

【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 4 月 5 日 (2007.4.5)

【公表番号】特表 2002-537292 (P2002-537292A)

【公表日】平成 14 年 11 月 5 日 (2002.11.5)

【出願番号】特願 2000-599745 (P2000-599745)

【国際特許分類】

C 0 7 D 235/30 (2006.01)

A 6 1 K 31/4184 (2006.01)

A 6 1 K 31/423 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 263/58 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 235/30 A

A 6 1 K 31/4184

A 6 1 K 31/423

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 43/00 1 2 3

C 0 7 D 263/58

【手続補正書】

【提出日】平成 19 年 2 月 13 日 (2007.2.13)

【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

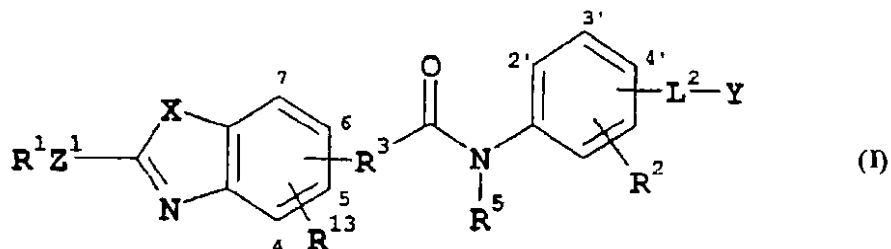
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 式 (I) :

【化 1】



[式中、

R¹ は場合によって置換されたアリールまたは場合によって置換されたヘテロアリールを表し；

R² は水素、ハロゲン、C₁₋₄アルキルまたはC₁₋₄アルコキシを表し；

R³ はアルキレン鎖、アルケニレン鎖またはアルキニレン鎖を表し；

R⁵ は水素またはC₁₋₄アルキルを表し；

R¹³ はアシル、アシルアミノ、アルコキシ、アルコキシカルボニル、アルキレンジオキ

シ、アルキルスルフィニル、アルキルスルホニル、アルキルチオ、アロイル、アロイルアミノ、アリール、アリールアルキルオキシ、アリールアルキルオキシカルボニル、アリールアルキルチオ、アリールオキシ、アリールオキシカルボニル、アリールスルフィニル、アリールスルホニル、アリールチオ、カルボキシ、シアノ、ハロ、ヘテロアロイル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキルオキシ、ヘテロアロイルアミノ、ヘテロアリールオキシ、水素、ヒドロキシ、ニトロ、トリフルオロメチル、 $Y^1 Y^2 N-$ 、 $Y^1 Y^2 NCO-$ 、 $Y^1 Y^2 NSO_2-$ 、 $Y^1 Y^2 N-C_{2-6}$ アルキレン- Z^1- 、アルキル $C(=O)-Y^1 N-$ 、アルキル $SO_2-Y^1 N-$ 、またはアリール、ヘテロアリール、ヒドロキシもしくは $Y^1 Y^2 N-$ で場合によって置換されたアルキルであり；

L^2 はそれぞれ R^6 （式中、 R^6 はアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、アリールアルキル、アリールアルケニル、アリールアルキニル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルケニル、シクロアルキルアルキニル、シクロアルケニル、シクロアルケニルアルキル、ヘテロアリール、ヘテロアリールアルキル、ヘテロアリールアルケニル、ヘテロアリールアルキニル、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロシクロアルキルアルキルである）またはヒドロキシ、 $-OR^6$ 、 $-O-C(=O)-R^6$ もしくは $-NY^1 Y^2$ （式中、 Y^1 および Y^2 は独立に水素、アルケニル、アルキル、アリール、アリールアルキル、シクロアルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアリールアルキルであるか、基 $-NY^1 Y^2$ は環状アミンを形成してよい）によって置換されたアルキルによって場合によって置換されたアルキレンまたはアルケニレン連鎖を表し；

X は O または NR^9 （式中、 R^9 は水素または C_{1-4} アルキルである）であり；

Y はカルボキシであり；

Z^1 は NR^5 を表す]

の化合物、対応する N -オキサイドおよびそれらのプロドラッグ、ならびに該化合物、その N -オキサイドおよびプロドラッグの医薬的に許容される塩および溶媒和化合物。

【請求項2】 R^1 は場合によって置換されたフェニルを表す請求項1記載の化合物

。

【請求項3】 Z^1 は NH を表す請求項1または2記載の化合物。

【請求項4】 R^{13} は、水素、 C_{1-4} アルキルまたは C_{1-4} アルコキシを表す請求項1～3のいずれかに記載の化合物。

【請求項5】 R^3 はメチレンを表す請求項1～4のいずれかに記載の化合物。

【請求項6】 R^5 は水素を表す請求項1～5のいずれかに記載の化合物。

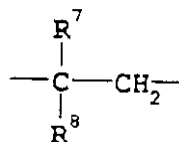
【請求項7】 R^2 は水素を表す請求項1～6のいずれかに記載の化合物。

【請求項8】 L^2 は C_{1-4} アルキル、場合によって置換されたフェニル、またはヒドロキシ、 $-OR^6$ 、 $-O-C(=O)-R^6$ もしくは $-NY^1 Y^2$ により置換されたアルキルによって場合によって置換された C_{1-4} アルキレン鎖を表す請求項1～7のいずれかに記載の化合物。

