

【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24年8月9日(2012.8.9)

【公表番号】特表2011-527677(P2011-527677A)

【公表日】平成23年11月4日(2011.11.4)

【年通号数】公開・登録公報2011-044

【出願番号】特願2011-517461(P2011-517461)

【国際特許分類】

C 07 D 207/09 (2006.01)  
A 61 P 43/00 (2006.01)  
A 61 P 9/00 (2006.01)  
A 61 P 1/16 (2006.01)  
A 61 P 25/28 (2006.01)  
A 61 P 9/04 (2006.01)  
A 61 P 9/12 (2006.01)  
A 61 P 11/00 (2006.01)  
A 61 P 15/00 (2006.01)  
A 61 P 17/00 (2006.01)  
A 61 P 27/02 (2006.01)  
A 61 P 1/18 (2006.01)  
A 61 P 31/04 (2006.01)  
A 61 P 29/00 (2006.01)  
A 61 P 19/02 (2006.01)  
A 61 P 1/04 (2006.01)  
A 61 P 25/00 (2006.01)  
A 61 P 17/06 (2006.01)  
A 61 P 37/06 (2006.01)  
A 61 P 37/02 (2006.01)  
A 61 P 9/10 (2006.01)  
A 61 P 3/10 (2006.01)  
A 61 P 39/02 (2006.01)  
A 61 P 25/04 (2006.01)  
A 61 P 13/12 (2006.01)  
A 61 P 19/08 (2006.01)  
A 61 P 11/06 (2006.01)  
A 61 P 29/02 (2006.01)  
A 61 P 11/16 (2006.01)  
A 61 P 35/00 (2006.01)  
A 61 P 35/02 (2006.01)  
C 07 D 211/34 (2006.01)  
A 61 K 31/451 (2006.01)  
C 07 D 401/06 (2006.01)  
A 61 K 31/454 (2006.01)  
C 07 D 413/06 (2006.01)  
A 61 K 31/4545 (2006.01)  
A 61 K 31/4709 (2006.01)  
C 07 D 401/10 (2006.01)  
C 07 D 407/06 (2006.01)  
A 61 K 31/4525 (2006.01)

C 0 7 D 207/34 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4025 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/40 (2006.01)  
 C 0 7 D 405/06 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/453 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/5377 (2006.01)  
 C 0 7 D 409/06 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/4535 (2006.01)  
 C 0 7 D 417/06 (2006.01)  
 C 0 7 D 471/04 (2006.01)  
 C 0 7 D 401/14 (2006.01)  
 C 0 7 D 211/60 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/538 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/506 (2006.01)  
 C 0 7 D 405/14 (2006.01)

## 【 F I 】

C 0 7 D 207/09	C S P
A 6 1 P 43/00	1 1 1
A 6 1 P 43/00	1 0 1
A 6 1 P 9/00	
A 6 1 P 1/16	
A 6 1 P 25/28	
A 6 1 P 9/04	
A 6 1 P 9/12	
A 6 1 P 11/00	
A 6 1 P 15/00	
A 6 1 P 17/00	
A 6 1 P 27/02	
A 6 1 P 1/18	
A 6 1 P 31/04	
A 6 1 P 29/00	1 0 1
A 6 1 P 19/02	
A 6 1 P 1/04	
A 6 1 P 25/00	
A 6 1 P 17/06	
A 6 1 P 37/06	
A 6 1 P 37/02	
A 6 1 P 9/10	
A 6 1 P 3/10	
A 6 1 P 39/02	
A 6 1 P 25/04	
A 6 1 P 9/10	1 0 1
A 6 1 P 13/12	
A 6 1 P 19/08	
A 6 1 P 11/06	
A 6 1 P 29/02	
A 6 1 P 11/16	
A 6 1 P 35/00	
A 6 1 P 35/02	
C 0 7 D 211/34	

