

【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4月27日(2006.4.27)

【公開番号】特開2000-204077(P2000-204077A)

【公開日】平成12年7月25日(2000.7.25)

【出願番号】特願平11-53564

【国際特許分類】

C 0 7 D 233/20 (2006.01)
A 6 1 P 9/00 (2006.01)
A 6 1 P 9/10 (2006.01)
A 6 1 P 17/00 (2006.01)
A 6 1 P 17/06 (2006.01)
A 6 1 K 31/41 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 37/00 (2006.01)
A 6 1 P 37/06 (2006.01)
C 0 7 D 249/06 (2006.01)
C 0 7 D 249/12 (2006.01)
C 0 7 D 257/04 (2006.01)
C 0 7 D 263/10 (2006.01)
C 0 7 D 291/04 (2006.01)
C 0 7 D 285/13 (2006.01)
C 0 7 D 285/12 (2006.01)
C 0 7 D 285/135 (2006.01)
C 0 7 D 285/125 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 233/20
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 17/00
 A 6 1 P 17/06
 A 6 1 K 31/41
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 37/00
 A 6 1 P 37/06
 C 0 7 D 249/06 5 0 1
 C 0 7 D 249/12 5 0 1
 C 0 7 D 257/04 E
 C 0 7 D 263/10
 C 0 7 D 291/04
 C 0 7 D 285/12 C
 C 0 7 D 285/12 E
 C 0 7 D 285/12 D

【手続補正書】

【提出日】平成18年2月28日(2006.2.28)

【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

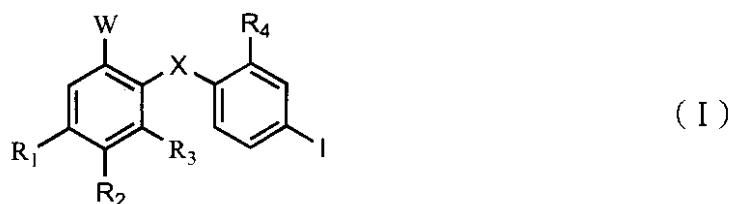
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 式 (I)

【化 1】

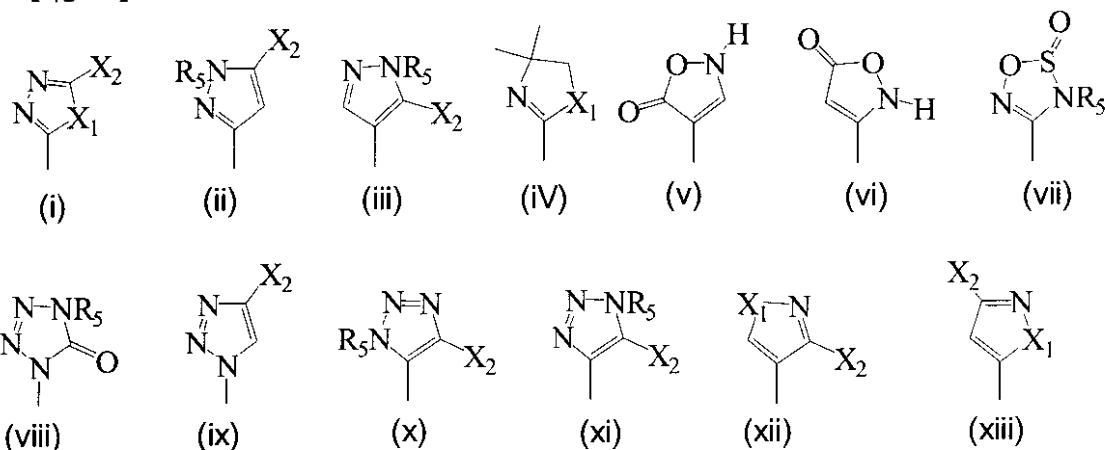


の化合物またはその医薬的に許容し得る塩または C_{1-8} エステル。

上記式において、

W は、式 (i) ~ (xiii)

