

【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20年9月4日 (2008.9.4)

【公表番号】特表2004-504399(P2004-504399A)

【公表日】平成16年2月12日 (2004.2.12)

【年通号数】公開・登録公報2004-006

【出願番号】特願2002-514137(P2002-514137)

【国際特許分類】

C 0 7 D 498/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/395 (2006.01)

A 6 1 P 13/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 27/06 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 498/08

A 6 1 K 31/395

A 6 1 P 13/02

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 27/06

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成20年7月16日 (2008.7.16)

【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

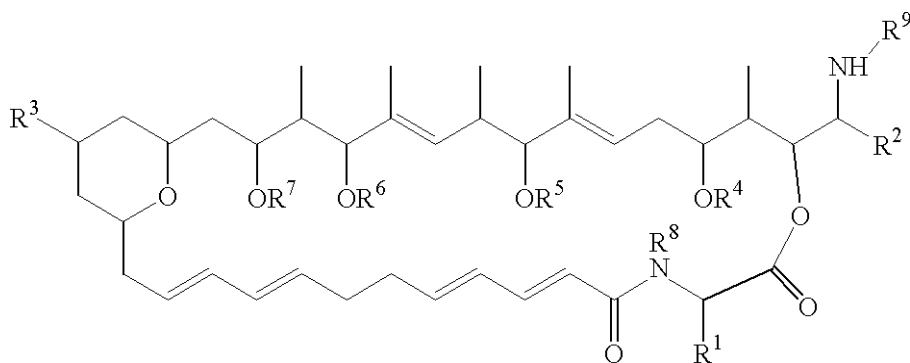
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】 式

【化 1】

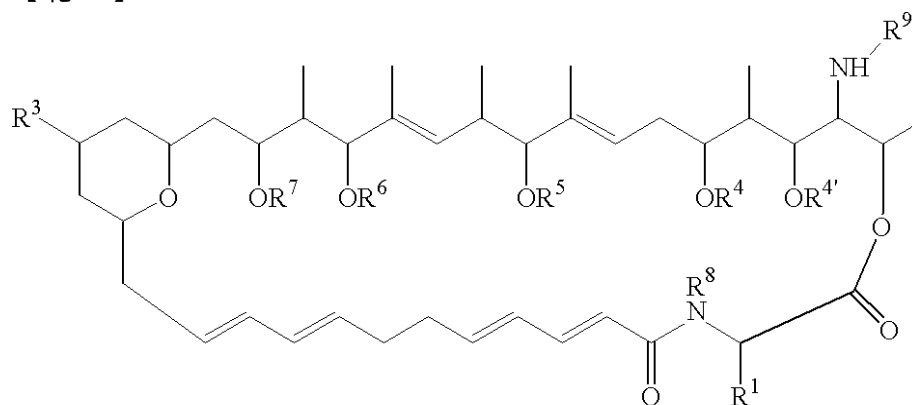


(I)

又は



## 【化 2】



(I I)

[ 式中、

R<sup>1</sup> は、H、直鎖若しくは分枝 C<sub>1</sub> - 3<sub>0</sub> 飽和アルキル、直鎖若しくは分枝 C<sub>2</sub> - 3<sub>0</sub> 不飽和アルキル、又は環骨格に 6 - 10 炭素原子を含むアリールであり、R<sup>1</sup> は、非置換か、若しくは 1 つ以上の置換基で置換され、置換基は同じか、若しくは異なって、オキソ (= O)、OR<sup>1a</sup>、CO<sub>2</sub>R<sup>1a</sup>、及び OC(O)R<sup>1a</sup> からなる群から選択され、R<sup>1a</sup> は、H、直鎖若しくは分枝 C<sub>1</sub> - 3<sub>0</sub> 飽和アルキル、直鎖若しくは分枝 C<sub>2</sub> - 3<sub>0</sub> 不飽和アルキル、又は環骨格に 6 - 10 炭素原子を含むアリールである；

