

【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1月14日(2010.1.14)

【公表番号】特表2009-518359(P2009-518359A)

【公表日】平成21年5月7日(2009.5.7)

【年通号数】公開・登録公報2009-018

【出願番号】特願2008-543828(P2008-543828)

【国際特許分類】

C 0 7 D	239/95	(2006.01)
A 6 1 K	31/517	(2006.01)
A 6 1 P	21/02	(2006.01)
A 6 1 P	25/10	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/06	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	25/22	(2006.01)
A 6 1 P	25/14	(2006.01)
A 6 1 P	17/14	(2006.01)
A 6 1 P	25/18	(2006.01)
A 6 1 P	13/10	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	1/10	(2006.01)
A 6 1 P	25/08	(2006.01)
A 6 1 P	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	15/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/00	(2006.01)
A 6 1 P	27/16	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	5/48	(2006.01)
A 6 1 P	9/12	(2006.01)
A 6 1 P	37/06	(2006.01)
A 6 1 P	25/04	(2006.01)
A 6 1 P	15/10	(2006.01)
A 6 1 P	25/06	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/26	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	15/06	(2006.01)
A 6 1 P	11/02	(2006.01)
A 6 1 P	1/12	(2006.01)
A 6 1 P	25/20	(2006.01)
A 6 1 P	25/02	(2006.01)
A 6 1 P	27/00	(2006.01)

A 6 1 P 1/02 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 239/95 C S P

A 6 1 K 31/517

A 6 1 P 21/02

A 6 1 P 25/10

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/06

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 17/14

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 13/10

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 1/10

A 6 1 P 25/08

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 27/16

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 5/48

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 25/04

A 6 1 P 15/10

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/26

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 15/06

A 6 1 P 11/02

A 6 1 P 1/12

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 25/02

A 6 1 P 27/00

A 6 1 P 1/02

C 0 7 D 401/04

【 手続補正書 】

【 提出日 】 平成21年11月16日 (2009.11.16)

【 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

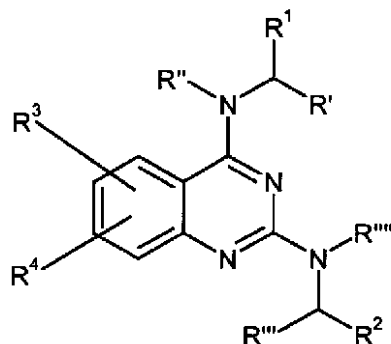
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I のキナゾリン - 2 , 4 - ジアミン誘導体

【化 1】



(I)

その任意の異性体若しくはその異性体の任意の混合物、又はその医薬として許容できる塩

[ 式中、

$R^1$  は、 $-(CH_2)_v-R^5$  を表し；ここで、 $v$  は、0 又は 1 であり、 $R^5$  はフェニル基であり；このフェニル基は、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、アルキル、 $R^e R^f N$  - 及び  $R^e R^f N$  - アルキルからなる群から独立に選択される 1 個又は複数の置換基で場合によって置換されており；

$R'$  及び  $R''$  は、互いに独立に、水素若しくは  $R^a$  - アルキルであり；又は

$R'$  は、 $R''$  と一緒になって  $-(CH_2)_p$  - を形成し；ここで、 $p$  は、3、4 若しくは 5 であり；又は

$R'$  は、 $R^1$  のフェニル基のオルト位に  $-(CH_2)_q$  - 架橋を形成し；ここで、 $q$  は、2、3 若しくは 4 であり； $R''$  は、水素若しくは  $R^a$  - アルキルであり；

$R^2$  は、 $-(CH_2)_w-R^6$  を表し；ここで、 $w$  は、0 又は 1 であり、 $R^6$  はフェニル基であり、このフェニル基は、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、アルキル、 $R^g R^h N$  - 及び  $R^g R^h N$  - アルキルからなる群から独立に選択される 1 個又は複数の置換基で場合によって置換されており；

$R'''$  及び  $R''''$  は、互いに独立に、水素若しくは  $R^b$  - アルキルであり；又は

$R'''$  は、 $R''''$  と一緒になって  $-(CH_2)_s$  - を形成し；ここで、 $s$  は、3、4 若しくは 5 であり；又は

$R'''$  は、 $R^2$  のフェニル基のオルト位に  $-(CH_2)_t$  - 架橋を形成し；ここで、 $t$  は、2、3 若しくは 4 であり； $R''''$  は、水素若しくは  $R^b$  - アルキルであり；

