

【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6日(2006.4.6)

【公表番号】特表2005-523254(P2005-523254A)

【公表日】平成17年8月4日(2005.8.4)

【年通号数】公開・登録公報2005-030

【出願番号】特願2003-561595(P2003-561595)

【国際特許分類】

C 0 7 D 231/54 (2006.01)

A 6 1 K 31/416 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 5/44 (2006.01)

A 6 1 P 5/46 (2006.01)

A 6 1 P 25/22 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

C 0 7 D 403/06 (2006.01)

C 0 7 D 409/06 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 231/54 C S P

A 6 1 K 31/416

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 5/44

A 6 1 P 5/46

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 25/24

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 29/00

C 0 7 D 403/06

C 0 7 D 409/06

【手続補正書】

【提出日】平成18年2月16日(2006.2.16)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

【補正方法】変更

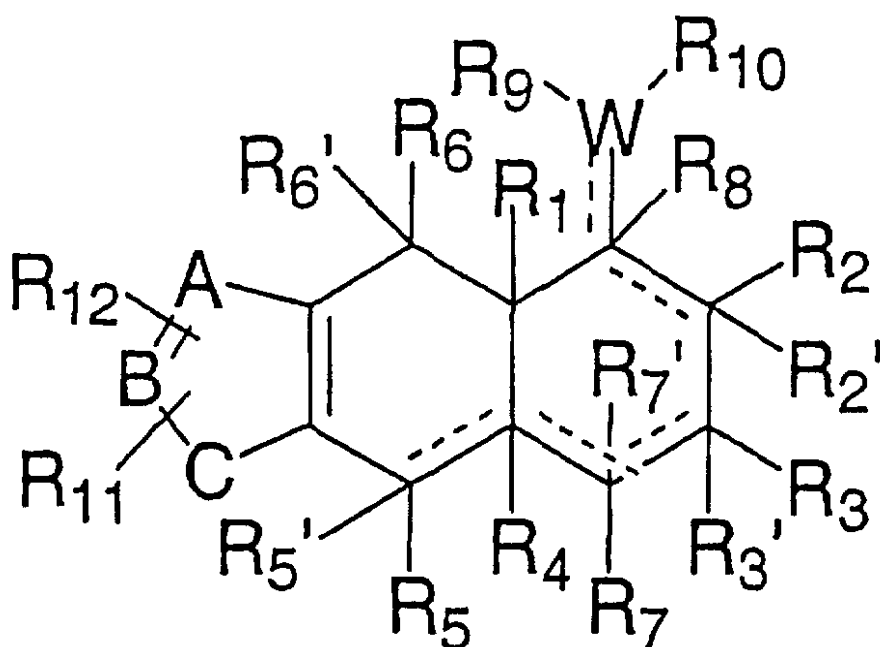
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記構造式の化合物または医薬的に利用可能なその塩、溶媒和物または水和物。

【化1】



(式中、A、BおよびCはそれぞれ独立に炭素、窒素、酸素または硫黄であるが、ただしA、BおよびCの少なくとも1つは窒素、酸素または硫黄であり、さらにA、BおよびCの2つ以上が酸素または硫黄であることはなく、

Wは炭素、酸素、窒素または硫黄であり、Wが炭素および窒素以外のものであるときは、Wの正規の原子価が維持するようR₈、R₉およびR₁₀の1つまたは2つ以上は存在せず、

R₁は水素、アルキル、置換アルキル、アシル、置換アシル、アシルアミノ、置換アシルアミノ、アミノ、アルキルアミノ、置換アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、置換ジアルキルアミノ、アルコキシカルボニル、置換アルコキシカルボニル、アリーラルキル、置換アリーラルキル、アリーロキシカルボニル、置換アリーロキシカルボニル、カルバモイル、置換カルバモイル、カルボキシ、シアノ、ハロ、ヘテロアルキルもしくは置換ヘテロアルキル、ヘテロアリーラルキルもしくは置換ヘテロアリーラルキルであり、

R₂、R₃、R₅、R₆、R₆'およびR₇はそれぞれ独立に水素、アルキル、置換アルキル、アシル、置換アシル、アシルアミノ、置換アシルアミノ、アルコキシ、置換アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、置換アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、置換ジアルキルアミノ、アルキルスルホニル、置換アルキルスルホニル、アルキルスルフィニル、置換アルキルスルフィニル、アルキルチオ、置換アルキルチオ、アルコキシカルボニル、置換アルコキシカルボニル、アリーラルキル、置換アリーラルキル、アリーロキシカルボニル、置換アリーロキシカルボニル、カルバモイル、置換カルバモイル、カルボキシ、シアノ、ハロ、ヘテロアルキル、置換ヘテロアルキル、ヘテロアリーラルキル、置換ヘテロアリーラルキルまたはヒドロキシであり；

