

【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7月27日(2006.7.27)

【公表番号】特表2005-535630(P2005-535630A)

【公表日】平成17年11月24日(2005.11.24)

【年通号数】公開・登録公報2005-046

【出願番号】特願2004-516575(P2004-516575)

【国際特許分類】

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/4155 (2006.01)

A 6 1 K 31/4178 (2006.01)

A 6 1 K 31/433 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/06 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 403/12 C S P

A 6 1 K 31/4155

A 6 1 K 31/4178

A 6 1 K 31/433

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 9/08

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/10 1 0 1

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/04

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 417/12

【手続補正書】

【提出日】平成18年6月2日(2006.6.2)

【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】請求項1

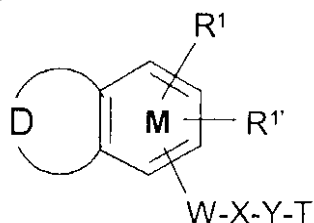
【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項1】

式I

【化1】



式中、

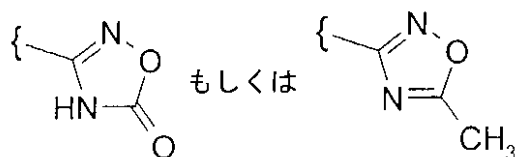
Dは、存在しないか、または、

飽和、完全に不飽和、または部分的に不飽和の3～4員アルキレン鎖であり、ここで1～3個の炭素原子はNで置換されてよく、および/または1または2個の炭素原子は、1または2個のO原子および/または1または2個のS原子で置換されてよいが、ここで最大3個までの炭素原子が置換され、およびここで、加えて、アルキレン鎖および/またはそれらに存在する窒素は、Hal、A、 $-[C(R^3)_2]_n-Ar$ 、 $-[C(R^3)_2]_n-Het$ 、 $-[C(R^3)_2]_n$ -シクロアルキル、 OR^2 、 $N(R^2)_2$ 、 NO_2 、 CN 、 $COOR^2$ 、 $CON(R^2)_2$ 、 NR^2COA 、 NR^2SO_2A 、 COR^2 、 SO_2NR^2 および/または $S(O)_m A$ で、単置換、二置換、または三置換されてよく、およびここで、さらにアルキレン鎖中の1つの CH_2 基は $C=O$ 基で置換されてもよく、

Mは、フェニル環又は1～2個のN、Oおよび/またはS原子を含有することのできる芳香族複素環であり、

R^1 および $R^{1'}$ は、それぞれ互いに独立して、H、Hal、A、 OR^2 、 $N(R^2)_2$ 、 NO_2 、 CN 、 $COOR^2$ 、 $CON(R^2)_2$ 、 $C(=S)N(R^2)_2$ 、 $-[C(R^3)_2]_n-Ar$ 、 $-[C(R^3)_2]_n-Het$ 、 $-[C(R^3)_2]_n$ -シクロアルキル、 $-[C(R^3)_2]_n-N(R^3)_2$ 、 CN 、 $-C(=NH)-NH_2$ であり、それは無置換か、または $C(=O)R^3$ 、 $COOR^3$ 、 OR^3 、 $OCOR^3$ 、 $OCOOR^3$ もしくは通常のアミノ保護基で単置換され、または

【化2】



であり、

R^2 は、H、A、 $-[C(R^3)_2]_n-Ar$ 、 $-[C(R^3)_2]_n-Het$ 、 $-[C(R^3)_2]_n$ -シクロアルキル、 $-[C(R^3)_2]_n-N(R^3)_2$ または $-[C(R^3)_2]_n-OR^3$ であり、

$R^{2'}$ は、H、A、 $-[C(R^3)_2]_n-Ar'$ 、 $-[C(R^3)_2]_n-Het'$ 、 $-[C(R^3)_2]_n$ -シクロアルキル、 $-[C(R^3)_2]_n-N(R^3)_2$ 、または $-[C(R^3)_2]_n-OR^3$ であり、

$R^{2''}$ は、H、A、 $-[C(R^3)_2]_n-Ar'$ 、 $-[C(R^3)_2]_n$ -シクロアルキル、 $-[C(R^3)_2]_n-N(R^3)_2$ 、または $-[C(R^3)_2]_n-OR^3$ であり、

R^3 は、HまたはAであり、

Wは、単環式または二環式の、飽和、不飽和、もしくは芳香族の、1～4個のN、Oおよび/またはS原子を有する炭素環または複素環であり、それは R^2 で単置換もしくは二置換されてもよく、

