

【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 2003-532708 (P2003-532708A)

【公表日】平成 15 年 11 月 5 日 (2003.11.5)

【出願番号】特願 2001-582286 (P2001-582286)

【国際特許分類】

C 07 C 49/395 (2006.01)

A 61 K 31/122 (2006.01)

A 61 K 31/4015 (2006.01)

A 61 K 31/4035 (2006.01)

A 61 K 31/4196 (2006.01)

A 61 K 31/426 (2006.01)

A 61 K 31/433 (2006.01)

A 61 K 31/4439 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 17/06 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

C 07 C 49/597 (2006.01)

C 07 D 207/448 (2006.01)

C 07 D 249/12 (2006.01)

C 07 D 277/20 (2006.01)

C 07 D 277/36 (2006.01)

C 07 D 285/08 (2006.01)

C 07 D 417/12 (2006.01)

C 07 D 209/48 (2006.01)

【 F I 】

C 07 C 49/395

A 61 K 31/122

A 61 K 31/4015

A 61 K 31/4035

A 61 K 31/4196

A 61 K 31/426

A 61 K 31/433

A 61 K 31/4439

A 61 P 3/10

A 61 P 9/10

A 61 P 17/06

A 61 P 25/28

A 61 P 35/00

A 61 P 43/00 1 1 1

C 07 C 49/597

C 07 D 207/448

C 07 D 249/12 5 0 8

C 07 D 277/36

C 07 D 285/08

C 0 7 D 417/12

C 0 7 D 209/48

Z

【手続補正書】

【提出日】平成16年7月27日(2004.7.27)

【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

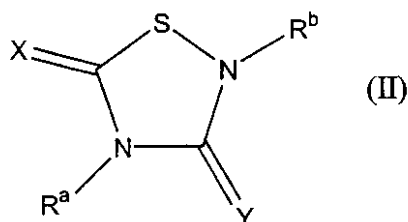
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

G S K - 3 が関与する疾患の治療方法のための製薬組成物の調製における、
一般式 (II) :

【化1】



[式中、

R^a 及び R^b は、水素、アルキル、シクロアルキル、ハロアルキル、アリール、 $-(Z)_n$ -アリール、ヘテロアリール、 $-OR^3$ 、 $-C(O)R^3$ 、 $-C(O)OR^3$ 、 $-(Z)_n-C(O)OR^3$ 、及び $-S(O)_t-$ から個別に選択され、

Z は、 $-C(R^3)(R^4)-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-O-$ 、 $-C(=NR^3)-$ 、 $-S(O)_t-$ 、及び $N(R^3)-$ から個別に選択され；
 n は、0、1、または2であり；

t は、0、1、または2であり；

R^3 及び R^4 は、水素、アルキル、アリール、及び複素環から個別に選択され；並びに

X 及び Y は、 $=O$ 、 $=S$ 、 $=N(R^3)$ 、及び $=C(R^1)(R^2)$ から個別に選択される]

を有する化合物の使用であって、

前記方法が、式 (II) の化合物の有効量をこうした治療を必要とするヒトに投与する工程を含む、前記化合物の使用。

【請求項2】

前記疾患が、アルツハイマー病及びインスリン非依存性糖尿病から選択される、請求項1に記載の使用。

【請求項3】

前記疾患が、癌、組織の形成異常もしくは化生、乾癬、動脈硬化症、または再狭窄などの過剰増殖性疾患である、請求項2に記載の使用。

【請求項4】

式 (II) の化合物において、 R^a 及び R^b が、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール(アルキル、ハロ、及びアルコキシから選択される基により任意に置換されている)、 $-C(R^3)(R^4)$ -アリール(前記アリール部分は、アルキル、ハロ、及びアルコキシから選択される基により任意に置換されている)、 $-OR^3$ 、 $-C(O)OR^3$ 、及び $-C(R^3)(R^4)-C(O)OR^3$ から個別に選択され、

R^3 及び R^4 が、水素、アルキル、及び複素環から個別に選択される、請求項1乃至3のいずれか一項に記載の使用。

【請求項5】

式(II)の化合物において、 R^a 及び R^b が、アルキル、アリール(アルキル、ハロ、及びアルコキシから選択される基により任意に置換されている)、 $-\text{CH}_2$ -アリール(前記アリール部分は、アルキル、ハロ、及びアルコキシから選択される基により任意に置換されている)、及び $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ から個別に選択され、 R^3 が水素またはアルキルである、請求項4に記載の使用。

【請求項6】

式(II)の化合物において、 R^a 及び R^b が、メチル、エチル、プロピル、ベンジル、フェニル(メチル、フルオロ、クロロ、プロモ、及びメトキシから選択される基によって任意に置換されている)、及び $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{O}$ -エチルから個別に選択される、請求項4に記載の使用。

【請求項7】

式(II)の化合物において、 X 及び Y が、 $=\text{O}$ 、 $=\text{S}$ 、及び $=\text{NR}^3$ (式中 R^3 は複素環である)から個別に選択される、請求項1、2、または3に記載の使用。

