

【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18年12月21日(2006.12.21)

【公表番号】特表2006-517201(P2006-517201A)

【公表日】平成18年7月20日(2006.7.20)

【年通号数】公開・登録公報2006-028

【出願番号】特願2006-500277(P2006-500277)

【国際特許分類】

C 0 7 D	239/91	(2006.01)
C 0 7 D	217/24	(2006.01)
A 6 1 K	31/513	(2006.01)
A 6 1 K	31/472	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/04	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/02	(2006.01)
A 6 1 P	19/10	(2006.01)
C 1 2 N	9/64	(2006.01)
C 1 2 N	9/99	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D	239/91	
C 0 7 D	217/24	C S P
A 6 1 K	31/513	
A 6 1 K	31/472	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	9/04	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	1/00	
A 6 1 P	1/02	

A 6 1 P 19/10

C 1 2 N 9/64

Z

C 1 2 N 9/99

## 【手続補正書】

【提出日】平成18年10月6日(2006.10.6)

## 【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

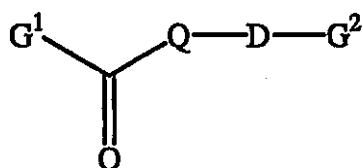
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

式 I :

## 【化1】



の化合物又は薬学的に許容できるその塩であって、

式中：

各々のG<sup>1</sup>及びG<sup>2</sup>は、独立に、C<sub>3</sub>～C<sub>7</sub>シクロアルキル-(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；C<sub>5</sub>又はC<sub>6</sub>シクロアルキル-(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；C<sub>8</sub>～C<sub>10</sub>ビシクロアルキル-(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；3～7員ヘテロシクロアルキル-(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；5又は6員ヘテロシクロアルキル-(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；8～10員ヘテロビシクロアルキル-(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；フェニル-(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；ナフチル-(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；5又は6員ヘテロアリール-(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；8～10員ヘテロビアリール-(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；5又は6員ヘテロシクロアルキル-フェニレニル-(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；ビフェニル-(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；5又は6員ヘテロアリール-フェニレニル-(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；

5又は6員ヘテロアリール-(5又は6員ヘテロアリーレニル)--(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；

フェニル-L-(フェニレニル)--(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；フェニル-L-(5又は6員ヘテロアリーレニル)--(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；8～10員ヘテロビアリール-フェニレニル-(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；フェニル-(5又は6員ヘテロアリーレニル)--(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；ナフチル-(5又は6員ヘテロアリーレニル)--(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；フェニル-O-(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；フェニル-S-(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；フェニル-S(O)--(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；フェニル-S(O)<sub>2</sub>--(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；フェニル-(8～10員ヘテロビアリーレニル)--(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-；

から選択される未置換の又は置換された基であり、そして、上記G<sup>1</sup>及びG<sup>2</sup>が各々独立に

、各々独立に炭素又は窒素原子上で、

$C_1 \sim C_6$ アルキル -  $(G)_m$  - ;

$C_1 \sim C_6$ アルキル；

$CN$ ；

$CF_3$ ；

$HO$ ；

( $C_1 \sim C_6$ アルキル) -  $O$ ；

( $C_1 \sim C_6$ アルキル) -  $S$ ；

( $C_1 \sim C_6$ アルキル) -  $S(O)$ ；

( $C_1 \sim C_6$ アルキル) -  $S(O)_2$ ；

$O_2N$ ；

$H_2N$ ；

( $C_1 \sim C_6$ アルキル) -  $N(H)$ ；

( $C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$  -  $N$ ；

( $C_1 \sim C_6$ アルキル) -  $C(O)O$  - ( $C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$  - ;

( $C_1 \sim C_6$ アルキル) -  $C(O)O$  - (1 ~ 8員ヘテロアルキレニル) $_m$  - ;

( $C_1 \sim C_6$ アルキル) -  $C(O)N(H)$  - ( $C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$  - ;

( $C_1 \sim C_6$ アルキル) -  $C(O)N(H)$  - (1 ~ 8員ヘテロアルキレニル) $_m$  - ;

$H_2NS(O)_2$  - ( $C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$  - ;

( $C_1 \sim C_6$ アルキル) -  $N(H)S(O)_2$  - ( $C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$  - ;

( $C_1 \sim C_6$ アルキル) $_2$  -  $NS(O)_2$  - ( $C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$  - ;

3 ~ 6員ヘテロシクロアルキル -  $(G)_m$  - ;

5又は6員ヘテロアリール -  $(G)_m$  - ;

( $C_1 \sim C_6$ アルキル) -  $S(O)_2$  -  $N(H)$  -  $C(O)$  - ( $C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$  - ; 及び