R₂'、R₃'、R₅'、R₇'およびR₈は存在しないか、またはそれぞれ独立に水素、アルキル、置換アルキル、アシル、置換アシル、アシルアミノ、置換アシルアミノ、アルコキシ、置換アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、置換アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、置換ジアルキルアミノ、アルキルスルホニル、置換アルキルスルホニル、アルキルスルフィニル、置換アルキルスルフィニル、アルキルチオ、置換アルキルチオ、アルコキシカルボニル、置換アルコキシカルボニル、アリーラルキル、置換アリーラルキル、アリーロキシカルボニル、置換アリーロキシカルボニル、カルバモイル、置換カルバモイル、カルボキシ、シアノ、ハロ、ヘテロアルキル、置換ヘテロアルキル、ヘテロアリーラルキル、置換ヘテロアリーラルキルまたはヒドロキシであり；

R₄は存在しないか、または水素、アルキル、置換アルキル、アシル、置換アシル、アシルアミノ、置換アシルアミノ、アミノ、アルキルアミノ、置換アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、置換ジアルキルアミノ、アルコキシカルボニル、置換アルコキシカルボニル、

アリールアルキル、置換アリールアルキル、アリールオキシカルボニル、置換アリールオキシカルボニル、カルバモイル、置換カルバモイル、カルボキシ、シアノ、ハロ、ヘテロアルキル、置換ヘテロアルキル、ヘテロアリールアルキルまたは置換ヘテロアリールアルキルであり；

R_9 は水素、アルキル、置換アルキル、アルコキシ、置換アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、置換アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、置換ジアルキルアミノ、カルボキシ、シアノ、ハロ、オキソ、チオ、ヒドロキシであるか、または存在せず；

R_{10} は水素、アルキル、置換アルキル、アシル、置換アシル、アルコキシカルボニル、置換アルコキシカルボニル、アリール、置換アリール、アリールアルキル、置換アリールアルキル、アリールオキシカルボニル、置換アリールオキシカルボニル、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロヘテロアルキル、置換シクロヘテロアルキル、ヘテロアルキル、置換ヘテロアルキル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキルであるか、または存在せず；

R_{10} および R_2 は互いに直接結合して1つの環を形成することができ、ベンゼン環などのさらに別の環が R_{10} および R_2 間の結合と縮合していてもよく、前記別の環はそれ自体アルキル、アルコキシ、ハロ、アルキル、置換アルキル、アシル、置換アシル、シクロアルキルまたは置換シクロアルキルで置換されていてもよく、さらに

R_{11} および R_{12} は、それぞれ独立に水素、アルキル、置換アルキル、アシル、置換アシル、アシルアミノ、置換アシルアミノ、アルコキシ、置換アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、置換アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、置換ジアルキルアミノ、アルキルスルホニル、置換アルキルスルホニル、アルキルスルフィニル、置換アルキルスルフィニル、アルキルチオ、置換アルキルチオ、アルコキシカルボニル、置換アルコキシカルボニル、アリール、置換アリール、アリールアルキル、置換アリールアルキル、アリールオキシカルボニル、置換アリールオキシカルボニル、カルバモイル、置換カルバモイル、カルボキシ、シアノ、ハロ、オキソ、チオ、ヘテロアルキル、置換ヘテロアルキル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキルまたはヒドロキシであり、

一本線および点線で示されている式(1)中の結合の1つは二重結合であるが、ただし環内原子の正規の原子価の要件が満たされることを条件とする)。

【請求項2】

A、BおよびCが炭素または窒素である請求項1の化合物。

【請求項3】

Aが炭素であり、BおよびCが窒素である請求項2の化合物。

【請求項4】

R_1 および R_4 が、それぞれ独立に水素、アルキル、置換アルキル、アシル、置換アシル、アルコキシカルボニル、置換アルコキシカルボニル、カルボキシ、シアノ、カルバモイル、置換カルバモイル、ヘテロアルキルおよび置換ヘテロアリールアルキルである請求項1の化合物。

