

【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 17 年 12 月 22 日 (2005.12.22)

【公表番号】特表 2005-518363(P2005-518363A)

【公表日】平成 17 年 6 月 23 日 (2005.6.23)

【年通号数】公開・登録公報 2005-024

【出願番号】特願 2003-546888(P2003-546888)

【国際特許分類第 7 版】

C 07 D 277/82

A 61 K 31/5377

A 61 P 9/00

A 61 P 9/04

A 61 P 9/10

A 61 P 11/00

A 61 P 11/06

A 61 P 21/02

A 61 P 25/00

A 61 P 25/02

A 61 P 25/08

A 61 P 25/14

A 61 P 25/16

A 61 P 25/18

A 61 P 25/20

A 61 P 25/22

A 61 P 25/24

A 61 P 25/28

A 61 P 25/36

A 61 P 29/00

A 61 P 37/08

A 61 P 43/00

C 07 D 417/12

【F I】

C 07 D 277/82 C S P

A 61 K 31/5377

A 61 P 9/00

A 61 P 9/04

A 61 P 9/10

A 61 P 11/00

A 61 P 11/06

A 61 P 21/02

A 61 P 25/00

A 61 P 25/02 1 0 1

A 61 P 25/08

A 61 P 25/14

A 61 P 25/16

A 61 P 25/18

A 61 P 25/20

A 61 P 25/22

A 61 P 25/24

A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 25/36
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 37/08
 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16年7月15日(2004.7.15)

【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

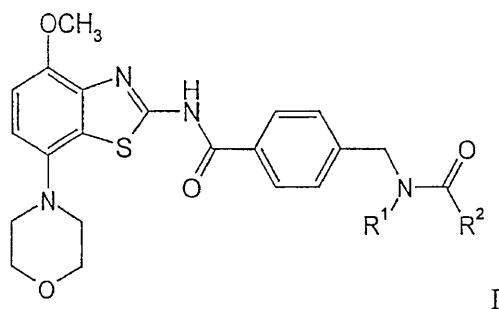
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(I)：

【化1】



〔式中、

 R^1 は、水素又は低級アルキルであり； R^2 は、低級アルキル、 $-(CH_2)_n-O-$ 低級アルキル、 C_{3-6} -シクロアルキル又は $-(CH_2)_n-NR_2$ であり； R は、(R_2 の場合は相互に独立に)水素、低級アルキル又は $-(CH_2)_n-O-$ 低級アルキルであるか、あるいは R_2 は、N原子と一緒にピロリジン環を形成してもよく； n は、1、2又は3である〕で示される化合物、及び薬剤学的に許容しうるその酸付加塩。

【請求項2】

 R^2 が、 $-(CH_2)_n-O-$ 低級アルキルであり、そして R^1 が、水素又は低級アルキルである、請求項1記載の式(I)の化合物。

【請求項3】

化合物が、4-〔(2-メトキシ-アセチルアミノ)-メチル〕-N-(4-メトキシ-7-モルホリン-4-イル-ベンゾチアゾール-2-イル)-ベンズアミド、又は4-〔(メトキシアセチル-メチル-アミノ)-メチル〕-N-(4-メトキシ-7-モルホリン-4-イル-ベンゾチアゾール-2-イル)-ベンズアミドである、請求項2記載の式(I)の化合物。

【請求項4】

 R^2 が、 C_{3-6} -シクロアルキルであり、そして R^1 が、水素又は低級アルキルである、請求項1記載の化合物。

【請求項5】

化合物が、4 - [(シクロプロパンカルボニル - アミノ) - メチル] - N - (4 - メトキシ - 7 - モルホリン - 4 - イル - ベンゾチアゾール - 2 - イル) - ベンズアミド、
 4 - [(シクロブタンカルボニル - アミノ) - メチル] - N - (4 - メトキシ - 7 - モルホリン - 4 - イル - ベンゾチアゾール - 2 - イル) - ベンズアミド、
 4 - [(シクロプロパンカルボニル - メチル - アミノ) - メチル] - N - (4 - メトキシ - 7 - モルホリン - 4 - イル - ベンゾチアゾール - 2 - イル) - ベンズアミド、又は
 4 - [(シクロブタンカルボニル - メチル - アミノ) - メチル] - N - (4 - メトキシ - 7 - モルホリン - 4 - イル - ベンゾチアゾール - 2 - イル) - ベンズアミドである、請求項 4 記載の化合物。

