

【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18年4月20日(2006.4.20)

【公表番号】特表2005-536465(P2005-536465A)

【公表日】平成17年12月2日(2005.12.2)

【年通号数】公開・登録公報2005-047

【出願番号】特願2004-503480(P2004-503480)

【国際特許分類】

C 0 7 H 17/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/7048 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

C 0 7 B 53/00 (2006.01)

C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 H 17/08 C S P B

A 6 1 K 31/7048

A 6 1 P 31/04

C 0 7 B 53/00 G

C 0 7 B 61/00 3 0 0

C 0 7 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成18年3月6日(2006.3.6)

【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

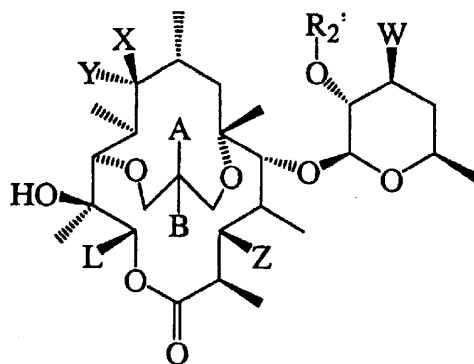
【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項1】

式

【化1】



(I)

式中、

Aは：

a) -OH；

- b) $-OR_p$ 、式中 R_p はヒドロキシ保護基である；
- c) $-R_1$ 、式中 R_1 は独立して：
- (1) アリール；
 - (2) 置換アリール；
 - (3) ヘテロアリール；および
 - (4) 置換ヘテロアリール
- から選択される；
- d) $-OR_1$ 、式中 R_1 は先に定義された通りである；
- e) $-R_2$ 、式中 R_2 は：
- (1) 水素；
 - (2) ハロゲン；
 - (3) ハロゲン、アリール、置換アリール、ヘテロアリール、および置換ヘテロアリールから選択される1以上の置換基で任意に置換された、0、SまたはNから選択される0、1、2、または3個のヘテロ原子を任意に含む $C_1 \sim C_{12}$ アルキル；
 - (4) ハロゲン、アリール、置換アリール、ヘテロアリール、および置換ヘテロアリールから選択される1以上の置換基で任意に置換された、0、SおよびNから選択される0、1、2、または3個のヘテロ原子を任意に含む $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル；ならびに
 - (5) ハロゲン、アリール、置換アリール、ヘテロアリール、および置換ヘテロアリールから選択される1以上の置換基で任意に置換された、0、SおよびNから選択される0、1、2、または3個のヘテロ原子を任意に含む $C_2 \sim C_{12}$ アルキニル
- から選択される；
- f) $-OR_2$ 、式中 R_2 は独立して先に定義された通りである；
- g) $-S(O)_n R_{11}$ 、式中 $n=0$ 、1または2であり、 R_{11} は独立して水素、 R_1 または R_2 であり、ここで R_1 および R_2 は先に定義された通りである；
- h) $-NHC(O)R_{11}$ 、式中 R_{11} は先に定義された通りである；
- i) $-NHC(O)NHR_{11}$ 、式中 R_{11} は先に定義された通りである；
- j) $-NHS(O)_2 R_{11}$ 、式中 R_{11} は先に定義された通りである；
- k) $NR_{14}R_{15}$ 、式中 R_{14} および R_{15} はそれぞれ独立して R_{11} であり、ここで R_{11} は先に定義された通りである；ならびに
- l) $-NHR_3$ 、式中 R_3 はアミノ保護基である
- から選択され、
- Bは：
- a) 水素；
 - b) 重水素；
 - c) ハロゲン；
 - d) $-OH$ ；
 - e) R_1 、式中 R_1 は先に定義された通りである；
 - f) R_2 、式中 R_2 は先に定義された通りである；
 - g) $-OR_p$ 、式中、Bがハロゲン、 $-OH$ 、または $-OR_p$ のとき、Aは R_1 または R_2 であるという条件で、 R_p は先に定義された通りである；
- から選択されるか、あるいは、
- AおよびBは、それらが結合する炭素原子と共に：
- a) $C=O$ ；
 - b) $C(OR_2)_2$ 、式中 R_2 は先に定義された通りである；
 - c) $C(SR_2)_2$ 、式中 R_2 は先に定義された通りである；
 - d) $C(OR_{12})(OR_{13})$ 、式中 R_{12} および R_{13} は独立して $C_1 \sim C_6$ アルキルであるか、または共に $-(CH_2)_m-$ であり、 $m=2$ または3である；
 - e) $C(SR_{12})(SR_{13})$ 、式中 R_{12} 、 R_{13} 、および m は先に定義された通りである；
 - f) $C=CHR_{11}$ 、式中 R_{11} は先に定義された通りである；
 - g) $C=N-O-R_{11}$ 、式中 R_{11} は先に定義された通りである；

