

【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22年7月22日(2010.7.22)

【公表番号】特表2008-542291(P2008-542291A)

【公表日】平成20年11月27日(2008.11.27)

【年通号数】公開・登録公報2008-047

【出願番号】特願2008-513727(P2008-513727)

【国際特許分類】

C 0 7 D 215/38 (2006.01)

C 0 7 D 277/20 (2006.01)

C 0 7 D 277/56 (2006.01)

A 6 1 K 31/426 (2006.01)

A 6 1 K 31/47 (2006.01)

C 0 7 D 263/56 (2006.01)

A 6 1 K 31/423 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 215/38

C 0 7 D 277/56 C S P

A 6 1 K 31/426

A 6 1 K 31/47

C 0 7 D 263/56

A 6 1 K 31/423

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成22年5月24日(2010.5.24)

【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

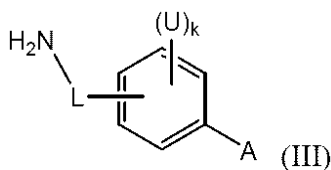
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の式 I I I で表される化合物又は I I I の薬学的に許容される塩であって：

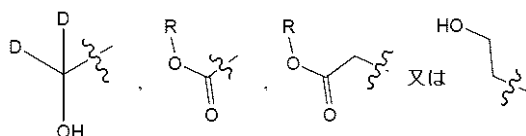
【化 1 B】



式中、L が結合又は C H₂ であり；

A が

【化 2 B】



であり；

D が非分枝鎖の低級アルキルであり；

R が置換若しくは非置換 C 1、C 2、C 3、C 4、C 5、C 6、C 7 若しくは C 8 直鎖アルキル、又は置換若しくは非置換 C 3、C 4、C 5、C 6、C 7 若しくは C 8 分枝鎖アルキルであり；ここで、該置換直鎖アルキル若しくは該置換分枝鎖アルキルは、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロゲン、ヒドロキシル、アルキルカルボニルオキシ、アリアルカルボニルオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、アリアルオキシカルボニルオキシ、カルボキシレート、アルキルカルボニル、アリアルカルボニル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルキルチオカルボニル、アルコキシ、ホスフェート、ホスホナト、ホスフィナト、シアノ、アミノ（アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリアルアミノ、ジアリアルアミノ及びアルキルアリアルアミノを含む）、アシルアミノ（アルキルカルボニルアミノ、アリアルカルボニルアミノ、カルバモイル及びウレイドを含む）、アミジノ、イミノ、スルフヒドリル、アルキルチオ、アリアルチオ、チオカルボキシレート、スルフェート、アルキルスルフィニル、スルファモイル、スルホンアミド、トリフルオロメチル、シアノ、アジド、ヘテロシクリル、アルキルアリアル、及び芳香族若しくはヘテロ芳香族成分から選択される 1 つ以上の置換基を有し；

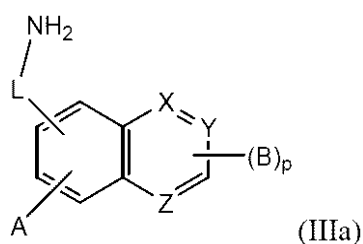
2 つの隣接する U 置換基が、5 員又は 6 員の複素環を形成し、ここで、該複素環は、ハロゲン、ヒドロキシ、カルバモイル、アリアル及びアミノからなる群から選択される置換基で場合により置換されており；そして

k が 2 である、化合物。

【請求項 2】

2 つの隣接する U 置換基が結合して 5 員又は 6 員の縮合複素環を形成し、以下の式 III a に基づく構造を有する化合物又は III a の薬学的に許容される塩を形成し；