R<sup>2</sup> は、H、直鎖若しくは分枝 C<sub>1</sub> - 3<sub>0</sub> 飽和アルキル、直鎖若しくは分枝 C<sub>2</sub> - 3<sub>0</sub> 不飽和アルキル、又は環骨格に 6 - 10 炭素原子を含むアリールであり、R<sup>2</sup> は、非置換か、若しくは 1 つ以上の置換基で置換され、置換基は同じか、若しくは異なって、オキソ (= O)、OR<sup>2a</sup>、又は OC(O)R<sup>2a</sup> からなる群から選択され、R<sup>2a</sup> は、H、直鎖若しくは分枝 C<sub>1</sub> - 3<sub>0</sub> 飽和アルキル、直鎖若しくは分枝 C<sub>2</sub> - 3<sub>0</sub> 不飽和アルキル、又は環骨格に 6 - 10 炭素原子を含むアリールである；

R<sup>3</sup> は、H、直鎖若しくは分枝 C<sub>1</sub> - 3<sub>0</sub> 飽和アルキル、直鎖若しくは分枝 C<sub>2</sub> - 3<sub>0</sub> 不飽和アルキル、又は環骨格に 6 - 10 炭素原子を含むアリールである；

R<sup>4</sup>、及び R<sup>4</sup> - R<sup>8</sup> は、同じか、若しくは異なって、各々が、R<sup>10</sup>、C(O)R<sup>10</sup>、又は SO<sub>2</sub>R<sup>10</sup> であり、R<sup>10</sup> は、H、直鎖若しくは分枝 C<sub>1</sub> - 3<sub>0</sub> 飽和アルキル、直鎖若しくは分枝 C<sub>2</sub> - 3<sub>0</sub> 不飽和アルキル、又は環骨格に 6 - 10 炭素原子を含むアリールであり、R<sup>10</sup> は、非置換か、若しくは 1 つ以上の置換基で置換され、置換基は同じか、若しくは異なって、オキソ (= O)、OR<sup>10a</sup>、CO<sub>2</sub>R<sup>10a</sup>、及び OC(O)R<sup>10a</sup> からなる群から選択され、R<sup>10a</sup> は、H、直鎖若しくは分枝 C<sub>1</sub> - 3<sub>0</sub> 飽和アルキル、直鎖若しくは分枝 C<sub>2</sub> - 3<sub>0</sub> 不飽和アルキル、又は環骨格に 6 - 10 炭素原子を含むアリールである；

R<sup>9</sup> は、R<sup>9a</sup>、C(O)R<sup>9a</sup>、又は SO<sub>2</sub>R<sup>9a</sup> であり、R<sup>9a</sup> は、H、直鎖若しくは分枝 C<sub>1</sub> - 3<sub>0</sub> 飽和アルキル、直鎖若しくは分枝 C<sub>2</sub> - 3<sub>0</sub> 不飽和アルキル、又は環骨格に 6 - 10 炭素原子を含むアリールであり、R<sup>9a</sup> は、非置換か、若しくは 1 つ以上の置換基で置換され、置換基は同じか、若しくは異なって、オキソ (= O)、OR<sup>9b</sup>、OC(O)R<sup>9b</sup>、OSO<sub>2</sub>R<sup>9b</sup>、NHR<sup>9b</sup>、NHC(O)R<sup>9b</sup> 及び NH SO<sub>2</sub>R<sup>9b</sup> からなる群から選択され、R<sup>9b</sup> は、H、直鎖若しくは分枝 C<sub>1</sub> - 3<sub>0</sub> 飽和アルキル、直鎖若しくは分枝 C<sub>2</sub> - 3<sub>0</sub> 不飽和アルキル、又は環骨格に 6 - 10 炭素原子を含むアリールであり、R<sup>9b</sup> は、非置換か、若しくは 1 つ以上の置換基で置換され、置換基は同じか、若しくは異なって、オキソ (= O)、OR<sup>9c</sup>、CO<sub>2</sub>R<sup>9c</sup> 及び OC(O)R<sup>9c</sup> からなる群から選択され、R<sup>9c</sup> は、H、直鎖若しくは分枝 C<sub>1</sub> - 3<sub>0</sub> 飽和アルキル、直鎖若しくは分枝 C<sub>2</sub> - 3<sub>0</sub> 不飽和アルキル、又は環骨格に 6 - 10 炭素原子を含むアリールである；

R<sup>1a</sup>、R<sup>2a</sup>、R<sup>10a</sup> 及び R<sup>9c</sup> は、非置換か、又は、ハロゲン、アミノ、ヒドロキ

