

【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 19 年 2 月 1 日 (2007.2.1)

【公表番号】特表 2002-534515 (P2002-534515A)

【公表日】平成 14 年 10 月 15 日 (2002.10.15)

【出願番号】特願 2000-593597 (P2000-593597)

【国際特許分類】

C 0 7 D 249/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/18 (2006.01)

A 6 1 K 31/235 (2006.01)

A 6 1 K 31/337 (2006.01)

A 6 1 K 31/41 (2006.01)

A 6 1 K 31/4196 (2006.01)

A 6 1 K 31/421 (2006.01)

A 6 1 K 31/4245 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

A 6 1 K 31/5517 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

C 0 7 D 249/12 (2006.01)

C 0 7 D 257/04 (2006.01)

C 0 7 D 263/10 (2006.01)

C 0 7 D 271/10 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 249/14 5 0 4

A 6 1 K 31/18

A 6 1 K 31/235

A 6 1 K 31/337

A 6 1 K 31/41

A 6 1 K 31/4196

A 6 1 K 31/421

A 6 1 K 31/4245

A 6 1 K 31/437

A 6 1 K 31/5517

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 9/04
 A 6 1 P 9/08
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 17/06
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 31/12
 A 6 1 P 31/18
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 37/02
 C 0 7 D 249/12 5 0 9
 C 0 7 D 257/04 C
 C 0 7 D 263/10
 C 0 7 D 271/10

【手続補正書】

【提出日】平成18年12月11日(2006.12.11)

【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

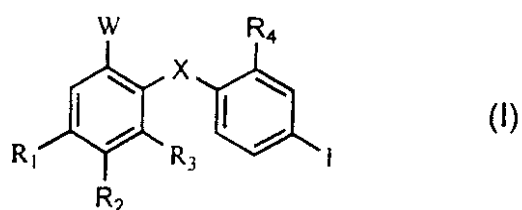
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

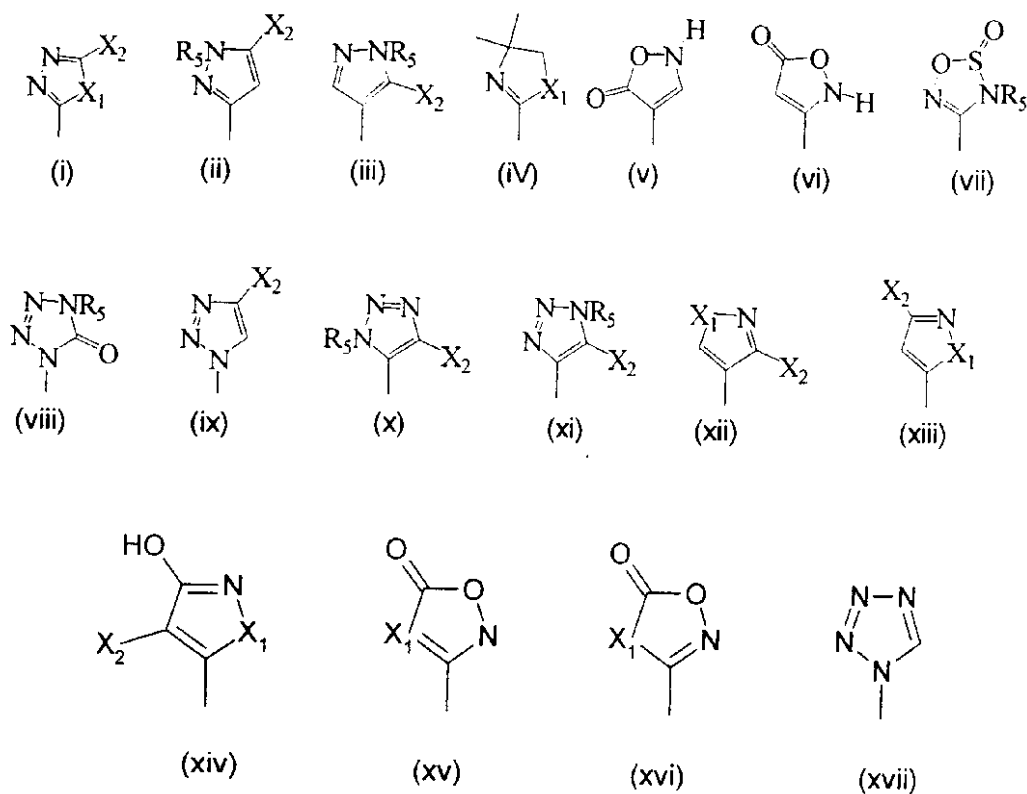
【請求項1】 式(I)