h) $C=N-O-Ar_1-M-Ar_2$ 、式中、

(1) $-Ar_1$ は R_{31} 、ここで R_{31} は独立して：

(a) $-R_1$ 、式中 $-R_1$ は先に定義された通りである；

(b) ハロゲン、アリール、置換アリール、ヘテロアリール、および置換ヘテロアリールから選択される1以上の置換基で任意に置換された、0、SまたはNから選択される0、1、2、または3個のヘテロ原子を任意に含む $-C_1 \sim C_{12}$ アルキル；

(c) ハロゲン、アリール、置換アリール、ヘテロアリール、および置換ヘテロアリールから選択される1以上の置換基で任意に置換された、0、SおよびNから選択される0、1、2、または3個のヘテロ原子を任意に含む $-C_2 \sim C_{12}$ アルケニル；または

(d) ハロゲン、アリール、置換アリール、ヘテロアリール、および置換ヘテロアリールから選択される1以上の置換基で任意に置換された、0、SおよびNから選択される0、1、2、または3個のヘテロ原子を任意に含む $-C_2 \sim C_{12}$ アルキニル；

から選択される、であり；

(2) $-M$ は非存在であるか、あるいは

(a) 0、SまたはNから選択される0～3個のヘテロ原子；および
 $-C=N-$ 、 $-N=N-$ または $C(0)$ から選択される0～3個の基；

を任意に含む $-C_1 \sim C_{12}$ アルキル；

(b) 0、SまたはNから選択される0～3個のヘテロ原子；および
 $-C=N-$ 、 $-N=N-$ または $C(0)$ から選択される0～3個の基；

を任意に含む $-C_2 \sim C_{12}$ アルケニル；

(c) 0、SまたはNから選択される0～3個のヘテロ原子；および
 $-C=N-$ 、 $-N=N-$ または $C(0)$ から選択される0～3個の基；

を任意に含む $-C_2 \sim C_{12}$ アルキニル；

(d) 置換アリール；

(e) 置換ヘテロアリール；または

(f) 置換ヘテロシクロアルキル；

から選択され、ならびに

(3) $-Ar_2$ は：

(a) アリール；

(b) 置換アリール；

(c) ヘテロアリール；または

(d) 置換ヘテロアリール；

から選択される；

i) $C=NNHR_{11}$ 、式中 R_{11} は先に定義された通りである；

j) $C=NNHC(O)R_{11}$ 、式中 R_{11} は先に定義された通りである；

k) $C=NNHC(O)NHR_{11}$ 、式中 R_{11} は先に定義された通りである；

l) $C=NNHS(O)_2R_{11}$ 、式中 R_{11} は先に定義された通りである；

m) $C=NNHR_3$ 、式中 R_3 は先に定義された通りである；

n) $C=NR_{11}$ 、式中 R_{11} は先に定義された通りである；または

o) $C=N=N=CHR_{11}$ 、式中 R_{11} は先に定義された通りである

から選択され、

XおよびYの一方は水素であり、他方は：

a) 水素；

b) 重水素；

c) $-OH$ ；

d) $-OR_p$ 、式中 R_p は先に定義された通りである；

e) $-NR_4R_5$ 、式中 R_4 および R_5 はそれぞれ独立して；

(1) 水素；

(2) ハロゲン、アリール、置換アリール、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールから選択される1以上の置換基で任意に置換された $C_1 \sim C_{12}$ アルキル；または

(3) R_4 および R_5 が、それらが結合する窒素原子と共に、O、S および N から選択される 0 ~ 2 個の付加ヘテロ原子を含む 3 ~ 10 員のヘテロアルキル環を形成する；