び

( $C_1 \sim C_6$ アルキル) -  $C(O) - N(H) - S(O)_2 - (C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$  -

から独立に選択される1 ~ 6の置換基で独立に置換され、

この際、 $G^1$ 又は $G^2$ の炭素原子上の各々の置換基は、更に、ハロ及び $HO_2C$ から独立に選択されることが可能；

$G^1$ 又は $G^2$ の同じ炭素原子上の2の置換基は、それらが結合している該炭素原子と一緒にになって基 $C = O$ を形成することができ；

$G^1$ 及び $G^2$ は、両方が、フェニル、ベンジル、ナフチル、 $C_3 \sim C_7$ シクロアルキル - ( $C_1 \sim C_8$ アルケニル) $_m$  - 、 $C_8 \sim C_{10}$ ビシクロアルキル - ( $C_1 \sim C_8$ アルケニル) $_m$  - 、3 ~ 7員ヘテロシクロアルキル - ( $C_1 \sim C_8$ アルケニル) $_m$  - 、及び8 ~ 10員ヘテロビシクロアルキル - ( $C_1 \sim C_8$ アルケニル) $_m$  - から独立に選択されることはなく；

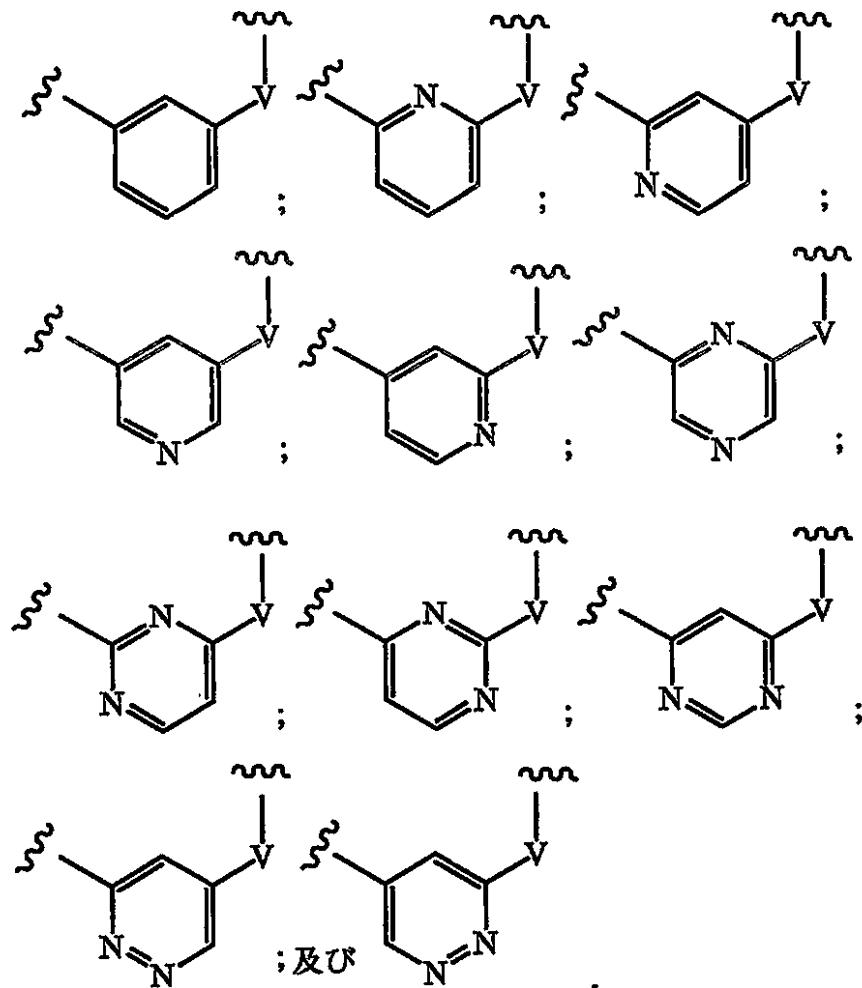
各々の $m$ は、0又は1の整数から独立に選択され；

$G$ 及び $L$ は、各々、 $CH_2$ 、 $C(O)$ 、 $N(H)$ 、 $N(C_1 \sim C_6$ アルキル)、 $O$ 、 $S$ 、 $S(O)$ 、及び $S(O)_2$ から独立に選択され；

