

【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26年12月4日 (2014.12.4)

【公表番号】特表2013-545731 (P2013-545731A)

【公表日】平成25年12月26日 (2013.12.26)

【年通号数】公開・登録公報2013-069

【出願番号】特願2013-535412 (P2013-535412)

【国際特許分類】

C 0 7 C 251/18 (2006.01)

C 0 7 C 281/16 (2006.01)

C 0 7 C 211/42 (2006.01)

C 0 7 C 323/29 (2006.01)

C 0 7 D 207/12 (2006.01)

C 0 7 D 211/44 (2006.01)

A 6 1 K 31/40 (2006.01)

A 6 1 K 31/4465 (2006.01)

A 6 1 K 31/15 (2006.01)

A 6 1 K 31/155 (2006.01)

A 6 1 K 31/265 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 9/08 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 251/18 C S P

C 0 7 C 281/16

C 0 7 C 211/42

C 0 7 C 323/29

C 0 7 D 207/12

C 0 7 D 211/44

A 6 1 K 31/40

A 6 1 K 31/4465

A 6 1 K 31/15

A 6 1 K 31/155

A 6 1 K 31/265

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 9/08

【手続補正書】

【提出日】平成26年10月15日 (2014.10.15)

【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

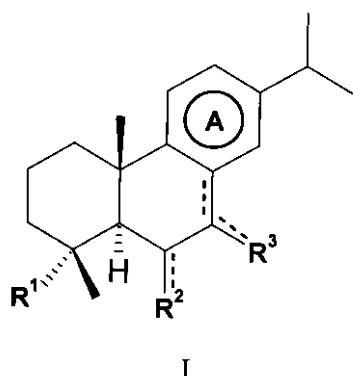
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 I を有する化合物であって

【化 1】



式中、

R^1 はイミノキシを意味する $-CH=NOR^4$ 、 $-CH_2NHOR^4$ 、 $-CH_2XR^5$ 、 $-CH=CHR^6$ 、 $-CH=NR^7$ 、アミノ- (C_3-C_6) アルキル、又は、ヘテロシクロアルキル部分がピペリジニル、ピロリジニル及びテトラヒドロフラニルから成る群から選択されるヘテロシクロアルキル-アルキルであり；

R^7 はグアニジノであり；

R^6 はアミノ- (C_1-C_6) アルキル又は、ヘテロシクロアルキル部分がピペリジニル、ピロリジニル及びテトラヒドロフラニルから成る群から選択されたヘテロシクロアルキル-アルキルであり；

R^5 はアミノ- (C_1-C_6) アルキル又は、ヘテロシクロアルキル部分がピペリジニル、ピロリジニル及びテトラヒドロフラニルから成る群から選択されたヘテロシクロアルキル-アルキルであり；

R^4 はH、アミノ- (C_1-C_6) アルキル、ヘテロシクロアルキル、ヒドロキシアルキル、ヒドロキシアルキルオキシアルキル又はカルボキシアルキルであり；

X はO又はSであり；

環内記号

【化 2】



が単結合又は二重結合を表し、それが二重結合を表す場合は、炭素環へ R^3 を結合する記号

【化 3】



は単結合を表し、前記炭素環 A は部分的に不飽和であり；

前記炭素環へ R^2 を結合する前記記号

【化 4】



は単結合又は二重結合を表し；

前記炭素環へ R^2 を結合する前記記号

【化 5】

が単結合を表す場合、 R^2 は H 又はヒドロキシルであるか；又は、

前記炭素環へ R^2 を結合する前記記号

【化 6】

がそれぞれカルボニル又はオキシムを意味する二重結合を表す場合、 R^2 は O 又は N ~ O
 R^8 であり；

R^8 は H 又は ($C_1 \sim C_6$) アルキルであり；

前記炭素環へ R^3 を結合する前記記号

【化 7】

が単結合又は二重結合を表し、

前記炭素環へ R^3 を結合する前記記号

【化 8】

が単結合を表す場合、 R^3 は H であるか；又は、

前記炭素環へ R^3 を結合する前記記号

【化 9】

がそれぞれカルボニル又はオキシムを意味する二重結合を表す場合、 R^3 は O 又は N ~ O
 R^8 であり、

炭素環 A は芳香族であるか又は部分的に不飽和であり；

但し、 R^4 が H である場合、 R^2 は H ではなく；

エナンチオマー、ジアステレオマー、それらのラセミ体及びそれらの薬学的に許容可能な
 塩などのそれらの光学的に活性な形態である、化合物。

【請求項 2】

R^1 が $-CH=NO R^4$ である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R^4 がアミノ - ($C_1 \sim C_6$) アルキル又はヘテロシクロアルキルである、請求項 1 ~
 2 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 4】

薬剤としての請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物を含む組成物。

【請求項 5】

高血圧、心不全、心肥大、腎不全、糸球体硬化症、タンパク尿及び血管手術後の血管狭
 窄の予防及び / 又は治療のための、請求項 4 に記載の組成物。

【請求項 6】

前記心血管の疾患が高血圧である、請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 7】

高血圧が内因性ウアバインの効果により引き起こされる、請求項 6 に記載の組成物。

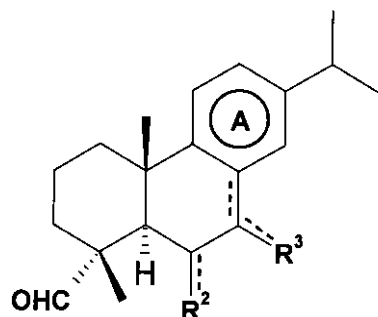
【請求項 8】

薬学的に許容される賦形剤とともに、請求項 1 ～ 3 に記載の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 9】

請求項 1 に記載の化合物の合成のためのプロセスであって、前記記号 R^1 はイミノキシを意味する $-CH=NO R^4$ であり、炭素環 A は芳香族であるか又は部分的に不飽和であり、 R^2 及び R^3 は請求項 1 で定義した通りであり、式中炭素環 A は芳香族であるか又は部分的に不飽和であり、 R^2 及び R^3 は上記で定義した通りである式 I I の化合物

【化 1 0】



式 (I I)

を、式中 R^4 は上記で定義した通りであり、 x は 0 ～ 3 に含まれる整数である式 (I I I) の化合物

【化 1 1】



と、室温でピリジン中において反応させることを含む、プロセス。