

【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19年10月11日(2007.10.11)

【公表番号】特表2007-505085(P2007-505085A)
 【公表日】平成19年3月8日(2007.3.8)
 【年通号数】公開・登録公報2007-009
 【出願番号】特願2006-525833(P2006-525833)
 【国際特許分類】

C 0 7 D 403/06 (2006.01)
C 0 7 D 403/14 (2006.01)
A 6 1 K 31/506 (2006.01)
C 0 7 D 401/14 (2006.01)
C 0 7 D 405/14 (2006.01)
C 0 7 D 417/14 (2006.01)
C 0 7 D 498/08 (2006.01)
A 6 1 K 31/5386 (2006.01)
C 0 7 D 413/14 (2006.01)
A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
A 6 1 K 31/541 (2006.01)
A 6 1 P 3/10 (2006.01)
A 6 1 P 3/04 (2006.01)
A 6 1 P 15/00 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)

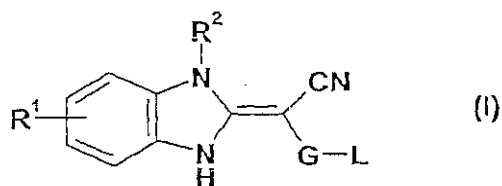
【F I】

C 0 7 D 403/06
 C 0 7 D 403/14 C S P
 A 6 1 K 31/506
 C 0 7 D 401/14
 C 0 7 D 405/14
 C 0 7 D 417/14
 C 0 7 D 498/08
 A 6 1 K 31/5386
 C 0 7 D 413/14
 A 6 1 K 31/5377
 A 6 1 K 31/541
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 3/04
 A 6 1 P 15/00
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】
 【提出日】平成19年8月27日(2007.8.27)
 【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】

式(1)のベンゾイミダゾールアセトニトリル：

【化 1】



又はその互変異性体、その幾何異性体、エナンチオマー、ジアステレオマーもしくはそのラセミ体としてのその光学活性型、又はそれらの医薬として許容され得る塩：

(式中、Gは、ピリジニルであり；

Lは、アミノ基、もしくはN、O、Sから選択された少なくとも1個のヘテロ原子を含む、3-8員のヘテロシクロアルキルであるか、又はLは、アシルアミノ部分であり；

R¹は、水素、スルホニル、アミノ、カルボキシ、アミノカルボニル、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル又はC₁-C₆-アルコキシ、アリール、ハロゲン、シアノ又はヒドロキシを含む又はからなる群より選択され；

R²は、水素、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル又はC₁-C₆-アルコキシを含む又はからなる群より選択される)。

