

【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11月17日(2005.11.17)

【公表番号】特表2005-508382(P2005-508382A)

【公表日】平成17年3月31日(2005.3.31)

【年通号数】公開・登録公報2005-013

【出願番号】特願2003-542147(P2003-542147)

【国際特許分類第7版】

C 0 7 C 237/40

A 6 1 K 31/166

A 6 1 K 31/4409

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 27/00

A 6 1 P 27/06

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

C 0 7 C 231/12

C 0 7 D 213/38

C 0 7 D 213/89

【F I】

C 0 7 C 237/40

A 6 1 K 31/166

A 6 1 K 31/4409

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/10 1 0 1

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 27/00

A 6 1 P 27/06

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

C 0 7 C 231/12

C 0 7 D 213/38

C 0 7 D 213/89

【手続補正書】

【提出日】平成16年4月23日(2004.4.23)

【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

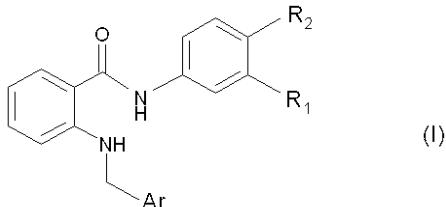
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I：

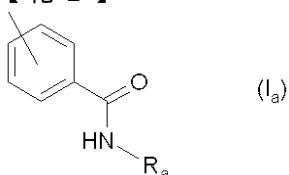
【化1】



[式中、

Arは部分構造式I_a；

【化2】



(式中、R_aはHまたは低級アルキルである。)

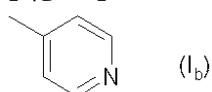
で示され；そして

R₁はHまたはペルフルオロ低級アルキルを示し；そして

R₂はH、ハロゲン、C₂～C₇アルキル、C₂～C₇アルケニルまたは低級アルキニルを示すか；または

Arは部分構造式I_b：

【化3】



で示され；そして

R₁はペルフルオロ低級アルキルを示し；そして

R₂は臭素、ヨウ素、C₂～C₇アルキル、C₂～C₇アルケニルまたは低級アルキニルを示すか；あるいは

R₁はHを示し；そして

R₂はフッ素、臭素、ヨウ素、エチル、C₅～C₇アルキル、C₂～C₇アルケニルまたは低級アルキニルを示す。]

で示されるアントラニル酸アミド

またはそのN-オキシドまたは互変異性体、

あるいはそのアントラニル酸アミドの塩、そのN-オキシドまたはその互変異性体。

【請求項2】

式I[式中、

Arは部分構造式I_a（式中R_aはHまたは低級アルキルである。）で示され；そして

R₁はHまたはトリフルオロメチルを示し；そして

R₂はH、ハロゲン、C₂～C₇アルキル、C₂～C₇アルケニルまたは低級アルキニルを示すか；または

Arは部分構造式I_bで示され；そして

R₁はトリフルオロメチルを示し；そして

R_2 は臭素、ヨウ素、 $C_2 \sim C_7$ アルキル、 $C_2 \sim C_7$ アルケニルまたは低級アルキニルを示すか；あるいは

R_1 は H を示し；そして

R_2 はフッ素、臭素、ヨウ素、エチル、 $C_5 \sim C_7$ アルキル、 $C_2 \sim C_7$ アルケニルまたは低級アルキニルを示す。]

で示されるアントラニル酸アミド

またはその N - オキシドまたは互変異性体

あるいはそのアントラニル酸アミドの塩、その N - オキシドまたはその互変異性体である請求項 1 に記載のアントラニル酸アミド。

【請求項 3】

式 I [式中、

A_r は部分構造式 I_a (式中、 R_a は H または低級アルキルを示す。) で示される；

R_1 は H またはトリフルオロメチルを示し；そして

R_2 は H、ハロゲン、 $C_2 \sim C_7$ アルキル、 $C_2 \sim C_7$ アルケニルまたは低級アルキニルを示す。]

で示されるアントラニル酸アミド

またはその互変異性体

あるいはそのアントラニル酸アミドの塩またはその互変異性体

である請求項 1 または 2 に記載のアントラニル酸アミド。

【請求項 4】

式 I [式中、

A_r は部分構造式 I_b で示される；

R_1 はトリフルオロメチルを示し；そして

R_2 は臭素、ヨウ素、 $C_2 \sim C_7$ アルキル、 $C_2 \sim C_7$ アルケニルまたは低級アルキニルを示すか；または

R_1 は H を示し；そして

R_2 はフッ素、臭素、ヨウ素、エチル、 $C_5 \sim C_7$ アルキル、 $C_2 \sim C_7$ アルケニルまたは低級アルキニルを示す。]

