

【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9月13日(2007.9.13)

【公表番号】特表2007-521272(P2007-521272A)

【公表日】平成19年8月2日(2007.8.2)

【年通号数】公開・登録公報2007-029

【出願番号】特願2006-517373(P2006-517373)

【国際特許分類】

**C 0 7 D 223/32 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/55 (2006.01)**

**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 27/16 (2006.01)**

**A 6 1 P 9/12 (2006.01)**

**A 6 1 P 9/04 (2006.01)**

**A 6 1 P 9/10 (2006.01)**

**A 6 1 P 1/16 (2006.01)**

**A 6 1 P 13/12 (2006.01)**

**A 6 1 P 7/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 3/12 (2006.01)**

**A 6 1 P 7/02 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/20 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/22 (2006.01)**

**A 6 1 P 15/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 25/00 (2006.01)**

【F I】

C 0 7 D 223/32 C S P

A 6 1 K 31/55

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 27/16

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/10 1 0 3

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 7/00

A 6 1 P 3/12

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 25/22

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 25/00

【手続補正書】

【提出日】平成19年6月15日(2007.6.15)

【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

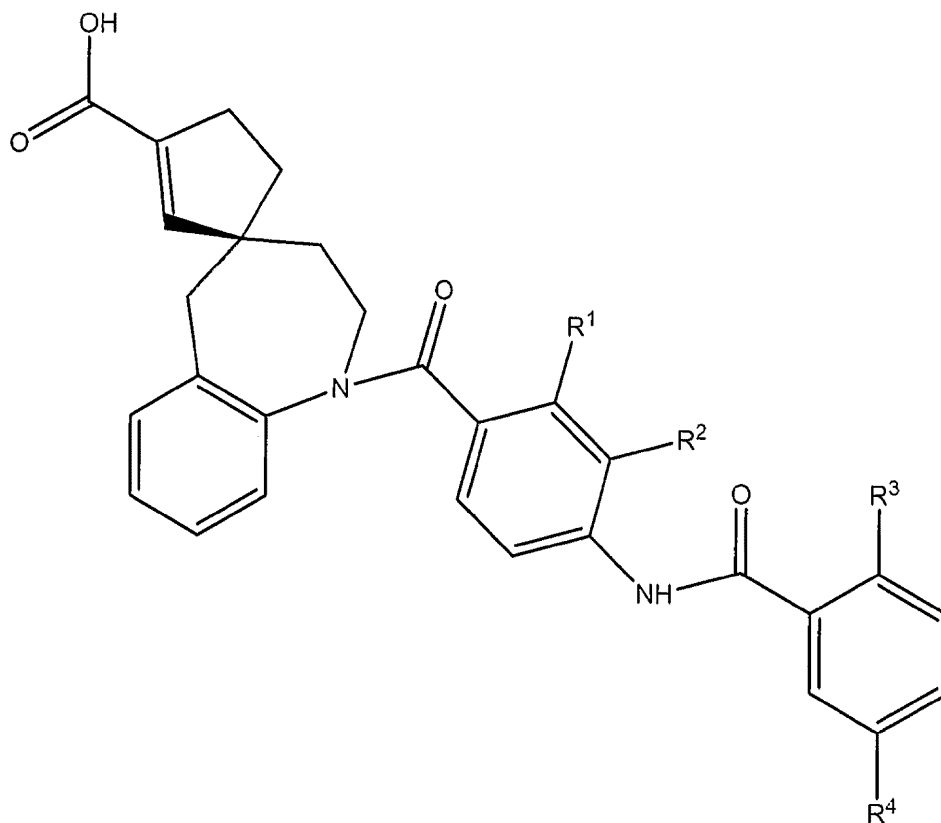
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

【化 1】



I

[ 式中、

$R^1$  および  $R^2$  の中の一方は H でありそしてもう一方は H、 $NR^5R^6$ 、 $C_{1-6}$  アルコキシ、ヒドロキシまたはハロであり、ここで、 $R^5$  および  $R^6$  は、各々独立して、H または  $C_{1-3}$  アルキルであり、

$R^3$  は、クロロであり、

$R^4$  は、クロロ、フルオロ、メトキシまたはメチルである ]

で表される化合物またはこれの薬学的に受け入れられる  $C_{1-6}$  エステル、 $C_{1-6}$  アミドもしくはジ ( $C_{1-6}$  アルキル) アミドまたは塩。

