

【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17年12月22日(2005.12.22)

【公表番号】特表2004-520435(P2004-520435A)

【公表日】平成16年7月8日(2004.7.8)

【年通号数】公開・登録公報2004-026

【出願番号】特願2002-571486(P2002-571486)

【国際特許分類第7版】

C 0 7 D 211/34

A 6 1 K 31/496

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 43/00

C 0 7 D 211/96

C 0 7 D 401/06

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 409/14

C 0 7 D 413/06

C 0 7 D 413/14

C 0 7 D 417/06

【F I】

C 0 7 D 211/34

A 6 1 K 31/496

A 6 1 P 1/00

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 25/00 1 0 1

A 6 1 P 25/06

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 25/20

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 43/00 1 1 3

C 0 7 D 211/96

C 0 7 D 401/06

C O 7 D 401/14
 C O 7 D 405/14
 C O 7 D 409/14
 C O 7 D 413/06
 C O 7 D 413/14
 C O 7 D 417/06

【手続補正書】

【提出日】平成17年2月1日(2005.2.1)

【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

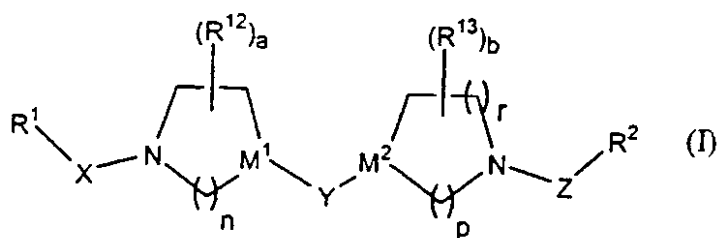
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

以下の式：

【化1】

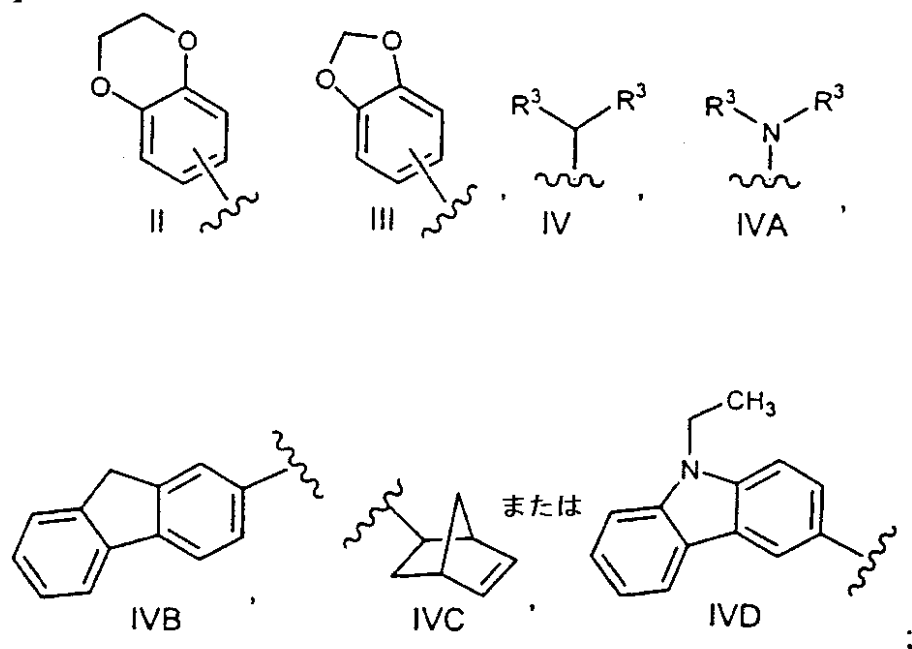


の化合物またはその薬学的に受容可能な塩もしくは溶媒和物であって、ここで：

(A) R^1 が、以下：

- (1) アリール；
- (2) ヘテロアリール；
- (3) ヘテロシクロアルキル；
- (4) アルキル；
- (5) $-C(O)N(R^{4B})_2$ ；
- (6) シクロアルキル；
- (7) アリールアルキル；
- (8) ヘテロアリールヘテロアリール；または
- (9) 以下：

