

【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27年10月15日 (2015.10.15)

【公表番号】特表2014-525442(P2014-525442A)

【公表日】平成26年9月29日 (2014.9.29)

【年通号数】公開・登録公報2014-053

【出願番号】特願2014-528492(P2014-528492)

【国際特許分類】

C 0 7 D 277/24 (2006.01)

C 0 7 D 277/32 (2006.01)

A 6 1 K 31/426 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 31/10 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 17/14 (2006.01)

A 6 1 P 15/14 (2006.01)

A 6 1 P 5/24 (2006.01)

A 0 1 N 43/78 (2006.01)

A 0 1 P 3/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 277/24 C S P

C 0 7 D 277/32

A 6 1 K 31/426

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 31/04

A 6 1 P 3/00

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 31/10

A 6 1 P 17/00 1 0 1

A 6 1 P 13/08
A 6 1 P 17/14
A 6 1 P 15/14
A 6 1 P 5/24
A 0 1 N 43/78 A
A 0 1 P 3/00

【手続補正書】

【提出日】平成27年8月24日(2015.8.24)

【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

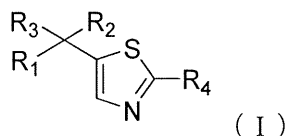
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の化合物：

【化 1】



(式中、

R_1 および R_2 はそれぞれ独立して、任意に置換されたアリール、任意に置換されたナフチル、任意に置換されたヘテロアリール、任意に置換されたアルキル、任意に置換されたアラルキル、任意に置換されたシクロアルキル、任意に置換されたヘテロシクロアルキルまたは任意に置換されたヘテロアリールアルキルであり、

R_3 は、H、OH、アルコキシ、アミノ、アルキルアミノまたはジアルキルアミノであり、

R_4 は、Hまたはハロである)。

【請求項 2】

R_3 はOHである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R_2 は任意に置換されたアルキルであり、 R_3 はOHである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

R_1 は任意に置換されたアリールであり、 R_2 はアルキルであり、 R_3 はOHである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

R_1 は任意に置換されたヘテロアリールであり、 R_2 はアルキルであり、 R_3 はOHである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

R_1 は置換アリールであり、 R_2 はアルキルであり、 R_3 はOHである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

R_1 は任意に置換されたナフチルであり、 R_2 はアルキルであり、 R_3 はOHである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

R_1 は置換ナフチルであり、 R_2 はアルキルであり、 R_3 はOHである、請求項7に記載の化合物。

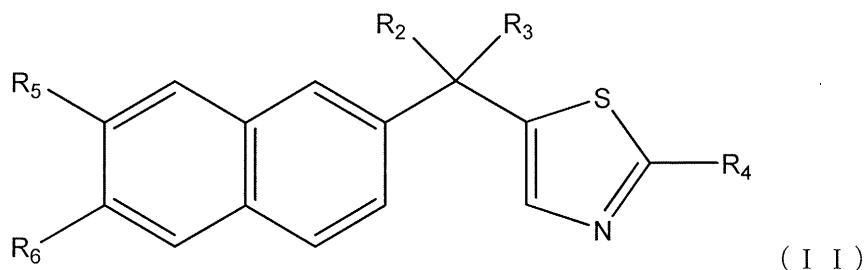
【請求項9】

R_1 は、アルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、シアノ、ハロ、アミノ、モノアルキルアミノ、ジアルキルアミノまたはヘテロアリールから独立して選択される1、2、3または4つの置換基で置換されたナフチルである、請求項8に記載の化合物。

【請求項10】

式(I I)の構造：

【化2】



(式中、 R_5 および R_6 は独立して、H、ハロゲン、アルコキシ、1～5個のフッ素を含むフルオロアルコキシ、シアノ、カルボキサミド、任意に置換されたアリールまたは任意に置換されたヘテロアリールである)を有する、請求項1に記載の化合物。

【請求項11】

R_4 はHである、請求項1に記載の式(I)の化合物。

【請求項12】

R_4 はクロロである、請求項1に記載の式(I)の化合物。

【請求項13】

1-(2-クロロ-チアゾール-5-イル)-1-(6,7-ジメトキシナフタレン-2-イル)-2-メチルプロパン-1-オール(1)、または

1-(6,7-ジメトキシナフタレン-2-イル)-2-メチル-1-(チアゾール-5-イル)プロパン-1-オール(2)