から選択される；

から選択されるか、

あるいは X および Y は、それらが結合する炭素原子と共に：

a) $C=O$ ；

b) $C=N-Q$ 、式中 Q は：

(1) R_{11} 、式中 R_{11} は先に定義された通りである；

(2) アミノ保護基；

(3) $C(O)R_{11}$ 、式中 R_{11} は先に定義された通りである；

(4) OR_6 、式中 R_6 は独立して：

(a) 水素；

(b) $-CH_2O(CH_2)_2OCH_3$ ；

(c) $-CH_2O(CH_2O)_nCH_3$ 、式中 n は先に定義された通りである；

(d) アリール、置換アリール、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールから選択される 1 以上の置換基で任意に置換された $-C_1 \sim C_{12}$ アルキル；

(e) $C_3 \sim C_{12}$ シクロアルキル；

(f) $C(O)-C_1 \sim C_{12}$ アルキル；

(g) $C(O)-C_3 \sim C_{12}$ シクロアルキル；

(h) $C(O)-R_{11}$ 、式中 R_{11} は先に定義された通りである；

(ii) $-Si(R_a)(R_b)(R_c)$ 、式中 R_a 、 R_b および R_c はそれぞれ独立して $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、アリールおよび置換アリールから選択される；

から選択される；あるいは

(5) $O-C(R_7)(R_8)-O-R_6$ 、式中、 R_6 は、 $C(O)-C_1 \sim C_{12}$ アルキル、 $C(O)-C_3 \sim C_{12}$ シクロアルキル、または $C(O)-R_1$ でないという条件で、先に定義された通りであり、 R_7 および R_8 はそれらが結合する炭素原子と共に $C_3 \sim C_{12}$ シクロアルキル基であるか、あるいはそれぞれ独立して

1. 水素；または

2. $C_1 \sim C_{12}$ アルキル

から選択される；

から選択される、

から選択され、

L は：

a) $-CH_3$ ；

b) $-CH_2CH_3$ ；

c) $-CH(OH)CH_3$ ；

d) アリール、置換アリール、ヘテロアリール、および置換ヘテロアリールから選択される 1 以上の置換基で任意に置換された $C_1 \sim C_6$ アルキル；

e) アリール、置換アリール、ヘテロアリール、および置換ヘテロアリールから選択される 1 以上の置換基で任意に置換された $C_2 \sim C_6$ アルケニル；

f) アリール、置換アリール、ヘテロアリール、および置換ヘテロアリールから選択される 1 以上の置換基で任意に置換された $C_2 \sim C_6$ アルキニル；

から選択され、

W は $-NR_{14}R_{15}$ 、式中 R_{14} および R_{15} はそれぞれ独立して：

a) 水素；

b) ハロゲン、アリール、置換アリール、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールから選択された 1 以上の置換基で任意に置換された $C_1 \sim C_{12}$ アルキル；

c) ハロゲン、アリール、置換アリール、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールから選択された 1 以上の置換基で任意に置換された $C_1 \sim C_{12}$ アルケニル；

d) ハロゲン、アリール、置換アリール、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールから

選択された1以上の置換基で任意に置換された $C_1 \sim C_{12}$ アルキニル；

e) R_{14} および R_{15} が、それらが結合する窒素と共にヘテロシクロアルキル部分を形成する；

から選択される、であり、

Zは：

(a) 水素；

(b) -OH；

(c) $-OR_p$ 、式中 R_p は先に定義された通りである；

(d) $-OR_{11}$ 、式中 R_{11} は先に定義された通りである；

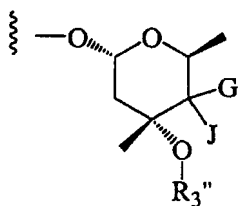
(e) $-OC(O)R_{11}$ 、式中 R_{11} は先に定義された通りである；