A 6 1 K 31/451  
 C 0 7 D 401/06  
 A 6 1 K 31/454  
 C 0 7 D 413/06  
 A 6 1 K 31/4545  
 A 6 1 K 31/4709  
 C 0 7 D 401/10  
 C 0 7 D 407/06  
 A 6 1 K 31/4525  
 C 0 7 D 207/34  
 A 6 1 K 31/4025  
 A 6 1 K 31/40  
 C 0 7 D 405/06  
 A 6 1 K 31/453  
 A 6 1 K 31/5377  
 C 0 7 D 409/06  
 A 6 1 K 31/4535  
 C 0 7 D 417/06  
 C 0 7 D 471/04 1 1 3  
 C 0 7 D 471/04 1 1 4 A  
 C 0 7 D 401/14  
 C 0 7 D 471/04 1 0 8 A  
 C 0 7 D 211/60  
 A 6 1 K 31/538  
 A 6 1 K 31/506  
 C 0 7 D 405/14

## 【手続補正書】

【提出日】平成24年6月22日(2012.6.22)

## 【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

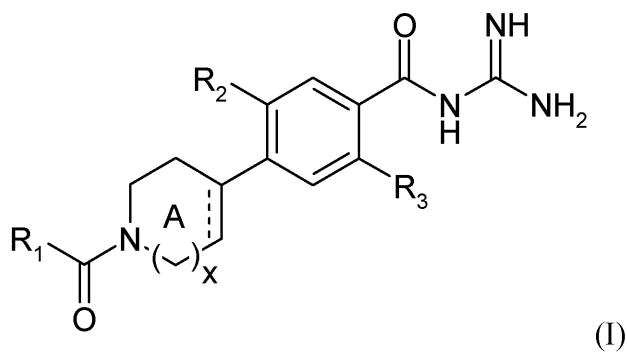
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

式(I)：

## 【化48】



(式中、

Xは、0又は1であるため、式I内のA環は、ピペリジニル環、テトラヒドロピリジン環又はピロリジニル環であり；

R<sub>1</sub>は、アミノ、C<sub>1~5</sub>アルキル、炭素環-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-、ヘテロシクリル-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-及びヘテロアリール-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-から選択され、各R<sub>1</sub>は、独立して、ハロゲン、オキソ、ヒドロキシル、シアノ、カルボキシ、カルボキサミド、C<sub>1~4</sub>アルキル、C<sub>1~4</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1~4</sub>アルキルアミノカルボニル、C<sub>1~4</sub>ジアルキルアミノカルボニル、C<sub>1~4</sub>アルコキシ-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-、C<sub>1~4</sub>アシリル、C<sub>1~4</sub>アシリルオキシ-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-、C<sub>1~4</sub>アルキル-S(=O)<sub>n</sub>-、C<sub>1~4</sub>アルキル-S(=O)<sub>m</sub>-N(R<sub>4</sub>)-、R<sub>5</sub>-N(R<sub>4</sub>)-S(=O)<sub>m</sub>-、C<sub>3~7</sub>シクロアルキル-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-、ヘテロシクリル-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-、アリール-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-(C<sub>1~4</sub>アルキル、ハロゲン、メトキシ、トリフルオロメトキシ又はシアノで場合により置換されている)、ヘテロアリール-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-、フェノキシ(ハロゲン、メトキシ、C<sub>1~4</sub>アルキル-S(=O)<sub>n</sub>、C<sub>1~4</sub>アルキル-S(=O)<sub>m</sub>-N(R<sub>4</sub>)-、シアノ又はトリフルオロメトキシで場合により置換されている)、-C(=O)N(R<sub>6</sub>)(R<sub>7</sub>)及び-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>N(R<sub>6</sub>)(R<sub>7</sub>)から選択される置換基3個までで場合により置換されており、R<sub>1</sub>上の各置換基は、可能ならば、場合により部分的又は完全にハロゲン化されており；

R<sub>2</sub>は、ハロゲン、水素、C<sub>1~5</sub>アルキル、C<sub>1~4</sub>アルキル-S(=O)<sub>m</sub>-N(R<sub>4</sub>)-、C<sub>1~4</sub>アルキル-N(R<sub>4</sub>)-S(=O)<sub>m</sub>-及びC<sub>1~4</sub>アルキル-S(=O)<sub>n</sub>-から選択され、各R<sub>2</sub>は、可能ならば、場合により部分的又は完全にハロゲン化されており；

