

【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23年9月29日 (2011.9.29)

【公表番号】特表2010-531811(P2010-531811A)

【公表日】平成22年9月30日 (2010.9.30)

【年通号数】公開・登録公報2010-039

【出願番号】特願2010-513583(P2010-513583)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/352 (2006.01)  
 C 0 7 D 311/58 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/353 (2006.01)  
 C 0 7 D 311/66 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/427 (2006.01)  
 C 0 7 D 417/04 (2006.01)  
 C 0 7 D 311/16 (2006.01)  
 C 0 7 D 405/04 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4433 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/501 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/506 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/497 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4025 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4178 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4196 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/41 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/53 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/395 (2006.01)  
 C 0 7 D 311/26 (2006.01)  
 A 6 1 P 29/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 19/02 (2006.01)  
 A 6 1 P 1/04 (2006.01)  
 A 6 1 P 13/12 (2006.01)  
 A 6 1 P 11/06 (2006.01)  
 A 6 1 P 9/10 (2006.01)  
 A 6 1 P 9/12 (2006.01)  
 A 6 1 P 3/06 (2006.01)  
 A 6 1 P 39/06 (2006.01)  
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/352  
 C 0 7 D 311/58 C S P  
 A 6 1 K 31/353  
 C 0 7 D 311/66  
 A 6 1 K 31/427  
 C 0 7 D 417/04  
 C 0 7 D 311/16 1 0 1  
 C 0 7 D 405/04  
 A 6 1 K 31/4433  
 A 6 1 K 31/501  
 A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/497  
 A 6 1 K 31/4025  
 A 6 1 K 31/4178  
 A 6 1 K 31/4196  
 A 6 1 K 31/41  
 A 6 1 K 31/53  
 A 6 1 K 31/395  
 C 0 7 D 311/26  
 A 6 1 P 29/00  
 A 6 1 P 19/02  
 A 6 1 P 1/04  
 A 6 1 P 29/00 1 0 1  
 A 6 1 P 13/12  
 A 6 1 P 11/06  
 A 6 1 P 9/10 1 0 1  
 A 6 1 P 9/12  
 A 6 1 P 3/06  
 A 6 1 P 39/06  
 A 6 1 P 43/00 1 1 2

## 【手続補正書】

【提出日】平成23年6月28日(2011.6.28)

## 【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】

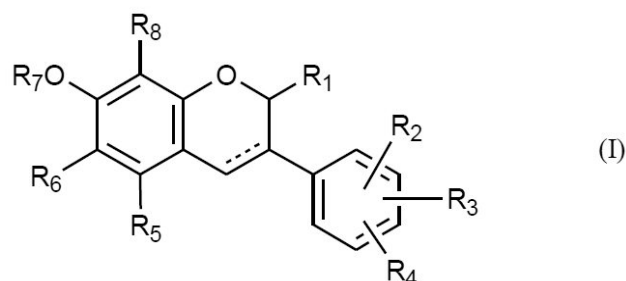
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式(I)で表される化合物を含有する、抗炎症剤又は抗酸化剤としての医薬であって

、

【化 1】



該式中、

$R_1$  はヒドロキシ、 $OR_9$ 、 $OC(O)R_9$ 、 $OSi(R_{10})_3$ 、アルキル、シクロアルキル、アミノアルキル、 $-NR_{11}(R_{12})$ 、 $R_{11}(R_{12})N$ -アルキル、アリール、アリールアルキル、チオール、アルキルチオ、ニトロ、シアノ、ハロ、アルケニル、アルキニル、ヘテロアリール、アリールアルキルアミノ又はアルキルアリールであり、

$R_2$ 、 $R_3$  及び  $R_4$  はそれぞれ独立に水素、ヒドロキシ、 $OR_9$ 、 $OC(O)R_9$ 、 $OSi(R_{10})_3$ 、アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、チオール、アルキルチオ、ニトロ、シアノ又はハロであり、

