

【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 07 C 237/40

A 61 K 31/166

A 61 K 31/4409

A 61 P 3/10

A 61 P 9/10

A 61 P 11/06

A 61 P 15/00

A 61 P 17/06

A 61 P 19/02

A 61 P 27/00

A 61 P 27/06

A 61 P 29/00

A 61 P 35/00

A 61 P 35/02

C 07 C 231/12

C 07 D 213/38

C 07 D 213/89

【F I】

C 07 C 237/40

A 61 K 31/166

A 61 K 31/4409

A 61 P 3/10

A 61 P 9/10

A 61 P 9/10 1 0 1

A 61 P 11/06

A 61 P 15/00

A 61 P 17/06

A 61 P 19/02

A 61 P 27/00

A 61 P 27/06

A 61 P 29/00

A 61 P 29/00 1 0 1

A 61 P 35/00

A 61 P 35/02

C 07 C 231/12

C 07 D 213/38

C 07 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

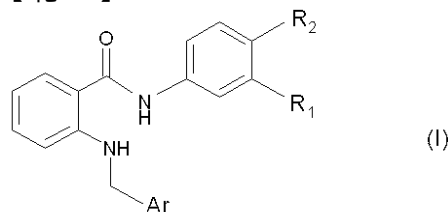
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

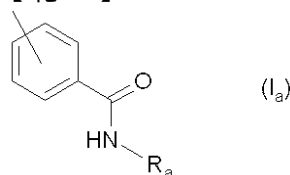
【化 1】



[式中、

A r 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。)

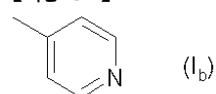
で示され ; そして

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

A r 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、

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

A r 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 - ブロモ - 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 - ブロモフェニル) - 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。

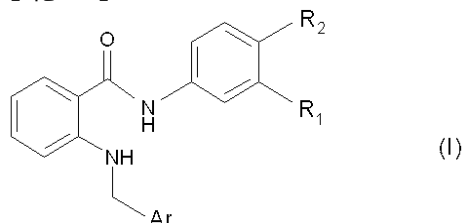
【請求項 9】

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】

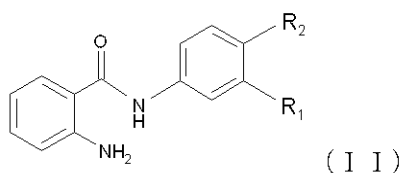


[式中、 R_2 は水素またはハロゲンを示す ; 残りの記号 R_1 および A_r は請求項 1 で定義の通りである。]

で示されるアントラニル酸アミドの製法であって、

式 I I :

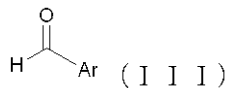
【化 5】



[式中、 R_1 および R_2 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 I I I :

【化 6】



[式中、 A_r 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 I I および I I I 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。