

【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4月26日(2007.4.26)

【公表番号】特表2006-522034(P2006-522034A)

【公表日】平成18年9月28日(2006.9.28)

【年通号数】公開・登録公報2006-038

【出願番号】特願2006-504582(P2006-504582)

【国際特許分類】

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 25/18 (2006.01)

A 6 1 P 15/10 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 405/12 C S P

A 6 1 K 31/496

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 25/00 1 0 1

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 15/10

【手続補正書】

【提出日】平成19年3月7日(2007.3.7)

【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】請求項1

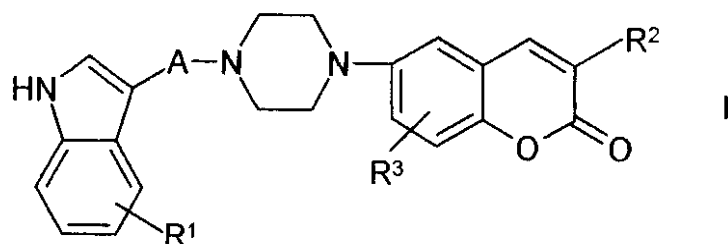
【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項1】

式I

【化 1】



式中、

R^1 は、H、OH、CN、Hal、CONHR、OB、CO₂B、CF₃、NR₂、NRCOR、NRCOOR、またはNRCONR₂ であり、

R^2 は、NR₂、NRCOR、NRCOOR、NRCONR₂、NO₂、NRSO₂R₂、NRCOR、またはNRCONR₂ であり、

R^3 は、H、OH、CN、Hal、CONHR、OB、CO₂B、CF₃、NO₂、NR₂、NRCOR、NRCOOR、またはNRCONR₂ であり、

R は、互いに独立して、H、B、Het、またはAr であり、

A は、2、3、4、5、または6 個のC 原子を有する、直鎖状または分枝状の、一置換または多置換された炭素鎖であり、

B は、1、2、3、4、5、または6 個のC 原子を有する、直鎖状または分枝状のアルキル基である、

で表される化合物、またはそれらの薬学的に使用可能なプロドラッグ、誘導体、溶媒和物、立体異性体、もしくは塩、あるいは全ての比率でのそれらの混合物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】請求項 9

【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項 9】

N - (6 - { 4 - [4 - (5 - シアノ - 1 H - インドール - 3 - イル) ブチル] ピペラジン - 1 - イル } - 2 - オキソ - 2 H - クロメン - 3 - イル) メチルアミド、

エチル (6 - { 4 - [4 - (5 - シアノ - 1 H - インドール - 3 - イル) ブチル] ピペラジン - 1 - イル } - 2 - オキソ - 2 H - クロメン - 3 - イル) カルバメート、

メチル N - (6 - { 4 - [4 - (5 - シアノ - 1 H - インドール - 3 - イル) ブチル] ピペラジン - 1 - イル } - 2 - オキソ - 2 H - クロメン - 3 - イル) カルバメート、

N - (6 - { 4 - [4 - (5 - シアノ - 1 H - インドール - 3 - イル) ブチル] ピペラジン - 1 - イル } - 2 - オキソ - 2 H - クロメン - 3 - イル) - 2 , 2 - ジメチルプロピオンアミド、

3 - { 4 - [4 - (3 - アミノ - 2 - オキソ - 2 H - クロメン - 6 - イル) ピペラジン - 1 - イル] ブチル } - 1 H - インドール - 5 - カルボニトリル、

の群から選択される式 I の化合物、またはそれらの薬学的に使用可能なプロドラッグ、誘導体、溶媒和物、立体異性体、もしくは塩。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0001

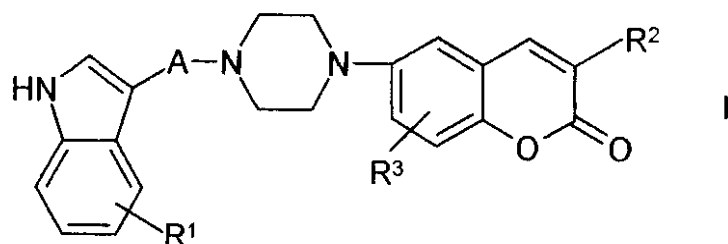
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0001】

本発明は、式 I :

【化 1】



式中、

R^1 は、H、OH、CN、Hal、CONHR、OB、CO₂B、CF₃、NR₂、NRCOR、NRCOOR、またはNRCO₂NR₂であり、

R^2 は、NR₂、NRCOR、NRCOOR、NRCO₂NR₂、NO₂、NRSO₂R₂、NRCOR、またはNRCO₂NR₂であり、

R^3 は、H、OH、CN、Hal、CONHR、OB、CO₂B、CF₃、NO₂、NR₂、NRCOR、NRCOOR、またはNRCO₂NR₂であり、

Rは、互いに独立して、H、B、Het、またはArであり、

Aは、2、3、4、5、または6個のC原子を有する、直鎖状または分枝状の、一置換または多置換された炭素鎖であり、

Bは、1、2、3、4、5、または6個のC原子を有する、直鎖状または分枝状のアルキル基である、

で表されるクロメノンインドール誘導体、またはそれらの薬学的に使用可能なプロドラッグ、誘導体、溶媒和物、立体異性体、もしくは塩、全ての比率でのそれらの混合物に関する。

【手続補正 4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0019

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0019】

所望により、方法の出発物質も、反応混合物から単離することなく、代わりに即座に式Iの化合物に変換することにより、そのまま形成させることもできる。

式IIのピペラジン誘導体の大部分は既知である。それらが商業的に入手可能でなく既知でない場合、それらは既知の方法により製造することができる。例えば、それらは、ビス(2-クロロエチル)アミン、またはビス(2-クロロエチル)アンモニウムクロリドと、アミノ-置換されたベンゾピラン化合物との反応により製造することができる。

【手続補正 5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0020

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0020】

式IIIのインドール誘導体の大部分は既知であり、いくつかは商業的に入手できる。さらに、該化合物は、求電子的芳香族置換または求核的芳香族置換により、既知化合物から製造することができる。用いられる出発物質は、好ましくは、対応するインドール-3-アルカン酸である(ジャッパ(Japp)- Klingemann)-型フィッシャー(Fischer)インドール合成と同様にして製造することができる：この点については、Boettcher et al., J. Med. Chem. 1992, 35, 4020-4026またはIyer et al., J. Chem. Soc. Perkin Trans. II 1973, 872-878)。