$R_5$  及び  $R_6$  はそれぞれ独立に水素、ヒドロキシ、 $OR_9$ 、 $OC(O)R_9$  又はアルキルであり、

$R_7$  は水素、アルキル、ハロアルキル、 $C(O)R_9$ 、 $Si(R_{10})_3$ 、シクロアルキル、アリール又

はアリールアルキルであり、

$R_8$ は水素、ヒドロキシ、 $OR_9$ 、 $OC(O)R_9$ 、アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ニトロ、シアノ又はハロであり、

$R_9$ はアルキル、ハロアルキル、アリール又はアリールアルキルであり、

$R_{10}$ は独立にアルキル又はアリールであり、

$R_{11}$ 及び $R_{12}$ はそれぞれ独立に水素、アルキル、アリールアルキル、アリール若しくはBOCであり、又は結合した窒素原子を含めて共に複素環を形成し、かつ、

「---」の描画は、単結合又は二重結合を表し、

該炭化水素置換基は任意で1つ又は複数のアルキル、ハロ、アシルオキシ、ヒドロキシ、ハロ、アルコキシ、シリルオキシ、ニトロ及びシアノで置換することができ、かつ、該化合物は薬学的に許容されるそれらの塩を含む、  
医薬。

【請求項 2】

炎症性疾患又は障害の治療のための、請求項1に記載の医薬。

【請求項 3】

炎症性疾患又は障害が、変形性関節炎、炎症性腸疾患(潰瘍性大腸炎及びクローン病)、潰瘍性直腸炎、遠位大腸炎、自己免疫障害(SLE、関節リウマチ、糸球体腎炎)、喘息及び肺炎症に関わる疾患、アテローム性動脈硬化を含む心血管障害、高血圧及び脂質悪液質から選択される、請求項2に記載の医薬。

【請求項 4】

抗酸化剤としての使用のための、請求項1に記載の医薬。

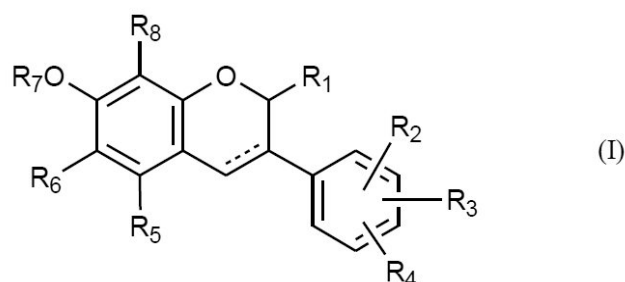
【請求項 5】

請求項1に規定される式(I)の1つ又は複数の化合物、又は薬学的に許容されるその塩若しくは誘導体を含む、炎症の治療、予防、若しくは回復のための、又は抗酸化剤としての、薬剤。

【請求項 6】

一般式(I)で表される化合物であって、

【化 2】



該式中、

$R_1$ はヒドロキシ、 $OR_9$ 、 $OC(O)R_9$ 、アルキル、シクロアルキル、アミノアルキル、 $-NR_{11}(R_{12})$ 、 $R_{11}(R_{12})N$ -アルキル、アリール、アリールアルキル、チオール、アルキルチオ、ニトロ、シアノ、ハロ、アルケニル、アルキニル、ヘテロアリール、アリールアルキルアミノ又はアルキルアリールであり、

$R_2$ 、 $R_3$ 及び $R_4$ はそれぞれ独立に水素、ヒドロキシ、 $OR_9$ 、 $OC(O)R_9$ 、アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、チオール、アルキルチオ、ニトロ、シアノ又はハロであり、