【化 2】



の 1 種であり；

X₁ は O、S または N R_F であり；

X₂ は、OH、SH または N H R_E であり；

R_E および R_F のそれぞれは、H または C₁₋₄ アルキルであり；

R₁ および R₂ のそれぞれは、独立して、H、F、NO₂、Br および Cl から選択されたものであり；

R₃ は、H または F であり；

R₄ は、H、Cl または CH₃ であり；

R₅ は、H または C₃₋₄ アルキルであり；そして

上述したそれぞれの炭化水素基は、場合によっては、独立してハロゲン、ヒドロキシル、アミノ、(アミノ)スルホニルおよび NO₂ から選択された 1 ~ 3 個の置換分によって置換されていてもよく；そして

上述したそれぞれの複素環式基は、場合によっては、独立してハロゲン、C₃₋₄ アルキル、C₃₋₆ シクロアルキル、C₃₋₄ アルケニル、C₃₋₄ アルキニル、フェニル、ヒドロキシル、アミノ、(アミノ)スルホニルおよび NO₂ から選択された 1 ~ 3 個の置換分によって置換されていてもよく、そしてそれぞれの置換分アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニルまたはフェニルは、場合によっては、独立してハロゲン、C₁₋₂ アルキル、ヒドロキシル、アミノおよび NO₂ から選択された 1 ~ 2 個の置換分によって置換されていてもよい。

【請求項 2】 R₁ が臭素または塩素である請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】 R₂ が弗素である請求項 1 記載の化合物。

【請求項 4】 R₃ が H である請求項 1 記載の化合物。

- 【請求項 5】 R_2 および R_3 のそれぞれが H である請求項 4 の化合物。
 【請求項 6】 R_2 および R_3 のそれぞれが 弗素である請求項 1 記載の化合物。
 【請求項 7】 R_1 が 臭素である請求項 6 記載の化合物。
 【請求項 8】 R_1 が 弗素である請求項 6 記載の化合物。
 【請求項 9】 R_2 が ニトロである請求項 1 の化合物。
 【請求項 10】 R_3 が H である請求項 8 記載の化合物。
 【請求項 11】 R_4 が 塩素である請求項 1 記載の化合物。
 【請求項 12】 R_4 が メチルである請求項 1 記載の化合物。
 【請求項 13】 R_5 が H である請求項 1 記載の化合物。
 【請求項 14】 R_5 が CH_3 である請求項 1 記載の化合物。
 【請求項 15】 X_1 が O または S である請求項 1 記載の化合物。
 【請求項 16】 X_1 が NH または NCH_3 である請求項 1 記載の化合物。
 【請求項 17】 X_2 が OH、SH または NH_2 である請求項 1 記載の化合物。
 【請求項 18】 X_2 が $NHCH_3$ または OH である請求項 1 記載の化合物。
 【請求項 19】 請求項 1 記載の化合物および医薬的に許容し得る担体からなる医薬

組成物。

【請求項 20】 構造：〔5-フルオロ-2-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル〕-(4-ヨード-2-メチル-フェニル)-アミン；〔2,3-ジフルオロ-6-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル〕-(4-ヨード-2-メチル-フェニル)-アミン；〔4-ヨード-2-メチル-フェニル〕-〔2,3,4-トリフルオロ-6-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル〕-アミン；〔4-プロモ-2,3-ジフルオロ-6-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル〕-(4-ヨード-2-メチル-フェニル)-アミン；〔5-フルオロ-4-ニトロ-2-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル〕-(4-ヨード-2-メチル-フェニル)-アミン；〔2-(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロ-オキサゾール-2-イル)-5-フルオロ-フェニル〕-(4-ヨード-2-メチル-フェニル)-アミン；〔6-(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロ-オキサゾール-2-イル)-2,3-ジフルオロ-フェニル〕-(4-ヨード-2-メチル-フェニル)-アミン；〔6-(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロ-オキサゾール-2-イル)-2,3,4-トリフルオロ-フェニル〕-(4-ヨード-2-メチル-フェニル)-アミン；〔4-プロモ-6-(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロ-オキサゾール-2-イル)-2,3-ジフルオロ-フェニル〕-(4-ヨード-2-メチル-フェニル)-アミン；〔2-(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロ-オキサゾール-2-イル)-5-フルオロ-4-ニトロ-フェニル〕-(4-ヨード-2-メチル-フェニル)-アミン；5-〔4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル〕-〔1,3,4〕チアジアゾール-2-オール；5-〔3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル〕-〔1,3,4〕チアジアゾール-2-オール；5-〔3,4,5-トリフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル〕-〔1,3,4〕チアジアゾール-2-オール；5-〔5-プロモ-3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル〕-〔1,3,4〕チアジアゾール-2-オール；5-〔4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-5-ニトロ-フェニル〕-〔1,3,4〕チアジアゾール-2-オール；5-〔4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル〕-〔1,3,4〕オキサジアゾール-2-オール；5-〔3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル〕-〔1,3,4〕オキサジアゾール-2-オール；5-〔3,4,5-トリフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル〕-〔1,3,4〕オキサジアゾール-2-オール；5-〔5-プロモ-3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル〕-〔1,3,4〕オキサジアゾール-2-オール；5-〔4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-5-ニトロ-フェニル〕-〔1,3,4〕オキサジアゾール-2-オール；5-〔4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-