【化1】



[式中、Wは、以下の式(i) ~ (xiii)

【化2】



の一つであり；

X_1 は、O、S、または NR_F であり；

X_2 は、OH、SH、または NHR_E であり；

R_E および R_F の各々は、Hまたは C_{1-4} アルキルであり；

R_1 および R_2 の各々は、独立してH、F、 NO_2 、BrおよびClから選ばれ；

また、 R_1 は、 $SO_2NR_6R_H$ であることができるか、または R_1 および R_2 は、これらが結合しているベンゼン環と一緒にインドル、イソインドル、ベンゾフラン、ベンゾチオフェン、インダゾール、ベンゾイミダゾール、またはベンゾチアゾールを構成し；

R_3 は、HまたはFであり；

R_6 、 R_H および R_4 の各々は、独立してH、Clおよび CH_3 から選ばれ；

R_5 は、Hまたは C_{3-4} アルキルであり、そして

ここで、上記の各炭化水素基は、場合によりハロゲン、ヒドロキシル、アミノ、(アミノ)スルホニル、および NO_2 から独立して選ばれる1～3個の置換基で置換されており、ここで、上記の各複素環式基は、場合によりハロゲン、 C_{3-4} アルキル、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-4} アルケニル、 C_{3-4} アルキニル、フェニル、ヒドロキシル、アミノ、(アミノ)スルホニル、および NO_2 から独立して選ばれる1～3個の置換基で置換されており、ここで、各置換基アルキル、シクロアルキル、アルケニル、アルキニルまたはフェニルは、さらに場合によりハロゲン、 C_{1-2} アルキル、ヒドロキシル、アミノ、および NO_2 から独立して選ばれる1～2個の置換基で置換されている]

の化合物またはその医薬上許容しうる塩もしくは C_{1-8} エステル。

【請求項2】 R_1 がブromoまたはクロロである請求項1に記載の化合物。

【請求項3】 R_2 がフルオロである請求項1に記載の化合物。

【請求項4】 R_3 がHである請求項1に記載の化合物。

【請求項5】 R_2 および R_3 の各々がHである請求項1に記載の化合物。

【請求項6】 R_2 および R_3 の各々がフルオロである請求項1に記載の化合物。

【請求項7】 R_1 がブromoである請求項1に記載の化合物。

【請求項8】 R_1 がフルオロである請求項1に記載の化合物。

【請求項 9】 R_2 がニトロである請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】 R_3 が H である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】 R_4 がクロロである請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 12】 R_4 がメチルである請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 13】 R_5 が H である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 14】 R_5 が CH_3 である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 15】 X_1 が O または S である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 16】 X_1 が NH または NCH_3 である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 17】 X_2 が OH、SH、または NH_2 である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 18】 X_2 が $NHCH_3$ または OH である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 19】 請求項 1 に記載の化合物および医薬上許容し得る担体からなる医薬組成物。