$R_5$ 及び $R_6$ はそれぞれ独立に水素、ヒドロキシ、 $OR_9$ 、 $OC(O)R_9$ 又はアルキルであり、

$R_7$ は水素であり、

$R_8$ は水素、ヒドロキシ、 $OR_9$ 、 $OC(O)R_9$ 、アルキル、シクロアルキル、アリール、アリールアルキル、ニトロ、シアノ又はハロであり、

$R_9$ はアルキル、ハロアルキル、アリール又はアリールアルキルであり、

$R_{11}$ 及び $R_{12}$ はそれぞれ独立に水素、アルキル、アリールアルキル、アリール若しくはBOC

C、又は結合した窒素原子を含めて共に複素環を形成し、かつ、

「---」の描画は、単結合又は二重結合を表し、好ましくは二重結合を表し、

該炭化水素置換基は任意で1つ又は複数のアルキル、ハロ、アシルオキシ、ヒドロキシ、ハロ、アルコキシ、シリルオキシ、ニトロ及びシアノで置換することができ、かつ、該化合物は薬学的に許容されるそれらの塩を含み、

ただし、以下の化合物：

2,4',7-トリヒドロキシイソフラバン、

2,3-ビス(4-ヒドロキシフェニル)-2H-1-ベンゾピラン-7-オール、

3-(3,4-ジヒドロキシフェニル)-2-(2,4,6-トリヒドロキシフェニル)-5,7-クロマンジオール、

3,4-ジヒドロ-2-メチル-3-フェニル-2H-1-ベンゾピラン-7-オール、

2-メチル-4',7-ジヒドロキシイソフラブ-3-エン、

2-エチル-4',7-ジヒドロキシイソフラブ-3-エン、

2-イソプロピル-4',7-ジヒドロキシイソフラブ-3-エン、

2-フェニル-4',7-ジヒドロキシイソフラブ-3-エン、

2-(4-フルオロフェニル)-4',7-ジヒドロキシイソフラブ-3-エン、

2-(4-アニシル)-4',7-ジヒドロキシイソフラブ-3-エン、

2-ナフチル-4',7-ジヒドロキシイソフラブ-3-エン、

2-チエニル-4',7-ジヒドロキシイソフラブ-3-エン、

2-ビニル-4',7-ジヒドロキシイソフラブ-3-エン、

2-(4-ヒドロキシフェニル)-3-フェニル-7-メトキシ-2H-1-ベンゾピラン、

2-(N-n-ブチル-N-メチル-10-アミノデシル)-3(4-ヒドロキシフェニル)-7-ヒドロキシ-2H-1-ベンゾピラン、及び

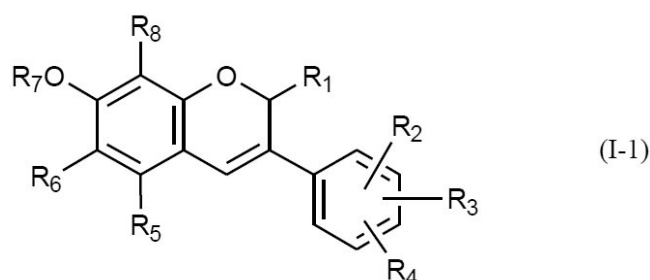
2-(N-n-ブチル-N-メチル-11-アミノウンデシル)-3(4-ヒドロキシフェニル)-7-ヒドロキシ-2H-1-ベンゾピラン、

は特定の除外される、化合物。

【請求項 7】

式(I-1)で表される、請求項6に記載の化合物であって、

【化 3】



該式中、

$R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、 $R_4$ 、 $R_5$ 、 $R_6$ 、 $R_7$ 及び $R_8$ は請求項6に規定される、化合物。

【請求項 8】

$R_1$ がプロピル、n-ブチル、t-ブチル、トリフルオロメチル、アミノメチル、アリル、エチニル、メトキシ、エトキシ、プロモプロボキシ、ベンジルアミノ、シアノ、ヒドロキシ、メチルチオ、エチルチオ、チアゾリル、トリアゾリル、ピリジニル、ピリダジル、ピリミジニル、ピラジニル、ピロリル、イミダジル、トリアゾリル、テトラゾリル、トリアジニル、及びテトラジニルからなる群から選択される、請求項6又は7に記載の化合物。