R<sub>3</sub>は、水素、C<sub>1~5</sub>アルキル、C<sub>1~5</sub>アルコキシ、C<sub>1~5</sub>チオアルキル、C<sub>1~5</sub>アシリル、C<sub>1~5</sub>アシリルオキシカルボニル、ハロゲン、ヒドロキシル及びアミノ(C<sub>1~5</sub>アルキル、C<sub>1~5</sub>アシリル又はC<sub>3~7</sub>シクロアルキル-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-で場合により一置換又は二置換されている)から選択され；

各R<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>は、独立して、水素、C<sub>1~5</sub>アルキル、C<sub>1~5</sub>アシリル、C<sub>3~7</sub>シクロアルキル-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-、フェニル及びベンジルから選択されるか、又は

R<sub>4</sub>とR<sub>5</sub>は、それらが結合する窒素と一緒にになって、ヘテロシクリル環を形成しており；

各R<sub>6</sub>及びR<sub>7</sub>は、独立して、水素、ヒドロキシル、C<sub>1~5</sub>アルキル、C<sub>1~5</sub>アシリル、C<sub>3~7</sub>シクロアルキル-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-、フェニル及びベンジルから選択されるか、又は

R<sub>6</sub>とR<sub>7</sub>は、それらが結合する窒素と一緒にになって、ヘテロシクリル環を形成しており；

mは、1又は2であり；

nは、0~2である)で示される化合物、又は薬学的に許容しうるその塩。

### 【請求項2】

R<sub>2</sub>が、水素、C<sub>1~5</sub>アルキル及びC<sub>1~4</sub>アルキル-S(=O)<sub>n</sub>-から選択され、各R<sub>2</sub>が、可能ならば、場合により部分的又は完全にハロゲン化されており；

R<sub>3</sub>が、水素、C<sub>1~5</sub>アルキル、C<sub>1~5</sub>アルコキシ、ハロゲン及びヒドロキシルから選択され；

各R<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>が、独立して、水素、C<sub>1~5</sub>アルキル、C<sub>1~5</sub>アシリル、C<sub>3~7</sub>シクロアルキル-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-、フェニル及びベンジルから選択され；

各R<sub>6</sub>及びR<sub>7</sub>が、独立して、水素、ヒドロキシル、C<sub>1~5</sub>アルキル、C<sub>1~5</sub>アシリル、C<sub>3~7</sub>シクロアルキル-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-、フェニル及びベンジルから選択される、請求項1記載の化合物。

### 【請求項3】

R<sub>1</sub>が、アミノ、C<sub>1~5</sub>アルキル、C<sub>3~7</sub>シクロアルキル-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-、フェニル-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-、インダニル-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>、ナフチル-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>、-ヘテロシクリル-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-(ここで、該ヘテロシクリルは、アゼチジニル、テトラヒドロ