【請求項 6】

R^2 が、低級アルキルであり、そして R^1 が、水素又は低級アルキルである、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 7】

化合物が、N - (4 - メトキシ - 7 - モルホリン - 4 - イル - ベンゾチアゾール - 2 - イル) - 4 - [(メチル - プロピオニル - アミノ) - メチル] - ベンズアミド、
 N - (4 - メトキシ - 7 - モルホリン - 4 - イル - ベンゾチアゾール - 2 - イル) - 4 - (プロピオニルアミノ - メチル) - ベンズアミド、
 4 - [(アセチル - メチル - アミノ) - メチル] - N - (4 - メトキシ - 7 - モルホリン - 4 - イル - ベンゾチアゾール - 2 - イル) - ベンズアミド、
 4 - (アセチルアミノ - メチル) - N - (4 - メトキシ - 7 - モルホリン - 4 - イル - ベンゾチアゾール - 2 - イル) - ベンズアミド、又は
 4 - [(エチル - プロピオニル - アミノ) - メチル] - N - (4 - メトキシ - 7 - モルホリン - 4 - イル - ベンゾチアゾール - 2 - イル) - ベンズアミドである、請求項 6 記載の化合物。

【請求項 8】

R^2 が、 $-(CH_2)_n - NR_2$ であり、そして R^1 が、低級アルキルである、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 9】

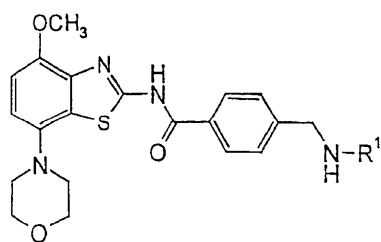
化合物が、4 - [(ジメチルアミノアセチル - メチル - アミノ) - メチル] - N - (4 - メトキシ - 7 - モルホリン - 4 - イル - ベンゾチアゾール - 2 - イル) - ベンズアミド、又は
 N - (4 - メトキシ - 7 - モルホリン - 4 - イル - ベンゾチアゾール - 2 - イル) - 4 - { [メチル - (ピロリジン - 1 - イル - アセチル) - アミノ] - メチル} - ベンズアミドである、請求項 8 記載の化合物。

【請求項 10】

請求項 1 ~ 9 記載の式 (I) の化合物の製造方法であって、

a) 式 (2) :

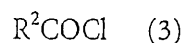
【化 2】



(2)

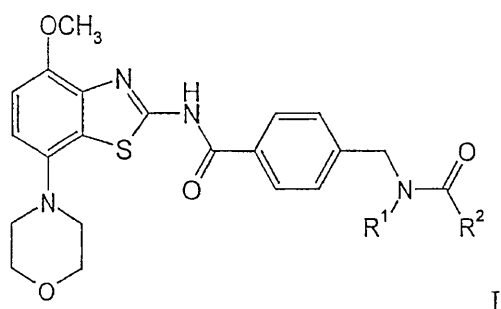
で示される化合物を、式 (3) :

【化 3】



で示される化合物と反応させることにより、式 (I) :

【化 4】



〔式中、 R^1 及び R^2 は、請求項1と同義である〕で示される化合物にすること、及び所望であれば、得られる化合物を薬剤学的に許容しうる酸付加塩に変換することを経とする方法。

【請求項 1 1】

請求項 1 0 記載の方法又は同等の方法により製造された、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 1 2】

請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項記載の 1 つ以上の化合物と薬剤学的に許容しうる賦形剤とを含む医薬。

【請求項 1 3】

アデノシン受容体に関連する疾患の処置用の、請求項 1 2 記載の医薬。

【請求項 1 4】

アデノシン A_{2A} 受容体に関連する疾患の処置用の対応する医薬の製造のための、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項記載の化合物の使用。