

【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24年6月7日(2012.6.7)

【公表番号】特表2008-542444(P2008-542444A)

【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2008-515847(P2008-515847)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/82 (2006.01)

A 6 1 K 31/4545 (2006.01)

C 0 7 D 413/04 (2006.01)

C 0 7 D 239/36 (2006.01)

A 6 1 K 31/513 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 213/82 C S P

A 6 1 K 31/4545

C 0 7 D 413/04

C 0 7 D 239/36

A 6 1 K 31/513

C 0 7 D 403/04

C 0 7 D 401/04

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 25/00

【誤訳訂正書】

【提出日】平成24年4月13日(2012.4.13)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

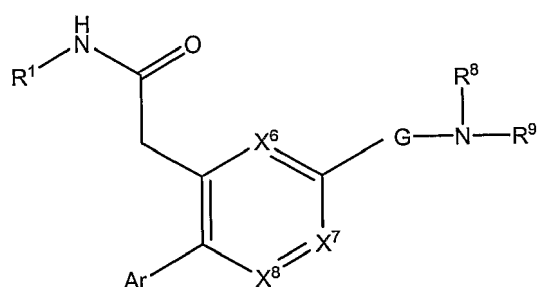
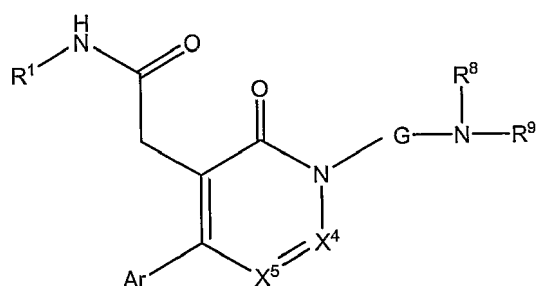
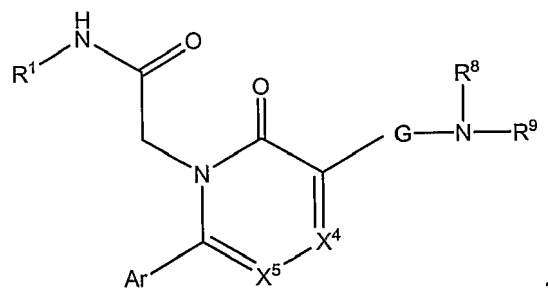
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

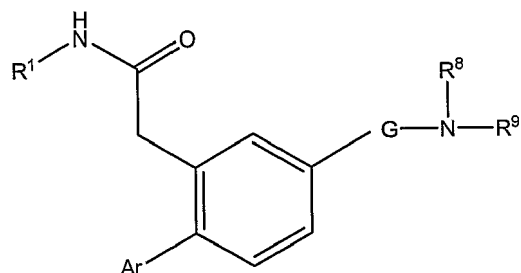
【請求項1】

式：

## 【化 1】



又は



(式中、

$X^4$  および  $X^5$  は、 $CR^4 - CR^5$ 、 $N - CR^5$  および  $CR^4 - N$  から選択され；

$X^6$ 、 $X^7$  および  $X^8$  の 1 つは  $N$  であり、他の 2 つは  $CR^4$  および  $CR^5$  であり；

$R^1$  は、 $(C_{1-10})$  アルキル、 $(C_{3-10})$  シクロアルキル、および  $[(C_{3-10})$  シクロアルキル  $(C_{1-2})$  アルキル] から選択され、前記  $(C_{1-10})$  アルキル、 $(C_{3-10})$  シクロアルキル、および  $[(C_{3-10})$  シクロアルキル  $(C_{1-2})$  アルキル] は、場合により 1 個以上のハロゲン、 $(C_{1-6})$  アルコキシ、 $(C_{2-6})$  アルケニル、 $(C_{2-6})$  アルキニル、フェニルまたはベンジルで置換されていてもよく；

$Ar$  は、

(i)  $(C_{6-10})$  アリールであって、場合によりハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、 $COOR^5$ 、 $NR^6R^7$ 、フェニル、 $(C_{5-6})$  ヘテロアリール、 $(C_{1-6})$  アルキル、 $(C_{3-6})$  シクロアルキル、 $(C_{1-6})$  アルキルオキシおよび  $(C_{3-6})$  シクロアルキルオキシから選択される 1 個から 3 個の置換基で置換されていてもよく、前記  $(C_{1-6})$  アルキル、 $(C_{3-6})$  シクロアルキル、 $(C_{1-6})$  アルキルオキシおよび  $(C_{3-6})$  シクロアルキルオキシは、場合により 1 個以上のハロゲンで置換されていてもよく；