【請求項 2】

前記R¹が、H又はC₁-C₃アルキルである、請求項1に記載のベンゾイミダゾールアセトニトリル。

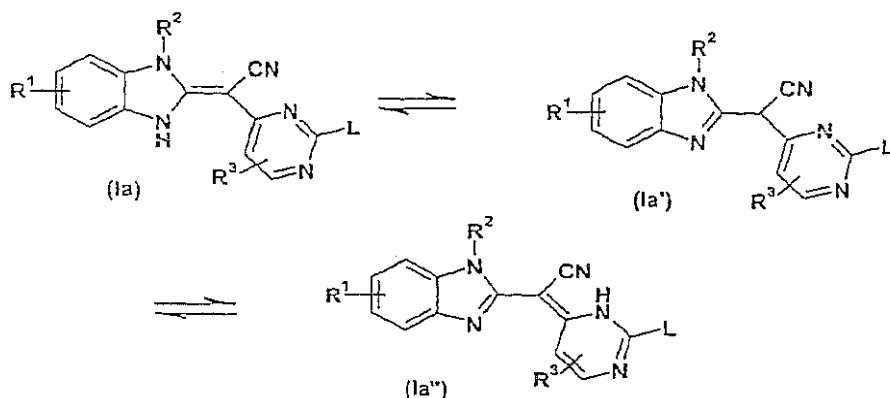
【請求項 3】

前記R²が、C₁-C₃アルキルである、請求項1又は2に記載のベンゾイミダゾールアセトニトリル。

【請求項 4】

下記のいずれかの式を有する、請求項1～3のいずれか1項に記載のベンゾイミダゾールアセトニトリル：

【化 2】



(式中、R¹は、先に定義したものであり；及び

R³は、水素、C₁-C₆-アルキル、C₂-C₆-アルケニル、C₂-C₆-アルキニル又はC₁-C₆-アルコキシを含む又はからなる群より選択され；

Lは、式-NR⁵R⁶のアミノ基であり、ここでR⁵及びR⁶は、各々互いに独立してH、C₁-C₆-アル

キル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、飽和又は不飽和の3-8-員のシクロアルキル、3-8-員のヘテロシクロアルキル、 C_1-C_6 -アルキルアリール、 C_1-C_6 -アルキルヘテロアリール、 C_1-C_6 -アルケニルアリール、 C_1-C_6 -アルケニルヘテロアリール、 C_1-C_6 -アルキニルアリール、 C_1-C_6 -アルキニルヘテロアリール、 C_1-C_6 -アルキルシクロアルキル、 C_1-C_6 -アルキルヘテロシクロアルキル、 C_1-C_6 -アルケニルシクロアルキル、 C_1-C_6 -アルケニルヘテロシクロアルキル、 C_1-C_6 -アルキニルシクロアルキル、 C_1-C_6 -アルキニルヘテロシクロアルキル、又は R^5 及び R^6 は、それらが結合した窒素と一緒に環を形成しても良い)。

【請求項5】

前記 R^5 は、水素又はメチルもしくはエチルもしくはプロピル基であり、及び R^6 は、H、(C_1-C_{10})-アルキル、 C_1-C_6 アルキル-アリール、 C_1-C_6 -アルキル-ヘテロアリール、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール又はヘテロアリール、及び4-8員の飽和又は不飽和のシクロアルキルからなる群より選択される、請求項1~4のいずれか1項に記載のベンゾイミダゾールアセトニトリル。

【請求項6】

前記 R^5 は、Hであり、及び R^6 は、(C_1-C_6)-アルキル、3-8員のシクロアルキル、3-8員のヘテロシクロアルキル、ヘテロアリール、 C_1-C_6 -アルキル-ヘテロアリール、 C_1-C_6 アルキル-シクロアルキル、 C_1-C_6 アルキル-ヘテロシクロアルキルからなる群より選択される、請求項1~5のいずれか1項に記載のベンゾイミダゾールアセトニトリル。

【請求項7】

前記Lは、式- $NR^5C(O)R^6$ のアシルアミノ部分であり、ここで R^5 及び R^6 は、各々互いに独立してH、 C_1-C_6 -アルキル、 C_2-C_6 -アルケニル、 C_2-C_6 -アルキニル、 C_1-C_6 -アルコキシ、アリール、ヘテロアリール、飽和又は不飽和の3-8-員のシクロアルキル、3-8-員のヘテロシクロアルキル、 C_1-C_6 -アルキルアリール、 C_1-C_6 -アルキルヘテロアリール、 C_1-C_6 -アルケニルアリール、 C_1-C_6 -アルケニルヘテロアリール、 C_1-C_6 -アルキニルアリール、 C_1-C_6 -アルキニルヘテロアリール、 C_1-C_6 -アルキルシクロアルキル、 C_1-C_6 -アルキルヘテロシクロアルキル、 C_1-C_6 -アルケニルシクロアルキル、 C_1-C_6 -アルケニルヘテロシクロアルキル、 C_1-C_6 -アルキニルシクロアルキル、 C_1-C_6 -アルキニルヘテロシクロアルキルである、請求項1~3のいずれか1項に記載のベンゾイミダゾールアセトニトリル。

【請求項8】

下記からなる群より選択される、請求項1~7のいずれか1項に記載のベンゾイミダゾールアセトニトリル：

(2Z)-(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)(2-{[3-(1H-ピラゾール-1-イル)プロピル]アミノ}ピリミジン-4-イル)アセトニトリル

