

【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 1 月 5 日 (2006.1.5)

【公表番号】特表 2001-512103 (P2001-512103A)

【公表日】平成 13 年 8 月 21 日 (2001.8.21)

【出願番号】特願 2000-505130 (P2000-505130)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/82 (2006.01)

A 6 1 K 31/455 (2006.01)

A 6 1 P 7/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 213/82

A 6 1 K 31/455

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成 17 年 7 月 4 日 (2005.7.4)

【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

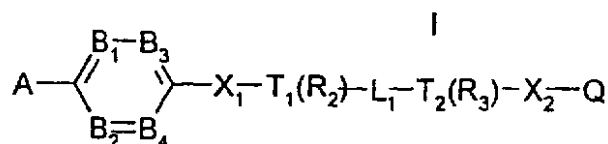
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 式 I の化合物およびそれらの薬学的に受容可能な塩：

【化 1】



ここで：

A は、必要に応じて置換した 5 員または 6 員の単環式芳香環であり、該芳香環は、酸素原子、窒素原子およびイオウ原子から選択される 1 個、2 個または 3 個の環ヘテロ原子を含有する；

B₁、B₂、B₃ および B₄ は、独立して、CH または窒素原子であり、ここで、B₁、B₂、B₃ および B₄ から形成された環は、必要に応じて、置換され得る；但し、B₁、B₂、B₃ および B₄ の少なくとも 1 個は、窒素である；

T₁ は、CH または N である；

T₂ は、CH または N である；

但し、T₁ および T₂ の少なくとも 1 個は、N である；

X₁ は、T₁ が CH または N のとき、SO、SO₂、C(R₄)₂ または CO である；または、さらに、X₁ は、T₁ が CH のとき、O または S である；ここで、各 R₄ は、独立して、水素または (1 - 4 C) アルキルである；

L₁ は、(1 - 4 C) アルキレンまたは (1 - 3 C) アルキレンカルボニルである；

R₂ は、水素または (1 - 4 C) アルキルである；

R₃ は、水素または (1 - 4 C) アルキルである；

または R₂ および R₃ は、結合して、C₁₋₄ アルキレン基または -CH₂CO- 基を形成す

る；ここで、 T_1 、 R_2 、 R_3 、 T_2 および L_1 により形成される環は、必要に応じて、置換されている；

X_2 は、 $S(O)_y$ 、 $C(R^5)_2$ または CO であり、ここで、 y は、1または2である；そして各 R^5 は、水素または C_{1-4} アルキルである；

Q は、フェニル、ナフチル、フェニル(1-4C)アルキル、フェニル(2-4C)アルケニル、フェニル(2-4C)アルキニルまたは複素環部分であり、該複素環部分は、窒素、酸素およびイオウから選択される4個までの環ヘテロ原子を含有し、そして Q は、必要に応じて、置換されている。

【請求項2】 Q が、置換されていないか、または以下から選択される1個、2個または3個の置換基により置換されているか、いずれかである、請求項1に記載の式Iの化合物：ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、トリフルオロメタンスルホニル、カルボキシ、カルバモイル、(1-4C)アルキル、(2-4C)アルケニル、(2-4C)アルキニル、(1-4C)アルコキシ、(2-4C)アルケニルオキシ、(2-4C)アルキニルオキシ、(1-4C)アルキルチオ、(1-4C)アルキルスルフィニル、(1-4C)アルキルスルホニル、(1-4C)アルキルアミノ、ジ-(1-4C)アルキルアミノ、(1-4C)アルコキシカルボニル、 N -(1-4C)アルキルカルバモイル、 N 、 N -ジ-(1-4C)アルキルカルバモイル、(2-4C)アルカノイル、(2-4C)アルカノイルアミノ、ヒドロキシ-(1-4C)アルキル、(1-4C)アルコキシ-(1-4C)アルキル、カルボキシ-(1-4C)アルキル、(1-4C)アルコキシカルボニル-(1-4C)アルキル、カルバモイル-(1-4C)アルキル、 N -(1-4C)アルキルカルバモイル-(1-4C)アルキル、 N 、 N -ジ-(1-4C)アルキルカルバモイル-(1-4C)アルキル、フェニル、ヘテロアリール、フェノキシ、フェニルチオ、フェニルスルフィニル、フェニルスルホニル、ベンジル、ベンゾイル、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールチオ、ヘテロアリールスルフィニルおよびヘテロアリールスルホニル：ここで、該ヘテロアリール置換基、またはヘテロアリール含有置換基中のヘテロアリール基は、5員または6員の単環式ヘテロアリール環を含有し、該ヘテロアリール環は、窒素、酸素およびイオウから選択される3個までのヘテロ原子を含有し、そしてここで、該フェニル、ヘテロアリール、フェノキシ、フェニルチオ、フェニルスルフィニル、フェニルスルホニル、ヘテロアリールオキシ、ヘテロアリールチオ、ヘテロアリールスルフィニル、ヘテロアリールスルホニル、ベンジルまたはベンゾイル置換基は、必要に応じて、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、ヒドロキシ、アミノ、ニトロ、カルボキシ、カルバモイル、(1-4C)アルキル、(1-4C)アルコキシ、(1-4C)アルキルアミノ、ジ-(1-4C)アルキルアミノ、(1-4C)アルコキシカルボニル、 N -(1-4C)アルキルカルバモイル、 N 、 N -ジ-(1-4C)アルキルカルバモイルおよび(2-4C)アルカノイルアミノから選択される1個、2個または3個の置換基を有する。

【請求項3】 T_1 、 T_2 、 L_1 、 R_2 および R_3 により形成される任意の環が、置換されていないか、またはヒドロキシ、オキソ、カルボキシ、(1-4C)アルコキシカルボニルまたは以下の1個から選択される1個または2個の置換基により置換されているか、いずれかである、請求項1または2のいずれかに記載の式Iの化合物：

$-(CH_2)_n-R$ 、 $-(CH_2)_n-NRR_1$ 、 $-CO-R$ 、 $-CO-NRR_1$ 、 $-(CH_2)_n-CO-R$ および $-(CH_2)_n-CO-NRR_1$ ；

ここで、 n は、1または2である；

R および R_1 は、独立して、水素、(1-4C)アルキル、(2-4C)アルケニル、(2-4C)アルキニル、ヒドロキシ(1-4C)アルキル、カルボキシ(1-4C)アルキルおよび(1-4C)アルコキシカルボニル(1-4C)アルキルから選択されるか、または可能な R および R_1 は、一緒になって、5員または6員の必要に応じて置換した複素環を形成し得、該複素環は、 R および R_1 が結合した窒素原子に加えて、窒素、酸素およびイオウから選択される1個または2個の追加のヘテロ原子を含有し得る。

【請求項4】 X_1 が、 CO である、前出の請求項のいずれかに記載の式Iの化合物

。

【請求項 5】 X_2 が、 SO_2 である、前出の請求項のいずれかに記載の式 I の化合物

。

【請求項 6】 医療で使用される、前出の請求項のいずれかに記載の式 I の化合物。

【請求項 7】 第 X a 因子媒介疾患または病態を処置するための薬剤の製造における、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物の使用。

【請求項 8】 請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物を含有する製薬組成物。

【請求項 9】 第 X a 因子媒介疾患または病態を処置ための組成物であって、該組成物は、有効量の請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の式 I の化合物を含む、組成物。