

【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 1 月 27 日 (2005.1.27)

【公表番号】特表 2004-509839 (P2004-509839A)

【公表日】平成 16 年 4 月 2 日 (2004.4.2)

【年通号数】公開・登録公報 2004-013

【出願番号】特願 2001-580904 (P2001-580904)

【国際特許分類第 7 版】

C 07 D 405/06

A 61 K 31/506

A 61 K 31/695

A 61 P 31/00

A 61 P 31/04

C 07 D 409/14

C 07 D 491/107

C 07 D 493/10

【F I】

C 07 D 405/06

A 61 K 31/506

A 61 K 31/695

A 61 P 31/00

A 61 P 31/04

C 07 D 409/14

C 07 D 491/107

C 07 D 493/10

C

【手続補正書】

【提出日】平成 14 年 12 月 9 日 (2002.12.9)

【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

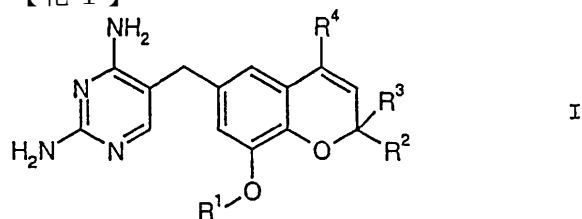
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 (I) :

【化 1】



〔式中、

R^1 は、アルキル又はシクロアルキルアルキルを表し、

R^2 及び R^3 は、それぞれ独立にアルキル又はシクロアルキルを表すか、あるいは隣接した炭素原子と一緒に、飽和の 3 員～6 員の炭素環又は複素環を表し（アルキル、シクロアルキル、炭素環又は複素環は、非置換であるか、又は置換されている）、そして

R^4 は、水素、ハロゲン、シアノ、アルキル、アルキルチオ、アルケニル、アルキニル、

ヒドロキシアルキル、ヒドロキシアルキニル、アルコキシアルキル、アルコキシアルキニル、トリアルキルシリル、アリール又はヘテロアリールを表す〕で示される置換クロメン誘導体、及びこれらの化合物の薬学的に許容しうる塩。

【請求項 2】

R^1 が、メチル又はエチルである、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

R^2 及び R^3 のそれぞれが、メチルである、請求項 1 又は 2 記載の化合物。

【請求項 4】

R^2 及び R^3 が、隣接した炭素原子と一緒に、シクロブチル又はテトラヒドロピラニルを表す、請求項 1 又は 2 記載の化合物。

【請求項 5】

R^4 が、臭素である、請求項 1～4 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 6】

R^4 が、メチルチオである、請求項 1～4 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 7】

5-(4-ブromo-8-メトキシ-2, 2-ジメチル-2H-クロメン-6-イルメチル)-ピリミジン-2, 4-ジアミン、

5-[(4-ブromo-2', 3', 5', 6'-テトラヒドロ-8-メトキシスピロ[2H-1-ベンゾピラン-2, 4'-[4H]ピラン]-6-イル)-メチル]-2, 4-ピリミジンジアミン、