で示されるアントラニル酸アミド

またはその N - オキシドまたは互変異性体

あるいはそのアントラニル酸アミドの塩またはその N - オキシドまたはその互変異性体である請求項 1 または 2 に記載のアントラニル酸アミド。

【請求項 5】

式 I [式中、

A_r は部分構造式 I_b で示される；

R_1 はトリフルオロメチルを示し；そして

R_2 は臭素、プロピル、プロペニルまたはプロピニルを示すか；あるいは

R_1 は H を示し；そして

R_2 はフルオロ、臭素、プロペニルまたはプロピニルを示す；

で示されるアントラニル酸アミド

またはその N - オキシドまたは互変異性体

あるいはそのアントラニル酸アミドの塩またはその N - オキシドまたは互変異性体である請求項 4 に記載のアントラニル酸アミド。

【請求項 6】

式 I [式中、

A_r は部分構造式 I_b の N - オキシドで示される；

R_1 はトリフルオロメチルを示し；そして

R_2 は臭素、プロピル、プロペニルまたはプロピニルを示す；

で示されるアントラニル酸アミド

またはその互変異性体

あるいはそのアントラニル酸アミドの塩またはその互変異性体である請求項4に記載のアントラニル酸アミド。

【請求項7】

2-[4-(ピリジニルメチル)アミノ-N-[4-(プロモ-3-(トリフルオロメチル)フェニル)-ベンズアミド]、

2-[4-(ピリジニルメチル)アミノ-N-(4-プロモフェニル)-ベンズアミド、

2-[3-[[(メチルアミノ)カルボニル]-フェニル]メチル]アミノ-N-[3-(トリフルオロメチル)フェニル]-ベンズアミド、

2-[4-(ピリジニルメチル)アミノ-N-[4-(1-プロピニル)-3-(トリフルオロメチル)フェニル]ベンズアミド、

2-[4-(ピリジニルメチル)アミノ-N-[4-(1-プロピニル)フェニル]-ベンズアミド、

2-[4-(ピリジニルメチル)アミノ-N-[4-[-(Z)-1-プロペニル]-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-ベンズアミド塩酸塩、

2-[4-(ピリジニルメチル)アミノ-N-[4-(1-プロピル)-3-(トリフルオロメチル)フェニル]-ベンズアミド、

N-(4-クロロ-3-トリフルオロメチル-フェニル)-2-[-(1-オキシ-ピリジン-4-イルメチル)-アミノ]-ベンズアミド、および

N-(4-フルオロ-3-トリフルオロメチル-フェニル)-2-[-(1-オキシ-ピリジン-4-イルメチル)-アミノ]-ベンズアミド、

から選択される式Iで示されるアントラニル酸アミド

またはそのN-オキシドまたはその互変異性体

あるいはこのアントラニル酸アミドの塩、そのN-オキシドまたはその互変異性体である請求項1に記載のアントラニル酸アミド。

【請求項8】

ヒトまたは動物体の処置法に使用する式Iで示されるアントラニル酸アミドまたはそのN-オキシドまたは互変異性体、またはこの化合物の医薬的に許容される塩である請求項1~7のいずれかに記載のアントラニル酸アミド。

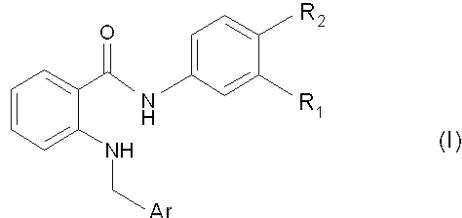
【請求項9】

請求項1~7のいずれかに記載の式Iで示されるアントラニル酸アミドまたはそのN-オキシドまたは互変異性体またはその化合物の医薬的に許容される塩またはその水和物または溶媒和物および医薬的に許容される担体少なくとも1種を含んでなる医薬調製物。

【請求項10】

式I:

【化4】

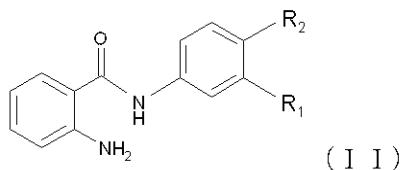


[式中、R₂は水素またはハロゲンを示す；残りの記号R₁およびArは請求項1で定義の通りである。]

で示されるアントラニル酸アミドの製法であって、

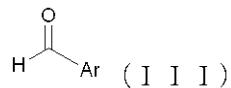
式II:

【化5】



[式中、R₁およびR₂は式Iについて前記定義した通りである。]で示される化合物と式III：

【化6】



[式中、Arは式Iで示される化合物について前記に定義した通りである。]で示されるカルボニル化合物とを還元剤の存在下に反応させる工程；ただし

ここに、式IIおよびIIIで示される出発化合物は必要なら官能基が保護された形で存在していてもよくおよび／または塩形成基が存在し、および塩型での反応が可能であれば塩型であってもよいものとする；なお

ここに、式Iで示される化合物が保護誘導体であればどの保護基も除去する工程；および

所望であれば、

式Iで示される化合物を式Iで示される別な化合物またはN-オキシドに変換する工程；式Iで示される遊離化合物を塩に変換する工程；

式Iで示される化合物の塩を遊離化合物または他の塩に変換する工程；

および／または

式Iで示される化合物の異性体混合物を個々の異性体に分離する工程；を含む式Iで示されるアントラニル酸アミドの製法。