

【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8月30日 (2012.8.30)

【公表番号】特表2012-500232(P2012-500232A)

【公表日】平成24年1月5日 (2012.1.5)

【年通号数】公開・登録公報2012-001

【出願番号】特願2011-523312(P2011-523312)

【国際特許分類】

C 07 D 271/10 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 3/04 (2006.01)

A 61 P 3/06 (2006.01)

A 61 P 9/12 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

A 61 P 13/12 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 35/04 (2006.01)

A 61 P 7/02 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 27/06 (2006.01)

A 61 P 27/02 (2006.01)

A 61 P 31/04 (2006.01)

A 61 P 1/16 (2006.01)

A 61 P 11/00 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 P 17/00 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 K 31/4245 (2006.01)

【 F I 】

C 07 D 271/10 C S P

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 3/10

A 61 P 3/04

A 61 P 3/06

A 61 P 9/12

A 61 P 9/00

A 61 P 13/12

A 61 P 29/00

A 61 P 35/00

A 61 P 35/04

A 61 P 7/02

A 61 P 25/00

A 61 P 27/06

A 61 P 27/02

A 61 P 31/04

A 61 P 1/16

A 6 1 P 11/00  
 A 6 1 P 29/00 1 0 1  
 A 6 1 P 19/02  
 A 6 1 P 1/04  
 A 6 1 P 17/00  
 A 6 1 P 25/28  
 A 6 1 K 31/4245

## 【手続補正書】

【提出日】平成24年7月9日(2012.7.9)

## 【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

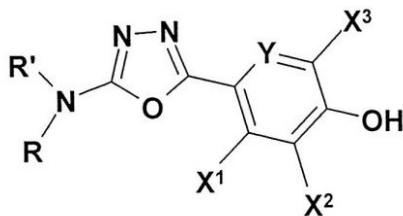
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I

【化 1】



式中、

R、R' は、各々、互いに独立してH、A、L - ArまたはL - Hetを示し、

Yは、N、CHまたはCR<sup>1 1</sup>を示し、X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>、X<sup>3</sup>は、各々、互いに独立してH、Hal、AまたはArを示し、Lは、欠如しているかまたはCR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、CR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>CR<sup>9</sup>R<sup>1 0</sup>、CR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>C(O R<sup>9</sup>)R<sup>1 0</sup>、OCR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>、OCR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>CR<sup>9</sup>R<sup>1 0</sup>、CR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>O、CR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>CR<sup>9</sup>R<sup>1 0</sup>OもしくはCR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>SO<sub>2</sub>を示し、R<sup>7</sup>、R<sup>8</sup>、R<sup>9</sup>、R<sup>1 0</sup>は、各々、互いに独立してHまたはAを示し、R<sup>1 1</sup>は、1～6個のC原子を有するアルキルを示し、ここで1～5個のH原子は、Fによって置き換えられていてもよく、

A、A' は、各々、互いに独立して1～10個のC原子を有するアルキルを示し、それは、非置換であるか、またはR<sup>3</sup>、= S、= NR<sup>7</sup>および/または= O(カルボニル酸素)によって単置換、二置換もしくは三置換されており、またここで、1つ、2つまたは3つのCH<sub>2</sub>基は、O、S、SO、SO<sub>2</sub>、NH、NR<sup>1 1</sup>によって、および/または-CH=CH-基によって置き換えられていてもよく、かつ/またはさらに、1～7個のH原子は、Fおよび/またはClによって置き換えられていてもよく、

あるいは3～7個のC原子を有する環状アルキルを示し、

Arは、フェニル、ナフチルまたはビフェニルを示し、その各々は、非置換であるかまたはA、Hal、OH、OA、Ar'、OAr'、Het、OHet、SH、SA、SAr'、SHet、NH<sub>2</sub>、NHA、NAA'、NHAr'、N(Ar')<sub>2</sub>、NHHet、N(Het)<sub>2</sub>、NAAr'、NAHet、SOA、SOAr'、SOHet、SO<sub>2</sub>A、SO<sub>2</sub>Ar'、SO<sub>2</sub>Het、NO<sub>2</sub>、CN、COOH、COOA、CONH<sub>2</sub>、CONHA、CONA<sub>2</sub>、NHCOA、NACOA、NHCONH<sub>2</sub>、NHCONHA、N