(2Z)-(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)(5-メチル-2-{[3-(1H-ピラゾール-1-イル)プロピル]アミノ}ピリミジン-4-イル)アセトニトリル

(2Z)-[2-(シクロブチルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イル](1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)アセトニトリル

(2Z)-(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)(5-メチル-2-{[3-(2-オキソピロリジン-1-イル)プロピル]アミノ}ピリミジン-4-イル)アセトニトリル

(2Z)-(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)(2-{[3-(2-オキソピロリジン-1-イル)プロピル]アミノ}ピリミジン-4-イル)アセトニトリル

(2Z)-(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)(2-{[3-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロピル]アミノ}ピリミジン-4-イル)アセトニトリル

(2Z)-(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)(5-メチル-2-{[3-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)プロピル]アミノ}ピリミジン-4-イル)アセトニトリル

[2-(シクロペンチルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イル](1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)アセトニトリル

(2Z)-(2-{[3-(2-オキソピロリジン-1-イル)プロピル]アミノ}ピリミジン-4-イル)(1-プロピル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)アセトニトリル

(1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル) { 5-メチル-2-[(2-ピリジン-3-イルエチル)アミノ]ピリミジン-4-イル } アセトニトリル

(2Z)-[2-(シクロブチルアミノ)ピリミジン-4-イル](1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)アセトニトリル

(2Z)-[2-(シクロヘプチルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イル](1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)アセトニトリル

[2-(シクロペンチルアミノ)ピリミジン-4-イル](1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)アセトニトリル

1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン(5-メチル-2-{ [3-(2-オキソピロリジン-1-イル)プロピル]アミノ } ピリミジン-4-イル)アセトニトリル

(2Z)-(1-シクロブチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)(2-{ [3-(2-オキソピロリジン-1-イル)プロピル]アミノ } ピリミジン-4-イル)アセトニトリル

(1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル) { 2-[(2-ピリジン-3-イルエチル)アミノ]ピリミジン-4-イル } アセトニトリル

(2Z)-(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)[2-(イソブチルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イル]アセトニトリル

(2Z)-(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)(2-{ [2-(1H-イミダゾール-4-イル)エチル]アミノ } ピリミジン-4-イル)アセトニトリル

(2Z)-(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)[2-(イソブチルアミノ)ピリミジン-4-イル]アセトニトリル

[2-(シクロプロピルアミノ)ピリミジン-4-イル](1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)アセトニトリル

[2-({ 2-[6-(ジメチルアミノ)ピリジン-3-イル]エチル } アミノ)ピリミジン-4-イル](1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)アセトニトリル

(1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)(2-{ [2-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)エチル]アミノ } ピリミジン-4-イル)アセトニトリル

(2Z)-(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)(2-{ [2-(1H-イミダゾール-4-イル)エチル]アミノ } -5-メチルピリミジン-4-イル)アセトニトリル

[2-({ 2-[6-(ジメチルアミノ)ピリジン-3-イル]エチル } アミノ)-5-メチルピリミジン-4-イル](1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)アセトニトリル

(2Z)-[2-(シクロヘプチルアミノ)ピリミジン-4-イル](1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)アセトニトリル

[2-(シクロプロピルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イル](1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)アセトニトリル

(1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル) { 2-[(2-ピリジン-2-イルエチル)アミノ]ピリミジン-4-イル } アセトニトリル

[2-(シクロペンチルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イル](1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)アセトニトリル

[2-(シクロヘキシルアミノ)ピリミジン-4-イル](1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)アセトニトリル

(2Z)-(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)(2-{ [2-(1H-インドール-3-イル)エチル]アミノ } -5-メチルピリミジン-4-イル)アセトニトリル

(1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル) { 5-メチル-2-[(2-ピリジン-2-イルエチル)アミノ]ピリミジン-4-イル } アセトニトリル

{ 2-[(2-エトキシエチル)アミノ]ピリミジン-4-イル } (1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)アセトニトリル

(1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル) { 5-メチル-2-[(1-メチルブチル)アミノ]ピリミジン-4-イル } アセトニトリル

(1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)[2-(メチルアミノ)ピリミジン-4-イル]アセトニトリル