【化 3 B】



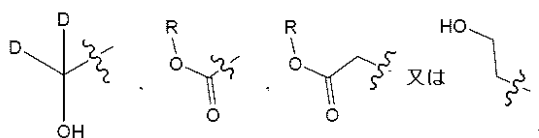
式中、X、Y 及び Z がそれぞれ独立して N、NH、O、S、CB、CH であるか、欠如しており、X、Y 及び Z の少なくとも 1 つが N 又は NH であり；

p が 0、1、2 又は 3 であり；

B がハロゲン原子、ヒドロキシル、カルバモイル、アリアル又はアミノであり；

A が

【化 4 B】



であり；

D が非分枝鎖の低級アルキルであり；

R が置換若しくは非置換 C 1、C 2、C 3、C 4、C 5、C 6、C 7 若しくは C 8 直鎖

アルキル、又は置換若しくは非置換 C 3、C 4、C 5、C 6、C 7 若しくは C 8 分枝鎖アルキルであり；ここで、該置換直鎖アルキル若しくは該置換分岐鎖アルキルは、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロゲン、ヒドロキシル、アルキルカルボニルオキシ、アリーールカルボニルオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、アリーールオキシカルボニルオキシ、カルボキシレート、アルキルカルボニル、アリーールカルボニル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルキルチオカルボニル、アルコキシ、ホスフェート、ホスホナト、ホスフィナト、シアノ、アミノ（アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリーールアミノ、ジアリーールアミノ及びアルキルアリーールアミノを含む）、アシルアミノ（アルキルカルボニルアミノ、アリーールカルボニルアミノ、カルバモイル及びウレイドを含む）、アミジノ、イミノ、スルフヒドリル、アルキルチオ、アリーールチオ、チオカルボキシレート、スルフェート、アルキルスルフィニル、スルファモイル、スルホンアミド、トリフルオロメチル、シアノ、アジド、ヘテロシクリル、アルキルアリーール、及び芳香族若しくはヘテロ芳香族成分から選択される 1 つ以上の置換基を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

L は単結合である、請求項 1 ~ 2 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 4】

前記縮合複素環が 6 員環である、請求項 2 ~ 3 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 5】

前記縮合複素環がピリジン環である、請求項 4 に記載の化合物。

【請求項 6】

前記縮合複素環が 5 員環である、請求項 2 ~ 3 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 7】

前記縮合複素環がチアゾール環、オキサゾール環、又はイミダゾール環である、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

前記縮合複素環がオキサゾール環である、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

B がアリーールである、請求項 2 又は 4 ~ 8 のいずれかに記載の化合物。

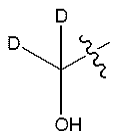
【請求項 10】

B がフェニルである、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

A が

【化 5 B】



である、請求項 2 又は 4 ~ 8 のいずれかに記載の化合物。

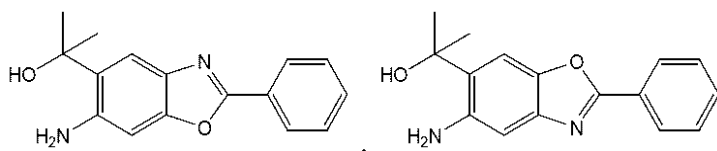
【請求項 12】

D が CH₃ である、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 13】

前記化合物が、以下：

【化 6 B】



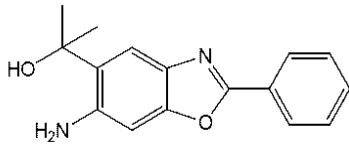
及びそれらの薬学的に許容される塩から選択される、請求項 1 ~ 12 のいずれかに記載の

化合物。

【請求項 1 4】

前記化合物が、以下：

【化 7 B】

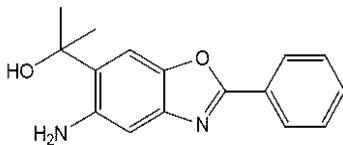


又はそれらの薬学的に許容される塩である、請求項 1 ~ 1 3 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 1 5】