【請求項5】

R_1 および R_4 が、それぞれ独立に水素、アルカニルまたは置換アルカニルである請求項1の化合物。

【請求項6】

R_1 および R_4 が、それぞれ独立に水素またはメチルである請求項1の化合物。

【請求項7】

R_2 、 R_3 、 R_5 、 R_6 、 R_6' および R_7 がそれぞれ独立に水素、アルキル、置換アルキル、アシル、置換アシル、アルコキシ、置換アルコキシ、アミノ、アルコキシカルボニル、置換アルコキシカルボニル、カルバモイル、置換カルバモイル、カルボキシ、シアノ、ハロ、ヘテロアルキル、置換ヘテロアルキルまたはヒドロキシである請求項1の化合物。

【請求項8】

R_2 、 R_2' 、 R_3 、 R_5 、 R_6 、 R_6' 、 R_7 および R_8 がそれぞれ独立に水素、アルカニルまたは置換

アルカニルである請求項 1 の化合物。

【請求項 9】

R_2 、 R_2' 、 R_3 、 R_5 、 R_6 、 R_6' 、 R_7 および R_8 が水素、アルカニルまたはメチルである請求項 1 の化合物。

【請求項 10】

R_4 および R_5' が存在しない請求項 1 の化合物。

【請求項 11】

R_4 および R_7' が存在しない請求項 1 の化合物。

【請求項 12】

R_3' および R_7' が存在しない請求項 1 の化合物。

【請求項 13】

R_3' 、 R_5' および R_7' がそれぞれ独立に水素、アルキル、置換アルキル、アシル、置換アシル、アルコキシ、置換アルコキシ、アミノ、アルコキシカルボニル、置換アルコキシカルボニル、カルバモイル、置換カルバモイル、カルボキシ、シアノ、ハロ、ヘテロアルキル、置換ヘテロアルキルまたはヒドロキシである請求項 1 の化合物。

【請求項 14】

R_3' 、 R_5' および R_7' がそれぞれ独立に水素、アルカニルまたは置換アルカニルである請求項 1 の化合物。

【請求項 15】

R_3' 、 R_5' および R_7' が水素またはメチルである請求項 1 の化合物。

【請求項 16】

R_9 が水素、アルコキシ、置換アルコキシ、ハロ、オキソ、チオ、ヒドロキシであるか、または存在しない請求項 1 の化合物。

【請求項 17】

R_9 がアルコキシ、オキソまたはヒドロキシである請求項 1 の化合物。

【請求項 18】

R_{10} が水素、アルキル、置換アルキル、アリール、置換アリール、アリールアルキル、置換アリールアルキル、ヘテロアルキル、置換ヘテロアルキル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキルであるか、または存在しない請求項 1 の化合物。

【請求項 19】

R_{10} がアリール、置換アリール、ヘテロアリールまたは置換ヘテロアリールである請求項 1 の化合物。

【請求項 20】

R_{11} および R_{12} がそれぞれ独立に水素、アルキル、アルコキシ、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、アルキルスルホニル、アルキルスルフィニル、アルキルチオ、アルコキシカルボニル、置換アルコキシカルボニル、アリール、置換アリール、アリールアルキル、置換アリールアルキル、カルバモイル、カルボキシ、シアノ、ハロ、オキソ、チオ、ヘテロアルキル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキルまたはヒドロキシである請求項 1 の化合物。

【請求項 21】

R_{11} および R_{12} がそれぞれ独立に水素、アリール、置換アリール、アリールアルキル、置換アリールアルキル、オキソ、ヘテロアルキル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、置換ヘテロアリールアルキルまたはヒドロキシである請求項 1 の化合物。

【請求項 22】

R_{11} および R_{12} がそれぞれ独立に水素、アリールまたは置換アリールである請求項 1 の化合物。

【請求項 23】

R_1 、 R_2 、 R_2' 、 R_3 、 R_3' 、 R_5 、 R_6 、 R_6' 、 R_7 、 R_7' および R_8 が水素、アルキルまたはアリ-

ルアルキルであり、さらに R_4 および R_5' が存在しない請求項1の化合物。

【請求項24】

R_1 がメチルであり、 R_2 、 R_2' 、 R_3 、 R_3' 、 R_5 、 R_6 、 R_6' 、 R_7 、 R_7' および R_8 が水素であり、さらに R_4 および R_5' が存在しない請求項1の化合物。

