

【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 6 月 15 日 (2006.6.15)

【公表番号】特表 2002-518324(P2002-518324A)

【公表日】平成 14 年 6 月 25 日 (2002.6.25)

【出願番号】特願 2000-554363(P2000-554363)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4015 (2006.01)

A 6 1 K 31/4035 (2006.01)

A 6 1 K 31/45 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 P 31/06 (2006.01)

C 0 7 D 207/404 (2006.01)

C 0 7 D 207/416 (2006.01)

C 0 7 D 207/448 (2006.01)

C 0 7 D 211/88 (2006.01)

C 0 7 D 209/48 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/4015

A 6 1 K 31/4035

A 6 1 K 31/45

A 6 1 K 31/454

A 6 1 P 31/06

C 0 7 D 207/404

C 0 7 D 207/416

C 0 7 D 207/448

C 0 7 D 211/88

C 0 7 D 209/48 Z

【手続補正書】

【提出日】平成 18 年 4 月 18 日 (2006.4.18)

【手続補正 1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

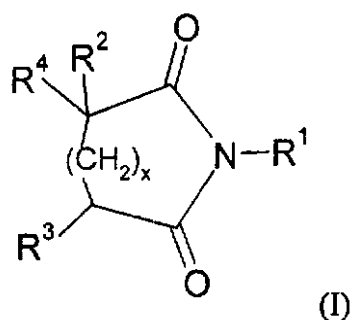
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

ミコバクテリウム・ツベルクロシス、ミコバクテリウム・ボビス、ミコバクテリウム・アビウム、またはミコバクテリウム・マリナムを原因とするミコバクテリア疾患の治療に用いる薬物の製造における、一般式 (I)

【化 1】



[式中、xは0であり；

R¹は、水素原子であるか、またはC₁－C₂₀アルキルもしくはミルタニル基であるか、または(CH₂)_yCONH－R⁵基（式中、yは1－6の整数であり、R⁵は、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、カルボキシル、ハロゲン、トリフルオロメチル、C₁－C₆アルキル、C₁－C₆アルコキシ、C₁－C₆アルコキシカルボニル、ピペリジル、ピペラジニルおよびモルホリニルから選択された1以上の置換基によって置換されているフェニル基である）であり；そして、

R²は水素原子またはC₁－C₆アルキル基であるか、あるいはR²はR³と共に炭素－炭素一重結合を形成し、あるいはR²はR⁴と共に＝CH₂基を形成し、

R³は水素原子であるか、または上記のようにR²と結合し、そして、

R⁴は、水素原子またはC₁－C₆アルキル基であるか；あるいはジ（C₁－C₆アルキル）アミノ置換基で置換されているフェニル基であるか；あるいは、アミノ、ニトロ、ヒドロキシル、カルボキシル、トリフルオロメチル、C₁－C₆アルキル、C₁－C₆アルコキシ、C₁－C₆アルコキシカルボニル、ピペリジル、ピペラジニルおよびモルホリニルから選択された1以上の置換基によって芳香環を置換されているアニリノ基であるか；あるいは、－SCH₂CH₂OH、－SCH₂CH₂NH₂、－SCH₂CH₂(NH₂)CO₂Hまたは－SCH₂CH₂NHCO－R⁶（式中、R⁶はC₁－C₁₀アルキルもしくはC₃－C₆シクロアルキル基、またはアミノ、ニトロ、ヒドロキシル、カルボキシル、ハロゲン、トリフルオロメチル、C₁－C₆アルキル、C₁－C₆アルコキシ、C₁－C₆アルコキシカルボニル、ピペリジル、ピペラジニルおよびモルホリニルから選択された1以上の置換基で置換されているフェニル基である）であるか；あるいは、R⁴は上記のようにR²と連結する；

但し、

(i) R¹、R²、R³およびR⁴は、それぞれが同時に水素原子であることはない]の化合物、またはその医薬として許容しうる塩もしくは溶媒化合物の使用。

【請求項2】

R¹が、水素原子、またはC₄－C₁₀アルキルもしくはミルタニル基、または(CH₂)_yCONH－R⁵（式中、yは1または2であり、R⁵はピペリジル置換基で置換されたフェニル基である）基である、請求項1記載の使用。

【請求項3】

R²が、水素原子またはメチル基である、あるいはR²がR³と共に炭素－炭素一重結合を形成する、あるいはR²がR⁴と共に＝CH₂基を形成する、請求項1 または2記載の使用。

【請求項4】

R⁴が、水素原子、メチルもしくはエチル基、ジ（C₂－C₄アルキル）アミノ置換基で置換されているフェニル基、C₂－C₁₀アルキルアミノ基、ピペリジル置換基で置換されたアニリノ基、－SCH₂CH₂OH、－SCH₂CH₂NH₂、－SCH₂CH₂(NH₂)CO₂H、－SCH₂CH₂NHCO－R⁶（式中、R⁶は、C₇アルキル、シクロプロピル、シクロペンチルもしくはシクロヘキシル基、またはニトロ、C₁－C₄アルキルもしくはC₃－C₆アルコキシ置換基で置換されたフェニル基である）である、またはR⁴が請求項1に定義したようにR²と結合している、請求項1乃至3のいずれか一項に

