

【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

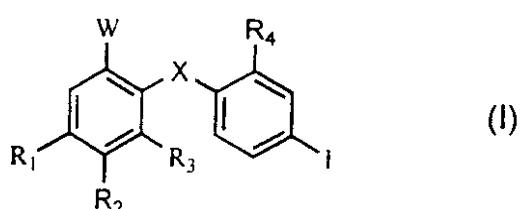
【補正方法】変更

## 【補正の内容】

## 【特許請求の範囲】

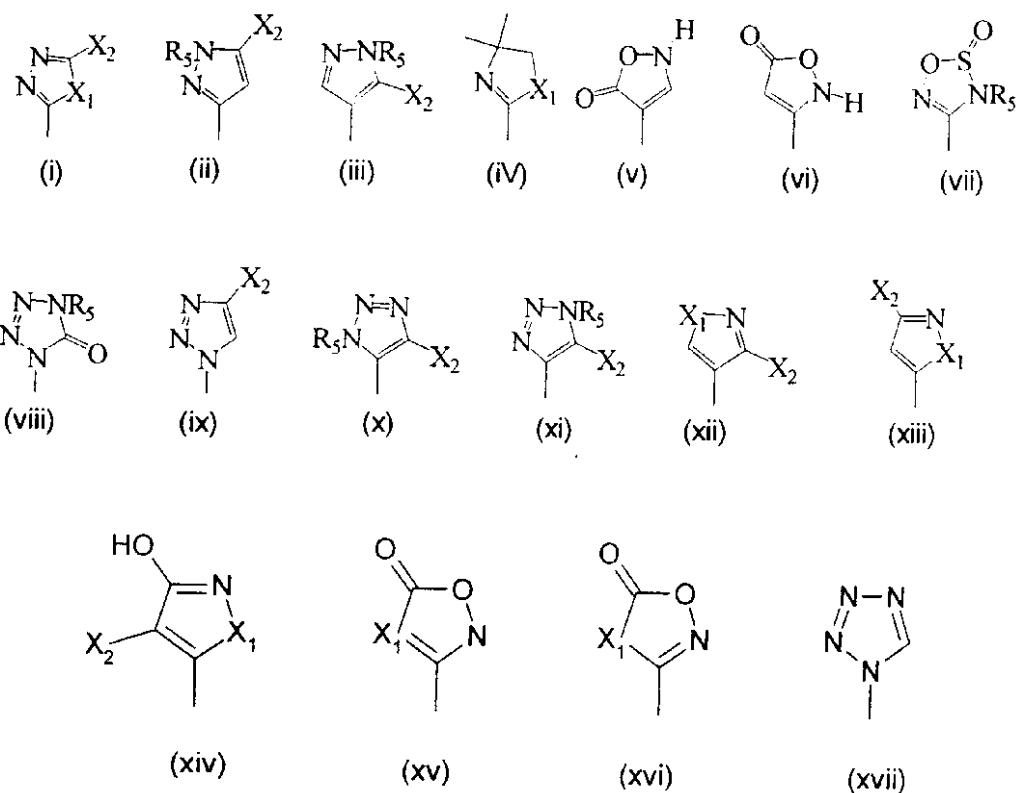
【請求項1】 式(I)

## 【化1】



[式中、Wは、以下の式(i)~(xiii)]

## 【化2】



の一つであり；

X<sub>1</sub>は、O、S、またはN R<sub>F</sub>であり；

X<sub>2</sub>は、OH、SH、またはN H R<sub>E</sub>であり；

R<sub>E</sub>およびR<sub>F</sub>の各々は、HまたはC<sub>1-4</sub>アルキルであり；

R<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>の各々は、独立してH、F、NO<sub>2</sub>、BrおよびClから選ばれ；

また、R<sub>1</sub>は、SO<sub>2</sub>NR<sub>G</sub>R<sub>H</sub>であることができるか、またはR<sub>1</sub>およびR<sub>2</sub>は、これらが結合しているベンゼン環と一緒にになってインドール、イソインドール、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<sub>3</sub>は、HまたはFであり；

R<sub>G</sub>、R<sub>H</sub>およびR<sub>4</sub>の各々は、独立してH、C<sub>1</sub>およびCH<sub>3</sub>から選ばれ；

R<sub>5</sub>は、HまたはC<sub>3-4</sub>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<sub>2</sub>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<sub>3-4</sub>アルキル、C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、C<sub>3-4</sub>アルケニル、C<sub>3-4</sub>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<sub>2</sub>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<sub>1-2</sub>アルキル、ヒドロキシル、アミノ、およびNO<sub>2</sub>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<sub>1-8</sub>エステル。

【請求項2】 R<sub>1</sub>がプロモ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<sub>2</sub>がフルオロである請求項1記載の化合物。

【請求項4】 R<sub>3</sub>がHである請求項1に記載の化合物。

【請求項5】 R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>の各々がHである請求項1に記載の化合物。

【請求項6】 R<sub>2</sub>およびR<sub>3</sub>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<sub>1</sub>がプロモである請求項1に記載の化合物。

【請求項8】 R<sub>1</sub>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<sub>5</sub> が H である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 14】  $R_5$  が  $C_6H_3$  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<sub>1</sub> が N—H をまたは N—C<sub>1</sub>H<sub>3</sub> である請求項 1 に記載の化合物。

【請求項17】 X<sub>1</sub>がOH、SH、またはNHである請求項1に記載の化庫に

【請求項 1-8】 X<sub>n</sub>が NH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>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。

[ 1 , 2 , 4 ] トリアゾール - 3 - オール ; 5 - [ 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 - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾール - 3 - オール ; または 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 ] - 4 H - [ 1 , 2 , 4 ] トリアゾール - 3 - オール を有する請求項 1 に記載の化合物。

2,4]トリアゾール-3-チオール; 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-[1,2,4]トリアゾール-3-チオール; 5-[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]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオールまたは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]-4H-[1,2,4]トリアゾール-3-チオールを有する請求項1に記載の化合物。

ル] - 1 - メチル - 1H - 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 - 1H - 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23】 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 - 1H - [ 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 - 1H - [ 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 - 1H - [ 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 - 1H - [ 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 - 1H - [ 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 - 3H - [ 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 - 3H - [ 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] - 3H - [ 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 - 3H - [ 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] - 2 - メチル - 2H - 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 - 2H - 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] - 2H - 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 - 2H - 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 - 2H - 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] - 1H - [ 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] - 1H - [ 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] - 1H - [ 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] - 1H - [ 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24】 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] - 2H - イソキサゾール - 5 - オン；3 - [ 3 , 4 - ジフルオ

口 - 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。