$R^a$  及び  $R^b$  は、互いに独立に、水素、ヒドロキシ、シアノ又は  $R^c R^d N$  - を表し；ここで、 $R^c$  及び  $R^d$  は、互いに独立に、水素又はアルキルを表し；

$R^e$ 、 $R^f$ 、 $R^g$  及び  $R^h$  は、互いに独立に、水素又はアルキルであり；並びに

$R^3$  及び  $R^4$  は、互いに独立に、水素、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、アルキル及びアルコキシからなる群から選択される ]。

【請求項 2】

$R^1$  が、 $-(CH_2)_v-R^5$  を表し；ここで、 $v$  は、0 又は 1 であり、 $R^5$  はフェニル基であり、このフェニル基は、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、アルキル、 $R^e R^f N$  - 及び  $R^e R^f N$  - アルキルからなる群から独立に選択され

る 1 個又は複数の置換基で場合によって置換されており；

$R'$  及び  $R''$  が、互いに独立に、水素若しくは  $R^a$  - アルキルであり；又は

$R'$  が、 $R''$  と一緒になって  $-(CH_2)_p-$  を形成し；ここで、 $p$  は、3、4 若しくは 5 であり；又は

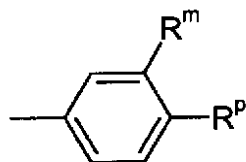
$R'$  が、 $R^1$  のフェニル基のオルト位に  $-(CH_2)_q-$  架橋を形成し；ここで、 $q$  は、2、3 若しくは 4 であり；並びに、 $R''$  が、水素若しくは  $R^a$  - アルキルであり；

ここで、 $R^e$  及び  $R^f$  は請求項 1 に定義の通りである、請求項 1 に記載のキナゾリン - 2, 4 - ジアミン誘導体。

【請求項 3】

$R^1$  が、

【化 2】



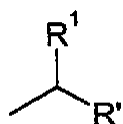
を表し；

ここで、 $R^m$  及び  $R^p$  は、互いに独立に、水素、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、アルキル、 $R^e R^f N$  - 及び  $R^e R^f - N$  - アルキルからなる群から選択され；

ここで、 $R^e$  及び  $R^f$  は請求項 1 に定義の通りである、請求項 1 に記載のキナゾリン - 2, 4 - ジアミン誘導体。

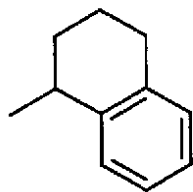
【請求項 4】

【化 3】



が、

【化 4】

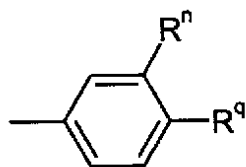


を表す、請求項 1 に記載のキナゾリン - 2, 4 - ジアミン誘導体。

【請求項 5】

$R^2$  が、

【化 5】



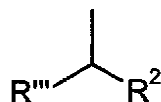
を表し；

ここで、 $R^n$  及び  $R^q$  は、互いに独立に、水素、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、アルキル、 $R^g R^h N$  - 及び  $R^g R^h - N$  - アルキルからなる群から選択され；

ここで、 $R^g$  及び  $R^h$  は請求項 1 に定義の通りである、請求項 1 から 4 までのいずれか一項に記載のキナゾリン - 2 , 4 - ジアミン誘導体。