フラニル、ピロリジニル、ピロリジノニル、テトラヒドロピラニル、ピペリジニル、ピペラジニル、チオモルホリニル、1,1-ジオキソ-1<sup>6</sup>-チオモルホリニル、テトラヒドロチオピラン1,1-ジオキシド又はモルホリニルである)及びヘテロアリール-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-(ここで、該ヘテロアリールは、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、トリアジニル、テトラジニル、ピロリル、ピリジノニル、イミダゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、チエニル、チアジアゾリル、ピラゾリル、フラニル、ピラニル、インドリル、インドリジニル、ブリニル、キノリニル、ジヒドロ-2H-キノリニル、2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリニル、テトラヒドロキノリニル、イソキノリニル、キナゾリニル、インダゾリル、イソインドリル、ベンゾオキサゾリル、ベンゾチアゾリル、ベンゾイミダゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾピラニル、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシニル、ベンゾジオキソリル、1,8-ナフチリジル、1,5-ナフチリジル、2,3-ジヒドロベンゾフリル、イミダゾ[1,2-a]ピリジル又は4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジニルである)から選択され、各R<sub>1</sub>が、独立して、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、カルボキシ、カルボキサミド、アセトキシ-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-, C<sub>1~4</sub>アルキル、C<sub>1~4</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1~4</sub>アルコキシ-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-, C<sub>1~4</sub>アシル、C<sub>1~4</sub>アルキル-S(O)<sub>n</sub>-, C<sub>1~4</sub>アルキル-S(O)<sub>m</sub>-N(R<sub>4</sub>)-, R<sub>5</sub>-N(R<sub>4</sub>)-S(O)<sub>m</sub>-, -C(O)N(R<sub>6</sub>)(R<sub>7</sub>), -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>N(R<sub>6</sub>)(R<sub>7</sub>)、ピリジル、ピリミジニル、イミダゾリル、ピラゾリル、ピロリジニル、オキサゾリル、フリル、フェニル(ハロゲン、メトキシ、トリフルオロメトキシ又はシアノで場合により置換されている)及びフェノキシ(C<sub>1~4</sub>アルキル-S(O)<sub>n</sub>-, C<sub>1~4</sub>アルキ尔-S(O)<sub>m</sub>-N(R<sub>4</sub>)-, シアノ又はトリフルオロメトキシで場合により置換されている)から選択される置換基3個までで場合により置換されており、R<sub>1</sub>上の各置換基が、可能ならば、場合により部分的又は完全にハロゲン化されており;

各R<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>が、独立して、水素、C<sub>1~5</sub>アルキル及びC<sub>3~7</sub>シクロアルキルから選択され;

各R<sub>6</sub>及びR<sub>7</sub>が、独立して、水素、C<sub>1~5</sub>アルキル及びC<sub>3~7</sub>シクロアルキルから選択される、請求項2記載の化合物。

#### 【請求項4】

R<sub>1</sub>が、アミノ、C<sub>1~5</sub>アルキル、C<sub>3~7</sub>シクロアルキル-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-、フェニル-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-、インダニル-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>、ナフチル-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>、-ヘテロシクリル-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-(ここで、該ヘテロシクリルは、テトラヒドロフラニル、ピロリジニル、ピロリジノニル、テトラヒドロピラニル、ピペリジニル、テトラヒドロチオピラン1,1-ジオキシド又はモルホリニルである)及びヘテロアリール-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-(ここで、該ヘテロアリールは、ピリジル、ピリミジニル、ピロリル、ピリジノニル、イミダゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、チエニル、ピラゾリル、フラニル、インドリル、キノリニル、2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリニル、ベンゾチアゾリル、2,3-ジヒドロ-1,4-ベンゾジオキシニル、ベンゾジオキソリル、1,8-ナフチリジル、1,5-ナフチリジル、2,3-ジヒドロベンゾフリル、イミダゾ[1,2-a]ピリジル又は4-メチル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[1,4]オキサジニルである)から選択され、各R<sub>1</sub>が、独立して、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、カルボキシ、カルボキサミド、アセトキシ-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-, C<sub>1~4</sub>アルキル、C<sub>1~4</sub>アルコキシカルボニル、C<sub>1~4</sub>アルコキシ-(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>-, C<sub>1~4</sub>アルキル-S(O)<sub>n</sub>-, R<sub>5</sub>-N(R<sub>4</sub>)-S(O)<sub>m</sub>-, -C(O)N(R<sub>6</sub>)(R<sub>7</sub>), -(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>N(R<sub>6</sub>)(R<sub>7</sub>)、ピリジル、ピリミジニル、イミダゾリル、ピラゾリル、ピロリジニル、オキサゾリル、フリル、フェニル(ハロゲン、メトキシ、トリフルオロメトキシ又はシアノで場合により置換されている)及びフェノキシ(C<sub>1~4</sub>アルキル-S(O)<sub>n</sub>-, C<sub>1~4</sub>アルキ尔-S(O)<sub>m</sub>-N(R<sub>4</sub>)-, シアノ又はトリフルオロメトキシで場合により置換されている)から選択される置換基3個までで場合により置換されており、R<sub>1</sub>上の各置換基が、可能ならば、場合により部分的又は完全にハロゲン化されており