Xは、 $CONR^2$ 、 $CONR^2C(R^3)_2$ 、 $-C(R^3)_2NR^2$ 、 $-C(R^3)_2NR^2C(R^3)_2$ 、 $-C(R^3)_2O-$ 、 $-C(R^3)_2OC(R^3)_2-$ 、または NR^2CO であり、

Yは、アルキレン、シクロアルキレン、Het-ジイル、またはAr-ジイルであり、

Tは、単環式または二環式の、飽和、不飽和、もしくは芳香族の、1～4個のN、Oおよび/またはS原子を有する炭素環または複素環であり、それは、=S、=NR²、=N-CN、=N-NO₂、=NOR²、=NCOR²、=NCOOR²または=NOCOR²で単置換もしくは二置換され、およびさらに、Hal、A、-[C(R³)₂]_n-Ar、-[C(R³)₂]_n-Het、-[C(R³)₂]_n-シクロアルキル、OR³、N(R³)₂、NO₂、CN、COOR²、CON(R²)₂、NR²COA、NR²CON(R²)₂、NR²SO₂A、COR²、SO₂NR²および/またはS(O)_mAで、単置換、二置換、もしくは三置換されてもよく、

Aは、1～10個の炭素原子を有する非分枝状、または分枝状アルキルであり、ここで1つまたは2つのCH₂基は、O原子またはS原子および/または-CH=CH-基で置換されてもよく、および/または加えて、1～7個のH原子はFで置換されてもよく、

Arは、フェニル、ナフチルまたはビフェニルであり、それぞれは、無置換か、またはHal、A、OR³、N(R³)₂、NO₂、CN、COOR³、CON(R³)₂、NR³COA、NR³CON(R³)₂、NR³SO₂A、COR³、SO₂N(R³)₂、S(O)_mA、-[C(R³)₂]_n-COOR²または-O-[C(R³)₂]_o-COOR²で、単置換、二置換もしくは三置換されており、

Ar'は、フェニルまたはベンジルであり、それぞれは、無置換か、またはHalで単置換、もしくは二置換されており、

Hetは、単環式または二環式の、飽和、不飽和、もしくは芳香族の、1～4個のN、Oおよび/またはS原子を有する炭素環または複素環であり、それは、無置換か、またはカルボニル酸素、=S、=N(R³)₂、Hal、A、-[C(R³)₂]_n-Ar、-[C(R³)₂]_n-Het'、-[C(R³)₂]_n-シクロアルキル、-[C(R³)₂]_n-OR²'、-[C(R³)₂]_n-N(R²')₂、NO₂、CN、-[C(R³)₂]_n-COOR²'、-[C(R³)₂]_n-CON(R²')₂、-[C(R³)₂]_n-NR²'COA、NR²'CON(R²')₂、-[C(R³)₂]_n-NR²'SO₂A、COR²'、SO₂NR²'および/またはS(O)_mAで単置換、二置換、もしくは三置換されてよく、

Het'は、単環式または二環式の、飽和、不飽和、もしくは芳香族の、1または2個のN、Oおよび/またはS原子を有する炭素環または複素環であり、それは、無置換か、またはカルボニル酸素、=S、=N(R³)₂、Hal、A、OR²'、N(R²')₂、NO₂、CN、COOR²'、CON(R²')₂、NR²'COA、NR²'CON(R²')₂、NR²'SO₂A、COR²'、SO₂NR²'および/またはS(O)_mAで単置換、二置換、もしくは三置換されてよく、

Halは、F、Cl、BrまたはIであり、

nは、0、1または2であり、

mは、0、1または2であり、

oは、1、2または3である、

で表される前記式Iの化合物、ならびにそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、およびすべての比率での混合物を含むそれらの立体異性体。

【手続補正2】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】請求項4

【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項4】

式中、

Dが、飽和、完全に不飽和、または部分的に不飽和の3～4員アルキレン鎖であり、ここで1～3個の炭素原子はNで置換されてよく、および/または1または2個の炭素原子は、1または2個のO原子および/または1または2個のS原子で置換されてよいが、ここで最大3個までの炭素原子が置換され、およびここで、加えて、アルキレン鎖および/ま

たはそれらに存在する窒素は、 H a l 、 A 、 O R^2 、または $\text{N}(\text{R}^2)_2$ で、単置換、二置換、または三置換されてよく、およびここで、さらにアルキレン鎖中の1つの C H_2 基は $\text{C}=\text{O}$ 基で置換されてもよい、
で表される請求項1または3に記載の式Iの化合物、ならびにそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、およびすべての比率での混合物を含むそれらの立体異性体。