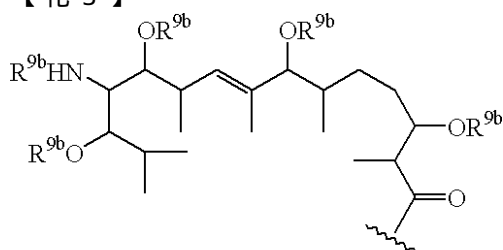


シル、オキソ(=O)、チオ、シアノ及びニトロからなる群から選択される1つ以上の置換基で置換されている]

を有する実質的に精製された化合物、又は医薬として許容できるその塩。

【請求項2】  $R^9$  が  $C(O)R^{9a}$  であり、式

【化3】

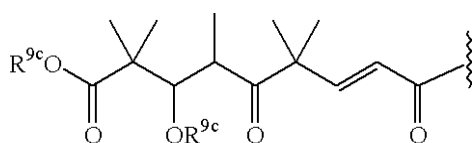


(A)

を有する、請求項1に記載の化合物又は塩。

【請求項3】 式(A)の窒素原子の  $R^{9b}$  置換基が、式

【化4】



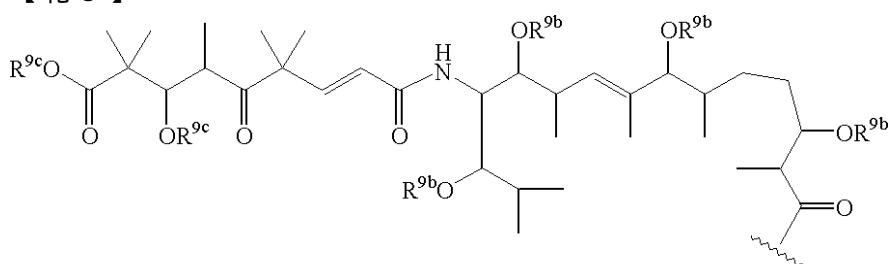
(B)

を有する、請求項2に記載の化合物又は塩。

【請求項4】  $R^1$  が  $CHOR^{1a}CO_2R^{1a}$  であり、 $R^2$  が  $CHOR^{2a}CH_3$  であり、 $R^4$  が  $C(O)CH_2CHOHCO_2R^{10a}$  である、請求項1に記載の化合物又は塩。

【請求項5】  $R^9$  が、式

【化5】



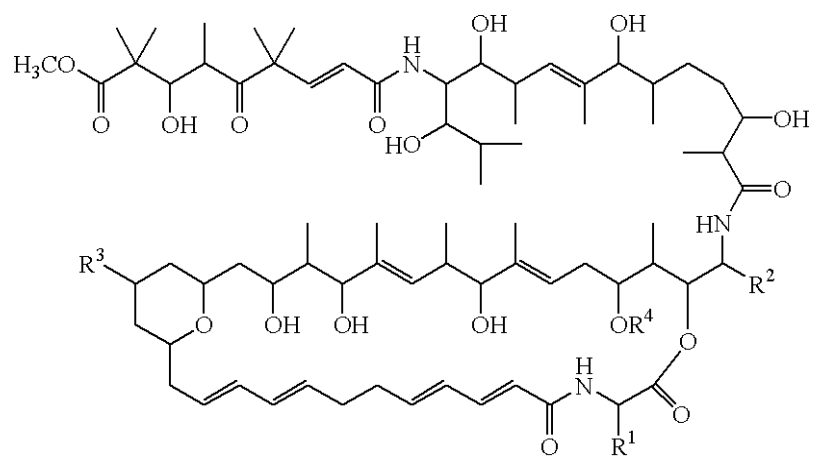
(C)

を有し、 $R^{9b}$  置換基の1つ以上がHであり、末端  $R^{9c}O(CO)$  エステル置換基の  $R^{9c}$  基がH又はメチルであり、その他の  $R^{9c}$  置換基がHである、請求項1に記載の化合物又は塩。