(1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)(5-メチル-2-{[2-(1H-ピラゾール-1-イル)エチル]アミノ}ピリミジン-4-イル)アセトニトリル
 1H-ベンゾイミダゾール-2-イル{5-メチル-2-[(2-ピリジン-3-イルエチル)アミノ]ピリミジン-4-イル}アセトニトリル
 (2Z)-(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)(2-{[2-(1H-イミダゾール-1-イル)エチル]アミノ}-5-メチルピリミジン-4-イル)アセトニトリル
 1H-ベンゾイミダゾール-2-イル{2-[(2-ピリジン-3-イルエチル)アミノ]ピリミジン-4-イル}アセトニトリル
 (1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル){2-[(1-メチルブチル)アミノ]ピリミジン-4-イル}アセトニトリル
 {2-[(シクロヘキシルメチル)アミノ]-5-メチルピリミジン-4-イル}(1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)アセトニトリル
 1H-ベンゾイミダゾール-2-イル[2-(シクロペンチルアミノ)ピリミジン-4-イル]アセトニトリル
 (1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル){6-メチル-2-[(2-ピリジン-3-イルエチル)アミノ]ピリミジン-4-イル}アセトニトリル
 1H-ベンゾイミダゾール-2-イル[2-(シクロプロピルアミノ)ピリミジン-4-イル]アセトニトリル
 [2-(シクロペンチルアミノ)-6-メチルピリミジン-4-イル](1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)アセトニトリル
 {2-[(シクロヘキシルメチル)アミノ]ピリミジン-4-イル}(1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)アセトニトリル
 (1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル){6-[(2-ピリジン-3-イルエチル)アミノ]ピリミジン-4-イル}アセトニトリル
 (1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル){2-[(3-ピロリジン-1-イルプロピル)アミノ]ピリミジン-4-イル}アセトニトリル
 (1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル)[2-(4-エチルピペラジン-1-イル)-5-メチルピリミジン-4-イル]アセトニトリル
 (1-エチル-1H-ベンゾイミダゾール-2-イル){2-[(2-フリルメチル)アミノ]-5-メチルピリミジン-4-イル}アセトニトリル
 (2Z)-(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン){5-メチル-2-[(1-メチルピペリジン-4-イル)アミノ]ピリミジン-4-イル}アセトニトリル
 (2Z)-[2-(シクロヘキシルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イル](1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)アセトニトリル
 (2Z)-[2-(エチルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イル](1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)アセトニトリル
 [2-(シクロペンチルアミノ)-5-メチルピリミジン-4-イル](1,3-ジエチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)アセトニトリル
 (2Z)-(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)[5-メチル-2-(ピペリジン-4-イルアミノ)ピリミジン-4-イル]アセトニトリル
 (2Z)-(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン){5-メチル-2-[(2-ピペリジン-1-イルエチル)アミノ]ピリミジン-4-イル}アセトニトリル
 N-{4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル}-4-(4-メチルピペラジン-1-イル)-4-オキソブタンアミド
 N-{4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]ピリミジン-2-イル}-4-(4-メチルピペラジン-1-イル)-4-オキソブタンアミド
 (1R,5R,7R)-N-{4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル}-6,8-ジオキサ-3-アザビシクロ[3.2.1]オクタン-7-カルボキシアミド
 (1S,5S,7S)-N-{4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリ

デン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル}-6,8-ジオキサ-3-アザピシクロ[3.2.1]オクタン-7-カルボキシアミド
 (1S,4S,5S,7R)-N-{4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル}-4-メチル-6,8-ジオキサ-3-アザピシクロ[3.2.1]オクタン-7-カルボキシアミド
 (1S,4R,5S,7R)-N-{4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル}-4-メチル-6,8-ジオキサ-3-アザピシクロ[3.2.1]オクタン-7-カルボキシアミド
 N-{4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル}ピペラジン-2-カルボキシアミド
 (4S)-N-{4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル}-1,3-チアゾリジン-4-カルボキシアミド
 (4R)-N-{4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル}-1,3-チアゾリジン-4-カルボキシアミド
 N-{4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル}-5-オキソ-L-プロリンアミド
 4-tert-ブチル 1-(9H-フルオレン-9-イルメチル)2-[({ 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル} アミノ)カルボニル]ピペラジン-1,4-ジカルボキシラート
 tert-ブチル(4S)-4-[({ 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル} アミノ)カルボニル]-1,3-チアゾリジン-3-カルボキシラート
 tert-ブチル(2S)-2-[({ 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル} アミノ)カルボニル]-5-オキソピロリジン-1-カルボキシラート
 tert-ブチル(4R)-4-[({ 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル} アミノ)カルボニル]-1,3-チアゾリジン-3-カルボキシラート
 2-(1-アセチルピペリジン-4-イル)-N-{4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル}アセトアミド
 N-{4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル}-4-メチルモルホリン-2-カルボキシアミド
 4-アセチル-N-{4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル}モルホリン-2-カルボキシアミド
 N-{4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル}-4-[(4-メチルピペラジン-1-イル)メチル]ベンズアミド
 tert-ブチル3-[({ 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル} アミノ)カルボニル]ピペリジン-1-カルボキシラート
 tert-ブチル4-[2-({ 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル} アミノ)-2-オキソエチル]ピペリジン-1-カルボキシラート
 N-{4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル}モルホリン-2-カルボキシアミド
 N-{4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル}-2-ピペリジン-4-イルアセトアミド
 N-4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル}ピペリジン-3-カルボキシアミド
 tert-ブチル2-[({ 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル} アミノ)カルボニル]モルホリン-4-カルボキ

シラート

N-[3-({ 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル } アミノ)-3-オキソプロピル]ベンズアミド
 tert-ブチル[2-({ 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル } アミノ)-2-オキソエチル]メチルカルバメート

N- { 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル } -1-メチルピペリジン-3-カルボキシアミド
 N~1~- { 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル } -N~2~-メチルグリシンアミド

N- { 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル } ピロリジン-3-カルボキシアミド
 tert-ブチル3-[({ 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル } アミノ)カルボニル]ピロリジン-1-カルボキシラート

(2S)-N- { 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル } -2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-2-カルボキシアミド
 tert-ブチル(2S)-2-[({ 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル } アミノ)カルボニル]-2,5-ジヒドロ-1H-ピロール-1-カルボキシラート

N- { 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル } -2-(2-メトキシフェニル)アセトアミド
 1-アセチル-N- { 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル } ピペリジン-4-カルボキシアミド

N-4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル } -1-メチルピペリジン-4-カルボキシアミド
 4-アミノ-N- { 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル } ブタンアミド

tert-ブチル4-[({ 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル } アミノ)カルボニル]ピペリジン-1-カルボキシラート

N- { 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル } ピペリジン-4-カルボキシアミド
 tert-ブチル[4-({ 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル } アミノ)-4-オキソブチル]カルバメート

N- { 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル } シクロペンタンカルボキシアミド
 N-4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル } -4-(4-メチルピペラジン-1-イル)ブタンアミド

N~1~- { 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル } -N~3~, N3~3~-ジメチル-アラニンアミド
 N- { 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル } -4-(ジメチルアミノ)ブタンアミド

(2Z)-(2-アミノ-5-メチルピリミジン-4-イル)(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)アセトニトリル

N- { 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル } -2-モルホリン-4-イルアセトアミド
 N~2~-ベンジル-N~1~- { 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル } グリシンアミド

N- { 4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)メチル]

-5-メチルピリミジン-2-イル}-2-(1,1-ジオキシドチオモルホリン-4-イル)アセトアミド
 N~1~-{4-[(Z)-シアノ(1-エチル-1,3-ジヒドロ-2H-ベンゾイミダゾール-2-イリデン)
 メチル]-5-メチルピリミジン-2-イル}-N~2~-ホルミルグリシンアミド。