【請求項 9】

$R_2$ 、 $R_3$ 及び $R_4$ がそれぞれ独立に水素、ヒドロキシ、 $OR_9$ 、 $OC(O)R_9$ 又はハロである、請求項6又は7に記載の化合物。

【請求項 10】

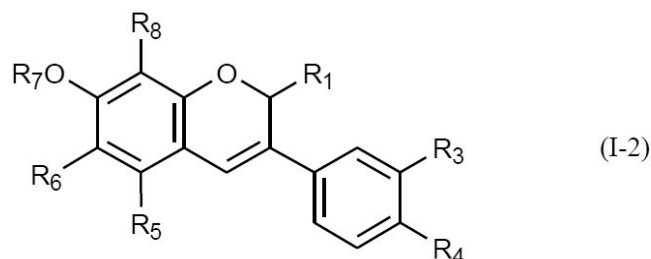
$R_2$ 、 $R_3$ 及び $R_4$ がそれぞれ独立に水素、ヒドロキシ、OMe又は $OC(O)Me$ である、請求項9に

記載の化合物。

【請求項 1 1】

式 (I-2) で表される、請求項 6 ~ 10 のいずれかに記載される化合物であって、

【化 4】



該式中、

$R_3$  及び  $R_4$  がそれぞれ独立に水素、ヒドロキシ、メトキシ又は  $OC(O)Me$  である、化合物。

【請求項 1 2】

$R_3$  及び  $R_4$  がそれぞれ独立に水素、ヒドロキシ又はメトキシである、請求項 11 に記載の化合物。

【請求項 1 3】

$R_3$  及び  $R_4$  の内の一つがヒドロキシであり他の一つが水素である、請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 1 4】

$R_5$ 、 $R_6$  及び  $R_8$  がそれぞれ独立に水素、ヒドロキシ又はメチルである、請求項 7 ~ 13 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 1 5】

$R_5$ 、 $R_6$  及び  $R_8$  の内の一つがヒドロキシ又はメチルである、請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 1 6】

$R_5$ 、 $R_6$  及び  $R_8$  が水素である、請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 1 7】

請求項 7 又は 11 に記載の化合物であって、該式中、

$R_1$  がヘテロアリールであり、

$R_2$  が H であり、

$R_3$  及び  $R_4$  がそれぞれ独立に水素、ヒドロキシ又はメトキシであり、

$R_5$ 、 $R_6$  及び  $R_8$  がそれぞれ独立に水素、ヒドロキシ又はメチルである、化合物。

【請求項 1 8】

請求項 17 に記載の化合物であって、

$R_1$  は 1 ~ 3 個の原子が窒素原子である 5 員又は 6 員芳香族環である、化合物。

【請求項 1 9】

請求項 18 に記載の化合物であって、

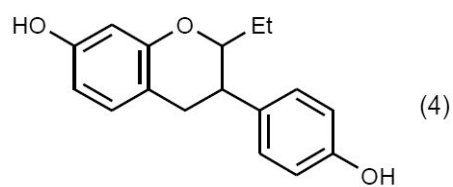
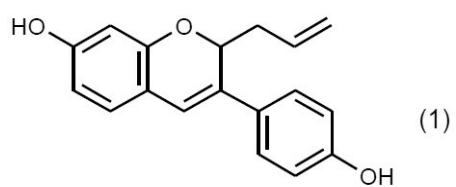
$R_1$  がピリジル、ピリミジニル、ピラジニル又はピリダジニルである、化合物。