【手続補正3】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】請求項5

【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項5】

式中、

Dは、飽和、完全に不飽和、または部分的に不飽和の3～4員アルキレン鎖であり、ここで1～3個の炭素原子はNで置換されてよく、および/または1または2個の炭素原子は、1または2個のO原子および/または1または2個のS原子で置換されてよいが、ここで最大3個までの炭素原子が置換され、およびここで、加えて、アルキレン鎖および/またはそれらに存在する窒素は、 A 、または N H_2 で、単置換、二置換、または三置換されてよい、

で表される請求項1、3および4のいずれかに記載の式Iの化合物、ならびにそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、およびすべての比率での混合物を含むそれらの立体異性体。

【手続補正4】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】請求項6

【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項6】

式中、

Dは、存在しないか、または飽和3～4員アルキレン鎖であり、ここで1～3個の炭素原子はNで置換されてよく、および/または1または2個の炭素原子は、1または2個のO原子で置換されてよいが、ここで最大3個までの炭素原子が置換され、およびここで、加えて、アルキレン鎖および/またはそれらに位置する窒素は、 N H_2 で単置換、または二置換されてよい、

で表される請求項1および3～5のいずれかに記載の式Iの化合物、ならびにそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、およびすべての比率での混合物を含むそれらの立体異性体。

【手続補正5】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】請求項7

【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項7】

式中、

Dは、存在しないか、または $-\text{C H}=\text{N}-\text{C H}=\text{C H}-$ 、 $-\text{C H}=\text{C H}-\text{N}=\text{C H}-$ 、 $-\text{N H}-\text{N}=\text{C H}-$ 、 $-\text{C H}=\text{N}-\text{N H}-$ 、 $-\text{O}-\text{N}=\text{C H}-$ もしくは $-\text{C H}=\text{N}-\text{O}-$ であり、
およびここで、加えて、Dは N H_2 で単置換されてよい、

で表される請求項1および3～5のいずれかに記載の式Iの化合物、ならびにそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、およびすべての比率での混合物を含むそれらの立体異性体。

【手続補正6】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】請求項 8

【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項 8】

式中、

R^1 は、H、 $-[C(R^3)_2]_n - N(R^3)_2$ 、 $CON(R^2)_2$ 、 $C(=S)NH_2$ または $N(R^2)_2$ であり、

$R^{1'}$ は、H である、

で表される請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載の式 I の化合物、ならびにそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、およびすべての比率での混合物を含むそれらの立体異性体。

【手続補正 7】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】請求項 2 2

【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項 2 2】

式中、

D は、存在しないか、または $-CH=N-CH=CH-$ 、 $-CH=CH-N=CH-$ 、 $-NH-N=CH-$ 、 $-CH=N-NH-$ 、 $-O-N=CH-$ もしくは $-CH=N-O-$ であり、

M はフェニル環であり、

R^1 は、H、 CH_2NH_2 、 $CONH_2$ 、 $C(=S)NH_2$ または NH_2 であり、

$R^{1'}$ は H であり、

W は、単環式の、飽和、不飽和、もしくは芳香族の 1 または 2 個の N、O および / または S 原子を有する炭素環または複素環であり、それは R^2 で単置換もしくは二置換されてもよく、

R^2 は、H、または 1、2、3、4、5 もしくは 6 個の炭素原子を有するアルキルであり、

$R^{2'}$ は、H、または 1、2、3、4、5 もしくは 6 個の炭素原子を有するアルキルであり、

X は、 $CONH$ 、 $CONHCH_2$ 、 CH_2NH 、または CH_2NHCH_2 であり、

Y は、アルキレン、または Ar - ジイルであり、

Ar は、フェニル、ナフチル、またはビフェニルであり、それぞれは、無置換かまたは、Hal、A、OH、 NH_2 、 NO_2 、CN、COOH、 $CONH_2$ 、 $NHCOA$ 、 $NHCONH_2$ 、 $NHSO_2A$ 、COH、 SO_2NH_2 、 $S(O)_m A$ 、 $-(CH_2)_n - COOR^{2'}$ 、もしくは $-O-(CH_2)_o - COOR^{2'}$ で、単置換、二置換、または三置換され、