【請求項 20】 構造：[5-フルオロ-2-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル]- (4-ヨード-2-メチル-フェニル)-アミン；[2,3-ジフルオロ-6-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル]- (4-ヨード-2-メチル-フェニル)-アミン；(4-ヨード-2-メチル-フェニル)-[2,3,4-トリフルオロ-6-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル]-アミン；[4-ブromo-2,3-ジフルオロ-6-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル]- (4-ヨード-2-メチル-フェニル)-アミン；[5-フルオロ-4-ニトロ-2-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル]- (4-ヨード-2-メチル-フェニル)-アミン；[2-(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロ-オキサゾール-2-イル)-5-フルオロ-フェニル]- (4-ヨード-2-メチル-フェニル)-アミン；[6-(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロ-オキサゾール-2-イル)-2,3-ジフルオロ-フェニル]- (4-ヨード-2-メチル-フェニル)-アミン；[6-(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロ-オキサゾール-2-イル)-2,3,4-トリフルオロ-フェニル]- (4-ヨード-2-メチル-フェニル)-アミン；[4-ブromo-6-(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロ-オキサゾール-2-イル)-2,3-ジフルオロ-フェニル]- (4-ヨード-2-メチル-フェニル)-アミン；[2-(4,4-ジメチル-4,5-ジヒドロ-オキサゾール-2-イル)-5-フルオロ-4-ニトロ-フェニル]- (4-ヨード-2-メチル-フェニル)-アミン；5-[4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-[1,3,4]-チアジアゾール-2-オール；5-[3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-[1,3,4]-チアジアゾール-2-オール；5-[3,4,5-トリフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-[1,3,4]-チアジアゾール-2-オール；5-[5-ブromo-3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-[1,3,4]-チアジアゾール-2-オール；5-[4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-5-ニトロ-フェニル]-[1,3,4]-チアジアゾール-2-オール；5-[4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-[1,3,4]-オキサジアゾール-2-オール；5-[3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-[1,3,4]-オキサジアゾール-2-オール；5-[5-ブromo-3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-[1,3,4]-オキサジアゾール-2-オール；5-[4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-5-ニトロ-フェニル]-[1,3,4]-オキサジアゾール-2-オール；5-[4-フルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-オール；5-[3,4-ジフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-オール；5-[3,4,5-トリフルオロ-2-(4-ヨード-2-メチル-フェニルアミノ)-フェニル]-4H-

[illegible]

[illegible]

ル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - オール ; または 4 - [4 - フルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - 5 - ニトロ - フェニル] - 1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - オールを有する請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 3】 構造 : 5 - [2 - (2 - アミノ - 4 - ヨード - フェニルアミノ) - 4 - フルオロ - フェニル] - 1 - メチル - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール - 4 - オール ; 5 - [2 - (2 - アミノ - 4 - ヨード - フェニルアミノ) - 3, 4 - ジフルオロフェニル] - 1 - メチル - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール - 4 - オール ; 5 - [2 - (2 - アミノ - 4 - ヨード - フェニルアミノ) - 3, 4, 5 - トリフルオロ - フェニル] - 1 - メチル - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール - 4 - オール ; 5 - [2 - (2 - アミノ - 4 - ヨード - フェニルアミノ) - 5 - ブロモ - 3, 4 - ジフルオロ - フェニル] - 1 - メチル - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール - 4 - オール ; 5 - [2 - (2 - アミノ - 4 - ヨード - フェニルアミノ) - 4 - フルオロ - 5 - ニトロ - フェニル] - 1 - メチル - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール - 4 - オール ; 5 - [4 - フルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチルフェニルアミノ) - フェニル] - 3 - メチル - 3 H - [1, 2, 3] トリアゾール - 4 - オール ; 5 - [3, 4 - ジフルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル] - 3 - メチル - 3 H - [1, 2, 3] トリアゾール - 4 - オール ; 3 - メチル - 5 - [3, 4, 5 - トリフルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル] - 3 H - [1, 2, 3] トリアゾール - 4 - オール ; 5 - [5 - ブロモ - 3, 4 - ジフルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル] - 3 - メチル - 3 H - [1, 2, 3] トリアゾール - 4 - オール ; 5 - [4 - フルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - 5 - ニトロ - フェニル] - 3 - メチル - 3 H - [1, 2, 3] トリアゾール - 4 - オール ; 4 - [4 - フルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル] - 2 - メチル - 2 H - ピラゾール - 3 - オール ; 4 - [3, 4 - ジフルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル] - 2 - メチル - 2 H - ピラゾール - 3 - オール ; 2 - メチル - 4 - [3, 4, 5 - トリフルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル] - 2 H - ピラゾール - 3 - オール ; 4 - [5 - ブロモ - 3, 4 - ジフルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル] - 2 - メチル - 2 H - ピラゾール - 3 - オール ; 4 - [4 - フルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - 5 - ニトロ - フェニル] - 2 - メチル - 2 H - ピラゾール - 3 - オール ; 1 - [4 - フルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル] - 4 - メチル - 1, 4 - ジヒドロ - テトラゾール - 5 - オン ; 1 - [3, 4 - ジフルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル] - 4 - メチル - 1, 4 - ジヒドロ - テトラゾール - 5 - オン ; 1 - メチル - 4 - [3, 4, 5 - トリフルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル] - 1, 4 - ジヒドロ - テトラゾール - 5 - オン ; 1 - [5 - ブロモ - 3, 4 - ジフルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル] - 4 - メチル - 1, 4 - ジヒドロ - テトラゾール - 5 - オン ; 1 - [4 - フルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - 5 - ニトロ - フェニル] - 4 - メチル - 1, 4 - ジヒドロ - テトラゾール - 5 - オン ; 1 - [4 - フルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル] - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール - 4 - オール ; 1 - [3, 4 - ジフルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル] - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール - 4 - オール ; 1 - [3, 4, 5 - トリフルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル] - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール - 4 - オール ; 1 - [5 - ブロモ - 3, 4 - ジフルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル] - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール - 4 - オール ; または 1 - [4 - フルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - 5 - ニトロ - フェニル] - 1 H - [1, 2, 3] トリアゾール - 4 - オールを有する請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 4】 構造 : 3 - [4 - フルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル] - 2 H - イソキサゾール - 5 - オン ; 3 - [3, 4 - ジフルオ

ロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル] - 2 H - イソキサゾール - 5 - オン ; 3 - [3 , 4 , 5 - トリフルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル] - 2 H - イソキサゾール - 5 - オン ; 3 - [5 - プロモ - 3 , 4 - ジフルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル] - 2 H - イソキサゾール - 5 - オン ; 3 - [4 - フルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - 5 - ニトロ - フェニル] - 2 H - イソキサゾール - 5 - オン ; [5 - フルオロ - 2 - (2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 2 1 > 4 __ - [1 , 2 , 3 , 5] オキサチアジアゾール - 4 - イル) - フェニル] - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニル) - アミン ; [2 , 3 - ジフルオロ - 6 - (2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 2 1 > 4 __ - [1 , 2 , 3 , 5] オキサチアジアゾール - 4 - イル) - フェニル] - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニル) - アミン ; (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニル) - [2 , 3 , 4 - トリフルオロ - 6 - (2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 2 1 > 4 __ - [1 , 2 , 3 , 5] オキサチアジアゾール - 4 - イル) - フェニル] - アミン ; [4 - プロモ - 2 , 3 - ジフルオロ - 6 - (2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 2 1 > 4 __ - [1 , 2 , 3 , 5] オキサチアジアゾール - 4 - イル) - フェニル] - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニル) - アミン ; [5 - フルオロ - 4 - ニトロ - 2 - (2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 2 1 > 4 __ - [1 , 2 , 3 , 5] オキサチアジアゾール - 4 - イル) - フェニル] - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニル) - アミン ; 4 - [4 - フルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル] - 4 H - イソキサゾール - 5 - オン ; 4 - [3 , 4 - ジフルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル] - 4 H - イソキサゾール - 5 - オン ; 4 - [3 , 4 , 5 - トリフルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル] - 4 H - イソキサゾール - 5 - オン ; 4 - [5 - プロモ - 3 , 4 - ジフルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - フェニル] - 4 H - イソキサゾール - 5 - オン ; または 4 - [4 - フルオロ - 2 - (4 - ヨード - 2 - メチル - フェニルアミノ) - 5 - ニトロ - フェニル] - 4 H - イソキサゾール - 5 - オンを有する請求項 1 に記載の化合物。