-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-オール; 5-[3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-オール; 5-[3,4,5-トリフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-オール; 5-[5-プロモ-3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-オール; または5-[4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-5-ニトロ-フェニル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-オールを有する請求項1記載の化合物。

【請求項21】 構造: 5-[4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-[1,3,4]チアジアゾール-2-イルアミン; 5-[3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-[1,3,4]チアジアゾール-2-イルアミン; 5-[3,4,5-トリフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-[1,3,4]チアジアゾール-2-イルアミン; 5-[5-プロモ-3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-[1,3,4]チアジアゾール-2-イルアミン; 5-[4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-5-ニトロ-フェニル]-[1,3,4]チアジアゾール-2-イルアミン; 5-[4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イルアミン; 5-[3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イルアミン; 5-[3,4,5-トリフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イルアミン; 5-[5-プロモ-3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イルアミン; 5-[4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-5-ニトロ-フェニル]-[1,3,4]オキサジアゾール-2-イルアミン; 5-[4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルアミン; 5-[3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルアミン; 5-[3,4,5-トリフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルアミン; 5-[5-プロモ-3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルアミン; 5-[4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-5-ニトロ-フェニル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-イルアミン; 5-[4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミン)-フェニル]-[1,3,4]チアジアゾール-2-チオール; 5-[3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-[1,3,4]チアジアゾール-2-チオール; 5-[3,4,5-トリフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-[1,3,4]チアジアゾール-2-チオール; 5-[5-プロモ-3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-[1,3,4]チアジアゾール-2-チオール; 5-[4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-5-ニトロ-フェニル]-[1,3,4]チアジアゾール-2-チオール; 5-[4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-[1,3,4]オキサジアゾール-2-チオール; 5-[3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-[1,3,4]オキサジアゾール-2-チオール; 5-[3,4,5-トリフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-[1,3,4]オキサジアゾール-2-チオール; 5-[5-プロモ-3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-[1,3,4]オキサジアゾール-2-チオール; 5-[4-フルオロ-2-(4-ヨード-2

-メチル-フェニルアミノ)-5-ニトロ-フェニル}-〔1,3,4〕オキサジアゾール-2-チオール; 5-〔4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-4H-〔1,2,4〕トリアゾール-3-チオール; 5-〔3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-4H-〔1,2,4〕トリアゾール-3-チオール; 5-〔3,4,5-トリフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-4H-〔1,2,4〕トリアゾール-3-チオール; 5-〔5-プロモ-3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-4H-〔1,2,4〕トリアゾール-3-チオール; または5-〔4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-5-ニトロ-フェニル}-4H-〔1,2,4〕トリアゾール-3-チオールを有する請求項1記載の化合物。