【請求項 9】

医薬品として使用するための、請求項1~8のいずれか1項に記載のベンゾイミダゾールアセトニトリル。

【請求項 10】

II型糖尿病、不適当な耐糖能、インスリン抵抗性、肥満、多嚢胞性卵巣症候群(PCOS)を含む、インスリン抵抗性又は高血糖症により媒介される代謝障害を予防及び/又は治療するための医薬品の調製における、請求項1~8のいずれか1項に記載のベンゾイミダゾールアセトニトリルの使用。

【請求項 11】

前記疾患が、II型糖尿病である、請求項9に記載のベンゾイミダゾールアセトニトリルの使用。

【請求項 12】

請求項1~8のいずれか1項に記載のベンゾイミダゾールアセトニトリル及びそれらの医薬品として許容され得る担体、希釈剤又は賦形剤を含有する、医薬組成物。

【請求項 13】

インスリン、アルドースレダクターゼ阻害剤、 α -グルコシダーゼ阻害剤、スルホニル尿素剤、ピグアニド、チアゾリジン、PPARアゴニスト、GSK-3阻害剤からなる群より選択される少なくとも1種の補助薬を更に含有する、請求項12に記載の組成物。

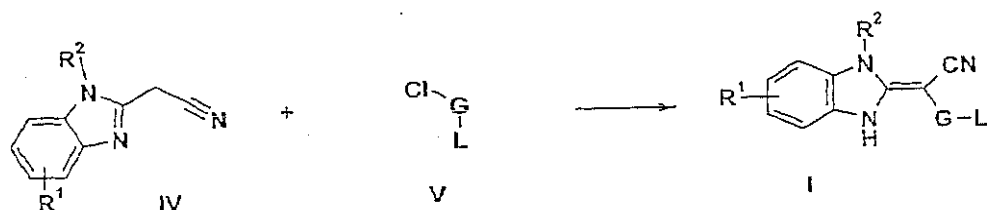
【請求項 14】

前記補助薬が、即効性インスリン、中間作用性インスリン、長期作用性インスリン、中間作用性及び即効性インスリンの組合せ、ミナルレスタット(Minalrestat)、トルレスタット(Tolrestat)、ソルビニル(Sorbinil)、メトソルビニル(Methosorbinil)、ゾポルレスタット(Zopolrestat)、エパルレスタット(Epalrestat)、ゼナレスタット(Zenarestat)、イミレスタット(Imirestat)、ポナルレスタット(Ponalrestat)、ONO-2235、GP-1447、CT-112、BAL-ARI 8、AD-5467、ZD5522、M-16209、NZ-314、M-79175、SPR-210、ADN 138、又はSNK-860、ミグリトール、アカルボース、グリピザイド、グリブリド、クロルプロパミド、トルブタミド、トラザミド、又はグリメピリドから成る群から選定される、請求項13に記載の組成物。