HCONA<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>A、NASO<sub>2</sub>A、CHO、COA、COAr'、COHet、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NHAr'、SO<sub>2</sub>N(Ar')<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NHHetおよび/またはSO<sub>2</sub>N(Het)<sub>2</sub>によって単置換、二置換、三置換もしくは四置換されており、

Hetは、1～4個のN、Oおよび/またはS原子を有し、A、Hal、OH、OA、Ar、OAr、Het'、OHet'、SH、SA、SAr'、SHet'、NH<sub>2</sub>、NHA、NAA'、NHAr'、N(Ar')<sub>2</sub>、NHHet'、N(Het')<sub>2</sub>、NAAr'、NAHet'、SOA、SOAr'、SOHet'、SO<sub>2</sub>A、SO<sub>2</sub>Ar'、SO<sub>2</sub>Het'、NO<sub>2</sub>、CN、COOH、COOA、CONH<sub>2</sub>、CONHA、CONA<sub>2</sub>、NHCOA、NACOA、NHCONH<sub>2</sub>、NHCONHA、NHCONA<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>A、NASO<sub>2</sub>A、CHO、COA、COAr'、COHet'、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NHAr'、SO<sub>2</sub>N(Ar')<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NHHet'またはSO<sub>2</sub>N(Het')<sub>2</sub>、=S、=NR<sup>7</sup>および/または=O(カルボニル酸素)によって単置換、二置換または三置換されていてもよい、単環式または二環式の飽和、不飽和または芳香族複素環を示し、

Ar'は、非置換であるか、またはA、Hal、OH、OA、O-フェニル、SH、SA、NH<sub>2</sub>、NHA、NAA'、NH-フェニル、SOA、SO-フェニル、SO<sub>2</sub>A、SO<sub>2</sub>-フェニル、NO<sub>2</sub>、CN、COOH、COOA、CONH<sub>2</sub>、CONHA、CONA<sub>2</sub>、NHCOA、NACOA、NHCONH<sub>2</sub>、NHCONHA、NHCONA<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>A、NASO<sub>2</sub>A、CHO、COA、CO-フェニル、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NH-フェニルおよび/またはSO<sub>2</sub>N(フェニル)<sub>2</sub>によって単置換、二置換、三置換もしくは四置換されているフェニルを示し、

Het'は、1～4個のN、Oおよび/またはS原子を有し、A、Hal、OH、OA、NH<sub>2</sub>、NHA、NAA'、SOA、SOAr'、SO<sub>2</sub>A、SO<sub>2</sub>Ar'、NO<sub>2</sub>、CN、COOH、COOA、CONH<sub>2</sub>、CONHA、CONA<sub>2</sub>、NHCOA、NACOA、NHCONH<sub>2</sub>、NHCONHA、NHCONA<sub>2</sub>、NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>A、NASO<sub>2</sub>A、CHO、COA、COAr'、SO<sub>3</sub>H、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NHAr'、SO<sub>2</sub>N(Ar')<sub>2</sub>、=S、=NR<sup>7</sup>および/または=O(カルボニル酸素)によって単置換、二置換または三置換されていてもよい、単環式または二環式の飽和、不飽和または芳香族複素環を示し、