【請求項 2】

$R^2$  がアミノである請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

$R^2$  が  $C_{1-4}$  アルコキシである請求項 1 記載の化合物。

【請求項 4】

$R^2$  がメトキシ、エトキシ、プロポキシ、イソプロポキシ、ブトキシ、イソブトキシまたは *t*-ブトキシである請求項 1 記載の化合物。

【請求項 5】

$R^2$  がメトキシまたはエトキシである請求項 4 記載の化合物。

【請求項 6】

$R^4$  がフルオロ、クロロまたはメチルである請求項 1 記載の化合物。

【請求項 7】

R<sup>4</sup>がフルオロまたはクロロである請求項1記載の化合物。

【請求項8】

R<sup>4</sup>がフルオロである請求項1記載の化合物。

【請求項9】

R<sup>2</sup>がメトキシ、エトキシまたはイソプロポキシである請求項6記載の化合物。

【請求項10】

R<sup>1</sup>がメトキシまたはエトキシである請求項6記載の化合物。

【請求項11】

R<sup>2</sup>がメトキシまたはエトキシである請求項7記載の化合物。

【請求項12】

(R) - 4 - (2 - クロロ - 5 - フルオロベンゾイル - 3 - メトキシ - 4 - アミノベンゾイル) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [6, 4] - スピロ - [5, 6] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、

(R) - 4 - (2 - クロロ - 5 - フルオロベンゾイル - 3 - エトキシ - 4 - アミノベンゾイル) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [6, 4] - スピロ - [5, 6] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、

(R) - 4 - (2 - クロロ - 5 - フルオロベンゾイル - 3 - イソプロポキシ - 4 - アミノベンゾイル) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [6, 4] - スピロ - [5, 6] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、

(R) - 4 - (2 - クロロ - 5 - フルオロベンゾイル - 3 - ヒドロキシ - 4 - アミノベンゾイル) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [6, 4] - スピロ - [5, 6] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、

(R) - 4 - (2 - クロロ - 5 - フルオロベンゾイル - 4 - アミノベンゾイル) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [6, 4] - スピロ - [5, 6] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、

(R) - 4 - (2 - クロロ - 5 - フルオロベンゾイル - 3 - アミノ - 4 - アミノベンゾイル) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [6, 4] - スピロ - [5, 6] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、

(R) - 4 - (2 - クロロ - 5 - フルオロベンゾイル - 3 - クロロ - 4 - アミノベンゾイル) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [6, 4] - スピロ - [5, 6] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、

(R) - 4 - (2 - クロロ - 5 - フルオロベンゾイル - 2 - クロロ - 4 - アミノベンゾイル) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [6, 4] - スピロ - [5, 6] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、

(R) - 4 - (2 - クロロ - 5 - フルオロベンゾイル - 2 - アミノ - 4 - アミノベンゾイル) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [6, 4] - スピロ - [5, 6] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、

(R) - 4 - (2 - クロロ - 5 - フルオロベンゾイル - 2 - ヒドロキシ - 4 - アミノベンゾイル) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [6, 4] - スピロ - [5, 6] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、

(R) - 4 - (2 - クロロ - 5 - フルオロベンゾイル - 2 - メトキシ - 4 - アミノベンゾイル) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [6, 4] - スピロ - [5, 6] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、

(R) - 4 - (2 - クロロ - 5 - メチルベンゾイル - 3 - メトキシ - 4 - アミノベンゾイル) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [6, 4] - スピロ - [5, 6] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、

(R) - 4 - (2 - クロロ - 5 - メチルベンゾイル - 3 - ヒドロキシ - 4 - アミノベンゾイル) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [6, 4] - スピロ - [5, 6] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、