【化 2】



から選択される基から選択され；該アリール、ヘテロアリール、アリールアルキルのアリール部分、式 I I のフェニル環、式 I I I のフェニル環、式 I V B のフェニル環、または式 I V D のフェニル環が、必要に応じて、以下：

- (1) ハロゲン；
- (2) ヒドロキシル；
- (3) 低級アルコキシ；
- (4) $-\text{O}$ アリール；
- (5) $-\text{S R}^{2\ 2}$ ；
- (6) $-\text{C F}_3$ ；
- (7) $-\text{O C F}_3$ ；
- (8) $-\text{O C H F}_2$ ；
- (9) $-\text{N R}^4 \text{ R}^5$ ；
- (10) フェニル；
- (11) N O_2 ；
- (12) $-\text{C O}_2 \text{ R}^4$ ；
- (13) $-\text{C O N}(\text{R}^4)_2$ （ここで、各 R^4 は、同一または異なる）；
- (14) $-\text{S}(\text{O})_2 \text{ R}^{2\ 2}$ ；
- (15) $-\text{S}(\text{O})_2 \text{ N}(\text{R}^{2\ 0})_2$ （ここで、各 $\text{R}^{2\ 0}$ は、同一または異なる）；
- (16) $-\text{N}(\text{R}^{2\ 4}) \text{ S}(\text{O})_2 \text{ R}^{2\ 2}$ ；
- (17) $-\text{C N}$ ；
- (18) $-\text{C H}_2 \text{ O H}$ ；
- (19) $-\text{O C H}_2 \text{ C H}_2 \text{ O R}^{2\ 2}$ ；
- (20) アルキル；
- (21) 置換フェニル（ここで、該フェニルは、アルキル、ハロゲン、 $-\text{C N}$ 、 $-\text{N O}_2$ 、 $-\text{O C H F}_2$ 、 $-\text{O}$ アルキルから独立して選択される 1～3 個の置換基を有する）；

(22) $-\text{O}$ アルキルアリール（ここで、該アリール基は、必要に応じて、独立して選択される 1～3 個のハロゲンで置換される）；または

- (23) フェニル；

から独立して選択される 1～3 個の置換基で置換され；

(B) X が、アルキルまたは $-\text{S}(\text{O})_2-$ から選択され；

(C) Yが、

(1) 単結合を表すか；または

(2) Yが、 $-C(O)-$ 、 $-C(S)-$ 、 $-(CH_2)_q-$ 、もしくは $-NR^4C(O)-$ から選択され；ただし：

(a) M^1 が、Nであるときに、Yが、 $-NR^4C(O)-$ でなく；そして

(b) Yが、結合であるときに、 M^1 および M^2 が、両方とも炭素であり；

(D) M^1 および M^2 が、CまたはNから独立して選択され；

(E) Zが、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $-SO_2-$ 、 $-C(O)-$ または $-C(O)NR^4$ から選択され；

(F) R^2 が、以下：

(1) NまたはN-Oから独立して選択される1～2個のヘテロ原子を有し、残りの環原子が、炭素である、6員ヘテロアリール環；

(2) 窒素、酸素、または硫黄から選択される1～3個のヘテロ原子を有し、残りの環原子が、炭素である、5員ヘテロアリール環；または

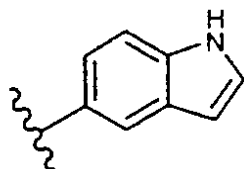
(3) アルキル基；

(4) アリール基（ここで、該置換フェニルが、ハロゲン、 $-O$ アルキル、 $-OCF_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-NHC(O)CH_3$ 、または $-O(CH_2)_qN(R^{10A})_2$ から独立して選択される1～3個の置換基で置換される）；