5-(8-エトキシ-2, 2, 4-トリメチル-2H-クロメン-6-イルメチル)-ピリミジン-2, 4-ジアミン、

5-(4-クロロ-8-メトキシ-2, 2-ジメチル-2H-クロメン-6-イルメチル)-ピリミジン-2, 4-ジアミン、

5-(8-エトキシ-4-エチル-2, 2-ジメチル-2H-クロメン-6-イルメチル)-ピリミジン-2, 4-ジアミン、

5-(8-メトキシ-2, 2-ジメチル-4-メチルスルファニル-2H-クロメン-6-イルメチル)-ピリミジン-2, 4-ジアミン、

5-(8-エトキシ-2, 2-ジメチル-4-プロピル-2H-クロメン-6-イルメチル)-ピリミジン-2, 4-ジアミン、

5-[8-メトキシ-4-(3-メトキシプロパー-1-イニル)-2, 2-ジメチル-2H-クロメン-6-イルメチル]-ピリミジン-2, 4-ジアミン、

5-[4-(4-フルオロフェニル)-8-メトキシ-2, 2-ジメチル-2H-クロメン-6-イルメチル]-ピリミジン-2, 4-ジアミン、

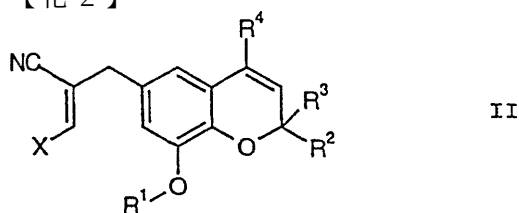
5-[(4-ブromo-8-エトキシスピロ[2H-1-ベンゾピラン-2, 1'-シクロブタン]-6-イル)メチル]-2, 4-ピリミジンジアミン、

5-(4-ブromo-8-エトキシ-2, 2-ジメチル-2H-クロメン-6-イルメチル)-ピリミジン-2, 4-ジアミンから選択される、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 8】

一般式 (I I) :

【化 2】



〔式中、 $R^1 \sim R^4$ は、請求項 1 と同義であり、そして X は、離脱基、好ましくは臭素、ヨウ素、メチルスルホニルオキシ、トリフルオロメチルスルホニルオキシ、フェニルスルホニルオキシ又は p-トリルスルホニルオキシである（ここで、官能基は、場合により保

護されている)] で示される化合物。

【請求項 9】

請求項 1～7 のいずれか 1 項記載の化合物及び治療上不活性な担体を含む、医薬。

【請求項 10】

更にスルホンアミドを含む、請求項 9 記載の医薬。

【請求項 11】

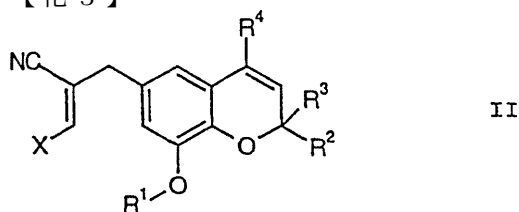
化合物対スルホンアミドの比が、1 : 40～1 : 1 重量部の間、好ましくは 1 : 10～1 : 2 重量部の間にある、請求項 10 記載の医薬。

【請求項 12】

請求項 1～7 のいずれか 1 項記載の化合物の製造方法であって、

a) 一般式 (I I) :

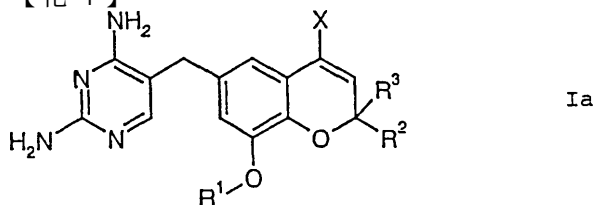
【化 3】



〔式中、 $R^1 \sim R^4$ は、請求項 1 と同義であり、X は、離脱基を表し、そして官能基は、場合により保護されている〕で示される化合物を、グアニジンと反応させ、そして存在する保護基を開裂すること、又は

b) R^4 が、水素又はハロゲン以外である、式 (I) の化合物の製造には、一般式 (I a) :

【化 4】



で示される化合物を、一般式 (I I I) :

$R^{40} Y$

(I I I)

〔式中、 $R^2 \sim R^3$ は、請求項 1 と同義であり、 R^{40} は、水素及びハロゲンを除いて、請求項 1 の R^4 と同義であり ($R^1 \sim R^3$ 及び R^{40} 中の官能基は、場合により保護されている)、記号 : X 及び Y の一方は、離脱基を表し、そしてもう一方は、この離脱基と一緒に離脱される基を表す〕で示される化合物と反応させ、そして存在する保護基を開裂すること、又は

c) 式 (I) の化合物を薬学的に許容しうる塩に変換すること
を特徴とする方法。

【請求項 13】

請求項 12 記載の方法により、又はその明白な化学的同等法により調製される、請求項 1～7 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 14】

医薬として使用するための、請求項 1～7 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 15】

抗菌活性医薬の製造における、請求項 1～7 のいずれか 1 項記載の化合物の使用。