(R) - 4 - (2 - クロロ - 5 - メチルベンゾイル - 4 - アミノベンゾイル) - 4 - アザ

- 3' - (カルボキシ) - [ 6 , 4 ] - スピロ - [ 5 , 6 ] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、  
( R ) - 4 - ( 2 - クロロ - 5 - メチルベンゾイル - 3 - アミノ - 4 - アミノベンゾイル ) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [ 6 , 4 ] - スピロ - [ 5 , 6 ] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、  
( R ) - 4 - ( 2 - クロロ - 5 - メチルベンゾイル - 3 - クロロ - 4 - アミノベンゾイル ) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [ 6 , 4 ] - スピロ - [ 5 , 6 ] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、  
( R ) - 4 - ( 2 - クロロ - 5 - メトキシベンゾイル - 3 - メトキシ - 4 - アミノベンゾイル ) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [ 6 , 4 ] - スピロ - [ 5 , 6 ] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、  
( R ) - 4 - ( 2 - クロロ - 5 - メトキシベンゾイル - 3 - ヒドロキシ - 4 - アミノベンゾイル ) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [ 6 , 4 ] - スピロ - [ 5 , 6 ] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、  
( R ) - 4 - ( 2 - クロロ - 5 - メトキシベンゾイル - 4 - アミノベンゾイル ) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [ 6 , 4 ] - スピロ - [ 5 , 6 ] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、  
( R ) - 4 - ( 2 - クロロ - 5 - メトキシベンゾイル - 3 - アミノ - 4 - アミノベンゾイル ) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [ 6 , 4 ] - スピロ - [ 5 , 6 ] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、  
( R ) - 4 - ( 2 - クロロ - 5 - メトキシベンゾイル - 3 - クロロ - 4 - アミノベンゾイル ) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [ 6 , 4 ] - スピロ - [ 5 , 6 ] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、  
( R ) - 4 - ( 2 , 5 - ジクロロベンゾイル - 3 - メトキシ - 4 - アミノベンゾイル ) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [ 6 , 4 ] - スピロ - [ 5 , 6 ] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、  
( R ) - 4 - ( 2 , 5 - ジクロロベンゾイル - 3 - ヒドロキシ - 4 - アミノベンゾイル ) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [ 6 , 4 ] - スピロ - [ 5 , 6 ] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、  
( R ) - 4 - ( 2 , 5 - ジクロロベンゾイル - 4 - アミノベンゾイル ) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [ 6 , 4 ] - スピロ - [ 5 , 6 ] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、  
( R ) - 4 - ( 2 , 5 - ジクロロベンゾイル - 3 - アミノ - 4 - アミノベンゾイル ) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [ 6 , 4 ] - スピロ - [ 5 , 6 ] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、および  
( R ) - 4 - ( 2 , 5 - ジクロロベンゾイル - 3 - クロロ - 4 - アミノベンゾイル ) - 4 - アザ - 3' - (カルボキシ) - [ 6 , 4 ] - スピロ - [ 5 , 6 ] - ベンゾウンデセ - 2' - エン、

から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 1 3】

化合物 6 および化合物 7 から選択される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 1 4】

化合物 7 の式で表される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 1 5】

化合物 6 の式で表される請求項 1 記載の化合物。

【請求項 1 6】

請求項 1 記載の化合物および薬学的に受け入れられる担体を含んで成る薬剤組成物。

【請求項 1 7】

化合物が請求項 5、8、9、10、13、14 または 15 から選択される請求項 1 6 記載の薬剤組成物。

【請求項 1 8】

有効成分として、請求項 1 記載の式 I で表される化合物を含んでなるバソプレシン受容体活性に関連した病気に苦しんでいる被験体を治療するための製薬学的製剤。

【請求項 19】

有効成分として、請求項 1 記載の式 I で表される化合物を含んでなるバソプレシン受容体活性に関連した病気の発病または進行を抑制するための製薬学的製剤。

【請求項 20】

病気が内耳疾患、高血圧、うっ血性心不全、心不全、冠状血管痙攣、心臓虚血、肝硬変、腎血管痙攣、腎不全、糖尿病性腎症、低ナトリウム血症、脳水腫、脳虚血、卒中、血栓症、水うっ滞、攻撃性、強迫神経症、月経困難症、ネフローゼ症候群、不安および中枢神経損傷から選択される請求項 18 または 19 記載の製剤。

【請求項 21】

病気がうっ血性心不全または心不全である請求項 20 記載の製剤。

【請求項 22】

病気が低ナトリウム血症である請求項 20 記載の製剤。

【請求項 23】

病気が高血圧である請求項 20 記載の製剤。

【請求項 24】

化合物を請求項 5、8、9、10、13、14 または 15 から選択する請求項 20 記載の製剤。

【請求項 25】

請求項 1 記載化合物のいずれかと薬学的に受け入れられる担体を混合することを含んで成る薬剤組成物製造方法。