【請求項6】 式

【化6】

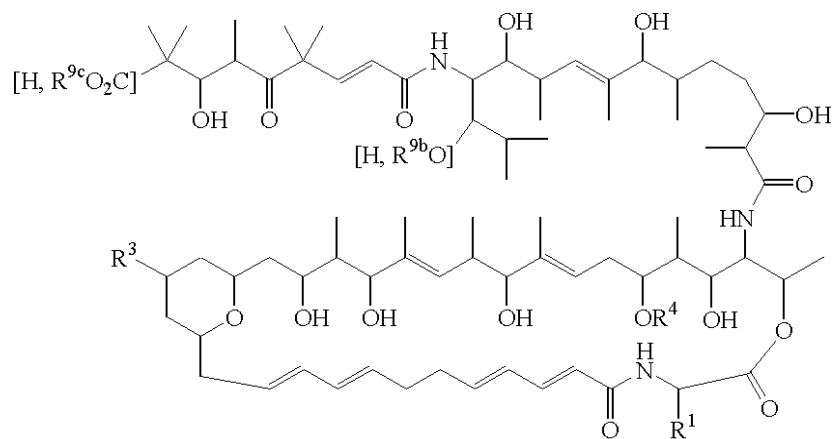




(D)

又は

【化 7】

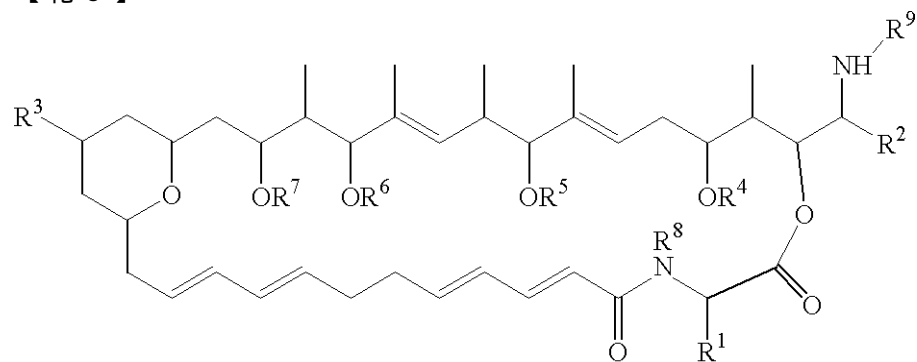


(E)

を有する、請求項 1 に記載の化合物又は塩。

【請求項 7】 式

【化 8】

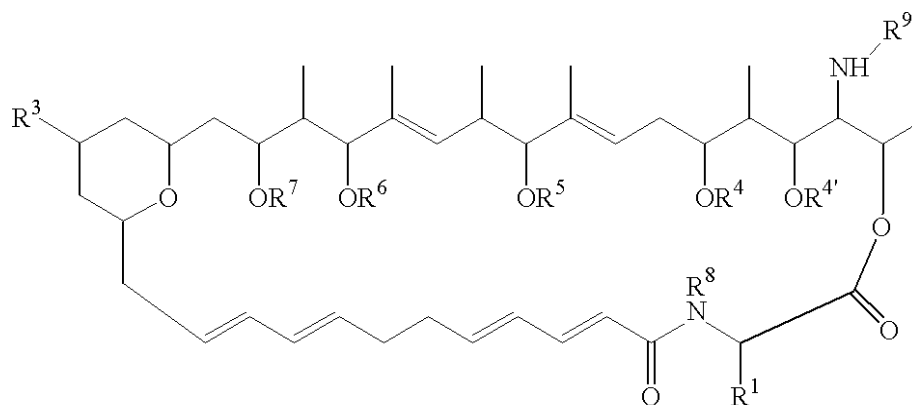


(I)

又は

【化 9】





(I I)

[ 式中、

$R^1$  は、H、直鎖若しくは分枝  $C_{1-30}$  飽和アルキル、直鎖若しくは分枝  $C_{2-30}$  不飽和アルキル、又は環骨格に 6 - 10 炭素原子を含むアリールであり、 $R^1$  は、非置換か、若しくは 1 つ以上の置換基で置換され、置換基は同じか、若しくは異なって、オキソ (= O)、 $OR^{1a}$ 、 $CO_2R^{1a}$ 、及び  $OC(O)R^{1a}$  からなる群から選択され、 $R^{1a}$  は、H、直鎖若しくは分枝  $C_{1-30}$  飽和アルキル、直鎖若しくは分枝  $C_{2-30}$  不飽和アルキル、又は環骨格に 6 - 10 炭素原子を含むアリールである；