Halは、F、Cl、BrまたはIを示す、  
で表される化合物または、それらの薬学的に使用可能な塩または立体異性体、またはすべての比率でのそれらの混合物。

【請求項2】

Rが、Hを示す、  
請求項1に記載の化合物または、それらの薬学的に使用可能な塩または立体異性体、またはすべての比率でのそれらの混合物。

【請求項3】

R'が、HまたはL-Arを示す、  
請求項1または2に記載の化合物または、それらの薬学的に使用可能な塩または立体異性体、またはすべての比率でのそれらの混合物。

【請求項4】

Lが、CR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>またはCR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>CR<sup>9</sup>R<sup>10</sup>を示す、  
請求項1、2または3に記載の化合物または、それらの薬学的に使用可能な塩または立体異性体、またはすべての比率でのそれらの混合物。

【請求項5】

Lが、CH<sub>2</sub>、CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>またはCH(CH<sub>3</sub>)を示す、  
請求項1～4のいずれか一項に記載の化合物または、それらの薬学的に使用可能な塩または立体異性体、またはすべての比率でのそれらの混合物。

【請求項6】

$X^1$ 、 $X^2$ 、 $X^3$ が、各々、互いに独立してH、HalまたはAを示す、  
請求項1～5のいずれか一項に記載の化合物または、それらの薬学的に使用可能な塩または立体異性体、またはすべての比率でのそれらの混合物。

【請求項7】

Aが、1～10個のC原子を有するアルキルを示し、ここで、1～7個のH原子が、Fおよび/またはClによって置き換えられていてもよい、  
請求項1～6のいずれか一項に記載の化合物または、それらの薬学的に使用可能な塩または立体異性体、またはすべての比率でのそれらの混合物。

【請求項8】

Arが、非置換であるか、またはA、Hal、OHおよび/またはOAによって単置換、二置換、三置換もしくは四置換されているフェニルを示す、  
請求項1～7のいずれか一項に記載の化合物または、それらの薬学的に使用可能な塩または立体異性体、またはすべての比率でのそれらの混合物。

【請求項9】

Hetが、1～4個のN、Oおよび/またはS原子を有する単環式の芳香族複素環を示す、  
請求項1～8のいずれか一項に記載の化合物または、それらの薬学的に使用可能な塩または立体異性体、またはすべての比率でのそれらの混合物。

【請求項10】

Hetが、2 - もしくは3 - フリル、2 - もしくは3 - チエニル、1 - 、2 - もしくは3 - ピロリル、1 - 、2 - 、4 - もしくは5 - イミダゾリル、1 - 、3 - 、4 - もしくは5 - ピラゾリル、2 - 、4 - もしくは5 - オキサゾリル、3 - 、4 - もしくは5 - イソキサゾリル、2 - 、4 - もしくは5 - チアゾリル、3 - 、4 - もしくは5 - イソチアゾリル、2 - 、3 - もしくは4 - ピリジル、2 - 、4 - 、5 - もしくは6 - ピリミジニル、1, 2, 3 - トリアゾール - 1 - 、 - 4 - もしくは - 5 - イル、1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - 、 - 3 - もしくは5 - イル、1 - もしくは5 - テトラゾリル、1, 2, 3 - オキサジアゾール - 4 - もしくは - 5 - イル、1, 2, 4 - オキサジアゾール - 3 - もしくは - 5 - イル、1, 3, 4 - チアジアゾール - 2 - もしくは - 5 - イル、1, 2, 4 - チアジアゾール - 3 - もしくは - 5 - イル、1, 2, 3 - チアジアゾール - 4 - もしくは - 5 - イル、3 - もしくは4 - ピリダジニルまたはピラジニルを示す、  
請求項1～9のいずれか一項に記載の化合物または、それらの薬学的に使用可能な塩または立体異性体、またはすべての比率でのそれらの混合物。

【請求項11】

$R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ が、各々、互いに独立してHまたは $R^{11}$ を示す、  
請求項1～10のいずれか一項に記載の化合物または、それらの薬学的に使用可能な塩または立体異性体、またはすべての比率でのそれらの混合物。