【請求項 2 0】

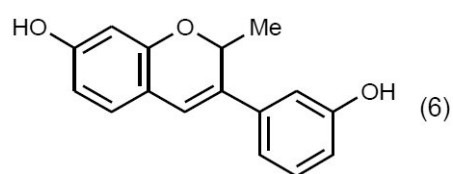
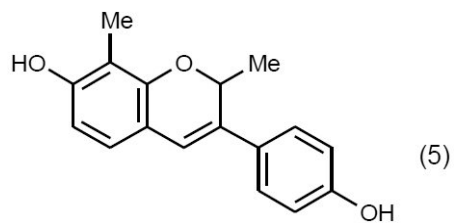
化合物 (1)、(4) ~ (33)、(35) ~ (36) 及び (38) から選択される、請求項 6 に記載の化合物

、

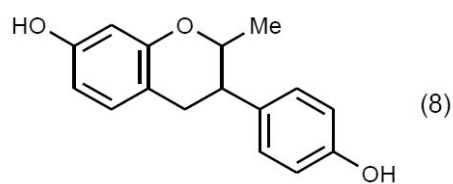
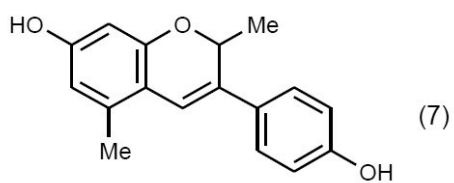
## 【化 5】



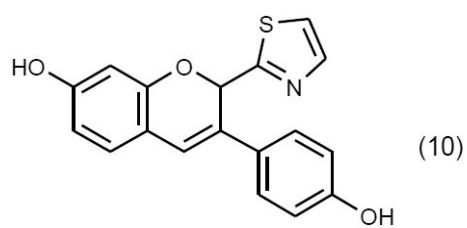
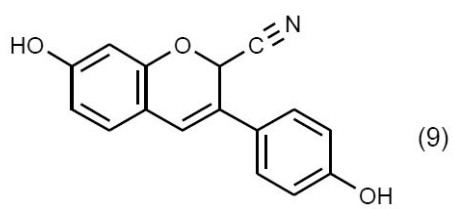
## 【化 6】



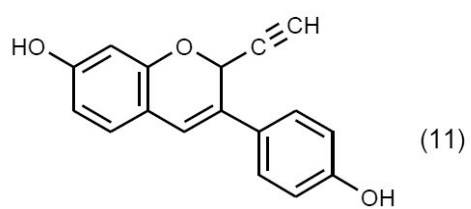
## 【化 7】



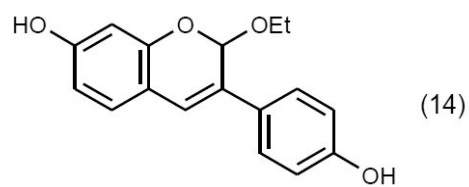
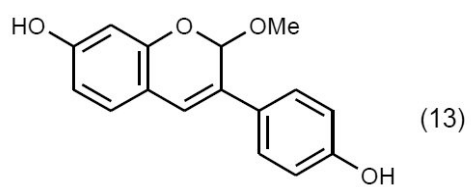
## 【化 8】



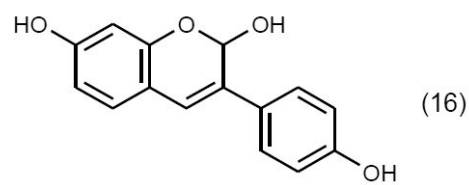
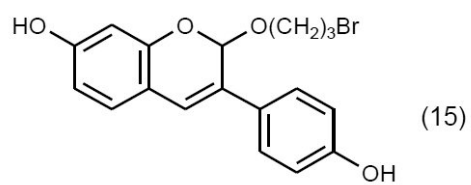
## 【化 9】



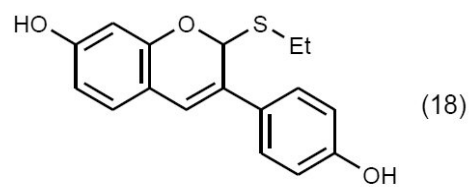
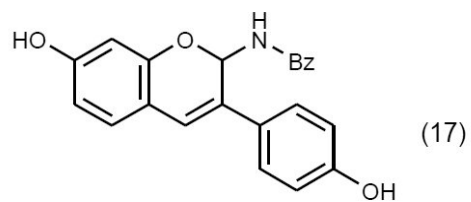
## 【化 1 0】



