

【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

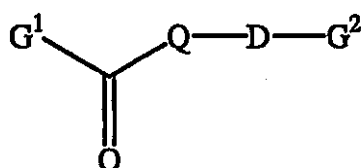
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式I:

【化1】



I

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^1 及び G^2 は、独立に、

$C_3 \sim C_7$ シクロアルキル - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$ - ;

C_5 又は C_6 シクロアルキル - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$ - ;

$C_8 \sim C_{10}$ ビシクロアルキル - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$ - ;

3 ~ 7 員ヘテロシクロアルキル - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$ - ;

5 又は 6 員ヘテロシクロアルキル - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$ - ;

8 ~ 10 員ヘテロビシクロアルキル - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$ - ;

フェニル - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$ - ;

ナフチル - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$ - ;

5 又は 6 員ヘテロアリール - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$ - ;

8 ~ 10 員ヘテロビアリール - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$ - ;

5 又は 6 員ヘテロシクロアルキル - フェニレニル - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$ - ;

ビフェニル - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$ - ;

5 又は 6 員ヘテロアリール - フェニレニル - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$ - ;

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) - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$ - ;

フェニル - L - (フェニレニル) - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$ - ;

フェニル - L - (5 又は 6 員ヘテロアリーレニル) - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$ - ;

8 ~ 10 員ヘテロビアリール - フェニレニル - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$ - ;

フェニル - (5 又は 6 員ヘテロアリーレニル) - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$ - ;

ナフチル - (5 又は 6 員ヘテロアリーレニル) - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$ - ;

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

フェニル - S - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$ - ;

フェニル - S(O) - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$ - ;

フェニル - S(O)₂ - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$ - ;

フェニル - (8 ~ 10 員ヘテロビアリーレニル) - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル) $_m$ -

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^1 及び G^2 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 ;

$(C_1 \sim C_6 \text{アルキル}) - O$;

$(C_1 \sim C_6 \text{アルキル}) - S$;

$(C_1 \sim C_6 \text{アルキル}) - S(O)$;

$(C_1 \sim C_6 \text{アルキル}) - S(O)_2$;

O_2N ;

H_2N ;

$(C_1 \sim C_6 \text{アルキル}) - N(H)$;

$(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})_2 - N$;

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

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

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

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

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

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

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

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 - $(G)_m$ - ;

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

び

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

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でき ;

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 - $(C_1 \sim C_8 \text{アルケニル})_m$ - 、 $C_8 \sim C_{10}$ ビシクロアルキル - $(C_1 \sim C_8 \text{アルケニル})_m$ - 、3 ~ 7 員ヘテロシクロアルキル - $(C_1 \sim C_8 \text{アルケニル})_m$ - 、及び 8 ~ 10 員ヘテロビシクロアルキル - $(C_1 \sim C_8 \text{アルケニル})_m$ - 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 ;