記載の使用。

【請求項 5】

式 (I) 化合物が：

- 1-デシルピロリジン-2, 5-ジオン、
- 1-((6, 6-ジメチルピシクロ[3, 1, 1]ヘプト-3-イル)メチル)-3-メチル-3-ピロリン-2, 5-ジオン、
- 3-メチル-1-ノニル-3-ピロリン-2, 5-ジオン、
- 3-メチレン-1-ノニルピロリジン-2, 5-ジオン、
- 3-メチル-1-オクチル-3-ピロリン-2, 5-ジオン、
- 3-メチレン-1-オクチルピロリジン-2, 5-ジオン、
- 1-オクチル-3-ピロリン-2, 5-ジオン、
- 1-デシル-3-ピロリン-2, 5-ジオン、
- 1-ノニル-3-ピロリン-2, 5-ジオン、
- 1-ブチル-3-ピロリン-2, 5-ジオン、
- 1-ヘキシル-3-ピロリン-2, 5-ジオン、
- 1-(オクチル-3-(オクチルアミノ)-ピロリジン-2, 5-ジオン、
- 1-デシル-3-(デシルアミノ)ピロリジン-2, 5-ジオン、
- 3-(オクチルアミノ)-3-ピロリジン-2, 5-ジオン、
- 3-(ヘプチルアミノ)-1-ノニルピロリジン-2, 5-ジオン、
- 1-ノニル-3-(ノニルアミノ)ピロリジン-2, 5-ジオン、
- 1-ノニル-3-(オクチルアミノ)ピロリジン-2, 5-ジオン、
- 2-アミノ-3-(3-メチル-1-ノニル-2, 5-ジオキソ-ピロリジン-3-イルチオ)プロパン酸、
- 2-アミノ-3-(3-メチル-1-オクチル-2, 5-ジオキソ-ピロリジン-3-イルチオ)プロパン酸、
- 2-アミノ-3-(1-オクチル-2, 5-ジオキソ-ピロリジン-3-イルチオ)プロパン酸、
- 3-メチル-1-オクチルピロリジン-2, 5-ジオン、
- 3-メチル-1-ノニルピロリジン-2, 5-ジオン、
- 2-(2, 5-ジオキソピロリジニル)-N-(4-ピペリジルフェニル)エタンアミド、
- 2-(2, 5-ジオキソピロリジニル)-N-(4-ピペリジルフェニル)プロパンアミド、
- 3-エチル-1-ノニルピロリジン-2, 5-ジオン、
- 3-(2-アミノエチルチオ)-1-ノニルピロリジン-2, 5-ジオン、
- 2-エチル-N-(2-(1-ノニル-2, 5-ジオキソピロリジン-3-イルチロ)エチル)ヘキサナミド、
- シクロプロピル-N-(2-(1-ノニル-2, 5-ジオキソピロリジン-3-イルチオ)エチル)ホルムアミド、
- (4-ブチルフェニル)-N-(2-(1-ノニル-2, 5-ジオキソピロリジン-3-イルチロ)エチル)ホルムアミド、
- (4-ヘキシルオキシフェニル)-N-(2-(1-ノニル-2, 5-ジオキソピロリジン-3-イルチオ)エチル)ホルムアミド、
- (4-メチルフェニル)-N-(2-(1-ノニル-2, 5-ジオキソピロリジン-3-イルチオ)エチル)ホルムアミド、
- (4-(tert-ブチル)フェニル)-N-(2-(1-ノニル-2, 5-ジオキソピロリジン-3-イルチオ)エチル)ホルムアミド、
- シクロペンチル-N-(2-(1-ノニル-2, 5-ジオキソピロリジン-3-イルチオ)エチル)ホルムアミド、
- シクロヘキシル-N-(2-(1-ノニル-2, 5-ジオキソピロリジン-3-イルチオ)エチル)ホルムアミド、

(4-ニトロフェニル)-N-(2-(1-ノニル-2, 5-ジオキソピロリジン-3-イルチオ)エチル)ホルムアミド、

3-((2-(ジブチルアミノ)エチル)アミノ)-1-ノニルピロリジン-2, 5-ジオン、

3-((2-(ジエチルアミノ)エチル)アミノ)-1-ノニルピロリジン-2, 5-ジオン、

1-ノニル-3-((4-ピペリジニルフェニル)アミノ)ピロリジン-2, 5-ジオン、

3-(ヒドロキシエチルチオ)-3-メチル-1-ノニルピロリジン-2, 5-ジオン、

3-(2-アミノエチルチオ)-3-メチル-1-ノニルピロリジン-2, 5-ジオン、および

3-メチル-1-オクチル-3-(オクチルアミノ)ピロリジン-2, 5-ジオン

より選択される、請求項1記載の使用。

【請求項6】

ミコバクテリア疾患がミコバクテリウム・ツベルクロシスを原因とする疾患である、請求項1乃至5のいずれか一項に記載の使用。