;

R<sub>2</sub> が、ハロゲン化 C<sub>1 ~ 3</sub> アルキル及び C<sub>1 ~ 4</sub> アルキル - S(O)<sub>m</sub> - から選択され；

R<sub>3</sub> が、水素、C<sub>1 ~ 5</sub> アルキル及び C<sub>1 ~ 5</sub> アルコキシから選択され；

各 R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub> 及び R<sub>7</sub> が、独立して、水素及び C<sub>1 ~ 5</sub> アルキルから選択される、請求項 3 記載の化合物。

#### 【請求項 5】

X が、0 又は 1 であるため、式 I 内の A 環が、ピペリジニル環又はピロリジニル環のいずれかであり；

R<sub>1</sub> が、アミノ、C<sub>1 ~ 5</sub> アルキル、C<sub>3 ~ 7</sub> シクロアルキル - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - 、フェニル - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - 、インダニル - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> 、ナフチル - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> 、- ヘテロシクリル - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - (ここで、該ヘテロシクリルは、ピロリジニル、ピロリジノニル、テトラヒドロピラニル、ピペリジニル、テトラヒドロチオピラン 1, 1 - ジオキシド又はモルホリニルである) 及びヘテロアリール - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - (ここで、該ヘテロアリールは、ピリジル、ピリミジニル、ピロリル、ピリジノニル、イミダゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、チエニル、ピラゾリル、フラニル、インドリル、キノリニル、2 - オキソ - 1, 2, 3, 4 - テトラヒドロキノリニル、ベンゾチアゾリル、2, 3 - ジヒドロベンゾフリル、イミダゾ [1, 2 - a] ピリジル又は 4 - メチル - 3, 4 - ジヒドロ - 2H - ベンゾ [1, 4] オキサジニルである) から選択され、各 R<sub>1</sub> が、独立して、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、カルボキシ、カルボキサミド、アセトキシ、C<sub>1 ~ 4</sub> アルキル、C<sub>1 ~ 4</sub> アルコキシカルボニル、C<sub>1 ~ 4</sub> アルコキシ - (CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub> - 、C<sub>1 ~ 4</sub> アルキル - S(O)<sub>n</sub> - 、R<sub>5</sub> - N(R<sub>4</sub>) - S(O)<sub>m</sub> - 、- C(O)N(R<sub>6</sub>)(R<sub>7</sub>)、- N(R<sub>6</sub>)(R<sub>7</sub>)、ピリジル、ピリミジニル、イミダゾリル、ピラゾリル、ピロリジニル、オキサゾリル、フェニル(ハロゲン又はメトキシで場合により置換されている) 及びフェノキシ(C<sub>1 ~ 4</sub> アルキル - S(O)<sub>n</sub> - 又は C<sub>1 ~ 4</sub> アルキル S(O)<sub>m</sub> - N(R<sub>4</sub>) - で場合により置換されている) から選択される置換基 3 個までで場合により置換されており、R<sub>1</sub> 上の各置換基が、可能ならば、場合により部分的又は完全にハロゲン化されており；