【請求項8】

式(II)の化合物において、 X が、 $=\text{O}$ である、請求項7に記載の使用。

【請求項9】

式(II)の化合物において、 X が $=\text{O}$ であり、 Y が $=\text{O}$ である、請求項8に記載の使用。

【請求項10】

式(II)の化合物において、 R^a 及び R^b が、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール(アルキル、ハロ、及びアルコキシから選択される基により任意に置換されている)、 $-\text{C}(\text{R}^3)(\text{R}^4)$ -アリール(前記アリール部分は、アルキル、ハロ、及びアルコキシから選択される基により任意に置換されている)、 $-\text{OR}^3$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ 、及び $-\text{C}(\text{R}^3)(\text{R}^4)-\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ から個別に選択され、 R^3 及び R^4 が、水素、アルキル、及び複素環から個別に選択され、 X 及び Y が、 $=\text{O}$ 、 $=\text{S}$ 、及び $=\text{NR}^3$ から個別に選択される、請求項1、2、または3に記載の使用。

【請求項11】

R^a 及び R^b が、水素、アルキル、シクロアルキル、アリール(アルキル、ハロ、及びアルコキシから選択される基により任意に置換されている)、 $-\text{C}(\text{R}^3)(\text{R}^4)$ -アリール(前記アリール部分は、アルキル、ハロ、及びアルコキシから選択される基により任意に置換されている)、 $-\text{OR}^3$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ 、及び $-\text{C}(\text{R}^3)(\text{R}^4)-\text{C}(\text{O})\text{OR}^3$ から個別に選択され、 R^3 及び R^4 が、水素及びアルキルから個別に選択され、 X が $=\text{O}$ である、請求項10に記載の使用。

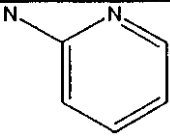
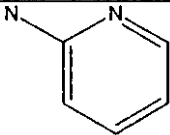
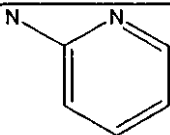
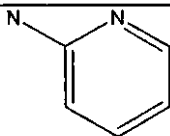
【請求項12】

R^a 及び R^b が、メチル、エチル、プロピル、ベンジル、フェニル(メチル、フルオロ、クロロ、プロモ、及びメトキシから選択される基によって任意に置換されている)、及び $-\text{CH}_2-\text{C}(\text{O})\text{O}$ -エチルから個別に選択され；
 X が $=\text{O}$ であり；
 Y が $=\text{O}$ である、
 請求項11に記載の使用。

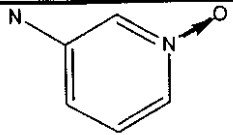
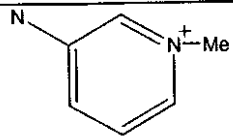
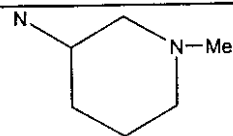
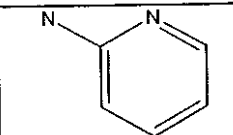
【請求項13】

式(II)の化合物が、以下の選択肢：

【表1A】

R ^a	R ^b	X	Y
CH ₂ Ph	Me	O	O
Et	Me	O	O
Et	nPr	O	O
Et	シクロヘキシル	O	O
Ph	Me	O	O
CH ₂ CO ₂ Et	Me	O	O
4-OMePh	Me	O	O
CH ₂ Ph	Et	O	O
Et	iPr	O	O
CH ₂ Ph	Et	O	S
CH ₂ Ph	CH ₂ Ph	O	S
Ph	Ph	O	S
Et	Et	O	S
シクロヘキシル	Me	O	O
4-MePh	Me	O	O
4-BrPh	Me	O	O
4-FPh	Me	O	O
4-ClPh	Me	O	O
Et	Me		O
Et	Et		O
Et	H		O
Me	Me		O

【表 1 B】

Et	Me		O
Et	Me		O
Et	Me		O
Et	Me		S

の一つに合致する、請求項 1 乃至 3 のいずれか一項に記載の使用。

【請求項 1 4】

式 (II) の化合物が、以下の選択肢：

【表 2】

R ^a	R ^b	X	Y
CH ₂ Ph	Me	O	O
Et	Me	O	O
Ph	Me	O	O
CH ₂ CO ₂ Et	Me	O	O
4-OMePh	Me	O	O
4-MePh	Me	O	O
4-BrPh	Me	O	O
4-FPh	Me	O	O
4-ClPh	Me	O	O
CH ₂ Ph	CH ₂ Ph	O	S
Ph	Ph	O	S

の一つに合致する、請求項 1 3 に記載の使用。

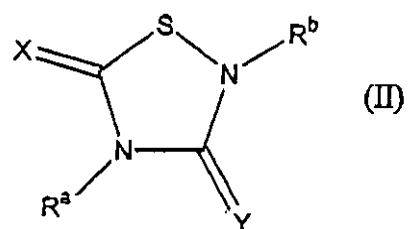
【請求項 1 5】

請求項 1 乃至 1 4 のいずれか一項に定義される式 (II) の化合物を、活性成分として含む製薬製剤。

【請求項 1 6】

一般式 (II)：

【化 2】



を有し、以下：

【表 3】

R ^a	R ^b	X	Y
CH ₂ Ph	Me	O	O
CH ₂ CO ₂ Et	Me	O	O
4-OMePh	Me	O	O
4-MePh	Me	O	O
4-BrPh	Me	O	O
4-FPh	Me	O	O
4-ClPh	Me	O	O
CH ₂ Ph	CH ₂ Ph	O	S
Ph	Ph	O	S

のいずれか一つである、化合物。