

【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24年11月22日 (2012.11.22)

【公表番号】特表2012-505241 (P2012-505241A)

【公表日】平成24年3月1日 (2012.3.1)

【年通号数】公開・登録公報2012-009

【出願番号】特願2011-531201 (P2011-531201)

【国際特許分類】

C 0 7 D 217/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

C 0 7 D 241/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/495 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/427 (2006.01)

A 6 1 K 31/472 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 217/16

A 6 1 P 25/28

C 0 7 D 417/12 C S P

A 6 1 K 31/496

C 0 7 D 241/08

A 6 1 K 31/495

C 0 7 D 417/14

A 6 1 K 31/427

A 6 1 K 31/472

【手続補正書】

【提出日】平成24年10月5日 (2012.10.5)

【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

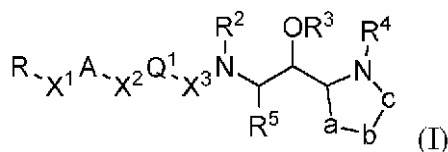
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



〔式中、

a、b 及び c は、任意に置換されていても良いアルキレン、NR₆、W、C(W)、S(O)、S(O)₂ 又はこれらの組み合わせからそれぞれ独立して選択され、ここで W は、O 又は S であり；或いは、a と b、b と c 又は a と c は、結合している原子と一緒にあって、任意に置換されていても良い二環式の環を形成し；但し、a - b - c は、W - W 又は C(W) - W - C(W) を含まず；

Q 1 は、二価炭素環、複素環、不飽和複素環、アリール又はヘテロアリール（それぞれ任意に置換されていても良い）であり；

X 2 は、NR 1、C (O)、S (O)、S (O) 2、NR 1 - C (O)、NR 1 - S (O)、NR 1 - S (O) 2、任意に置換されていても良いアルキレン又は任意に置換されていても良いアルキレンオキシであり；

X 3 は、C (O)、S (O)、S (O) 2 又はCHR 1 であり；

R は、アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、アリールアルキル又はヘテロアリールアルキル（それぞれ任意に置換されていても良い）であり；

X 1 は、任意に置換されていても良いアルキレンであり；

A は、O 又はNR 1 であり；或いはAは窒素原子であって、A及びX 1は一緒になって、任意に置換されていても良い複素環を形成し；

R 1 は、水素、アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール又はヘテロアリールアルキル（それぞれ任意に置換されていても良い）からそれぞれの場合に独立して選択され；

R 2、R 3 及びR 4 は、水素及びプロドラッグ形成基からなる群よりそれぞれの場合に独立して選択され；

R 5 は、アルキル、アルケニル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール又はヘテロアリールアルキル（それぞれ任意に置換されていても良い）であり；

R 6 は、水素、OR 7、S (O) R 7、S (O) 2 R 7、C (O) R 8、C (O) OR 7、C (O) NR 9 R 10、S (O) NR 9 R 10、S (O) 2 NR 9 R 10、アルキル、アルケニル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール又はヘテロアリールアルキル（それぞれ任意に置換されていても良い）であり；

R 7 は、アルキル、アルケニル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール及びヘテロアリールアルキル（それぞれ任意に置換されていても良い）からなる群よりそれぞれの場合に独立して選択され；

R 8 は、水素から、又はアルキル、アルケニル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール及びヘテロアリールアルキル（それぞれ任意に置換されていても良い）からなる群よりそれぞれの場合に独立して選択され；そして

R 9 及びR 10 は、水素から、又はアルキル、アルケニル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール、アルキルスルホニル、アリールスルホニル及びヘテロアリールアルキル（それぞれ任意に置換されていても良い）からなる群よりそれぞれの場合に独立して選択され；或いはR 9、R 10 及び結合している窒素原子は、任意に置換されていても良い複素環を形成する）で示される化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 2】

a が、C (O) 又はアルキレン又はC (O) アルキレン（それぞれ任意に置換されていても良い）である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

b が、任意に置換されていても良いアルキレン、O、S (O)、S (O) 2 又はNR 6 である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

c が、アルキレン又はC (O) アルキレン（それぞれ任意に置換されていても良い）であるか、或いはc が、C (O)、S (O)、S (O) 2 又はNR 6 である、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5】

a がC (O) であり、b がNR 6 であり、c が任意に置換されていても良いアルキレン

であり、そして R 6 が、アリアルアルキル又はアルキルである、請求項 1 , 3 , 又は 4 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6】

a、b 及び c が、結合している原子と一緒に、ピロリジン、オキサゾリジン、イソオキサゾリジン、ピラゾリジン、モルホリン、ピペリジン、ピペラジン、ピペラジノン、テトラヒドロキノリン、テトラヒドロイソキノリン、ホモピペリジン及びホモピペラジン（それぞれ任意に置換されていても良い）からなる群より選択される複素環を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

a が C (O) であり、b が任意に置換されていても良いアルキレンであり、c が N R 6 であり、そして R 6 がアリアルアルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

a 及び b と結合している原子とが、任意に置換されていても良い縮合二環式環を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

b 及び c と結合している原子とが、任意に置換されていても良い縮合二環式環を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