( i i ) ( C<sub>5</sub> - 10 ) ヘテロアリールであって、場合によりメチル、( C<sub>1</sub> - 6 ) アルキルオキシまたはハロゲンから選択される置換基で置換されていてもよく；および

( i i i ) ( C<sub>4</sub> - 7 ) シクロアルキル

から選択され；

R<sup>4</sup> および R<sup>5</sup> は、独立して、H、( C<sub>1</sub> - 6 ) アルキル、( C<sub>1</sub> - 6 ) アルキルオキシまたはハロゲンから選択され、前記 ( C<sub>1</sub> - 6 ) アルキルおよび ( C<sub>1</sub> - 6 ) アルキルオキシは、場合により、1 個以上のハロゲンで置換されていてもよく；

G は ( C<sub>4</sub> - C<sub>7</sub> ) アルキレンであり、ここで 1 個以上の - CH<sub>2</sub> - は、- S - 、 - S ( O ) - 、 - S O<sub>2</sub> - 、 - O - 、 - C ( = O ) - 、 - C H O H - 、 - N H - 、 C H F 、 C F<sub>2</sub> 、 - C H ( O - C<sub>1</sub> - 6 アルキル ) - 、 - C H ( O - C<sub>1</sub> - 4 アシル ) - 、 - C H ( C<sub>1</sub> - 6 アルキル ) - または - C ( C<sub>1</sub> - 6 アルキル )<sub>2</sub> - で置換されていてもよく、但し ( 1 ) 隣接する - CH<sub>2</sub> - 残基は、- S - 、 - S ( O ) - 、 - S O<sub>2</sub> - または - O - で置換されることはなく； ( 2 ) - S - 、 - S ( O ) - 、 - S O<sub>2</sub> - 、 - O - および - N H - 残基は、単一の炭素だけで分離されることはできない、あるいは、

G は炭素環または複素環であり、これらは中心環および - N R<sup>8</sup> R<sup>9</sup> に、直接結合または C<sub>1</sub> - C<sub>5</sub> アルキレン鎖によって結合している、あるいは、

G は含窒素複素環であり、これは中心環に直接結合または C<sub>1</sub> - C<sub>5</sub> アルキレン鎖によって結合しており；この場合、含窒素複素環の窒素は、- N R<sup>8</sup> R<sup>9</sup> に対応し、R<sup>9</sup> は形式上 G の一部となり、

前記炭素環、複素環及び含窒素複素環は、ハロゲン、ハロ C<sub>1</sub> - 6 アルキル、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> - 4 アルコキシ、C<sub>1</sub> - 4 アルコキシカルボニル、C<sub>1</sub> - 6 アルキル、アミノカルボニル、シアノ及びカルボニルから選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよい；