$R^2$  は、H、直鎖若しくは分枝  $C_{1-30}$  飽和アルキル、直鎖若しくは分枝  $C_{2-30}$  不飽和アルキル、又は環骨格に 6 - 10 炭素原子を含むアリールであり、 $R^2$  は、非置換か、若しくは 1 つ以上の置換基で置換され、置換基は同じか、若しくは異なって、オキソ (= O)、 $OR^{2a}$ 、又は  $OC(O)R^{2a}$  からなる群から選択され、 $R^{2a}$  は、H、直鎖若しくは分枝  $C_{1-30}$  飽和アルキル、直鎖若しくは分枝  $C_{2-30}$  不飽和アルキル、又は環骨格に 6 - 10 炭素原子を含むアリールである；

$R^3$  は、H、直鎖若しくは分枝  $C_{1-30}$  飽和アルキル、直鎖若しくは分枝  $C_{2-30}$  不飽和アルキル、又は環骨格に 6 - 10 炭素原子を含むアリールである；

$R^4$ 、及び  $R^4 - R^8$  は、同じか、若しくは異なって、各々が、 $R^{10}$ 、 $C(O)R^{10}$ 、又は  $SO_2R^{10}$  であり、 $R^{10}$  は、H、直鎖若しくは分枝  $C_{1-30}$  飽和アルキル、直鎖若しくは分枝  $C_{2-30}$  不飽和アルキル、又は環骨格に 6 - 10 炭素原子を含むアリールであり、 $R^{10}$  は、非置換か、若しくは 1 つ以上の置換基で置換され、置換基は同じか、若しくは異なって、オキソ (= O)、 $OR^{10a}$ 、 $CO_2R^{10a}$ 、及び  $OC(O)R^{10a}$  からなる群から選択され、 $R^{10a}$  は、H、直鎖若しくは分枝  $C_{1-30}$  飽和アルキル、直鎖若しくは分枝  $C_{2-30}$  不飽和アルキル、又は環骨格に 6 - 10 炭素原子を含むアリールである；

$R^9$  は、 $R^{9a}$ 、 $C(O)R^{9a}$ 、又は  $SO_2R^{9a}$  であり、 $R^{9a}$  は、H、直鎖若しくは分枝  $C_{1-30}$  飽和アルキル、直鎖若しくは分枝  $C_{2-30}$  不飽和アルキル、又は環骨格に 6 - 10 炭素原子を含むアリールであり、 $R^{9a}$  は、非置換か、若しくは 1 つ以上の置換基で置換され、置換基は同じか、若しくは異なって、オキソ (= O)、 $OR^{9b}$ 、 $OC(O)R^{9b}$ 、 $OSO_2R^{9b}$ 、 $NHR^{9b}$ 、 $NHC(O)R^{9b}$  及び  $NHSO_2R^{9b}$  からなる群から選択され、 $R^{9b}$  は、H、直鎖若しくは分枝  $C_{1-30}$  飽和アルキル、直鎖若しくは分枝  $C_{2-30}$  不飽和アルキル、又は環骨格に 6 - 10 炭素原子を含むアリールであり、 $R^{9b}$  は、非置換か、若しくは 1 つ以上の置換基で置換され、置換基は同じか、若しくは異なって、オキソ (= O)、 $OR^{9c}$ 、 $CO_2R^{9c}$  及び  $OC(O)R^{9c}$  からなる群から選択され、 $R^{9c}$  は、H、直鎖若しくは分枝  $C_{1-30}$  飽和アルキル、直鎖若しくは分枝  $C_{2-30}$  不飽和アルキル、又は環骨格に 6 - 10 炭素原子を含むアリールである；

$R^{1a}$ 、 $R^{2a}$ 、 $R^{10a}$  及び  $R^{9c}$  は、非置換か、又は、ハロゲン、アミノ、ヒドロキシル、オキソ (= O)、チオ、シアノ及びニトロからなる群から選択される 1 つ以上の置



換基で置換されている]

を有する化合物又は医薬として許容できるその塩

(但し、該化合物は、コンドロブシン A - D、及び 73 - デオキシコンドロブシン A からなる群から選択されない)。

【請求項 8】 請求項 1 - 7 のいずれかに記載の少なくとも 1 つの化合物又は塩及び医薬として許容できる担体を含む医薬組成物。

【請求項 9】 式 (I) 又は (II) の化合物或いはその塩以外の少なくとも 1 つの更なる治療上活性な化合物の治療有効量を更に含む、請求項 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 10】 液胞型 (H+) - ATP アーゼの阻害によって治療できる状態を治療するための、請求項 8 又は 9 に記載の医薬組成物。