジヒドロベンゾ [1,4]ダイオキシン - 5 - イル、2,3 - ジヒドロベンゾ [1,4]ダイオキシン - 6 - イル、2'、2' - ジフルオロベンゾ [1,3]ジオキソール - 4 - イル、または2'、2' - ジフルオロ - ベンゾ [1,3]ジオキソール - 5 - イルであるか、またはArは、ハロ、アミノ、C₁ - C₄アルキル、C₁ - C₄アルコキシ、ベンジルオキシ、シアノ、およびトリフルオロメチルからなる群から独立に選択される1または2個の置換基で置換されていることもあるイミダゾ [1,2 - a]ピリジン - 3 - イル、5,6,7,8 - テトラヒドロイミダゾ [1,2 - a]ピリジン - 3 - イル、イミダゾ [1,2 - a]ピリジン - 5 - イル、アミノで置換されていることもあるイミダゾ [1,2 - a]ピリミジン - 3 - イル、イミダゾ [1,2 - c]ピリミジン - 3 - イル、イミダゾ [1,2 - a]ピラジン - 3 - イル、イミダゾ [1,2 - b]ピリダジン - 3 - イル、イミダゾ [2,1 - b]チアゾール - 3 - イル、チアゾロ [3,2 - b] [1,2,4]トリアゾール - 6 - イル、ハロまたは-NR¹⁴R¹⁵で置換されていることもあるフロ [3,2 - c]ピリジン - 7 - イル、チエノ [3,2 - b]ピリジン - 7 - イル、ピラゾロ [2,3 - a]ピリジン - 3 - イル、ピラゾロ [1,5 - a]ピリジン - 3 - イル、または4,5,6,7 - テトラヒドロピラゾロ [1,5 - a]ピリジン - 3 - イルから選択される基であり；

R¹¹は、水素、C₁ - C₄アルキル、または-(CH₂)_p-Gであり；

R¹²は、ハロ、ヒドロキシ、アミノ、C₁ - C₄アルコキシ、-NHCO(O)(C₁ - C₄アルキル)または-O-(CH₂)_p-Gであり；

R¹³は、ハロであり；

pは、2、3、4、または5であり；

Gは、ヒドロキシまたはNR¹⁴R¹⁵であり；

R¹⁴およびR¹⁵は水素およびC₁ - C₅アルキルからなる群から独立に選択され；

R¹⁶は、水素またはシアノであり、

R¹⁷は、-NR⁸R⁹、C₁ - C₄アルキル、モルホリン - 4 - イル、またはビペリジン - 1 - イルである；

但し、nが0であるとき、W-X-Yは-CH(R³)-N(R²)-C(O)-でない】

で示される化合物、またはその製薬的に許容し得る塩を提供する。