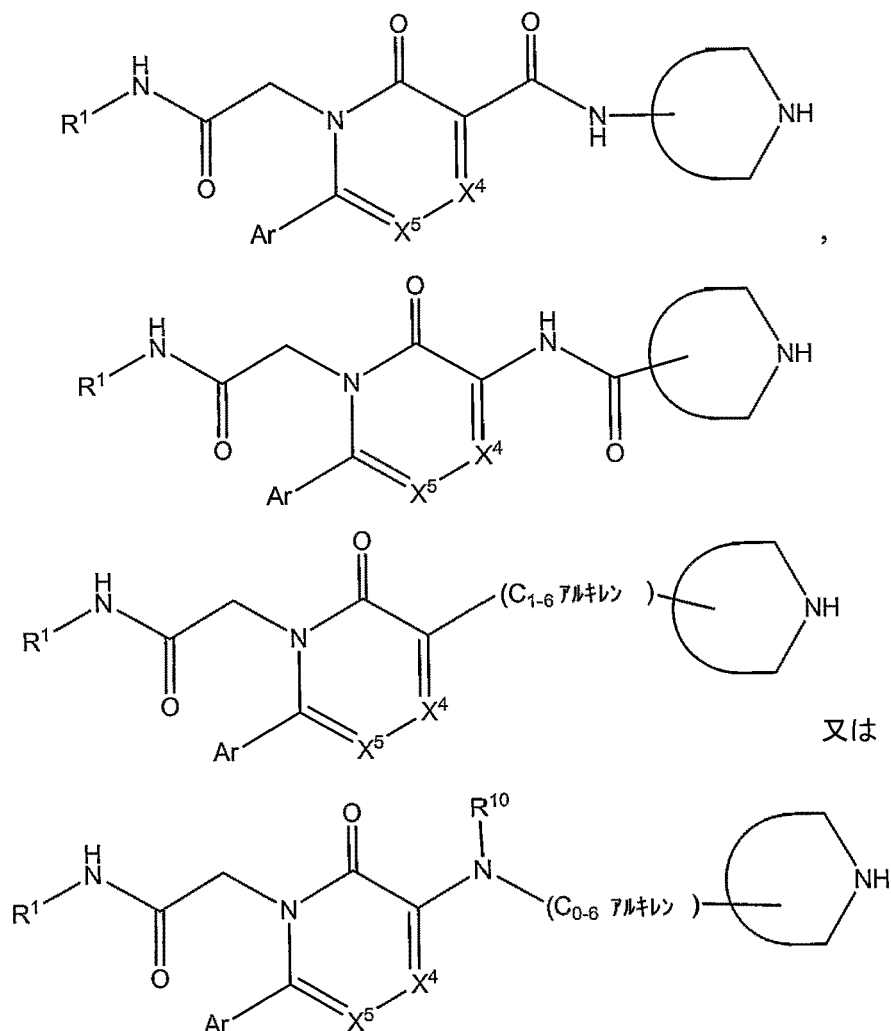
R<sup>8</sup> および R<sup>9</sup> は独立して、H又は C<sub>1</sub> - 6 アルキルであるか、あるいは N R<sup>8</sup> R<sup>9</sup> は単環式または 2 環式の 3 から 10 個の炭素を有する飽和含窒素複素環であり、R<sup>8</sup> および R<sup>9</sup> を有する窒素が、4 員から 7 員の含窒素複素環の一部であるとき、G はさらに - N ( R<sup>10</sup> ) - ( C<sub>3</sub> - 6 ) アルキレンであっててもよく；R<sup>10</sup> は、Hまたは ( C<sub>1</sub> - 6 ) アルキルである；

但し、X<sup>4</sup> および X<sup>5</sup> が C R<sup>4</sup> - N であり、および G がアルキレンであるとき、R<sup>1</sup> は、( C<sub>1</sub> - 6 ) アルキル、( C<sub>3</sub> - 6 ) シクロアルキルおよび [ ( C<sub>3</sub> - 6 ) シクロアルキル ( C<sub>1</sub> - 2 ) アルキル ] から選択される ) の化合物。

#### 【請求項 2】

式：

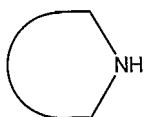
## 【化 2】



(式中、

 $R^1$  は、 $C_3 - C_6$  アルキルであり； $R^{10}$  は、Hまたは $(C_1 - 6)$  アルキルであり；および

## 【化 3】

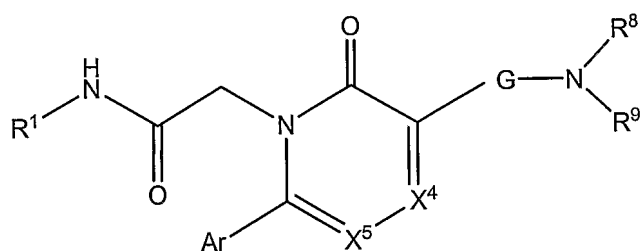


は、単環式または2環式の3から10個の炭素を有する飽和含窒素複素環である)の請求項1に記載の化合物。

## 【請求項 3】

式：

## 【化 4】



(式中、

 $X^4$  および  $X^5$  は、 $CR^4 - CR^5$ 、 $N - CR^5$  および  $CR^4 - N$  から選択され；

$R^1$  は、 $(C_{1-10})$  アルキル、 $(C_{3-10})$  シクロアルキル、 $[(C_{3-10})$  シクロアルキル  $(C_{1-2})$  アルキル] から選択され、前記  $(C_{1-10})$  アルキル、 $(C_{3-10})$  シクロアルキル、および  $[(C_{3-10})$  シクロアルキル  $(C_{1-2})$  アルキル] は、場合により、1 個以上のハロゲン、 $(C_{1-6})$  アルコキシ、 $(C_{2-6})$  アルケニル、 $(C_{2-6})$  アルキニル、フェニルまたはベンジルで置換されていてもよく；