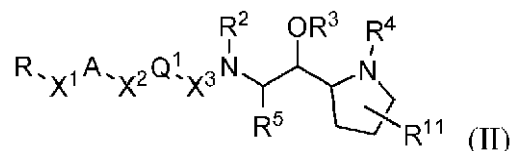
【請求項 10】

a 及び c と結合している原子とが、任意に置換されていても良い二環式環を形成する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

式 (I I) :

【化 2】



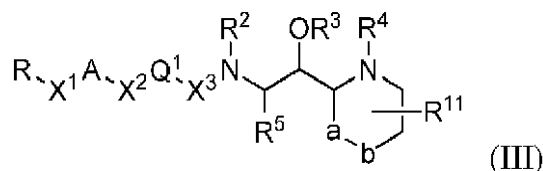
〔式中、

R 1 1 は水素であるか、或いは R 1 1 は、アルキル、アルケニル、ヘテロアルキル、アルコキシ、チオアルキル、ハロアルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリアル、アリアルアルキル、ヘテロアリアル又はヘテロアリアルアルキル（それぞれ任意に置換されていても良い）である〕で示される、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 12】

式 (I I I) :

【化 3】



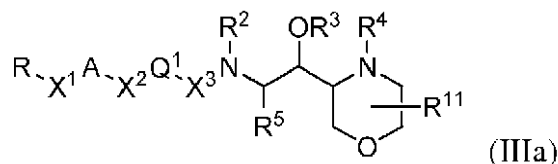
で示される、請求項 1 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 13】

下記の式 (I I I a) ~ (I I I c) のいずれかで示される、請求項 1 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

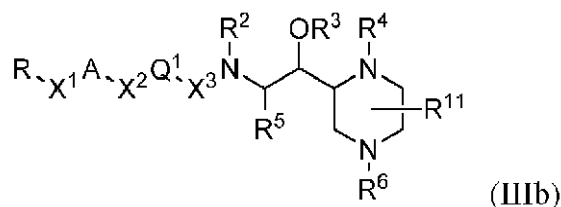
式 (I I I a) :

【化 4】



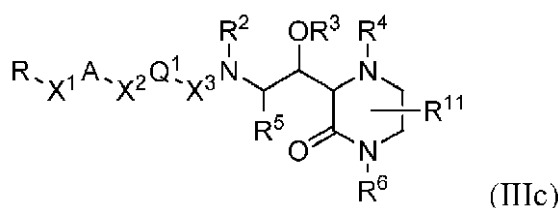
式 (I I I b) :

【化 5】



式 (I I I c) :

【化 6】

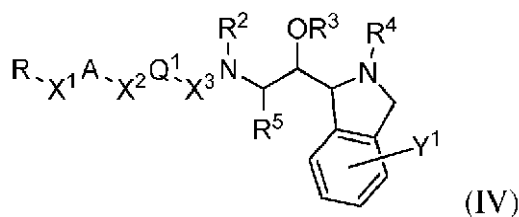


【請求項 1 4】

下記の式 (I V) 又は式 (V) で示される、請求項 1 に記載の化合物、又はその薬学的に許容される塩。

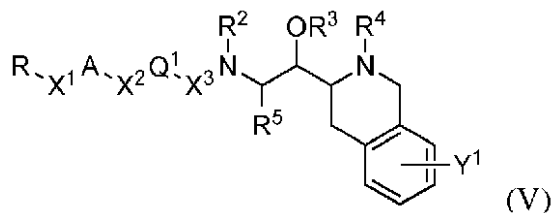
式 (I V) :

【化 7】



式 (V) :

【化 8】



〔式中、

Y 1 は、ヒドロキシ、ハロ、アルコキシ、C (O) - アルキル、C (O) - アリール、C (O) - アルコキシ、C (O) - アミノ、S (O) - アルキル、S (O) 2 - アルキル、S (O) - アリール、S (O) 2 - アリール、アルキル、ヘテロアルキル、シクロアルキル、アルケニル、アミノ、アルキレン - アミノ、アリール、アリールアルキル、ヘテロアリール及びヘテロアリールアルキル (それぞれ任意に置換されていても良い) からなる群よりそれぞれの場合に独立して選択される 1 ~ 3 つの任意の置換基を表す]

【請求項 1 5】

請求項 1 ~ 1 4 に記載の化合物のうちの 1 つ以上を含む、アルツハイマー病を治療する

ための組成物。