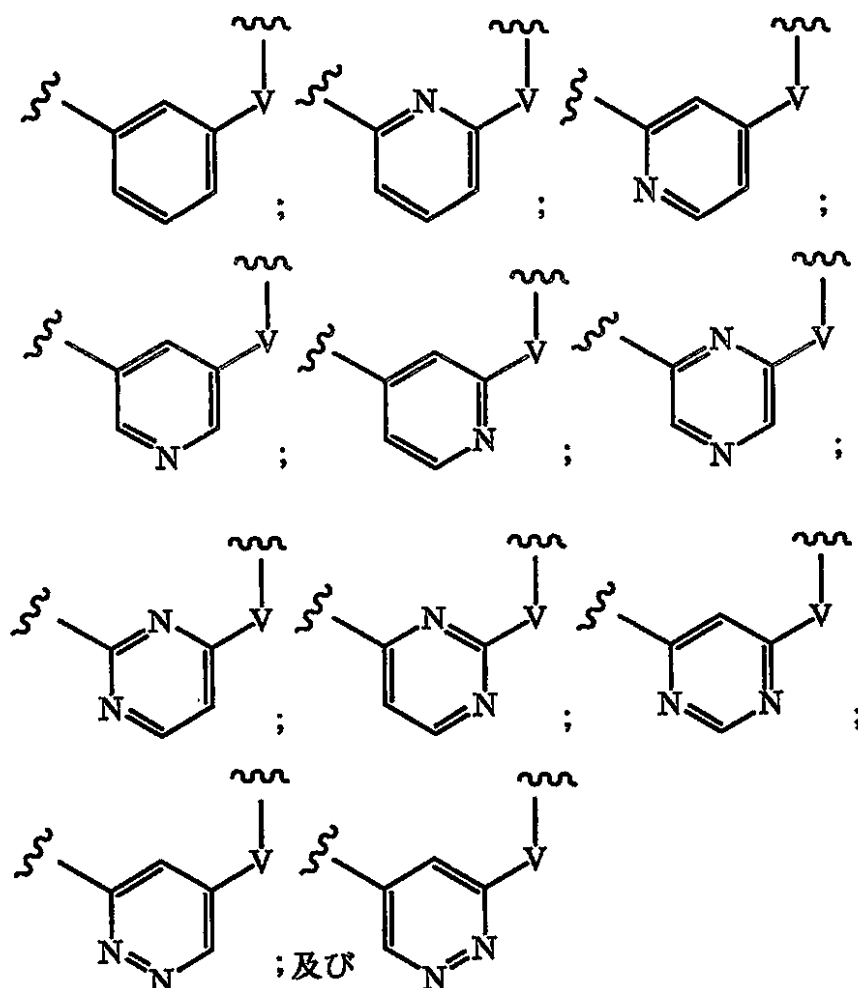
G 及び L は、各々、 CH_2 、 $C(O)$ 、 $N(H)$ 、 $N(C_1 \sim C_6 \text{アルキル})$ 、 O 、 S 、 $S(O)$

、及び $S(O)_2$ から独立に選択され ;

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

D は、

【化 2】



から選択される環状二価基であり；

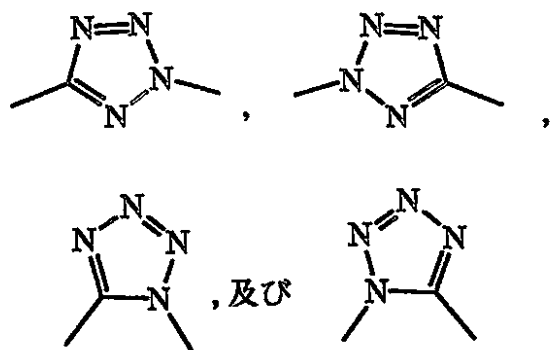
この際、基 D は、未置換であっても、炭素及び窒素原子上で、 CH_3 、 CF_3 、 $\text{N}-\text{C}-$ 、 $\text{CH}_3\text{C}(\text{O})$ 、 HO 、 CH_3O 、 $\text{C}(\text{F})\text{H}_2\text{O}$ 、 $\text{C}(\text{H})\text{F}_2\text{O}$ 、及び CF_3O から独立に選択される 1 又は 2 の基で置換されていてもよく；そして、基 D における炭素原子上の該置換基は、更に F 及び Cl から選択されることができ；そして

V は、炭素原子と、1 O、1 S、1 NH、1 N ($\text{C}_1 \sim \text{C}_6$ アルキル)、及び 4 N 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い、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、 CH_3 、 CF_3 、 $\text{N}-\text{C}-$ 、 $\text{CH}_3\text{C}(\text{O})$ 、 HO 、 CH_3O 、 $\text{C}(\text{F})\text{H}_2\text{O}$ 、 $\text{C}(\text{H})\text{F}_2\text{O}$ 、及び CF_3O 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でき、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 $C(O)N(R^5)$ であり、 R^5 が H 又は CH_3 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 $C_1 \sim C_8$ アルキレニルが、独立に、 CH_2 であるか、又は $C_1 \sim C_6$ 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、O₂N、H₂N、($C_1 \sim C_6$ 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 -、H₂NS(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 -、($C_1 \sim C_6$ アルキル) - C(O) - N(H) - S(O)₂ - ($C_1 \sim C_8$ アルキレニル)_m、ハロ、HO₂C、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_2 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 $C_1 \sim C_8$ アルキレニルが独立に CH_2 、CHF、CF₂、又は C(=O) であること以外は、 G^1 及び G^2 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。