【請求項 15】

下記工程

【化 3】

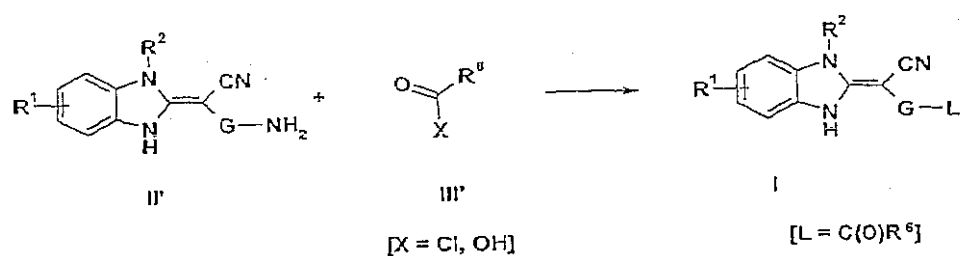


を含む、請求項1~8のいずれか1項に記載の式(I)のベンゾイミダゾールアセトニトリルの調製方法(式中、R¹、R²、G、Lは請求項1~8に記載の通りである)。

【請求項 16】

下記工程

【化 4】

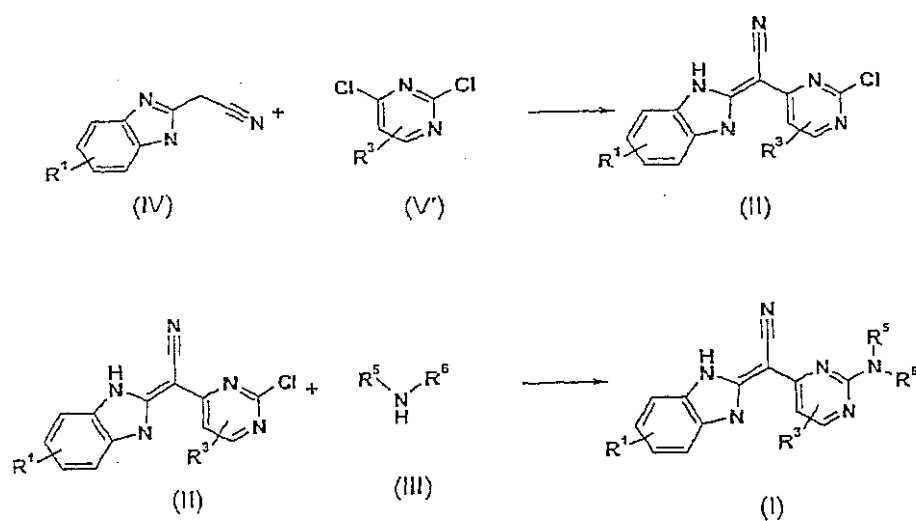


を含む、請求項1～8のいずれか1項に記載の式(I)のベンゾイミダゾールアセトニトリルの調製方法。

【請求項 17】

下記工程

【化 5】

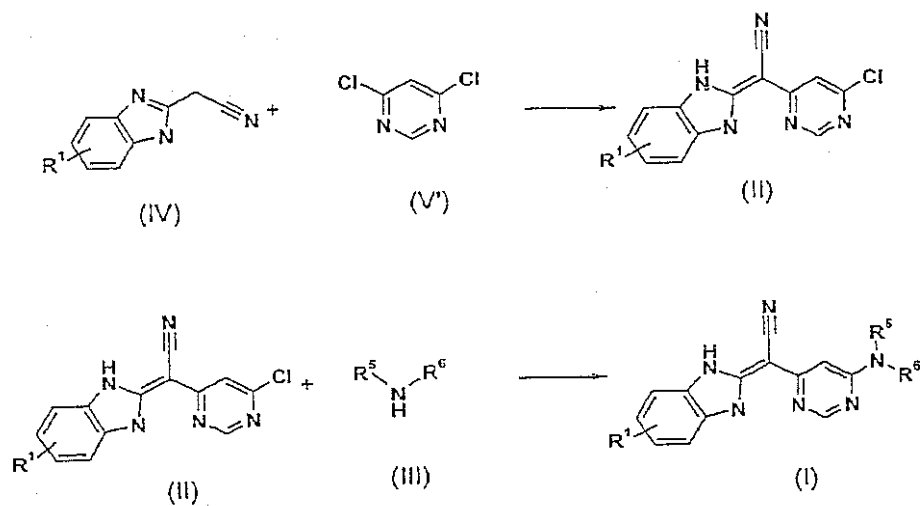


を含む、請求項15又は16に記載の方法(式中、R¹、R³、及びR⁴は請求項1～8に記載の通りである)。

【請求項 18】

下記工程

【化 6】



を含む、請求項15に記載の方法(式中、 R^1 、 R^3 、及び R^4 は請求項1～8に記載の通りである)。

【請求項 19】

1,3-ベンゾイミダゾール-2(3H)-イリデン(2-クロロ-6-メチルピリミジン-4-イル)アセトニトリル

1,3-ベンゾイミダゾール-2(3H)-イリデン(2-クロロ-6-メチルピリミジン-4-イル)アセトニトリル

1,3-ベンゾイミダゾール-2(3H)-イリデン(6-クロロピリミジン-4-イル)アセトニトリル：
からなる群より選択される、式(II)の中間体化合物。