【請求項12】

$R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ が、各々、互いに独立してHまたは $CH_3$ を示す、  
請求項1～11のいずれか一項に記載の化合物または、それらの薬学的に使用可能な塩または立体異性体、またはすべての比率でのそれらの混合物。

【請求項13】

Rが、Hを示し、  
 $R^1$ が、HまたはL - Arを示し、  
Yが、N、CHまたは $CR^{11}$ を示し、  
 $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X^3$ が、各々、互いに独立してH、HalまたはAを示し、  
Lが、 $CR^7R^8$ または $CR^7R^8CR^9R^{10}$ を示し、  
 $R^7$ 、 $R^8$ 、 $R^9$ 、 $R^{10}$ が、各々、互いに独立してHまたは $R^{11}$ を示し、  
 $R^{11}$ が、1～6個のC原子を有するアルキルを示し、ここで1～5個のH原子が、Fによって置き換えられていてもよく、  
Aが、1～10個のC原子を有するアルキルを示し、ここで1～7個のH原子が、Fお

よび／またはC lによって置き換えられていてもよく、

A rが、非置換であるか、またはA、H a l、O Hおよび／またはO Aによって単置換、二置換、三置換もしくは四置換されているフェニルを示し、

H a lが、F、C l、B rまたはIを示す、

請求項1～12のいずれか一項に記載の化合物または、それらの薬学的に使用可能な塩または立体異性体、またはすべての比率でのそれらの混合物。

【請求項14】

以下の群

【表1】

番号	構造式および／または名称
"A1"	3-エチル-4-[5-(3-フルオロベンジルアミノ)-1,3,4-オキサジアゾール-2-イル]-2-メチルフェノール
"A2"	3-エチル-4-[5-(3-メトキシベンジルアミノ)-1,3,4-オキサジアゾール-2-イル]-2-メチルフェノール
"A3"	3-エチル-4-{5-[ (R) -1-(3-メトキシフェニル)エチルアミノ]-1,3,4-オキサジアゾール-2-イル}-2-メチルフェノール
"A4"	4-(5-アミノ-1,3,4-オキサジアゾール-2-イル)-3-エチル-2-メチルフェノール
"A5"	6-[5-(3-フルオロベンジルアミノ)-1,3,4-オキサジアゾール-2-イル]ピリジン-3-オール
"A6"	2,3-ジフルオロ-4-[5-(3-フルオロベンジルアミノ)-1,3,4-オキサジアゾール-2-イル]フェノール

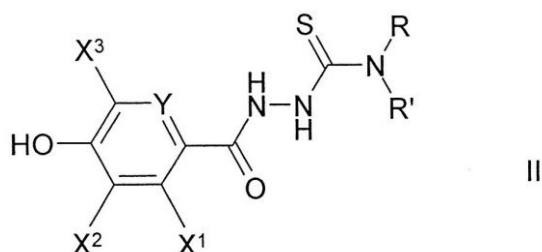
から選択される、請求項1に記載の化合物または、それらの薬学的に使用可能な塩または立体異性体、またはすべての比率でのそれらの混合物。

【請求項15】

請求項1～14のいずれか一項に記載の式Iで表される化合物または、それらの薬学的に使用可能な塩または立体異性体の製造方法であって、

a) 式I I

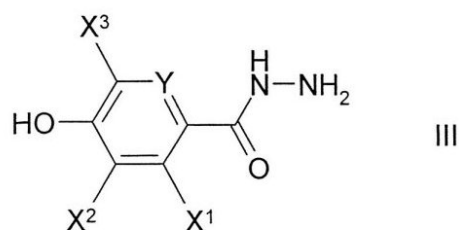
【化2】



式中、X<sup>1</sup>、X<sup>2</sup>、X<sup>3</sup>、R、R'およびYは、請求項1において示した意味を有する、  
で表される化合物を環化すること、  
あるいは、