前記化合物が、以下：

【化 8 B】



又はそれらの薬学的に許容される塩である、請求項 1 ~ 1 4 のいずれかに記載の化合物。

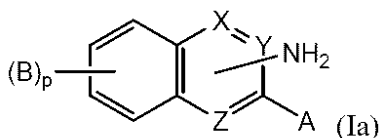
【請求項 1 6】

請求項 1 ~ 1 5 に記載の化合物又はそれらの薬学的に許容される塩を含む薬学的組成物。

【請求項 1 7】

以下の式 I a で表される化合物：

【化 9 B】



又は、I a の薬学的に許容される塩であって、

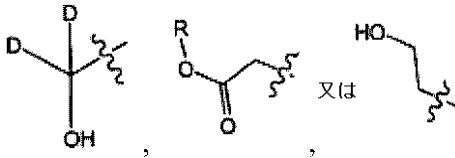
式中、X、Y 及び Z がそれぞれ独立して N、O、S、CH であるか、欠如しており、X、Y 及び Z の少なくとも 1 つが N であり；

p が 0、1、2 又は 3 であり；

B が、ハロゲン原子、ヒドロキシル、カルバモイル、置換若しくは非置換アリール又はアミノであって、ここで、該置換アリールは、ハロゲン、ヒドロキシル、アルコキシ、アルキルカルボニルオキシ、アリールカルボニルオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、アリールオキシカルボニルオキシ、カルボキシレート、アルキルカルボニル、アルキルアミノカルボニル、アラキルアミノカルボニル、アルケニルアミノカルボニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アラキルカルボニル、アルケニルカルボニル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アルキルチオカルボニル、ホスフェート、ホスホナト、ホスフィナト、シアノ、アミノ（アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリールアミノ、ジアリールアミノ及びアルキルアリールアミノを含む）、アシルアミノ（アルキルカルボニルアミノ、アリールカルボニルアミノ、カルバモイル及びウレイドを含む）、アミノ、イミノ、スルフヒドリル、アルキルチオ、アリールチオ、チオカルボキシレート、スルフェート、アルキルスルフィニル、スルファモイル、スルホンアミド、ニトロ、トリフルオロメチル、シアノ、アジド、ヘテロシクリル、アルキルアリール、及び芳香族若しくはヘテロ芳香族成分から選択される 1 つ以上の置換基を有し；

A が

【化 1 0 B】



であり；

D が非分枝鎖の低級アルキルであり；そして

R が置換若しくは非置換 C 1、C 2、C 3、C 4、C 5、C 6、C 7 若しくは C 8 直鎖アルキル、又は置換若しくは非置換 C 3、C 4、C 5、C 6、C 7 若しくは C 8 分枝鎖アルキルであり、ここで、該置換直鎖アルキル若しくは該置換分岐鎖アルキルは、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロゲン、ヒドロキシル、アルキルカルボニルオキシ、アリアルカルボニルオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、アリアルオキシカルボニルオキシ、カルボキシレート、アルキルカルボニル、アリアルカルボニル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルキルチオカルボニル、アルコキシ、ホスフェート、ホスホナト、ホスフィナト、シアノ、アミノ（アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリアルアミノ、ジアリアルアミノ及びアルキルアリアルアミノを含む）、アシルアミノ（アルキルカルボニルアミノ、アリアルカルボニルアミノ、カルバモイル及びウレイドを含む）、アミジノ、イミノ、スルフヒドリル、アルキルチオ、アリアルチオ、チオカルボキシレート、スルフェート、アルキルスルフィニル、スルファモイル、スルホンアミド、トリフルオロメチル、シアノ、アジド、ヘテロシクリル、アルキルアリアル、及び芳香族若しくはヘテロ芳香族成分から選択される 1 つ以上の置換基を有する、化合物。