である、請求項1に記載の化合物。

【請求項14】

請求項1～13のいずれか1項に記載の化合物を金属酵素に接触させることを含む、金属酵素活性の阻害方法。

【請求項15】

金属酵素に関連する障害もしくは疾患に罹患しているか罹患しやすい対象の治療において使用するための請求項1に記載の化合物。

【請求項16】

前記疾患もしくは障害は、4-ヒドロキシフェニルピルビン酸ジオキシゲナーゼ、5-リボキシゲナーゼ、アデノシンデアミナーゼ、アルコール脱水素酵素、アミノペプチダーゼN、アンギオテンシン変換酵素、アロマターゼ(CYP19)、カルシニューリン、カルバモイルリン酸合成酵素、炭酸脱水素酵素ファミリー、カテコール-O-メチル転移酵素、シクロオキシゲナーゼファミリー、ジヒドロピリミジン脱水素酵素-1、DNAポリメラーゼ、ファルネシルリン酸合成酵素、ファルネシル転移酵素、フマル酸還元酵素、GABAアミノ基転移酵素、HIF-プロリルヒドロキシラーゼ、ヒストン脱アセチル化酵素ファミリー、HIVインテグラーゼ、HIV-1逆転写酵素、イソロイシンtRNAリガーゼ、ラノステロールデメチラーゼ(CYP51)、マトリックスメタロプロテアーゼファミリー、メチオニンアミノペプチダーゼ、中性エンドペプチダーゼ、一酸化窒素合成酵素ファミリー、ホスホジエステラーゼIII、ホスホジエステラーゼIV、ホスホジエステラーゼV、ピルビン酸フェレドキシン酸化還元酵素、腎臓ペプチダーゼ、リボヌクレオシドニリン酸還元酵素、トロンボキサン合成酵素(CYP5a)、甲状腺ペルオキシダ

ーゼ、チロシナーゼ、ウレアーゼまたはキサンチン酸化酵素のいずれかによって媒介される、請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 17】

前記疾患もしくは障害は、1 - デオキシ - d - キシルロース - 5 - リン酸レダクトイソメラーゼ (D X R)、17 - ヒドロキシラーゼ (C Y P 17)、アルドステロン合成酵素 (C Y P 11 B 2)、アミノペプチダーゼ P、炭疽菌致死因子、アルギナーゼ、 - ラクタマーゼ、チトクローム P450 2A6、D - A l a - D - A l a リガーゼ、ドーパミン - ヒドロキシラーゼ、エンドセリン変換酵素 - 1、グルタミン酸カルボキシペプチダーゼ I I、グルタミニルシクラゼ、グリオキサラーゼ、ヘムオキシゲナーゼ、HPV/HSV E1 ヘルパーゼ、インドールアミン 2, 3 - ジオキシゲナーゼ、ロイコトリエン A 4 加水分解酵素、メチオニンアミノペプチダーゼ 2、ペプチド脱ホルミル酵素、ホスホジエステラーゼ V I I、レキサナーゼ、レチノイン酸ヒドロキシラーゼ (C Y P 26)、T N F - 変換酵素 (T A C E)、U D P - (3 - O - (R - 3 - ヒドロキシミリスチル)) - N - アセチルグルコサミン脱アセチル化酵素 (L p x C)、血管接着タンパク質 - 1 (V A P - 1) またはビタミン D ヒドロキシラーゼ (C Y P 24) のいずれかによって媒介される、請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 18】

前記疾患もしくは障害は、癌、心血管疾患、炎症性疾患、感染症、代謝性疾患、眼科疾患、中枢神経系 (C N S) 疾患、泌尿器疾患または胃腸疾患である、請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 19】

前記疾患もしくは障害は、前立腺癌、乳癌、子宮内膜症、子宮筋腫、炎症性腸疾患、乾癬、全身性真菌感染症、爪真菌症、心血管疾患、前立腺肥大、精巣癌、男性化症、多毛症、男性型脱毛症、思春期早発症、子宮癌、卵巣癌、乳腺症、子宮頸線維症、子宮腺筋症または多嚢胞性卵巣症候群である、請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 20】

請求項 1 ~ 13 のいずれかに記載の化合物を植物に接触させることを含む、植物の中または表面における真菌増殖の治療または予防方法。

【請求項 21】

請求項 1 に記載の化合物と薬学的に許容される担体とを含む組成物。