R<sub>2</sub> が、トリフルオロメチル又はメチルスルホニルであり；

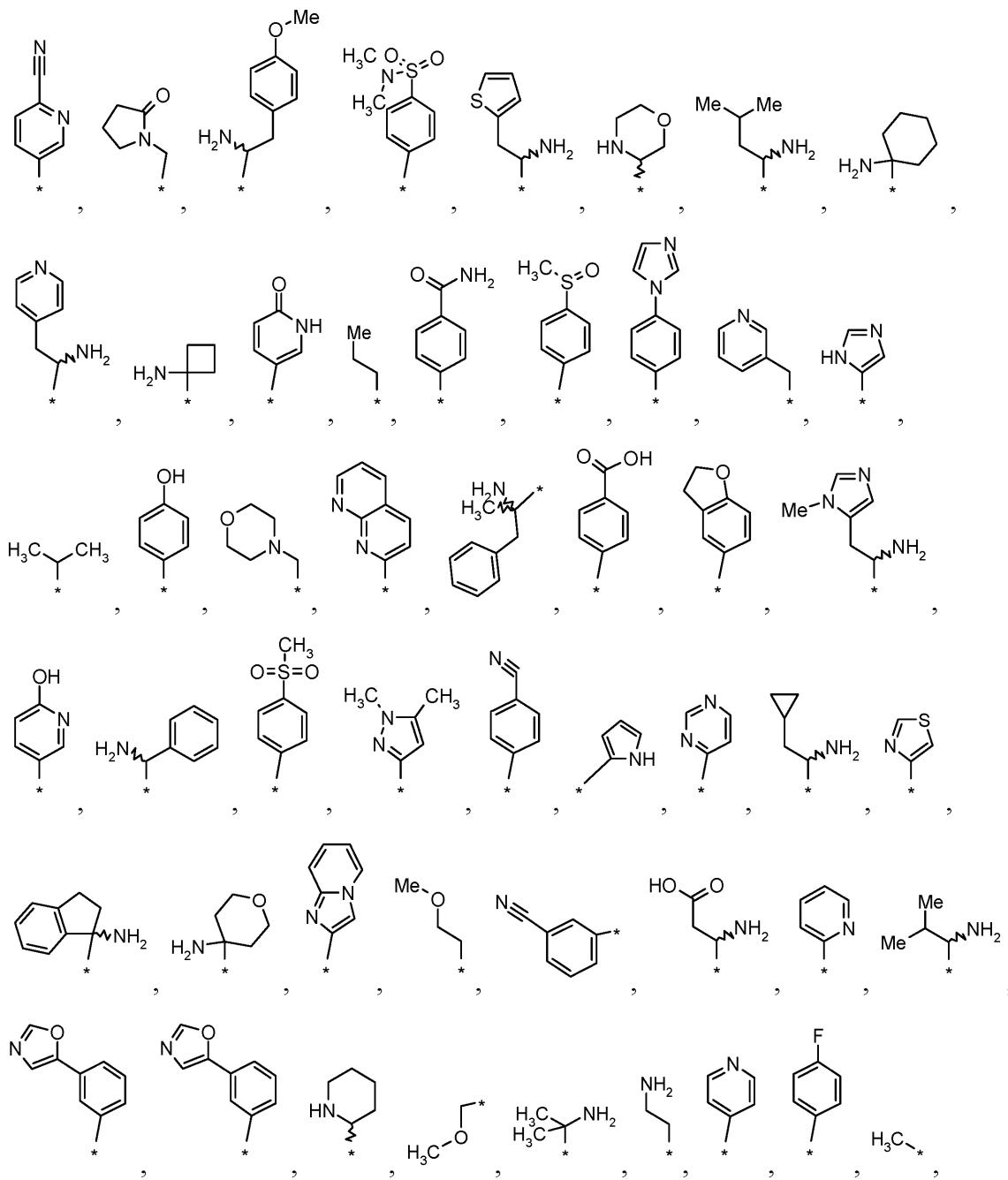
R<sub>3</sub> が、水素、メチル及びメトキシから選択され；