【請求項 1 8】

請求項 1 7 に記載の化合物であって、

式中、X が CH であり；

Z が N であり；

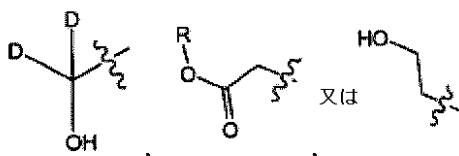
Y が、Y に結合した -NH₂ を有する C であり；

p が 0、1、2 又は 3 であり；

B が、ハロゲン原子、ヒドロキシル、カルバモイル、非置換若しくは置換アリアル又はアミノであって、ここで、該置換アリアルは、ハロゲン、ヒドロキシル、アルコキシ、アルキルカルボニルオキシ、アリアルカルボニルオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、アリアルオキシカルボニルオキシ、カルボキシレート、アルキルカルボニル、アルキルアミノカルボニル、アラルキルアミノカルボニル、アルケニルアミノカルボニル、アルキルカルボニル、アリアルカルボニル、アラルキルカルボニル、アルケニルカルボニル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アルキルチオカルボニル、ホスフェート、ホスホナト、ホスフィナト、シアノ、アミノ（アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリアルアミノ、ジアリアルアミノ及びアルキルアリアルアミノを含む）、アシルアミノ（アルキルカルボニルアミノ、アリアルカルボニルアミノ、カルバモイル及びウレイドを含む）、アミジノ、イミノ、スルフヒドリル、アルキルチオ、アリアルチオ、チオカルボキシレート、スルフェート、アルキルスルフィニル、スルファモイル、スルホンアミド、ニトロ、トリフルオロメチル、シアノ、アジド、ヘテロシクリル、アルキルアリアル、及び芳香族若しくはヘテロ芳香族成分から選択される 1 つ以上の置換基を有し；

A が

【化 1 1 B】



であり；

D が非分枝鎖の低級アルキルであり；そして

R が置換若しくは非置換 C 1、C 2、C 3、C 4、C 5、C 6、C 7 若しくは C 8 直鎖アルキル、又は置換若しくは非置換 C 3、C 4、C 5、C 6、C 7 若しくは C 8 分枝鎖アルキルであり、ここで、該置換直鎖アルキル若しくは該置換分岐鎖アルキルは、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロゲン、ヒドロキシル、アルキルカルボニルオキシ、アリーールカルボニルオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、アリーールオキシカルボニルオキシ、カルボキシレート、アルキルカルボニル、アリーールカルボニル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルキルチオカルボニル、アルコキシ、ホスフェート、ホスホナト、ホスフィナト、シアノ、アミノ（アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリーールアミノ、ジアリーールアミノ及びアルキルアリーールアミノを含む）、アシルアミノ（アルキルカルボニルアミノ、アリーールカルボニルアミノ、カルバモイル及びウレイドを含む）、アミジノ、イミノ、スルフヒドリル、アルキルチオ、アリーールチオ、チオカルボキシレート、スルフェート、アルキルスルフィニル、スルファモイル、スルホンアミド、トリフルオロメチル、シアノ、アジド、ヘテロシクリル、アルキルアリーール、及び芳香族若しくはヘテロ芳香族成分から選択される 1 つ以上の置換基を有する、化合物。

