

【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 0 7 D 487/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/407 (2006.01)

A 6 1 K 31/4355 (2006.01)

A 6 1 K 31/4745 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 K 31/5513 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 498/06 (2006.01)

C 0 7 D 519/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 487/06 C S P

A 6 1 K 31/407

A 6 1 K 31/4355

A 6 1 K 31/4745

A 6 1 K 31/55

A 6 1 K 31/5513

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 498/06

C 0 7 D 519/00 3 0 1

C 0 7 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

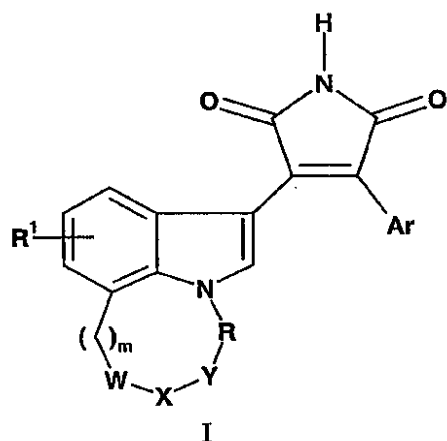
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

【化 1】



[式中、

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、 $-(CH_2)_n-$ 、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-C(CH_3)_2-$ 、 $-CH_2-Q^1-CH_2-$ 、または $-CH(OH)-CH(OH)-CH_2-$ であり；

Q^1 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、 $-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH(R^{3'})-N(R^2)-CH(R^3)-$ 、 $-N(R^4)-C(O)-CH_2-$ 、 $-C(O)-Q^2-CH_2-$ 、 $-CH(R^{3'})-O-CH_2-$ 、または $-CH(R^{3'})-N(R^4)-C(O)-$ であり；

Q^2 は $-N(R^4)-$ または $-CH_2-$ であり；

R^2 は水素、 $-(C_1 - C_4$ アルキレン) $-R^5$ 、 $C_5 - C_7$ 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 $C_1 - C_4$ アルコキシ) $)-C(NR^{16})R^{17}$ 、 $-C(O)R^6$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-CO(NR^8R^9)$ 、 $-SO_2(NR^8R^9)$ 、 $-SO_2(C_1 - C_4$ アルキル)、またはアミノ酸残基であり；

R^3 および $R^{3'}$ は、水素および $C_1 - C_4$ アルキルからなる群から独立に選択され、但し、 R^3 および $R^{3'}$ の1つのみが $C_1 - C_4$ アルキルであってよく；

R^4 は水素または $C_1 - C_4$ アルキルであり；

R^5 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、 $C_1 - C_4$ アルコキシで置換されていることもある $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、ハロおよび $C_1 - C_4$ 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 $C_3 - C_6$ 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、 $-CO_2H$ 、 $-CO(C_1 - C_4$ アルコキシ)、 $-CO(NR^8R^9)$ 、 $-NR^8R^9$ または $-($ モルホリン-4-イル $)$ カルボニルであり；

R^6 は、水素、3個までのハロ置換基で置換されていることもある $C_1 - C_{10}$ アルキル、1-アミノ-2-メトキシエタ-1-イル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、 $C_1 - C_4$ アルキル、トリフルオロメチル、カルボキシル、または $(C_1 - C_4$ アルコキシ)カルボニルで置換されていることもあるピリジニル、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 $C_1 - C_4$ アルキル基で置換されていることもあるモルホリン-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-ジヒドロピロロ[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 $C_1 - C_4$ 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 $(C_1 - C_4$ アルコキシ)カルボニル

ルまたは $C_1 - C_4$ アルキルで置換されたピペリジン - 4 - イルまたは - ($C_1 - C_4$ アルキレン) - R^{10} であり；

R^7 は ハロ で置換されていることもある $C_1 - C_6$ アルキル、2 - メトキシエタ - 1 - イル、- ($C_1 - C_2$ 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、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ 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；

R^8 は、水素または $C_1 - C_4$ アルコキシで置換されていることもある $C_1 - C_6$ アルキルであり；

R^9 は、水素または $C_1 - C_4$ アルコキシで置換されていることもある $C_1 - C_6$ アルキルであり；

R^{10} は、- $OCH_2CH_2OCH_3$ 、- $NR^{14}R^{15}$ 、 $C_3 - C_6$ 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 $C_1 - C_4$ 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こともあるイミダゾールであり；

Ar は、それぞれフェニル環が置換基 R^{12} および R^{13} 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 - (R^{11}) ベンズイミダゾール - 4 - イル、1 - (R^{11}) 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、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ 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 - $NR^{14}R^{15}$ 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；

R^{11} は、水素、 $C_1 - C_4$ アルキル、または - (CH_2)_p - G であり；

R^{12} は、ハロ、ヒドロキシ、アミノ、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、- $NHC(O)(C_1 - C_4$ アルキル) または - $O - (CH_2)_p - G$ であり；

R^{13} 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 $NR^{14}R^{15}$ であり；

R^{14} および R^{15} は水素および $C_1 - C_5$ アルキルからなる群から独立に選択され；

R^{16} は、水素またはシアノであり、

R^{17} は、- NR^8R^9 、 $C_1 - C_4$ 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 - $CH(R^3)$ - $N(R^2)$ - $C(O)$ - 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】

Ar が、フェニル環において置換基 R^{12} および R^{13} 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、 $C_1 - C_4$ アルキル、または $C_1 - C_4$ 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 - CH (R^3 ') - N (R^2) - CH (R^3) - 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】