(5) $-N(R^{11A})_2$ （ここで、各 R^{11A} が、H、アルキルまたはアリールから独立して選択される）；

(6) 以下の式：

【化3】



の基；または

(7) ヘテロアリールヘテロアリール基；

から選択され；該5員ヘテロアリール環（該(F)(2)）または該6員ヘテロアリール環（該(F)(1)）が、必要に応じて、以下：

(a) ハロゲン；

(b) ヒドロキシ；

(c) 低級アルキル；

(d) 低級アルコキシ；

(e) $-CF_3$ ；

(f) $-NR^4R^5$ ；

(g) フェニル；

(h) $-NO_2$ ；

(i) $-C(O)N(R^4)_2$ （ここで、各 R^4 は、同一または異なる）；

(j) $-C(O)_2R^4$ ；または

(k) ハロゲン、 $-O$ アルキル、 $-OCF_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ もしくは $-O(CH_2)_qN(R^{10A})_2$ から独立して選択される1～3個の置換基で置換されるフェニル；

から選択される1～3個の置換基で置換され；

(G) R^3 が、以下：

(1) アリール；

(2) ヘテロアリール；

(3) ヘテロシクロアルキル；

(4) アルキル；または

(5) シクロアルキル；

から選択され；ここで、該アリール R^3 基または該ヘテロアリール R^3 基が、必要に応じて、以下：

(a) ハロゲン；

(b) ヒドロキシル；

(c) 低級アルコキシ；

(d) $-O$ アリール；

(e) $-SR^{22}$ ；

(f) $-CF_3$ ；

(g) $-OCF_3$ ；

(h) $-OCHF_2$ ；

(i) $-NR^4R^5$ ；

(j) フェニル；

(k) $-NO_2$ ；

(l) $-CO_2R^4$ ；

(m) $-CON(R^4)_2$ （ここで、各 R^4 は、同一または異なる）；

(n) $-S(O)_2R^{22}$ ；

(o) $-S(O)_2N(R^{20})_2$ （ここで、各 R^{20} は、同一または異なる）；

(p) $-N(R^{24})S(O)_2R^{22}$ ；

(q) $-CN$ ；

(r) $-CH_2OH$ ；

(s) $-OCH_2CH_2OR^{22}$ ；または

(t) アルキル；

から独立して選択される 1～3 個の置換基で置換され；

(H) R^4 が、以下：

(1) 水素；

(2) $C_1 \sim C_6$ アルキル；

(3) シクロアルキル；

(4) シクロアルキルアルキル；

(5) ヘテロシクロアルキルアルキル；

(6) 架橋二環式シクロアルキル環；

(7) アリール環に結合した融合ヘテロシクロアルキル環を有する該アリール；

(8) アリール；

(9) アリールアルキル；

(10) アルキルアリール；

(11) $-(CH_2)_dCH(R^{12A})_2$ （ここで、 d は、1～3 であり、そして各 R^{12A} は、フェニルまたは置換フェニルから独立して選択され、該置換フェニルは、ハロゲン、 $-O$ アルキル、 $-OCF_3$ 、 $-CF_3$ 、 $-CN$ 、または $-NO_2$ から独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されている）；

(12) ヘテロシクロアルキルヘテロアリール；または

(13) $-(C_1 \sim C_6)$ アルキレン- $O-R^{22}$ ；

から選択され；ここで、該アリール R^4 基、該アリールアルキル R^4 基のアリール部分、または該アルキルアリール R^4 基のアリール部分は、必要に応じて、以下：

(a) ハロゲン；

(b) ヒドロキシル；

(c) 低級アルキル；

(d) 低級アルコキシ；

(e) $-CF_3$ ；

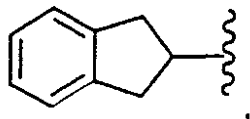
(f) $-N(R^{20})(R^{24})$ ；

- (g) フェニル；
 (h) $-\text{NO}_2$ ；
 (i) $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{20})_2$ （ここで、各 R^{20} は、同一または異なる）；
 (j) $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{22}$ ；
 (i) $-(\text{CH}_2)_k$ -シクロアルキル；
 (j) $-(\text{CH}_2)_q$ -アリール；または
 (k) $-(\text{CH}_2)_m-\text{OR}^{22}$ ；