$Ar$  は、 $(C_{6-10})$  アリールであって、場合により、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、 $COOR^5$ 、 $NR^6R^7$ 、フェニル、 $(C_{5-6})$  ヘテロアリール、 $(C_{1-6})$  アルキル、 $(C_{3-6})$  シクロアルキル、 $(C_{1-6})$  アルキルオキシおよび  $(C_{3-6})$  シクロアルキルオキシから選択される 1 個から 3 個の置換基で置換されていてもよく、前記  $(C_{1-6})$  アルキル、 $(C_{3-6})$  シクロアルキル、 $(C_{1-6})$  アルキルオキシおよび  $(C_{3-6})$  シクロアルキルオキシは、場合により 1 個以上のハロゲンで置換されていてもよく、または

$Ar$  は、 $(C_{5-10})$  ヘテロアリールであって、場合によりメチル、 $(C_{1-6})$  アルキルオキシまたはハロゲンから選択される置換基で置換されていてもよく；または

$Ar$  は、 $(C_{4-7})$  シクロアルキルであり

$R^4$  および  $R^5$  は、独立して、H、 $(C_{1-6})$  アルキル、 $(C_{1-6})$  アルキルオキシまたはハロゲンから選択され、前記  $(C_{1-6})$  アルキル、 $(C_{1-6})$  アルキルオキシは、場合により、1 個以上のハロゲンで置換されていてもよく；

$G$  は  $(C_4 - C_7)$  アルキレンであり、ここで 1 個以上の  $-CH_2-$  は、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-O-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-CHOH-$ 、 $-NH-$ 、 $CHF-$ 、 $CF_2-$ 、 $-CH(O-C_{1-6} \text{ アルキル})-$ 、 $-CH(O-C_{1-4} \text{ アシル})-$ 、 $-CH(C_{1-6} \text{ アルキル})-$  または  $-C(C_{1-6} \text{ アルキル})_2-$  で置換されていてもよく、但し (1) 隣接する  $-CH_2-$  残基は、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-SO_2-$  または  $-O-$  で置換されることはなく；(2)  $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-SO_2-$ 、 $-O-$  および  $-NH-$  残基は、単一の炭素だけで分離されることはできない、あるいは、

$G$  は炭素環または複素環であり、これらは中心環および  $-NR^8R^9$  に、直接結合または  $C_1 - C_5$  アルキレン鎖によって結合している、あるいは、

$G$  は含窒素複素環であり、これは中心環に直接結合または  $C_1 - C_5$  アルキレン鎖によって結合しており；この場合、含窒素複素環の窒素は、 $-NR^8R^9$  に対応し、 $R^9$  は形式上  $G$  の一部となり、

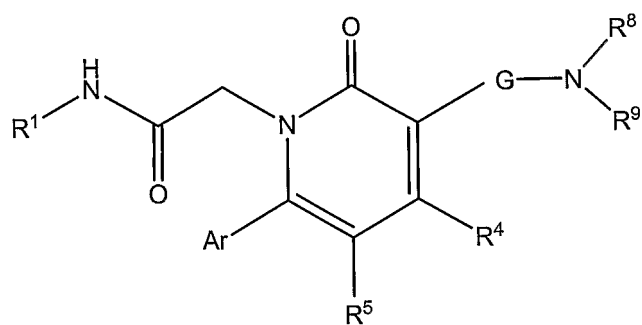
前記炭素環、複素環及び含窒素複素環は、ハロゲン、ハロ  $C_{1-6}$  アルキル、ヒドロキシ、 $C_{1-4}$  アルコキシ、 $C_{1-4}$  アルコキシカルボニル、 $C_{1-6}$  アルキル、アミノカルボニル、シアノ及びカルボニルから選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されていてもよい；