$Q$ は、 $O$ 、 $N(H)$ 、又は $N(C_1 \sim C_6$ アルキル)であり；

$D$ は、

【化2】



から選択される環状二価基であり；

この際、基Dは、未置換であっても、炭素及び窒素原子上で、 $\text{CH}_3$ 、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{N}-\text{C}-$ 、 $\text{CH}_3\text{C}(\text{O})$ 、 $\text{HO}$ 、 $\text{CH}_3\text{O}$ 、 $\text{C}(\text{F})\text{H}_2\text{O}$ 、 $\text{C}(\text{H})\text{F}_2\text{O}$ 、及び $\text{CF}_3\text{O}$ から独立に選択される1又は2の基で置換されていてもよく；そして、基Dにおける炭素原子上の該置換基は、更にF及びC1から選択されることが可能；そして

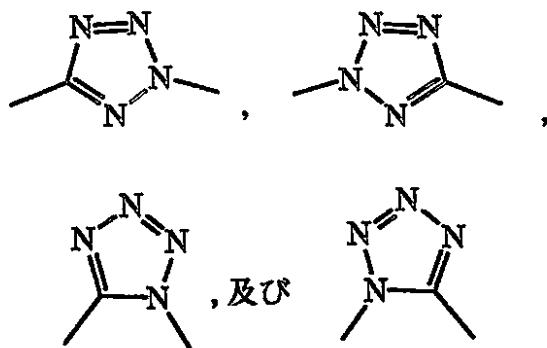
Vは、炭素原子と、1O、1S、1NH、1N( $\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル)、及び4Nから選択される1~4のヘテロ原子とを含有する5員ヘテロアリーレニル二価基であり、OとS原子が両方存在することはなく、該ヘテロアリーレニルは、未置換であっても、炭素又は窒素原子上で、 $\text{CH}_3$ 、 $\text{CF}_3$ 、 $\text{N}-\text{C}-$ 、 $\text{CH}_3\text{C}(\text{O})$ 、 $\text{HO}$ 、 $\text{CH}_3\text{O}$ 、 $\text{C}(\text{F})\text{H}_2\text{O}$ 、 $\text{C}(\text{H})\text{F}_2\text{O}$ 、及び $\text{CF}_3\text{O}$ から選択される1の基で置換されていてもよく；そして、基Vにおける該炭素原子上の置換基は、更にFから選択されることが可能。

化合物又はその塩。

【請求項2】

請求項1の化合物又は薬学的に許容できるその塩であって、Vが

## 【化3】



からなる群から選択される、化合物又は塩。

## 【請求項3】

請求項1の化合物又は薬学的に許容できるその塩であって、VがC(O)N(R<sup>5</sup>)であり、R<sup>5</sup>がH又はCH<sub>3</sub>である、化合物又は塩。

## 【請求項4】

請求項1～3のいずれか1項の化合物又は薬学的に許容できるその塩であって、各々のmが1であり、かつ、各々のC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニルが、独立に、CH<sub>2</sub>であるか、又はC<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル-(G)<sub>m</sub>-、C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル、CN、CF<sub>3</sub>、HO、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)-O、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)-S、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)-S(O)、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)-S(O)<sub>2</sub>、O<sub>2</sub>N、H<sub>2</sub>N、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)-N(H)、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>-N、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)-C(O)O-(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)-C(O)O-(1～8員ヘテロアルキレニル)<sub>m</sub>-、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)-C(O)N(H)-(1～8員ヘテロアルキレニル)<sub>m</sub>-、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)-C(O)N(H)-(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)-N(H)S(O)<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>-NS(O)<sub>2</sub>-(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>-、3～6員ヘテロシクロアルキル-(G)<sub>m</sub>-；5又は6員ヘテロアリール-(G)<sub>m</sub>-、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>アルキル)-S(O)<sub>2</sub>-N(H)-C(O)-(C<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニル)<sub>m</sub>、ハロ、HO<sub>2</sub>C、及び=Oから独立に選択される1又は2の置換基で置換されたCH<sub>2</sub>である化合物又はその塩。

## 【請求項5】

請求項1～4のいずれか1項の化合物又は薬学的に許容できるその塩であって、各々のmが1であり、かつ、各々のC<sub>1</sub>～C<sub>8</sub>アルキレニルが独立にCH<sub>2</sub>、CHF、CF<sub>2</sub>、又はC(=O)であること以外は、G<sup>1</sup>及びG<sup>2</sup>が請求項1で定義された通りである化合物又はその塩。

## 【請求項6】

請求項1の化合物又は薬学的に許容できるその塩を、薬学的に許容できる担体、賦形剤、又は希釈剤と混合して含んでなる医薬組成物。

## 【請求項7】

慢性関節リウマチ、骨関節炎、乳癌、心不全、及びアテローム硬化症性プラーク破裂から選択される疾患を治療するのに有用な医薬品の製造における、請求項1の化合物又は薬学的に許容できるその塩の使用。