R^2 が - C (O) R^6 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】0005

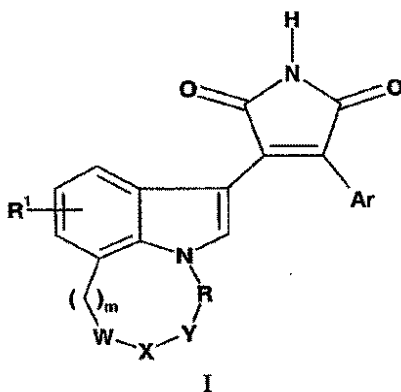
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0005】

本発明は式 I :

【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、 $-(CH_2)_n-$ 、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-C(CH_3)_2-$ 、 $-CH_2-Q^1-CH_2-$ 、
 または $-CH(OH)-CH(OH)-CH_2-$ であり；

Q^1 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、 $-CH_2-CH_2-CH_2-$ 、 $-CH(R^{3'})-N(R^2)-CH(R^3)-$ 、
 $-N(R^4)-C(O)-CH_2-$ 、 $-C(O)-Q^2-CH_2-$ 、 $-CH(R^{3'})-O-CH_2-$ 、
 または $-CH(R^{3'})-N(R^4)-C(O)-$ であり；

Q^2 は $-N(R^4)-$ または $-CH_2-$ であり；

R^2 は水素、 $-(C_1-C_4\text{アルキレン})-R^5$ 、 C_5-C_7 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、 $-C(S)-(モルホリン-4-イル\text{または}\ C_1-C_4\text{アルコキシ})$ 、
 $-C(NR^{16})R^{17}$ 、 $-C(O)R^6$ 、 $-CO_2R^7$ 、 $-CO(NR^8R^9)$ 、 $-SO_2(NR^8R^9)$ 、
 $-SO_2(C_1-C_4\text{アルキル})$ 、またはアミノ酸残基であ
 り；

R^3 および $R^{3'}$ は、水素および C_1-C_4 アルキルからなる群から独立に選択され、但し
 R^3 および $R^{3'}$ の1つのみが C_1-C_4 アルキルであってよく；

R^4 は水素または C_1-C_4 アルキルであり；

R^5 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、 C_1-C_4
 アルコキシで置換されていることもある C_1-C_4 アルコキシ、 C_3-C_6 シクロアルキル、
 ハロおよび C_1-C_4 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 C_3-C_6 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、 $-CO$
 $_2H$ 、 $-CO(C_1-C_4\text{アルコキシ})$ 、 $-CO(NR^8R^9)$ 、 $-NR^8R^9$ または $-(モル$
 ホリン - 4 - イル)カルボニルであり；

R^6 は、水素、3個までのハロ置換基で置換されていることもある C_1-C_{10} アルキル、
 1 - アミノ - 2 - メトキシエタ - 1 - イル、 C_3-C_6 シクロアルキル、 C_1-C_4 アルキル
 、トリフルオロメチル、カルボキシル、または $(C_1-C_4\text{アルコキシ})$ カルボニルで置換
 されていることもあるピリジニル、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 C_1-C_4 アルキル基で置換されていることもあるモルホリン
 - 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 - ジヒドロピロロ[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 C_1-C_4 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 $(C_1-C_4\text{アルコキシ})$ カルボニ
 ルまたは C_1-C_4 アルキルで置換されたピペリジン - 4 - イルまたは $-(C_1-C_4\text{アルキ$
 レン) - R^{10} であり；

R^7 はハロで置換されていることもある C_1-C_6 アルキル、2 - メトキシエタ - 1 - イ
 ル、 $-(C_1-C_2\text{アルキレン})-(モルホリン-4-イル\text{または}\text{ピロリジン-2-オン-1-イル})$ 、
 またはハロ、 C_1-C_4 アルキル、 C_1-C_4 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；

R^8 は、水素または C_1-C_4 アルコキシで置換されていることもある C_1-C_6 アルキル
 であり；

R^9 は、水素または C_1-C_4 アルコキシで置換されていることもある C_1-C_6 アルキル
 であり；

R^{10} は、 $-OCH_2CH_2OCH_3$ 、 $-NR^{14}R^{15}$ 、 C_3-C_6 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 C_1-C_4 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こともあるイミダゾリルであり；

Ar は、それぞれフェニル環が置換基 R^{12} および R^{13} で置換されていることもある、ペ

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 - (R^{11}) ベンズイミダゾール - 4 - イル、1 - (R^{11}) 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] ダイオキシシン - 5 - イル、2, 3 - ジヒドロベンゾ [1, 4] ダイオキシシン - 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、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ 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 - $NR^{14}R^{15}$ 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；

R^{11} は、水素、 $C_1 - C_4$ アルキル、または - (CH_2)_p - G であり；

R^{12} は、ハロ、ヒドロキシ、アミノ、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、- $NHC(O)(C_1 - C_4$ アルキル) または - $O - (CH_2)_p - G$ であり；

R^{13} 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 $NR^{14}R^{15}$ であり；

R^{14} および R^{15} は水素および $C_1 - C_5$ アルキルからなる群から独立に選択され；

R^{16} は、水素またはシアノであり、

R^{17} は、- NR^8R^9 、 $C_1 - C_4$ 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 - $CH(R^3)$ - $N(R^2)$ - $C(O)$ - 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。