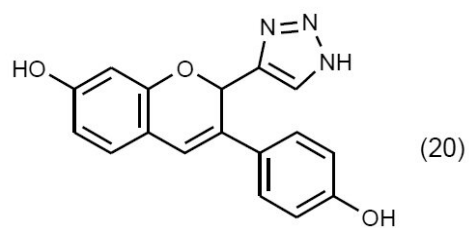
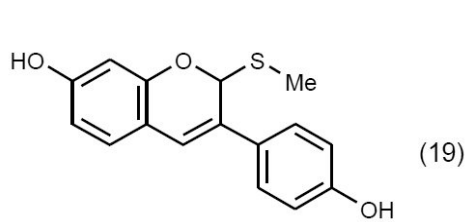
## 【化 1 1】



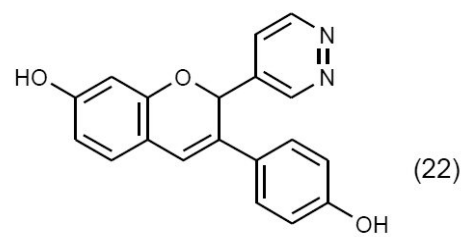
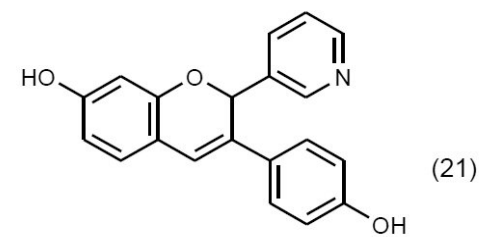
## 【化 1 2】



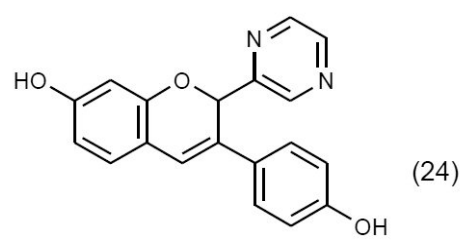
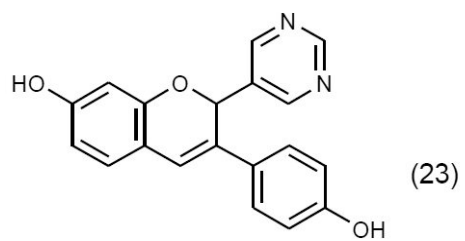
## 【化 1 3】



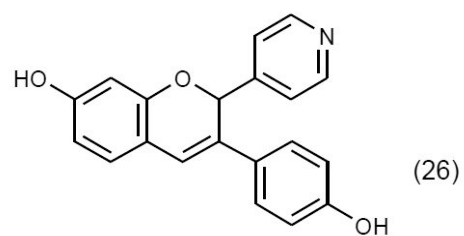
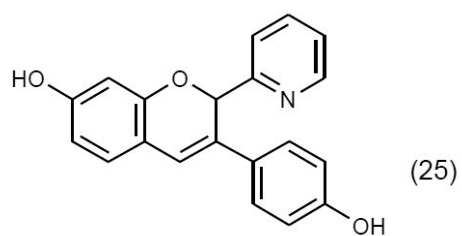
## 【化 1 4】



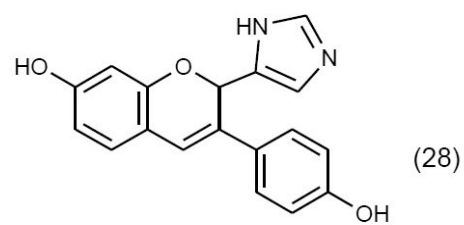
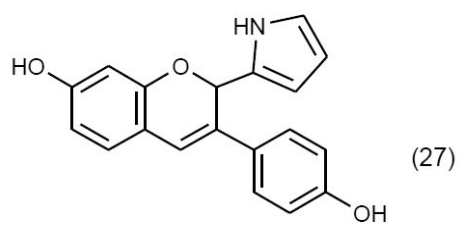
## 【化 1 5】