【請求項 1 9】

p が 1 である、請求項 1 8 に記載の化合物。

【請求項 2 0】

B がハロゲンである、請求項 1 8 に記載の化合物。

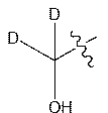
【請求項 2 1】

B が塩素である、請求項 2 0 に記載の化合物。

【請求項 2 2】

A が

【化 1 2 B】



である、請求項 1 8 に記載の化合物。

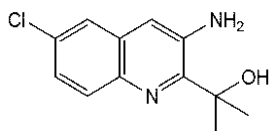
【請求項 2 3】

D が CH₃ である、請求項 1 8 に記載の化合物。

【請求項 2 4】

前記化合物が、以下：

【化 1 3 B】

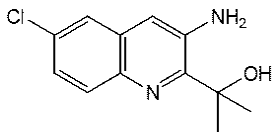


又はその薬学的に許容される塩である、請求項 2 1 に記載の化合物。

【請求項 2 5】

以下：

【化 1 4 B】

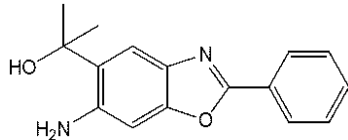


又はその薬学的に許容される塩である、化合物。

【請求項 2 6】

以下：

【化 1 5 B】

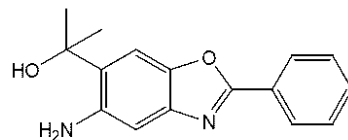


又はその薬学的に許容される塩である、化合物。

【請求項 2 7】

以下：

【化 1 6 B】

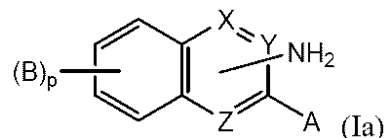


又はその薬学的に許容される塩である、化合物。

【請求項 2 8】

以下の式 I a によって表される化合物又は I a の薬学的に許容される塩、及び薬学的に許容される担体を含む薬学的組成物であって、

【化 1 7 B】



式中、X、Y 及び Z がそれぞれ独立して N、O、S、CH であるか、欠如しており、X、Y 及び Z の少なくとも 1 つが N であり；

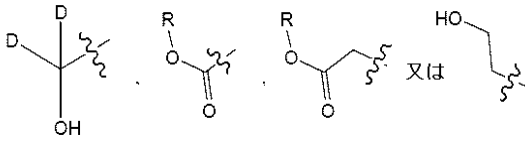
p が 0、1、2 又は 3 であり；

B が、ハロゲン原子、ヒドロキシル、カルバモイル、置換若しくは非置換アリール又はアミノであって、ここで、該置換アリールは、ハロゲン、ヒドロキシル、アルコキシ、アルキルカルボニルオキシ、アリールカルボニルオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、アリールオキシカルボニルオキシ、カルボキシレート、アルキルカルボニル、アルキルアミノカルボニル、アラルキルアミノカルボニル、アルケニルアミノカルボニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アラルキルカルボニル、アルケニルカルボニル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アルキルチオカルボニル、ホスフェート、ホスホナト、ホスフィナト、シアノ、アミノ（アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリールアミノ、ジアリールアミノ及びアルキルアリールアミノを含む）、アシルアミノ（アルキルカルボニルアミノ、アリールカルボニルアミノ、カルバモイル及びウレイドを含む）、アミジノ、イミノ、スルフヒドリル、アルキルチオ、アリールチオ、チオカルボキシレート、スルフェート、アルキルスルフィニル、スルファモイル、スルホンアミド、ニトロ、トリ

フルオロメチル、シアノ、アジド、ヘテロシクリル、アルキルアリール、及び芳香族若しくはヘテロ芳香族成分から選択される1つ以上の置換基を有し；

Aが

【化18B】



であり；

Dが非分枝鎖の低級アルキルであり；

Rが置換若しくは非置換C1、C2、C3、C4、C5、C6、C7若しくはC8直鎖アルキル、又は置換若しくは非置換C3、C4、C5、C6、C7若しくはC8分枝鎖アルキルであり；ここで、該置換直鎖アルキル若しくは該置換分枝鎖アルキルは、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロゲン、ヒドロキシル、アルキルカルボニルオキシ、アリールカルボニルオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、アリールオキシカルボニルオキシ、カルボキシレート、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルキルチオカルボニル、アルコキシ、ホスフェート、ホスホナト、ホスフィナト、シアノ、アミノ（アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリールアミノ、ジアリールアミノ及びアルキルアリールアミノを含む）、アシルアミノ（アルキルカルボニルアミノ、アリールカルボニルアミノ、カルバモイル及びウレイドを含む）、アミジノ、イミノ、スルフヒドリル、アルキルチオ、アリールチオ、チオカルボキシレート、スルフェート、アルキルスルフィニル、スルファモイル、スルホンアミド、トリフルオロメチル、シアノ、アジド、ヘテロシクリル、アルキルアリール、及び芳香族若しくはヘテロ芳香族成分から選択される1つ以上の置換基を有する、薬学的組成物。