b) 式 I I I

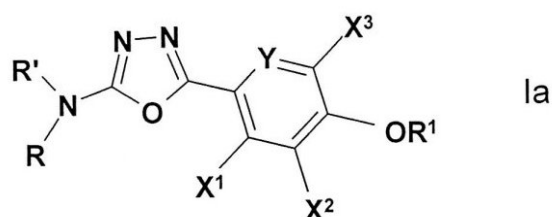
【化 3】



式中、 $X^1$ 、 $X^2$ 、 $X^3$  は、請求項 1 において示した意味を有する、  
で表される化合物を、ハロゲン化シアンと反応させること、  
あるいは、

c) 式 I a

【化 4】



で表され、式中  $R^1$  が 1、2、3 または 4 個の C 原子を有するアルキル基を示す化合物を、  
式 I で表される化合物にエーテル切断によって変換すること、  
かつ / または式 I で表される塩基または酸を、その塩の 1 種に変換すること、  
を特徴とする、前記方法。

【請求項 16】

請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の少なくとも 1 種の化合物および / または、それらの薬学的に使用可能な塩または立体異性体、またはすべての比率でのこれらの混合物、  
ならびに、任意に補形剤および / または補助剤を含む、医薬。

【請求項 17】

請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の化合物、または、それらの薬学的に使用可能な塩および立体異性体、またはすべての比率でのこれらの混合物の、キナーゼシグナル伝達の阻害、調整および / または変調が作用を奏する疾患の処置および / または予防のための医薬の製造のための使用。

【請求項 18】

キナーゼが SGK である、請求項 17 に記載の使用。

【請求項 19】

請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の化合物、または、それらの薬学的に使用可能な塩または立体異性体、またはすべての比率でのこれらの混合物の、請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の化合物による SGK の阻害により影響される疾患の処置のための医薬の製造のための、請求項 18 に記載の使用。

【請求項 20】

請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の化合物、または、これらの薬学的に使用可能な誘導体、溶媒和物または立体異性体、またはすべての比率でのこれらの混合物の、糖尿病、肥満、メタボリックシンドローム（異脂肪血症）、全身および肺高血圧症、心血管疾患および腎疾患、一般的にすべてのタイプの線維症および炎症プロセスにおけるもの、癌、腫瘍細胞、腫瘍転移、凝固障害、神経興奮性、緑内障、白内障、細菌感染の処置または予防のための、ならびに感染防止療法における、学習能力および注意力を増大させるための、ならびに細胞老化およびストレスの処置および予防、ならびに耳鳴の処置のための医薬

の製造のための、請求項 19 に記載の使用。

【請求項 21】

糖尿病が、真性糖尿病、糖尿病性腎症、糖尿病性神経障害、糖尿病性血管障害および微小血管障害である、請求項 20 に記載の使用。

【請求項 22】

心血管疾患が、心筋梗塞の後の心臓性線維症、心臓肥大、心不全および動脈硬化である、請求項 20 に記載の使用。

【請求項 23】

腎疾患が、糸球体硬化症、腎硬化症、腎炎、腎症および電解質排泄障害である、請求項 20 に記載の使用。

【請求項 24】

線維症および炎症プロセスが、肝硬変、肺線維症、線維性肺炎、リウマチおよび関節症、クローン病、慢性気管支炎、放射線線維症、硬化性皮膚炎、嚢胞性線維症、瘢痕およびアルツハイマー病である、請求項 20 に記載の使用。

【請求項 25】

請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の少なくとも 1 種の化合物および / または、これらの薬学的に使用可能な誘導体、溶媒和物 または立体異性体、またはすべての比率でのこれらの混合物、ならびに少なくとも 1 種の他の医薬活性成分を含む、医薬。

【請求項 26】

( a ) 有効量の請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の化合物および / または、これらの薬学的に使用可能な誘導体、溶媒和物 または立体異性体、またはすべての比率でのこれらの混合物、ならびに

( b ) 有効量の他の医薬活性成分  
の個別のパックからなる、セット (キット)。