$R^8$  および  $R^9$  は独立して、H 又は  $C_{1-6}$  アルキルであるか、あるいは  $NR^8R^9$  は単環式または 2 環式の 3 から 10 個の炭素有する飽和含窒素複素環であり、 $R^8$  および  $R^9$  を有する窒素が、4 員から 7 員の含窒素複素環の一部であるとき、 $G$  はさらに  $-N(R^{10})-$   $(C_{3-6})$  アルキレンであってもよく； $R^{10}$  は、H または  $(C_{1-6})$  アルキルである) の請求項 1 に記載の化合物。

#### 【請求項 4】

式：

【化 5】

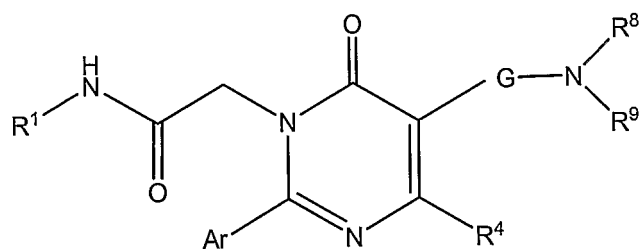


の請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

式：

【化 6】

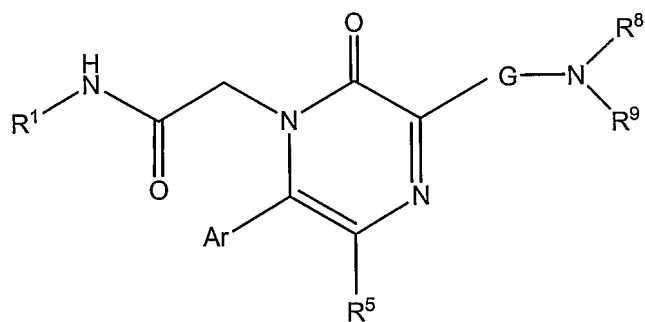


の請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 6】

式：

【化 7】

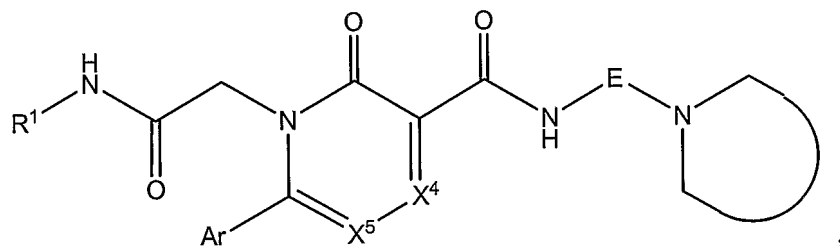


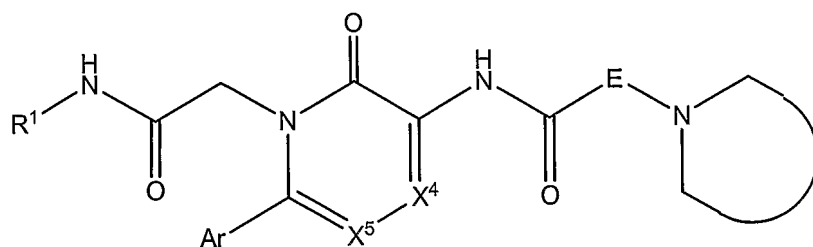
の請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 7】

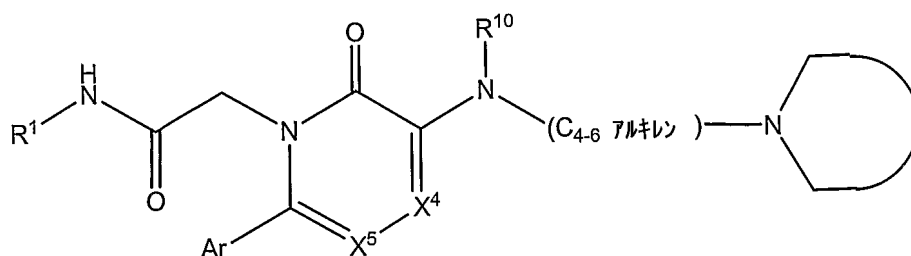
式：

【化 8】

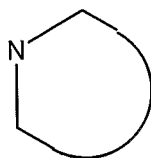




【化 9】



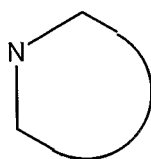
(式中、  
E は、(C<sub>2</sub> - C<sub>10</sub>)炭化水素であり；および  
【化 10】