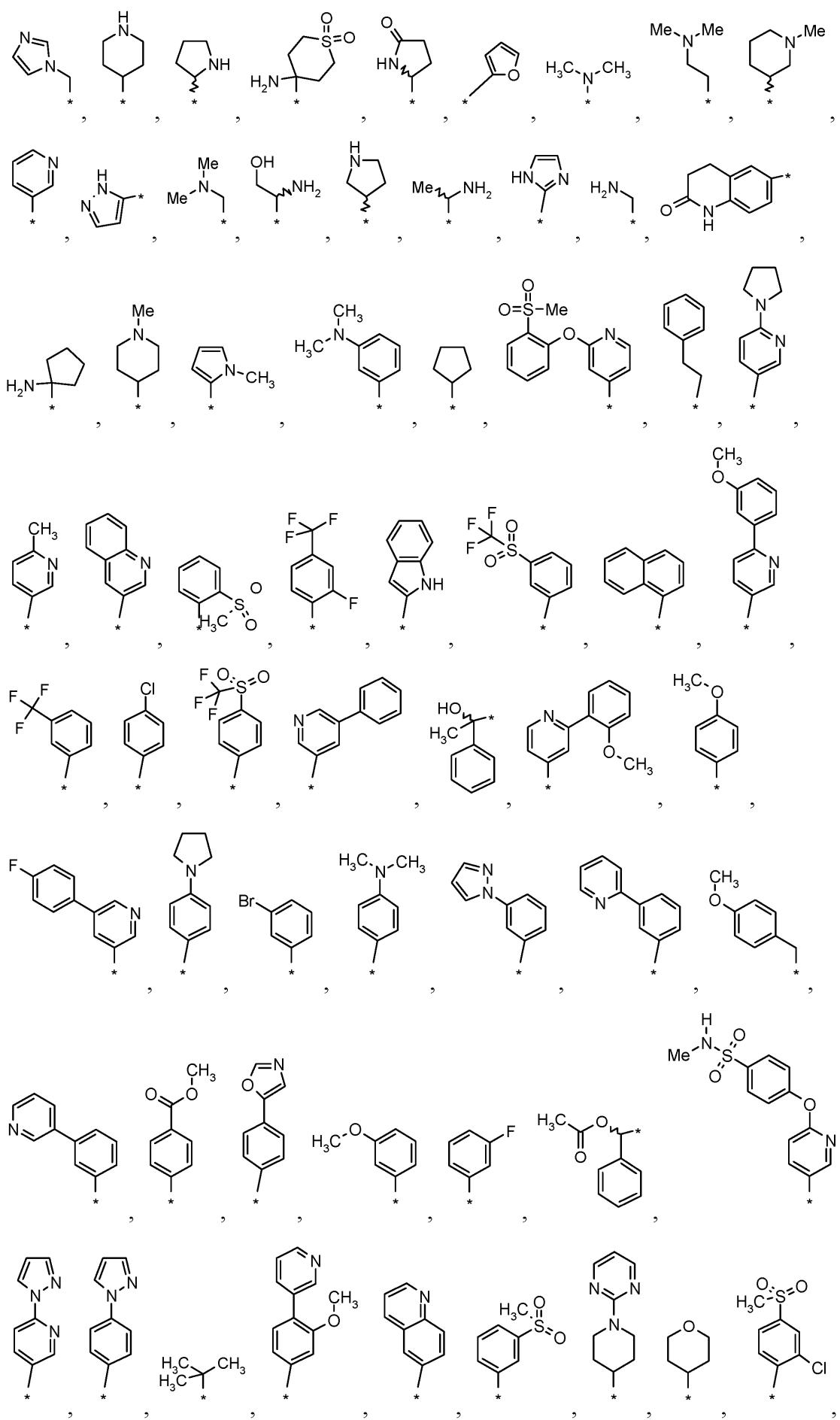
各 R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub> 及び R<sub>7</sub> が、独立して、水素及びメチルから選択される、請求項 4 記載の化合物。