【請求項9】 L^2 は C_{1-4} アルキル、場合によって置換されたフェニル、またはヒドロキシ、 $-OR^6$ 、 $-O-C(=O)-R^6$ もしくは $-NY^1 Y^2$ により置換されたアルキルによって場合によって置換されたエチレン鎖を表す請求項1～8のいずれかに記載の化合物。

【請求項10】 L^2 は

【化2】

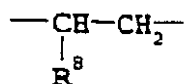


（式中、 R^7 および R^8 は両者独立に水素もしくは C_{1-4} アルキルであるか、または R^7 は水素であり、 R^8 は場合によって置換されたフェニルまたはヒドロキシ、 $-OR^4$ 、 $-O-C(=O)-R^6$ もしくは $-NY^1 Y^2$ により置換されたアルキルである）を表す請求項1～9

のいずれかに記載の化合物。

【請求項 1 1】 L^2 は

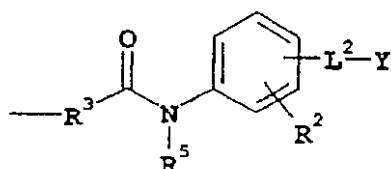
【化 3】



(式中、 R^8 は C_{1-4} アルキル、場合によって置換されたフェニルまたはヒドロキシ、 $-O$ R^6 、 $-O-C(=O)-R^6$ もしくは $-NY^1Y^2$ により置換された C_{1-4} アルキルである)を表す請求項 1 ~ 10 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 1 2】 基

【化 4】

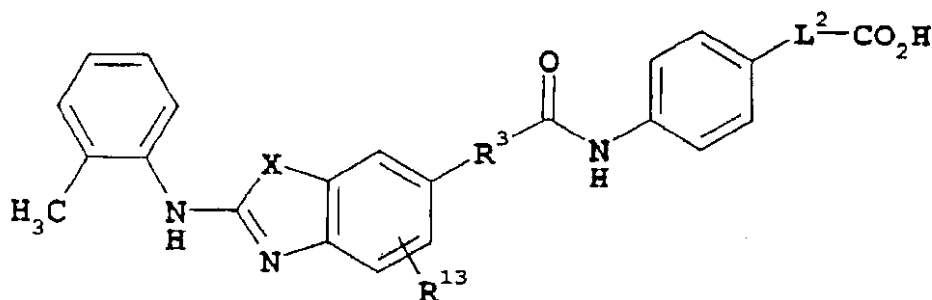


は、 X が O または NH である場合には、環の 6 位に結合し、 X が NR^9 であり、 R^9 が C_{1-4} アルキルである場合には、環の 5 または 6 位に結合する請求項 1 ~ 11 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 1 3】 基 $-L^2-Y$ はフェニル環の 4 位に結合する請求項 1 ~ 12 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 1 4】 以下の式：

【化 5】



(式中、

R^{13} は、水素、 C_{1-4} アルキルまたはメトキシであり、 X は O または NH であり、 R^3 は C_{1-2} アルキレンであり、 L^2 はフェニル、またはヒドロキシにより置換されたアルキルによって場合によって置換されたアルキレンである)の化合物、およびそれらのプロドラッグ、ならびに上記式の化合物およびそれらのプロドラッグの医薬的に許容される塩および溶媒和化合物。

【請求項 1 5】 R^{13} は、水素、メチル、エチルまたはメトキシを表す請求項 1 4 記載の化合物。

【請求項 1 6】 R^3 はメチレンを表す請求項 1 4 または 1 5 記載の化合物。

【請求項 1 7】 請求項 1 記載の化合物、対応する N -オキサイドもしくはプロドラッグ、または該化合物、その N -オキサイドもしくはプロドラッグの医薬的に許容される塩もしくは溶媒和化合物の有効量および医薬的に許容される担体または賦形剤からなる医薬組成物。

【請求項 1 8】 4 1 仲介細胞接着のインヒビターの投与により緩和できる状態に罹患しているかまたはそのような状態に冒されやすい患者の処置に使用するための請求項 1 7 記載の組成物。

【請求項 19】 炎症疾患の処置における使用のための請求項 17 または 18 記載の組成物。

【請求項 20】 喘息の処置における使用のための請求項 17 または 18 記載の組成物。

【請求項 21】 4 1 仲介細胞接着のインヒビターの投与により緩和できる状態に罹患しているかまたはそのような状態に冒されやすい患者の処置に使用する医薬の製造における請求項 1 に記載の化合物、対応する N - オキサイドもしくはプロドラッグ、または該化合物、その N - オキサイドもしくはプロドラッグの医薬的に許容される塩もしくは溶媒和化合物の使用。

【請求項 22】 喘息の処置用医薬の製造における請求項 1 に記載の化合物、対応する N - オキサイドもしくはプロドラッグ、または該化合物、その N - オキサイドもしくはプロドラッグの医薬的に許容される塩もしくは溶媒和化合物の使用。