は、単環式または 2 環式の 3 から 10 個の炭素を有する飽和含窒素複素環である) から選  
択される、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 8】

【化 11】

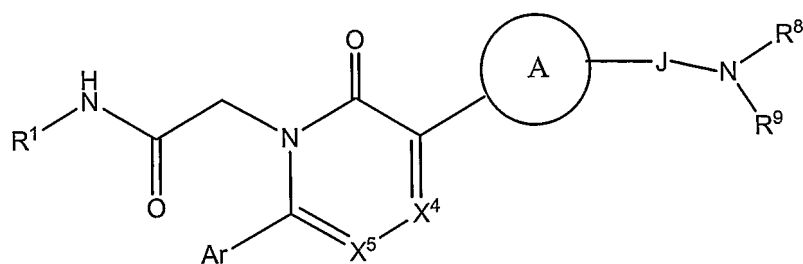


が、ピペリジン環またはモルホリン環である、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

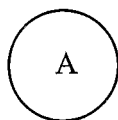
式：

【化 12】



(式中、  
J は、直接結合または (C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub>)炭化水素であり；および

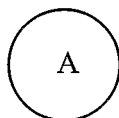
【化 1 3】



は、4 から 7 個の原子を有する単環式炭素環もしくは複素環または 9 から 13 個の原子を有する 2 環式炭素環もしくは複素環である ) の、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 10】

【化 1 4】

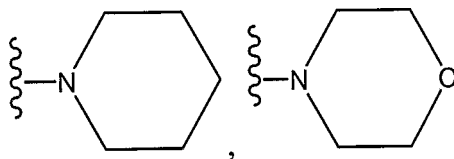


が、5 員または 6 員の含窒素複素環であり、および J がメチレン、エチレンまたはプロピレンである、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

- N R<sup>8</sup> R<sup>9</sup> が、

【化 1 5】

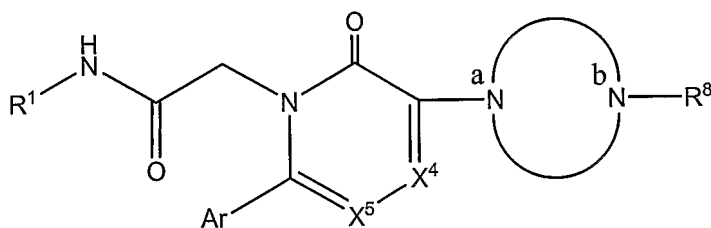


および - N [ C<sub>1 - 3</sub> アルキル ]<sub>2</sub> から選択される、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

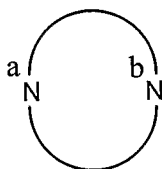
式：

【化 1 6】



( 式中、

【化 1 7】

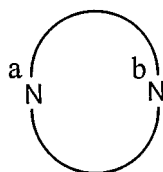


は、6 から 8 個の原子を有する含窒素単環式複素環または 9 から 13 個の原子を有する 2 環式複素環であり、b で指示された窒素は請求項 1 の窒素であり、および a で指示された窒素は請求項 1 の G の定義に含まれる ) の請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 13】