m および n は、それぞれ互いに独立して、0、1 または 2 であり、

o は、1、2、または 3 であり、

T は、ピペリジン - 1 - イル、ピロリジン - 1 - イル、1H - ピリジン - 1 - イル、モルホリン - 4 - イル、ピペラジン - 1 - イル、1,3 - オキサゾリジン - 3 - イル、2H - ピリダジン - 2 - イル、アゼパン - 1 - イル、2 - アザピシクロ [2 . 2 . 2] オクタン - 2 - イル、ピラゾール - 2 - イル、1,3,4 - チアジアゾール - 3 - イル、イミダゾリジン - 1 - イル、もしくは 1,2 - ジヒドロピラゾール - 2 - イルであり、それぞれは、 $=NR^2$ 、 $=N-CN$ 、 $=S$ 、もしくは $=NOR^2$ で、単置換、または二置換され、およびさらに、A、 $CONH_2$ もしくは $COOA$ で、単置換、または二置換されてもよい、で表される請求項 1、3 ~ 5 および 7 ~ 19 のいずれかに記載の式 I の化合物、ならびにそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、およびすべての比率での混合物を含むそれらの立体異性体。

【手続補正 8】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】請求項 2 3

【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項 2 3】

式中、

D は、存在しないかまたは、 $-CH=N-CH=CH-$ 、 $-CH=CH-N=CH-$ 、 $-NH-N=CH-$ 、 $-CH=N-NH-$ 、 $-O-N=CH-$ 、もしくは $-CH=N-O-$ であり、

M はフェニル環であり、

R^1 は、H、 CH_2NH_2 、 $CONH_2$ 、 $C(=S)NH_2$ 、または NH_2 であり、

$R^{1'}$ はHであり、

W は、シクロヘキサジイル、シクロペンタンジイル、フェニレン、ビフェニレン、フランジイル、チオフエンジイル、ピロールジイル、イミダゾールジイル、ピラゾールジイル、オキサゾールジイル、イソオキサゾールジイル、チアゾールジイル、イソチアゾールジイル、ピリジンジイル、ピリミジンジイル、またはピロリジンジイルであり、それぞれは、無置換かまたは、 R^2 で単置換もしくは二置換され、

R^2 は、H、または 1、2、3、4、5、もしくは 6 個の炭素原子を有するアルキルであり、

$R^{2'}$ は、H、または 1、2、3、4、5、もしくは 6 個の炭素原子を有するアルキルであり、

X は、 $CONH$ 、 $CONHCH_2$ 、 CH_2NH 、または CH_2NHCH_2 であり、

Y は、無置換かまたは、A、Br、Cl、もしくはFで、単置換、または二置換されたフェニレンであり、

A は、1、2、3、4、5、または 6 個の炭素原子を有し、および/または加えて、1~7 個のH原子がFで置換されてもよい非分枝状もしくは分枝状アルキルであり、

T は、ペペリジン-1-イル、ピロリジン-1-イル、1H-ピリジン-1-イル、モルホリン-4-イル、ピペラジン-1-イル、1,3-オキサゾリジン-3-イル、2H-ピリダジン-2-イル、アゼパン-1-イル、2-アザピシクロ[2.2.2]オクタン-2-イル、ピラゾール-2-イル、1,3,4-チアジアゾール-3-イル、イミダゾリジン-1-イル、または1,2-ジヒドロピラゾール-2-イルであり、それぞれは、 $=NR^2$ 、 $=N-CN$ 、 $=S$ 、もしくは $=NOR^2$ で、単置換、または二置換され、およびさらに、A、 $CONH_2$ または $COOA$ で、単置換、または二置換されてもよい、で表される請求項 1、3~5、7~19および22のいずれかに記載の式 I の化合物、ならびにそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、およびすべての比率での混合物を含むそれらの立体異性体。

【手続補正 9】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】請求項 2 4

【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項 2 4】

式中、

D は、存在しないかまたは、 $-CH=N-CH=CH-$ 、 $-CH=CH-N=CH-$ 、 $-NH-N=CH-$ 、 $-CH=N-NH-$ 、 $-O-N=CH-$ 、または $-CH=N-O-$ であり、

M はフェニル環であり、

R^1 は、H、 CH_2NH_2 、 $CONH_2$ 、 $C(=S)NH_2$ 、または NH_2 であり、

$R^{1'}$ はHであり、

W は、ピラゾールジイル、またはチアゾールジイルであり、それぞれは、無置換かまたは、Aで単置換されており、

X は $CONH$ であり、

Y は、無置換かまたは、A、Br、Cl、もしくはFで、単置換、または二置換されたフェニレンであり、

T は、2-イミノピロリジン-1-イル、2-イミノピペリジン-1-イル、2-イミノ-1,3,4-チアジアゾール-3-イル、2-イミノイミダゾリジン-1-イル、または3-イミノ-1,2-ジヒドロピラゾール-2-イル、および対応するヒドロキシイミノ、シアノイミノ、アルコキシイミノ、およびチオキソ誘導体であり、ここでさらに複素環基は、A、CONH₂、またはCOOAで、単置換、もしくは二置換されてよく、