【請求項22】 構造: 5-〔4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-イソチアゾール-3-オール; 5-〔3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-イソチアゾール-3-オール; 5-〔3,4,5-トリフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-イソチアゾール-3-オール; 5-〔5-プロモ-3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-イソチアゾール-3-オール; 5-〔4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-5-ニトロ-フェニル}-イソチアゾール-3-オール; 5-〔4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-イソキサゾール-3-オール; 5-〔3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-イソキサゾール-3-オール; 5-〔3,4,5-トリフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-イソキサゾール-3-オール; 5-〔5-プロモ-3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-イソキサゾール-3-オール; 5-〔4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-5-ニトロ-フェニル}-イソキサゾール-3-オール; 5-〔4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-1H-ピラゾール-3-オール; 5-〔3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-1H-ピラゾール-3-オール; 5-〔3,4,5-トリフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-1H-ピラゾール-3-オール; 5-〔5-プロモ-3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-1H-ピラゾール-3-オール; 5-〔4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-5-ニトロ-フェニル}-1H-ピラゾール-3-オール; 4-〔4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-イソチアゾール-3-オール; 4-〔3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-イソチアゾール-3-オール; 4-〔3,4,5-トリフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-イソチアゾール-3-オール; 4-〔5-プロモ-3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-イソチアゾール-3-オール; 4-〔4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-5-ニトロ-フェニル}-イソチアゾール-3-オール; 4-〔4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-イソキサゾール-3-オール; 4-〔3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-イソキサゾール-3-オール; 4-〔3,4,5-トリフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-イソキサゾール-3-オール; 4-〔5-プロモ-3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-イソキサゾール-3-オール; 4-〔4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-5-ニトロ-フェニル}-イソキサゾール-3-オール; 4-〔4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル}-1-メチル-1H-ピラゾール-3-オール; 4-〔3,4-ジフルオロ-2-(4-

エニルアミノ) - 5 - ニトロ - フェニル} - 1 H - { 1, 2, 3 } トリアゾール - 4 - オールを有する請求項 1 記載の化合物。

【請求項 24】 構造：3 - { 4 - フルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル} - 2 H - イソキサゾール - 5 - オン；3 - { 3, 4 - ジフルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル} - 2 H - イソキサゾール - 5 - オン；3 - { 3, 4, 5 - トリフルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル} - 2 H - イソキサゾール - 5 - オン；3 - { 5 - ブロモ - 3, 4 - ジフルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル - 2 H - イソキサゾール - 5 - オン；3 - { 4 - フルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - 5 - ニトロ - フェニル} - 2 H - イソキサゾール - 5 - オン；{ 5 - フルオロ - 2 - (2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 2 1 > 4 - { 1, 2, 3, 5 } オキサチアジアゾール - 4 - イル) - フェニル} - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニル) - アミン；{ 2, 3 - ジフルオロ - 6 - (2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 2 1 > 4 - { 1, 2, 3, 5 } オキサチアジアゾール - 4 - イル) - フェニル} - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニル) - アミン；(4 - ヨード - 2 - メチル - フェニル) - { 2, 3, 4 - トリフルオロ - 6 - (2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 2 1 > 4 - { 1, 2, 3, 5 } オキサチアジアゾール - 4 - イル) - フェニル} - アミン；{ 4 - ブロモ - 2, 3 - ジフルオロ - 6 - (2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 2 1 > 4 - { 1, 2, 3, 5 } オキサチアジアゾール - 4 - イル) - フェニル} - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニル) - アミン；{ 5 - フルオロ - 4 - ニトロ - 2 - (2 - オキソ - 2, 3 - ジヒドロ - 2 1 > 4 - { 1, 2, 3, 5 } オキサチアジアゾール - 4 - イル) - フェニル} - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニル) - アミン；4 - { 4 - フルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル} - 4 H - イソキサゾール - 5 - オン；4 - { 3, 4 - ジフルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル} - 4 H - イソキサゾール - 5 - オン；4 - { 3, 4, 5 - トリフルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル} - 4 H - イソキサゾール - 5 - オン；4 - { 5 - ブロモ - 3, 4 - ジフルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル} - 4 H - イソキサゾール - 5 - オン；または 4 - { 4 - フルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - 5 - ニトロ - フェニル} - 4 H - イソキサゾール - 5 - オンを有する請求項 1 記載の化合物。