

【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22年8月19日(2010.8.19)

【公表番号】特表2009-527496(P2009-527496A)

【公表日】平成21年7月30日(2009.7.30)

【年通号数】公開・登録公報2009-030

【出願番号】特願2008-555516(P2008-555516)

【国際特許分類】

C 07 D 401/12	(2006.01)
C 07 D 417/12	(2006.01)
A 61 K 31/5415	(2006.01)
C 07 D 413/12	(2006.01)
A 61 K 31/538	(2006.01)
C 07 D 413/14	(2006.01)
A 61 K 31/506	(2006.01)
C 07 D 498/04	(2006.01)
A 61 P 37/08	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 1/04	(2006.01)
A 61 P 37/06	(2006.01)

【F I】

C 07 D 401/12	
C 07 D 417/12	C S P
A 61 K 31/5415	
C 07 D 413/12	
A 61 K 31/538	
C 07 D 413/14	
A 61 K 31/506	
C 07 D 498/04	1 1 2 T
A 61 P 37/08	
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 P 29/00	
A 61 P 1/04	
A 61 P 37/06	

【手続補正書】

【提出日】平成22年7月2日(2010.7.2)

【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

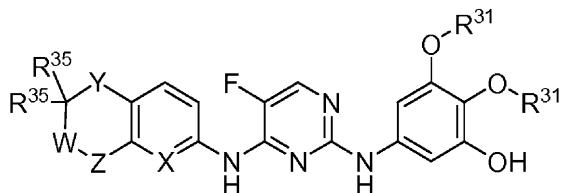
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式1の化合物、またはその立体異性体、塩、もしくはN-オキシド：



式中、Yは、S、O、SO、SO<sub>2</sub>、およびC(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>からなる群より選択され；

個々のR<sup>35</sup>は独立に、水素、(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル、およびハロからなる群より選択されるか、または両方のR<sup>35</sup>は、これらが結合する炭素とともにカルボニル基を形成し；

Wは、C=O、C=S、C=NH、C(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>、およびNR<sup>37</sup>からなる群より選択され；

Zは、C=OまたはNR<sup>37</sup>であり、ZおよびWの両方ともがNR<sup>37</sup>である訳ではないならば、ならびにZがC=Oならば、WはC(R<sup>7</sup>)<sub>2</sub>またはNR<sup>37</sup>であり；

Xは、CHまたはNであり；

個々のR<sup>31</sup>は独立に(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルであるか、または両方のR<sup>31</sup>はともに、任意で1~2個の(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキル基で置換されるか、または1個の(C<sub>3</sub>-C<sub>7</sub>)スピロシクロアルキル基で置換される(C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>)アルキレノ基を形成し；

個々のR<sup>7</sup>は独立に、水素または(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルキルであり；ならびに

R<sup>37</sup>は、水素または任意でフェニルまたはピリジルで置換されるメチルであり、該フェニルまたはピリジルは任意で(C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>)アルコキシで置換される。

#### 【請求項2】

YがOまたはSである、請求項1記載の化合物。

#### 【請求項3】

YがOである、請求項2記載の化合物。

#### 【請求項4】

両方のR<sup>35</sup>が同じである、請求項1記載の化合物。

#### 【請求項5】

両方のR<sup>35</sup>がメチルである、請求項4記載の化合物。

#### 【請求項6】

WがC=OまたはC=Sである、請求項1記載の化合物。

#### 【請求項7】

WがC=Oである、請求項6記載の化合物。

#### 【請求項8】

ZがNR<sup>37</sup>である、請求項1記載の化合物。

#### 【請求項9】

ZがNHである、請求項8記載の化合物。

#### 【請求項10】

XがNである、請求項1記載の化合物。

#### 【請求項11】

R<sup>31</sup>がメチルである、請求項1記載の化合物。

#### 【請求項12】

ZがNR<sup>37</sup>であり、かつR<sup>37</sup>がメチル、2-ピリジルメチル、または4-メトキシベンジルである、請求項1記載の化合物。

#### 【請求項13】

以下からなる群より選択されるか、またはその立体異性体、塩、もしくはN-オキシドである、請求項1記載の化合物：

5-フルオロ-N2-(3-ヒドロキシ-4,5-ジメトキシフェニル)-N4-[3-オキソ-ベンゾ[1,4]チアジン-6-イル]-2,4-ピリミジンジアミン；

N4-[2,2-ジメチル-3-オキソ-ベンゾ[1,4]チアジン-6-イル]-5-フルオロ-N2-(3-ヒドロキシ-4,5-ジメトキシフェニル)-2,4-ピリミジンジアミン；