A は、1、2、3、4、5、または6個の炭素原子を有し、および/または加えて、1~7個のH原子がFで置換されてもよい非分枝状もしくは分枝状アルキルである、

で表される請求項1、3~5および7~23のいずれかに記載の式Iの化合物、ならびにそれらの薬学的に使用できる誘導体、溶媒和物、およびすべての比率での混合物を含むそれらの立体異性体。

【手続補正10】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0004

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0004】

Het は、単環式または二環式の、飽和、不飽和、もしくは芳香族の、1~4個のN、Oおよび/またはS原子を有する炭素環または複素環であり、それは、無置換か、またはカルボニル酸素、=S、=N(R³)₂、Hal、A、-[C(R³)₂]_n-Ar、-[C(R³)₂]_n-Het'、-[C(R³)₂]_n-シクロアルキル、-[C(R³)₂]_n-OR^{2'}、-[C(R³)₂]_n-N(R^{2'})₂、NO₂、CN、-[C(R³)₂]_n-COOR^{2'}、-[C(R³)₂]_n-CON(R^{2'})₂、-[C(R³)₂]_n-NR^{2'}COA、NR^{2'}CON(R^{2'})₂、-[C(R³)₂]_n-NR^{2'}SO₂A、COR^{2'}、SO₂NR^{2'} および/またはS(O)_mAで単置換、二置換、もしくは三置換されてよく、

Het' は、単環式または二環式の、飽和、不飽和、もしくは芳香族の、1または2個のN、Oおよび/またはS原子を有する炭素環または複素環であり、それは、無置換か、またはカルボニル酸素、=S、=N(R³)₂、Hal、A、OR^{2'}、N(R^{2'})₂、NO₂、CN、COOR^{2'}、CON(R^{2'})₂、NR^{2'}COA、NR^{2'}CON(R^{2'})₂、NR^{2'}SO₂A、COR^{2'}、SO₂NR^{2'} および/またはS(O)_mAで単置換、二置換、もしくは三置換されてよく、

【手続補正11】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0027

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0027】

D は、好ましくは、-CO-NH-CO、-CO-NH-CH₂-、-NH-CH=CH-、-O-CH=CH-、-N=CH-O-、-N=CH-NH-、-NH-NH-CO-、-NH-N=N-、-NH-CO-CH₂-、-NH-CO-O-、-N=CH-S-、-NH-CO-S-、-NH-CO-NH-、-NH-N=CH-、-S-N=CH-、=CH-S-N=、-O-N=CH-、-O-NH-CO-、-NH-O-CO-、-N=CH-CH=CH-、-CH=N-CH=CH-、-N=N-CH=CH-、-N=CH-N=CH-、-N=CH-CH=N-、-N=N-N=CH-、-NH-CO-CH=CH-、-NH-CH=CH-CO-、-NH-CO-CH₂-CH₂-、-NH-CH₂-CH₂-CO-、-NH-CO-N=CH-、-N=CH-NH-CO-、-NH-CO-NH-CO-、-NH-CO-NH-CH₂-、-CH=N-N=CH-、-N⁻-S⁺=N-、-O-CH₂-O-、さらに-CH=N-NH-CO-、-CH=CH-NH-、-O-CH₂CH₂-O-、-CO-NH-NH-CO-、-N=N-NH-CO-、-O-CO-NH-CH₂-、または-O-CO-NH-CO-で

あり、ここで加えて、アルキレン鎖および/またはそれらに存在する窒素は、AまたはN H₂で単置換、二置換、もしくは三置換されてよい。

【手続補正12】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0045

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0045】

H e t は、H e t などの好ましい意味を有する。

Tは、好ましくは、1または2個のNおよび/またはO原子を有する、単環式の、飽和または不飽和の複素環であり、それは、=S、=NR²、=NOR²、=N-CN、=N-NO₂、=NCOR²、=NCOOR²、または=NOCOR²、特に=S、=NR²、または=NOR²で単置換または二置換され、およびさらに好ましくは、Aで単置換または二置換されていてもよい。