

【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 07 D 239/95 (2006.01)
A 61 K 31/517 (2006.01)
A 61 P 21/02 (2006.01)
A 61 P 25/10 (2006.01)
A 61 P 25/28 (2006.01)
A 61 P 9/10 (2006.01)
A 61 P 9/06 (2006.01)
A 61 P 11/06 (2006.01)
A 61 P 25/22 (2006.01)
A 61 P 25/14 (2006.01)
A 61 P 17/14 (2006.01)
A 61 P 25/18 (2006.01)
A 61 P 13/10 (2006.01)
A 61 P 35/00 (2006.01)
A 61 P 11/00 (2006.01)
A 61 P 9/00 (2006.01)
A 61 P 1/04 (2006.01)
A 61 P 1/10 (2006.01)
A 61 P 25/08 (2006.01)
A 61 P 25/24 (2006.01)
A 61 P 3/10 (2006.01)
A 61 P 15/00 (2006.01)
A 61 P 1/00 (2006.01)
A 61 P 27/16 (2006.01)
A 61 P 21/00 (2006.01)
A 61 P 5/48 (2006.01)
A 61 P 9/12 (2006.01)
A 61 P 37/06 (2006.01)
A 61 P 25/04 (2006.01)
A 61 P 15/10 (2006.01)
A 61 P 25/06 (2006.01)
A 61 P 25/00 (2006.01)
A 61 P 25/26 (2006.01)
A 61 P 25/16 (2006.01)
A 61 P 13/12 (2006.01)
A 61 P 15/06 (2006.01)
A 61 P 11/02 (2006.01)
A 61 P 1/12 (2006.01)
A 61 P 25/20 (2006.01)
A 61 P 25/02 (2006.01)
A 61 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

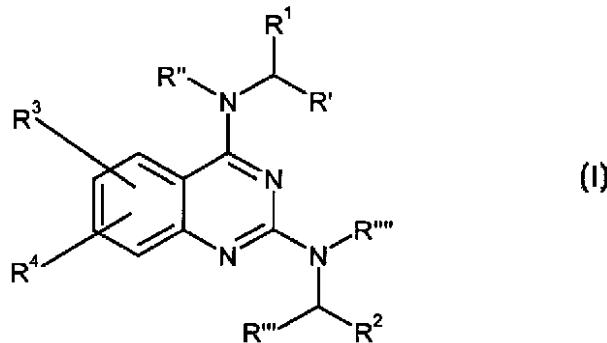
【補正の内容】

【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】



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；

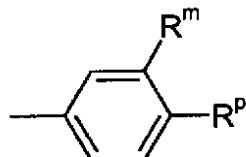
R' 及び R'' が、互いに独立に、水素若しくは R^a - アルキルであり；又は R' が、R'' と一緒にになって - (C_H₂)_p - を形成し；ここで、p は、3、4 若しくは 5 であり；又は

R' が、R¹ のフェニル基のオルト位に - (C_H₂)_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】

R¹ が、

【化 2】



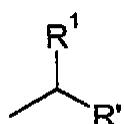
を表し；

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^eR^fN- 及び R^eR^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。

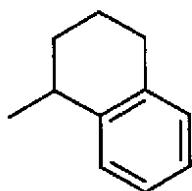
【請求項 4】

【化 3】



が、

【化 4】

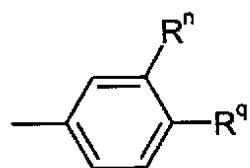


を表す、請求項 1 に記載のキナゾリン-2,4-ジアミン誘導体。

【請求項 5】

R² が、

【化5】



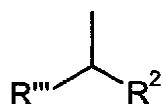
を表し；

ここで、Rⁿ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^gR^hN-及びR^gR^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。

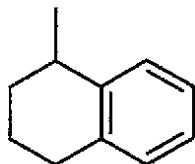
【請求項6】

【化6】



が、

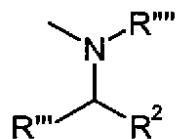
【化7】



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。

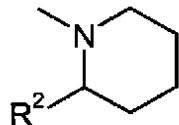
【請求項7】

【化8】



が、

【化9】



を表し；

ここで、R²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^2 , N^4 - ビス (4 - クロロベンジル) キナゾリン - 2 , 4 - ジアミン ;
 N^2 , N^4 - 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^2 - (3 - アミノメチルベンジル) - N^4 - (3 , 4 - ジフルオロベンジル) キナゾリン - 2 , 4 - ジアミン ;
 N^2 - [1 - (4 - フルオロフェニル) エチル)] - N^4 - (3 , 4 - ジフルオロベンジル) キナゾリン - 2 , 4 - ジアミン ;
 N^2 - (3 , 4 - ジフルオロベンジル) - N^4 - (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 - フェニルビペリジン - 1 - イル) キナゾリン - 4 - イル] アミン ;
 N^2 - ベンジル - N^4 - (4 - クロロベンジル) - N^2 - (ヒドロキシエチル) キナゾリン - 2 , 4 - ジアミン ;
 N^2 - ベンジル - N^4 - (4 - クロロベンジル) - N^2 - (シアノエチル) キナゾリン - 2 , 4 - ジアミン ;
 N^2 - ベンジル - N^4 - (4 - クロロベンジル) - N^2 - (ジメチルアミノエチル) キナゾリン - 2 , 4 - ジアミン ;
 N^4 - (1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル) - N^2 - (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^2 - (4 - クロロベンジル) - N^4 - (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^4 - (4 - クロロベンジル) - N^2 - (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、SK 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】

SK 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、囊胞性線維症、認知症、うつ病、II 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、多発性囊胞腎、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、シェーレン症候群、睡眠時無呼吸、痙攣、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。