【請求項25】

R_9 がアルコキシ、オキソまたはヒドロキシである請求項23または24の化合物。

【請求項26】

R_{10} がアリール、置換アリール、ヘテロアリールまたは置換ヘテロアリールである請求項23または24の化合物。

【請求項27】

Aが炭素であり、BおよびCが窒素であり、 R_{11} が水素であり、さらに R_{12} がアリール、置換アリール、ヘテロアリールまたは置換ヘテロアリールである請求項23または24の化合物。

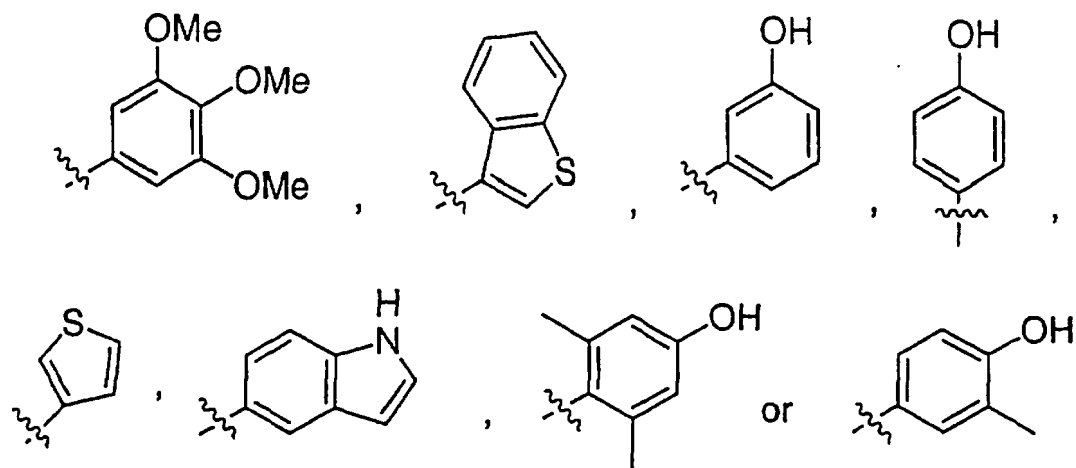
【請求項28】

R_1 がメチルであり、 R_2 、 R_2' 、 R_3 、 R_3' 、 R_5 、 R_6 、 R_6' 、 R_7 、 R_7' および R_8 が水素であり、 R_4 および R_5' が存在せず、 R_9 がアルコキシ、オキソまたはヒドロキシであり、 R_{10} がアリール、置換アリール、ヘテロアリールまたは置換ヘテロアリールであり、Aが炭素であり、BおよびCが窒素であり、 R_{11} が水素であり、さらに R_{12} がアリール、置換アリール、ヘテロアリールまたは置換ヘテロアリールである請求項1の化合物。

【請求項29】

R_9 が水素であり、さらに R_{10} が下記式である請求項36の化合物：

【化2】



【請求項30】

肥満、糖尿病、不安、抑うつ、神経変性または炎症性疾患の治療用または予防用医薬組成物であって、請求項1に記載の化合物の治療的に有効な量を含む組成物。

【請求項31】

請求項1の化合物を含む医薬組成物。

【請求項32】

肥満、糖尿病、不安、抑うつ、神経変性または炎症性疾患の治療用または予防用医薬組成物であって、請求項31に記載の組成物の治療的に有効な量を含む組成物。

【請求項33】

患者のグルコルチコイドレセプターの活性化、抑制、アゴニズムおよびアンタゴニズム作用の選択的調節用医薬組成物であって、請求項31に記載の組成物の治療的に有効な量を含む組成物。

【請求項34】

患者のグルコルチコイドレセプターの活性化、抑制、アゴニズムおよびアンタゴニズ

ム作用の選択的調節用医薬組成物であって、請求項1に記載の化合物の治療的に有効な量を含む組成物。

【請求項35】

肥満、糖尿病、不安、抑うつ、神経変性または炎症性疾患の治療を必要とする患者で前記疾病を治療または予防することを目的とする請求項1の化合物を含む組成物。

【請求項36】

グルココルチコイドレセプターのアンタゴニストである請求項1に記載の化合物。

【請求項37】

グルココルチコイドレセプターのアゴニストである請求項1に記載の化合物。

【請求項38】

請求項1乃至29のいずれか一項に記載の化合物を合成する方法。