【請求項29】

請求項28に記載の薬学的組成物であって、

式中、XがCHであり；

ZがNであり；

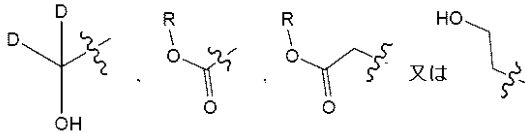
Yが、Yに結合した-NH₂を有するCであり；

pが0、1、2又は3であり；

Bが、ハロゲン原子、ヒドロキシル、カルバモイル、非置換若しくは置換アリール又はアミノであって、ここで、該置換アリールは、ハロゲン、ヒドロキシル、アルコキシ、アルキルカルボニルオキシ、アリールカルボニルオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、アリールオキシカルボニルオキシ、カルボキシレート、アルキルカルボニル、アルキルアミノカルボニル、アラルキルアミノカルボニル、アルケニルアミノカルボニル、アルキルカルボニル、アリールカルボニル、アラルキルカルボニル、アルケニルカルボニル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アルキルチオカルボニル、ホスフェート、ホスホナト、ホスフィナト、シアノ、アミノ（アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリールアミノ、ジアリールアミノ及びアルキルアリールアミノを含む）、アシルアミノ（アルキルカルボニルアミノ、アリールカルボニルアミノ、カルバモイル及びウレイドを含む）、アミジノ、イミノ、スルフヒドリル、アルキルチオ、アリールチオ、チオカルボキシレート、スルフェート、アルキルスルフィニル、スルファモイル、スルホンアミド、ニトロ、トリフルオロメチル、シアノ、アジド、ヘテロシクリル、アルキルアリール、及び芳香族若しくはヘテロ芳香族成分から選択される1つ以上の置換基を有し；

Aが

【化 19 B】



であり；

D が非分枝鎖の低級アルキルであり；そして

R が置換若しくは非置換 C 1、C 2、C 3、C 4、C 5、C 6、C 7 若しくは C 8 直鎖アルキル、又は置換若しくは非置換 C 3、C 4、C 5、C 6、C 7 若しくは C 8 分枝鎖アルキルであり、ここで、該置換直鎖アルキル若しくは該置換分岐鎖アルキルは、アルキル、アルケニル、アルキニル、ハロゲン、ヒドロキシル、アルキルカルボニルオキシ、アリーールカルボニルオキシ、アルコキシカルボニルオキシ、アリーールオキシカルボニルオキシ、カルボキシレート、アルキルカルボニル、アリーールカルボニル、アルコキシカルボニル、アミノカルボニル、アルキルアミノカルボニル、ジアルキルアミノカルボニル、アルキルチオカルボニル、アルコキシ、ホスフェート、ホスホナト、ホスフィナト、シアノ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アリーールアミノ、ジアリーールアミノ、アルキルアリーールアミノ、アシルアミノ、アルキルカルボニルアミノ、アリーールカルボニルアミノ、カルバモイル、ウレイド、アミジノ、イミノ、スルフヒドリル、アルキルチオ、アリーールチオ、チオカルボキシレート、スルフェート、アルキルスルフィニル、スルファモイル、スルホンアミド、トリフルオロメチル、シアノ、アジド、ヘテロシクリル、アルキルアリーール、及び芳香族若しくはヘテロ芳香族成分から選択される 1 つ以上の置換基を有する、薬学的組成物。

【請求項 30】

請求項 25 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩及び薬学的に許容される担体を含む、薬学的組成物。

【請求項 31】

萎縮型 AMD 及びシュタルガルト病を処置又は予防するための、請求項 2 又は 18 に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項 32】

萎縮型 AMD 及びシュタルガルト病を処置又は予防するための、請求項 25、26 又は 27 に記載の化合物を含む、組成物。