N4-[2,2-ジメチル-3-オキソ-ベンズ[1,4]オキサジン-6-イル]-5-フルオロ-N2-(3-ヒドロキシ-4,5-ジメトキシフェニル)-2,4-ピリミジンジアミン；

N4-[2,2-ジメチル-3-オキソ-ピリド[1,4]オキサジン-6-イル]-5-フルオロ-N2-(3-ヒドロキシ-4,5-ジメトキシフェニル)-2,4-ピリミジンジアミン；

5-フルオロ-N2-(3-ヒドロキシ-4,5-ジメトキシフェニル)-N4-[3-オキソ-ベンズ[1,4]オキサジン-6-イル]-2,4-ピリミジンジアミン；

N4-[2,2-ジフルオロ-3-オキソ-ベンズ[1,4]オキサジン-6-イル]-5-フルオロ-N2-(3-ヒドロキシ-4,5-ジメトキシフェニル)-2,4-ピリミジンジアミン；

5-フルオロ-N2-(3-ヒドロキシ-4,5-ジメトキシフェニル)-N4-[3-オキソ-4-(2-ピリジルメチル)-ベンズ[1,4]オキサジン-6-イル]-2,4-ピリミジンジアミン；

N4-(3,4-ジヒドロ-2H-2,2-ジメチル-5-ピリド[1,4]オキサジン-6-イル)-N2-[3,4-ジメトキシフェニル-5-ヒドロキシフェニル]-5-フルオロ-2,4-ピリミジンジアミン；

5-フルオロ-N2-(3-ヒドロキシ-4,5-ジメトキシフェニル)-N4-(1,3-(2H)-4,4-ジメチルイソキノリンジオン-7-イル)-2,4-ピリミジンジアミン；

(R/S)-5-フルオロ-N2-(3-ヒドロキシ-4,5-ジメトキシフェニル)-N4-[2-メチル-3-オキソ-4-(4-メトキシベンジル)-ベンズ[1,4]オキサジン-6-イル]-2,4-ピリミジンジアミン；

(R/S)-5-フルオロ-N2-(3-ヒドロキシ-4,5-ジメトキシフェニル)-N4-[2-メチル-3-オキソ-4-(4-メトキシベンジル)-ベンゾ[1,4]チアジン-6-イル]-2,4-ピリミジンジアミン；

5-フルオロ-N2-(3-ヒドロキシ-4,5-ジメトキシフェニル)-N4-(2,2,4-トリメチル-1,1,3-トリオキソ-ベンゾ[1,4]チアジン-6-イル)-2,4-ピリミジンジアミン；および

5-フルオロ-N2-(3-ヒドロキシ-4,5-ジメトキシフェニル)-N4-(4-メチル-3-オキソ-ベンゾ[1,4]チアジン-6-イル)-2,4-ピリミジンジアミン。

#### 【請求項 1 4】

請求項1記載の化合物、その立体異性体、塩、またはN-オキシド、および担体、賦形剤、または希釈剤を含む薬学的組成物。

#### 【請求項 1 5】

N4-[2,2-ジメチル-3-オキソ-ベンゾ[1,4]チアジン-6-イル]-5-フルオロ-N2-(3-ヒドロキシ-4,5-ジメトキシフェニル)-2,4-ピリミジンジアミン、またはその立体異性体、塩、もしくはN-オキシド。

#### 【請求項 1 6】

N4-[2,2-ジメチル-3-オキソ-ベンズ[1,4]オキサジン-6-イル]-5-フルオロ-N2-(3-ヒドロキシ-4,5-ジメトキシフェニル)-2,4-ピリミジンジアミン、またはその立体異性体、塩、もしくはN-オキシド。

#### 【請求項 1 7】

N4-[2,2-ジメチル-3-オキソ-ピリド[1,4]オキサジン-6-イル]-5-フルオロ-N2-(3-ヒドロキシ-4,5-ジメトキシフェニル)-2,4-ピリミジンジアミン、またはその立体異性体、塩、もしくはN-オキシド。