から独立して選択される 1～3 個の置換基で置換され；

(I) 各 R^{4B} が、H、ヘテロアリール、アルキル、アルケニル、以下の式：

【化 4】



の基、アリールアルキル、またはアリール部分がハロゲンから独立して選択される 1～3 個の置換基で置換されたアリールアルキルから独立して選択され；

(J) R^5 は、水素、 $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{20}$ 、 $-\text{C}(\text{O})_2\text{R}^{20}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^{20})_2$ （ここで、各 R^{20} は、同一または異なる）から選択され；

(K) 各 R^{10A} が、Hもしくは $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキルから独立して選択されるか、または各 R^{10A} が、これらを結合する窒素原子と一緒にあって、4～7員のヘテロシクロアルキル環を形成し；

(L) R^{12} が、

(1) アルキル、ヒドロキシル、アルコキシ、もしくはフルオロ（ただし、 R^{12} が、ヒドロキシまたはフルオロである場合、 R^{12} が、窒素に隣接する炭素に結合していない）から選択されるか；または

(2) R^{12} が、1つの環炭素から別の環炭素へとアルキル架橋を形成し；

(M) R^{13} が、

(1) アルキル、ヒドロキシル、アルコキシ、もしくはフルオロ（ただし、 R^{13} が、ヒドロキシまたはフルオロである場合、 R^{13} が、窒素に隣接する炭素に結合していない）から選択されるか；または

(2) R^{13} が、1つの環炭素から別の環炭素へとアルキル架橋を形成し；

(N) R^{20} が、水素、アルキル、またはアリールから選択され、ここで、該アリール基が、必要に応じて、ハロゲン、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、ヒドロキシル、もしくはメトキシから独立して選択される 1～3 個の基で置換されるか；または 2つの R^{20} 基が、存在する場合、該 2つの R^{20} 基は、これらを結合する窒素原子と一緒にあって 5員ヘテロ環式環もしくは 6員ヘテロ環式環を形成し；

(O) R^{22} が、ヘテロシクロアルキル、アルキル、またはアリールから選択され、ここで、該アリール基が、必要に応じて、ハロゲン、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、ヒドロキシル、またはメトキシから独立して選択される 1～3 個の基で置換され；

(P) R^{24} が、水素、アルキル、 $-\text{SO}_2\text{R}^{22}$ 、またはアリールから選択され、ここで、該アリール基が、必要に応じて、ハロゲン、 $-\text{CF}_3$ 、 $-\text{OCF}_3$ 、ヒドロキシル、またはメトキシから独立して選択される 1～3 個の基で置換され；

(Q) a が、0～2であり；

(R) b が、0～2であり；

(S) k が、1～5であり；

(T) m が、2～5であり；

(U) n が、1、2または 3（ただし、 M^1 が、Nであるときに、n が、1でない）であり；

(V) p が、1、2または 3（ただし、 M^2 が、Nであるときに、p が、1でない）で

あり；

(W) q が、1～5であり；そして

(X) r が、1、2、または3（ただし、r が、2または3であるときに、 M^2 が、Cであり、そしてp が、1である）である、
化合物。

【請求項2】

以下：化合物18、25、26、31、33、37、41、45、49、51、52、57、58～67、73～84、89～157、159～168、212～269、271～272、276～282、284、285、287～300、306、309～319、321～336、338～340、342～349、351～361、363～371、374～377、380～383、387～390、392～406、および408～410から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

有効量の請求項1に記載の化合物および薬学的に有効なキャリアを含む、薬学的組成物。

【請求項4】

請求項1に記載の化合物の使用であって、以下：

アレルギー、アレルギー誘導性気道応答、うっ血、低血圧、心臓血管疾患、低血圧、GI管の疾患、胃腸管の過剰運動性および低運動性ならびに過剰酸分泌および低酸分泌、肥満、睡眠障害、中枢神経系の障害、注意欠陥過活動性障害、中枢神経系の低活動および過剰活動、アルツハイマー病、精神分裂病ならびに片頭痛を処置する薬の製造のための、使用。