【化 1 8】

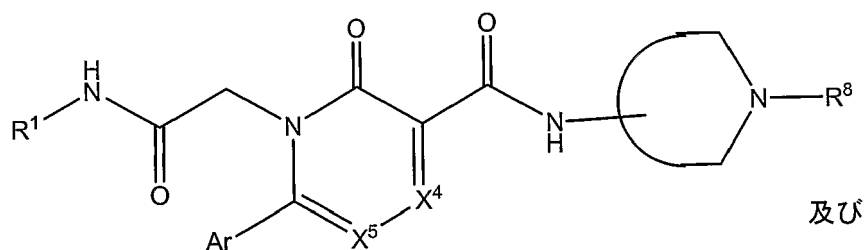
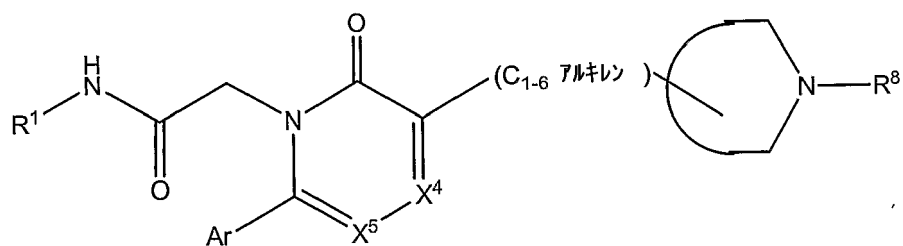
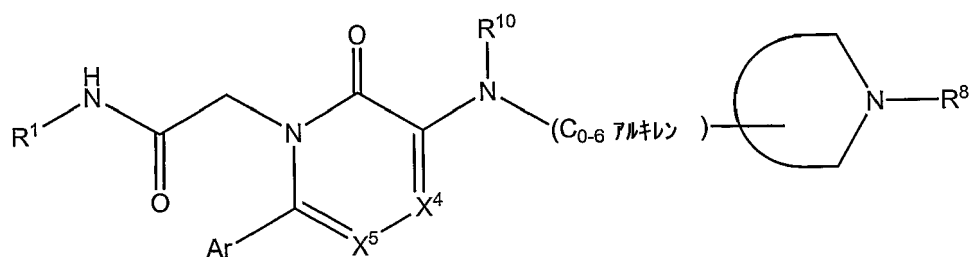


が、ヘキサヒドロ - 1 , 4 - ジアゼピン環である、請求項 1 2 に記載の化合物。

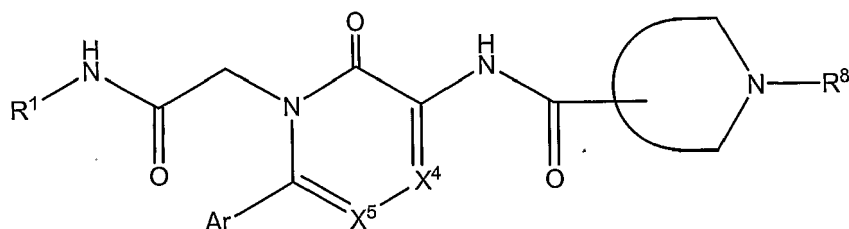
【請求項 1 4】

式：

【化 1 9】

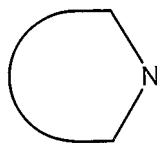


及び



( 式中、

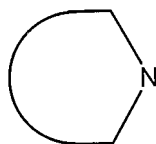
【化 2 0】



は、単環式または 2 環式の 3 から 10 個の炭素を有する飽和含窒素複素環であり；および R<sup>8</sup> が、水素および C<sub>1</sub> - C<sub>10</sub> 炭化水素から選択される) から選択される、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 1 5】