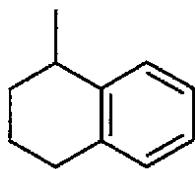
【請求項 6】

【化 6】



が、

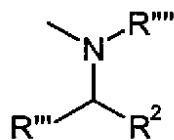
【化 7】



を表す、請求項 1 から 4 までのいずれか一項に記載のキナゾリン - 2 , 4 - ジアミン誘導体。

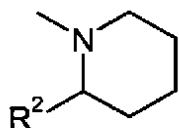
【請求項 7】

【化 8】



が、

【化 9】



を表し；

ここで、 $R^2$  は請求項 1 に定義の通りである、請求項 1 から 4 までのいずれか一項に記

載のキナゾリン - 2 , 4 - ジアミン誘導体。

【請求項 8】

v が 0 であり、w が 0 である、請求項 1 から 7 までのいずれか一項に記載のキナゾリン - 2 , 4 - ジアミン誘導体。

【請求項 9】

N<sup>2</sup> , N<sup>4</sup> - ビス ( 4 - クロロベンジル ) キナゾリン - 2 , 4 - ジアミン ;  
 N<sup>2</sup> , N<sup>4</sup> - ビス ( 3 , 4 - ジフルオロベンジル ) キナゾリン - 2 , 4 - ジアミン ;  
 N<sup>2</sup> - ( 3 - アミノメチルベンジル ) - N<sup>4</sup> - ( 3 , 4 - ジフルオロベンジル ) キナゾリン - 2 , 4 - ジアミン ;  
 N<sup>2</sup> - [ 1 - ( 4 - フルオロフェニル ) エチル ] - N<sup>4</sup> - ( 3 , 4 - ジフルオロベンジル ) キナゾリン - 2 , 4 - ジアミン ;  
 N<sup>2</sup> - ( 3 , 4 - ジフルオロベンジル ) - N<sup>4</sup> - ( 4 - ジメチルアミノベンジル ) キナゾリン - 2 , 4 - ジアミン ;  
 ( 4 - クロロベンジル ) - [ 2 - ( 2 - フェニルピペリジン - 1 - イル ) キナゾリン - 4 - イル ] アミン ;  
 N<sup>2</sup> - ベンジル - N<sup>4</sup> - ( 4 - クロロベンジル ) - N<sup>2</sup> - ( ヒドロキシエチル ) キナゾリン - 2 , 4 - ジアミン ;  
 N<sup>2</sup> - ベンジル - N<sup>4</sup> - ( 4 - クロロベンジル ) - N<sup>2</sup> - ( シアノエチル ) キナゾリン - 2 , 4 - ジアミン ;  
 N<sup>2</sup> - ベンジル - N<sup>4</sup> - ( 4 - クロロベンジル ) - N<sup>2</sup> - ( ジメチルアミノエチル ) キナゾリン - 2 , 4 - ジアミン ;  
 N<sup>4</sup> - ( 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル ) - N<sup>2</sup> - ( R ) - ( 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル ) キナゾリン - 2 , 4 - ジアミン ;  
 N<sup>2</sup> - ( 4 - クロロベンジル ) - N<sup>4</sup> - ( 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル ) キナゾリン - 2 , 4 - ジアミン ;  
 N<sup>4</sup> - ( 4 - クロロベンジル ) - N<sup>2</sup> - ( R ) - ( 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル ) キナゾリン - 2 , 4 - ジアミン ;

又はその医薬として許容できる塩である、請求項 1 に記載のキナゾリン - 2 , 4 - ジアミン誘導体。

【請求項 10】

医薬として許容できる少なくとも 1 種の担体、賦形剤又は希釈剤と共に、請求項 1 から 9 までのいずれか一項に記載のキナゾリン - 2 , 4 - ジアミン誘導体、又はその任意の異性体若しくはその異性体の任意の混合物、又はその医薬として許容できる塩の治療有効量を含む医薬組成物。

【請求項 11】

請求項 1 から 9 までのいずれか一項に記載のキナゾリン - 2 , 4 - ジアミン誘導体、又はその任意の異性体若しくはその異性体の任意の混合物、又はその医薬として許容できる塩の治療有効量を含む、S K チャネルの調節に応答性である、ヒトを含む哺乳動物の疾患又は障害又は状態の治療、予防又は緩和のための医薬組成物。

【請求項 12】

S K チャネルの調節に応答性である疾患、障害又は状態が、アブサンス発作、加齢による記憶喪失、アルツハイマー病、狭心症、不整脈、喘息、不安、運動失調、注意欠陥障害、脱毛症、双極性障害、膀胱興奮性亢進、膀胱排出障害、膀胱けいれん、脳腫瘍、脳虚血、慢性閉塞性肺疾患、癌、心血管障害、認知機能障害、大腸炎、便秘、けいれん、冠動脈けいれん、冠動脈性心疾患、嚢胞性線維症、認知症、うつ病、I I 型糖尿病、月経困難、てんかん、胃腸障害、胃食道逆流症、胃腸運動性減弱、胃腸運動不全、難聴、高インスリン血症、高血圧、免疫抑制、炎症性腸疾患、炎症性疼痛、間欠性跛行、過敏性腸症候群、虚血、虚血性心疾患、学習欠陥、男性勃起不全、躁うつ病、記憶障害、片頭痛、気分障害、運動ニューロン疾患、ミオキミア、筋緊張性ジストロフィー、筋緊張性筋ジストロフィー、ナルコレプシー、神経因性疼痛、疼痛、パーキンソン病、多発性嚢胞腎、術後イレウ

ス、早産、精神病、精神障害、腎障害、レイノー病、鼻漏、分泌性下痢、発作、シェーグレン症候群、睡眠時無呼吸、痙縮、睡眠障害、卒中、外傷性脳損傷、三叉神経痛、尿失禁、泌尿生殖器障害、血管けいれん、失明又は口腔乾燥である、請求項 11 に記載の医薬組成物。