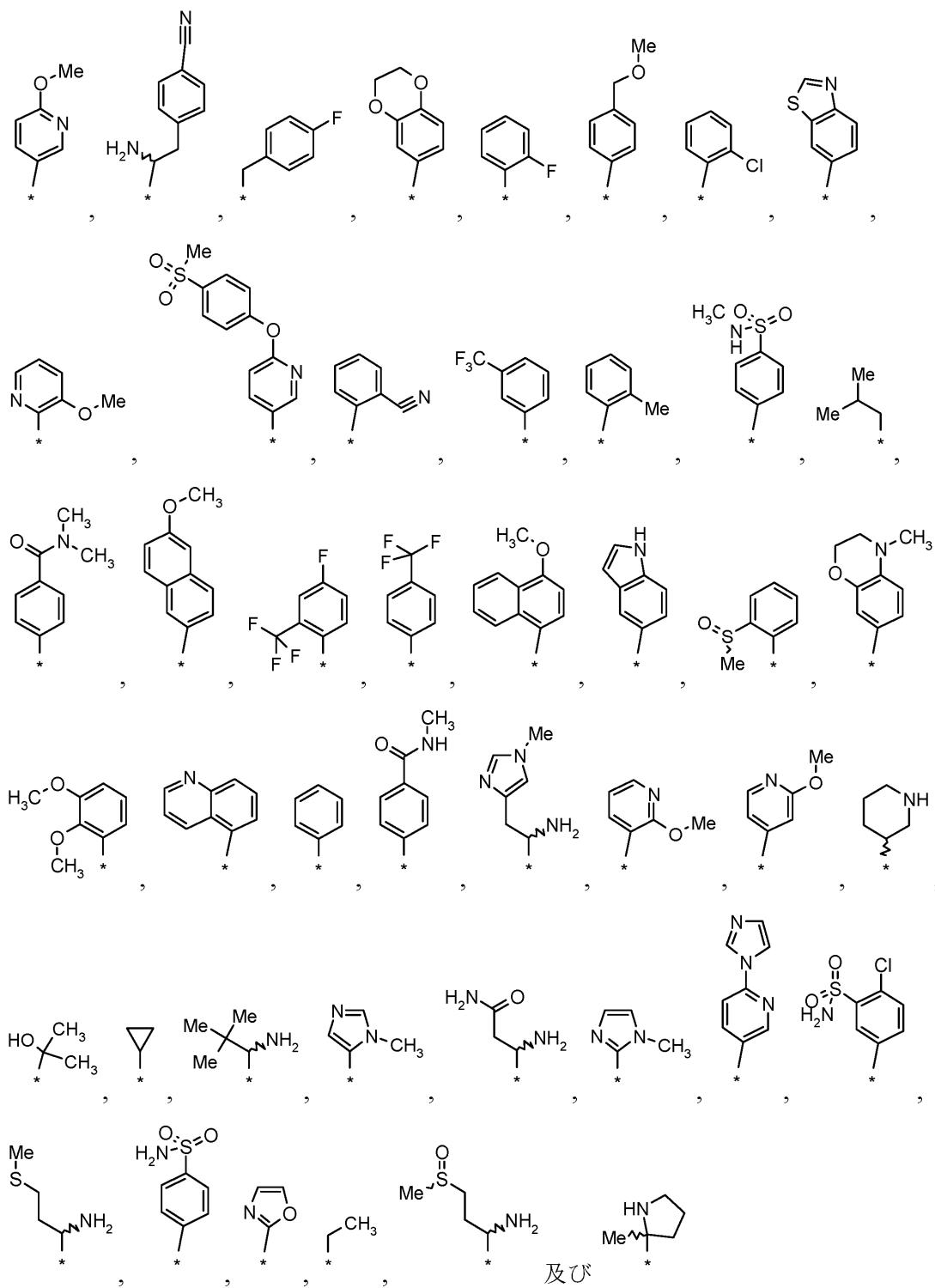
#### 【請求項 6】

R<sub>1</sub> が、

【化 4 9】







から選択される、請求項 5 記載の化合物。

**【請求項 7】**

X が、0 であるため、式 I 内の A 環が、ピロリジニル環である、請求項 6 記載の化合物。

**【請求項 8】**

X が、1 であるため、式 I 内の A 環が、ピペリジニル環である、請求項 6 記載の化合物。

**【請求項 9】**

治療上効果的な量の請求項 1 記載の化合物ならびに 1 種以上の薬学的に許容しうる担体及び / 又は佐剤を含む医薬組成物。

**【請求項 10】**

心筋、肝臓又は脳の傷害への急性応答、心不全の発症をきたす慢性の梗塞後、高血圧及び年齢に関連する応答から選択される疾患又は病状の処置用の請求項9記載の医薬組成物。