【化 2 1】

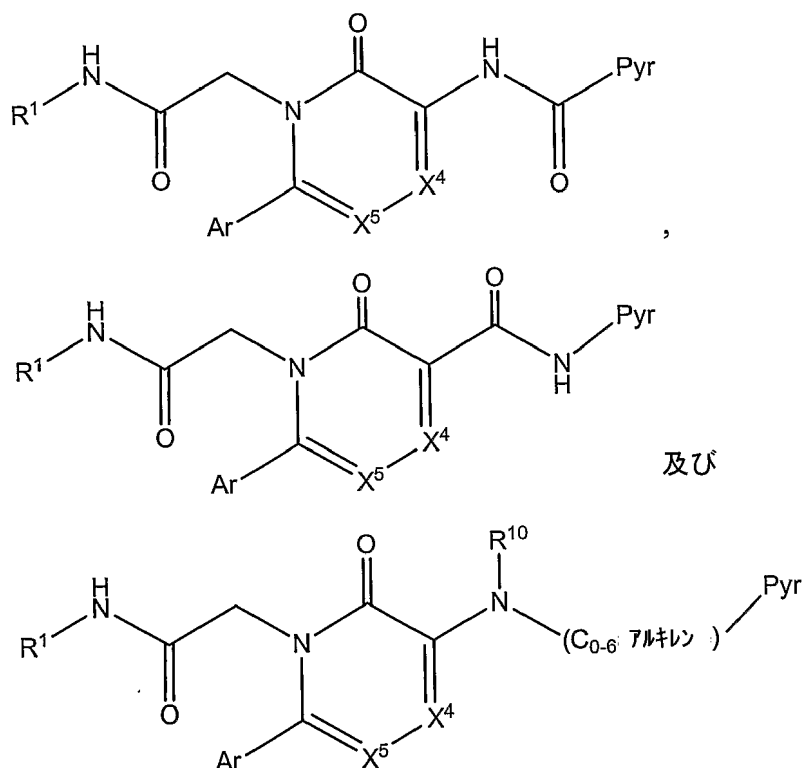


が、ピペリジン環であり、および  $R^8$  がメチルである、請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 16】

式：

【化 2 2】



(式中、

$X^4$  および  $X^5$  は、 $CR^4 - CR^5$ 、 $N - CR^5$  および  $CR^4 - N$  から選択され；

$R^1$  は、 $(C_{1-10})$  アルキル、 $(C_{3-6})$  シクロアルキル、 $(C_{3-6})$  シクロアルキル  $(C_{1-2})$  アルキルから選択され、前記  $(C_{1-10})$  アルキル、 $(C_{3-6})$  シクロアルキル、および  $(C_{3-6})$  シクロアルキル  $(C_{1-2})$  アルキルは、場合により、1 個以上のハロゲン、 $(C_{2-6})$  アルケニル、 $(C_{2-6})$  アルキニル、フェニルまたはベンジルで置換されていてもよく；

$Ar$  は、 $(C_{6-10})$  アリールであって、場合により、ハロゲン、ヒドロキシ、シアノ、 $COOR^5$ 、 $NR^6R^7$ 、フェニル、 $(C_{5-6})$  ヘテロアリール、 $(C_{1-6})$  アルキル、 $(C_{3-6})$  シクロアルキル、 $(C_{1-6})$  アルキルオキシおよび  $(C_{3-6})$  シクロアルキルオキシから選択される 1 個から 3 個の置換基で置換されていてもよく、前記  $(C_{1-6})$  アルキル、 $(C_{3-6})$  シクロアルキル、 $(C_{1-6})$  アルキルオキシおよび  $(C_{3-6})$  シクロアルキルオキシは、場合により、1 個以上のハロゲンで置換されていてもよく、または

$Ar$  は、 $(C_{5-10})$  ヘテロアリールであって、場合により、メチル、 $(C_{1-6})$  アルキルオキシまたはハロゲンから選択される置換基で置換されていてもよく、または

$Ar$  は、 $(C_{4-7})$  シクロアルキルであり；

$R^4$  および  $R^5$  は、独立して、 $H$ 、 $(C_{1-6})$  アルキル、 $(C_{1-6})$  アルキルオキシまたはハロゲンから選択され、前記  $(C_{1-6})$  アルキル、 $(C_{1-6})$  アルキルオキシは、場合により、1 個以上のハロゲンで置換されていてもよく；

$R^{10}$  は、H または ( $C_{1-6}$ ) アルキルであり；および

$Pyr$  は、炭素を介して結合しているイミダゾール、炭素を介して結合しているピリジン、及び炭素を介して結合している置換されたピリジンから選択される ) から選択される化合物。

【請求項 17】

$R^1$  が、 $C_{4-6}$  アルキル、シクロアルキル、およびフェニル、メトキシまたはアルキニルで置換された  $C_{1-3}$  アルキルから選択される、請求項 1 および 3 ~ 16 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 18】

$R^1$  が、*t*-ブチル、イソプロピル、シクロペンチル、-メチルベンジル、メトキシプロピルおよびプロパルギルから選択される、請求項 17 に記載の化合物。

【請求項 19】

$Ar$  が、フェニル、およびハロゲン、メチルまたはメトキシで置換されたフェニルから選択される、請求項 1 から 16 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 20】

医薬的に許容される担体および請求項 1 から 16 のいずれか一項に記載の化合物を含む医薬製剤。

【請求項 21】

医薬を製造するための、請求項 1 から 16 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項 22】

前記医薬が、利尿作用をもたらすための医薬、またはうつ病、ストレス疾患、攻撃的挙動、高齢者の不眠症、がん、クッシング病、および膵臓病から選択される疾患を治療するための医薬である、請求項 21 に記載の使用。