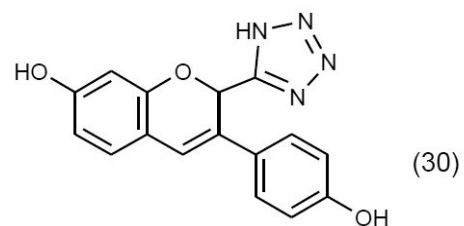
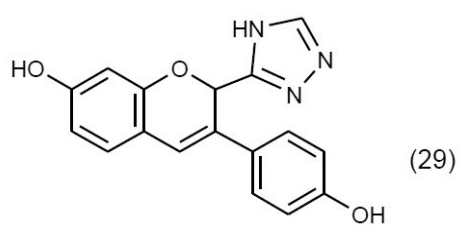
## 【化 1 6】



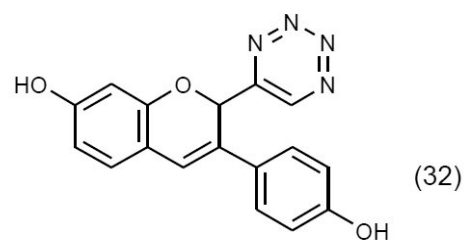
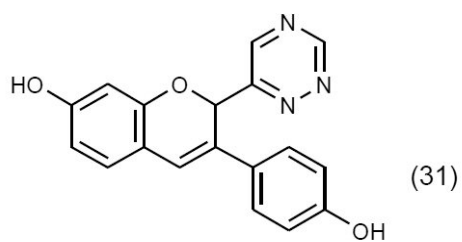
## 【化 1 7】



## 【化 1 8】

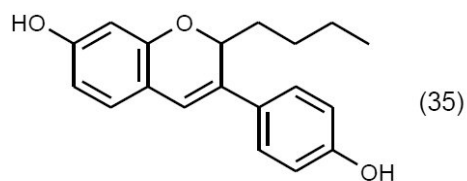
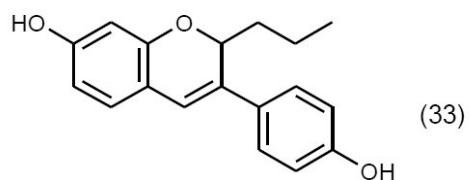


## 【化 1 9】

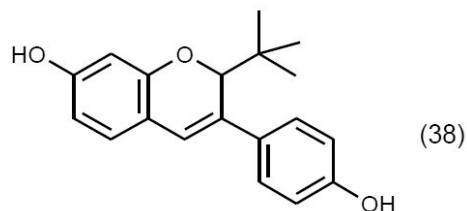
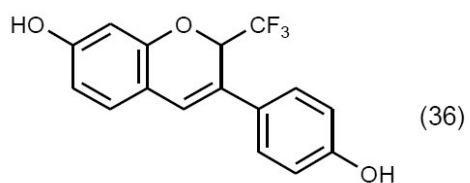




## 【化 2 0】



## 【化 2 1】



又は薬学的に許容されるその塩。

## 【請求項 21】

請求項6～20のいずれかに規定される一つ又は複数の式(1)の化合物又は薬学的に許容されるその塩を含み、一つ又は複数の医薬担体、賦形剤、補助剤及び/又は希釈剤を共に含む、医薬品組成物。

## 【請求項 22】

請求項6～20のいずれかに記載の化合物を、一つ又は複数の医薬担体、賦形剤、補助剤及び/又は希釈剤と合体させる工程を含む、医薬の製造方法。