(f) $-OC(O)NHR_{11}$ 、式中 R_{11} は先に定義された通りである；

(g) $-O(O)_nR_{11}$ 、式中 n および R_{11} は先に定義された通りである；あるいは

(h) -

【化2】



式中、

i. R_3'' は水素またはメチルであり；

ii. JまたはGの一方が水素であり、他方が：

1. 水素；

2. 重水素；

3. -OH；

4. $-OR_p$ 、式中 R_p は先に定義された通りである；

5. $-OR_{4''}$ 、式中 $R_{4''}$ は水素または R_{11} であり、ここで R_{11} は先に定義された通り

である；または

6. $-NR_4R_5$ 、式中 R_4 および R_5 は先に定義された通りである；

から選択されるか、あるいは

iii. その替わりとして、JおよびGはそれらが結合する炭素原子と共に：

1. $C=O$ ；

2. $C=N-Q$ 、式中Qは先に定義された通りである；

から選択される基を形成する、

から選択され、および

R_2' は水素または R_p であり、ここで R_p は先に定義された通りである、

で表される化合物、ならびにその薬学的に許容され得る塩、エステルおよびプロドラッグ

。

【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16

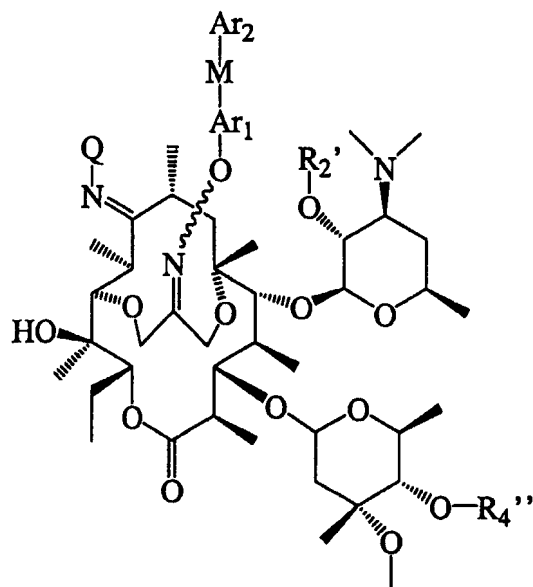
【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項16】

式(IX)：

【化 2 1】

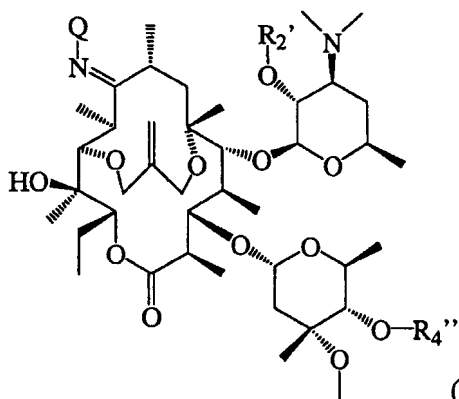


(IX)

式中、Q、Ar₁、M、Ar₂、R₂'およびR₄''は請求項1に定義された通りである、
で表される化合物を調製する方法であって、

(a) 式(16a)

【化 2 2】

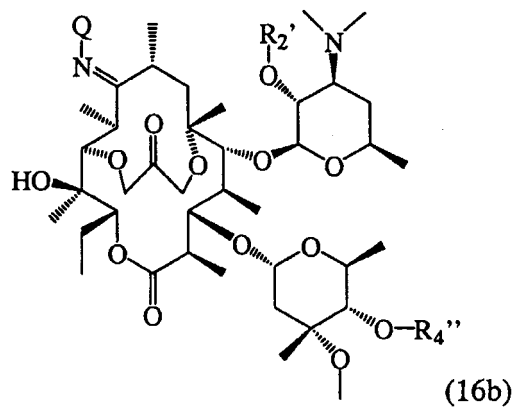


(16a)

式中、Q、R₂'、およびR₄''は先に定義された通りである、
で表される化合物を、酸化開裂を実施することのできる1つまたは複数の試薬と反応させる工程；

(b) 式(16b)

【化 2 3】



式中、Q、 R_2' 、および R_4'' は先に定義された通りである、
 で表される工程(a)で得られる化合物を、式

$Ar_1-M-Ar_2-O-NH_2$ 、式中、 Ar_1 、 Ar_2 、およびMは請求項1に定義された通りである、
 の化合物と、酸または塩基の存在下で反応させる工程；ならびに
 (c) 工程(d)から得られる化合物を任意に脱保護する工程
 を含む、方法。