

【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22年2月12日 (2010.2.12)

【公表番号】特表2009-522255(P2009-522255A)

【公表日】平成21年6月11日 (2009.6.11)

【年通号数】公開・登録公報2009-023

【出願番号】特願2008-548427(P2008-548427)

【国際特許分類】

C 07 D 413/04 (2006.01)

C 07 D 413/14 (2006.01)

A 61 K 31/422 (2006.01)

A 61 K 31/4439 (2006.01)

C 07 D 413/12 (2006.01)

A 61 K 31/454 (2006.01)

A 61 K 31/5377 (2006.01)

A 61 K 31/496 (2006.01)

A 61 P 19/10 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 3/04 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 25/16 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

A 61 P 25/08 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 25/24 (2006.01)

A 61 P 25/18 (2006.01)

A 61 P 17/14 (2006.01)

A 61 P 7/00 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 07 D 413/04 C S P

C 07 D 413/14

A 61 K 31/422

A 61 K 31/4439

C 07 D 413/12

A 61 K 31/454

A 61 K 31/5377

A 61 K 31/496

A 61 P 19/10

A 61 P 19/02

A 61 P 3/04

A 61 P 3/10

A 61 P 25/16

A 61 P 9/00

A 61 P 25/08

A 61 P 25/28

A 61 P 25/24

A 61 P 25/18

A 61 P 17/14

A 6 1 P 7/00

A 6 1 P 43/00 1 0 5

【手続補正書】

【提出日】平成21年12月18日(2009.12.18)

【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】

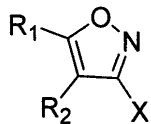
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記化学式 1 で表される新規なイソキサゾール誘導体又はその医薬剂的に許容される塩：

【化 1】

[化学式 1]



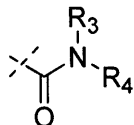
(式中、 R_1 は1以上の水素がアシル基、アミノ基、カルボアルコキシ基、カルボキシ基、カルボキシアミノ基、 $-O-$ カルバモイル基($-O-(C=O)-NH_2$)、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、チオ基、アルキル基、シクロアルキル基、アリール基、アルコキシ基、アリールオキシ基、スルホキシ基、グアニド基及びその組み合わせからなる群から選択された1種以上の置換基で置換可能なアリール基を表し；

R_2 は水素原子を表し；

Xは下記化学式 2 で表される1種の置換基を表す。

【化 2】

[化学式 2]



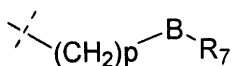
式中、

R_3 は水素原子を表し；

R_4 はアリール基で置換されたアルキル基を表し又は下記化学式 7 で表される置換基を表し、

【化 3】

[化学式 7]



式中、

pは2又は3を表し、

BはO、S、SO、又はS(=O)₂を表し；

R_7 は1以上の水素がアシル基、アミノ基、カルボアルコキシ基、カルボキシ基、カルボキシアミノ基、 $-O-$ カルバモイル基($-O-(C=O)-NH_2$)、シアノ基、ハロゲン原子、ヒドロキシ基、ニトロ基、チオ基、アルキル基、シクロアルキル基、アリール基、アルコキシ基、アリールオキシ基、スルホキシ基、グアニド基及びその組み合わせからなる群から選択された1種以上の置換基で置換可能なアリール基を表す。)。

【請求項 2】

イソキサゾール誘導体が下記化合物よりなる群から選択される、請求項 1 記載のイソキサゾール誘導体又はその医薬剂的に許容される塩：

- (1) : 5 - フラン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (3 - イミダゾール - 1 - イル - プロピル) - アミド
- (1 0) : 5 - フラン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (2 - ピリジン - 2 - イル - エチル) - アミド
- (1 1) : 5 - フラン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (2 - ピリジン - 3 - イル - エチル) - アミド
- (1 2) : 5 - フラン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (2 - ピリジン - 4 - イル - エチル) - アミド
- (3 3) : 5 - フラン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (2 - イミダゾール - 1 - イル - エチル) - アミド
- (3 5) : 5 - フラン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 [2 - (2 - メチル - イミダゾール - 1 - イル) - エチル] - アミド
- (3 6) : 5 - フラン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 [2 - (5 - メチル - イミダゾール - 1 - イル) - エチル] - アミド
- (3 7) : 5 - フラン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 [2 - (4 - メチル - イミダゾール - 1 - イル) - エチル] - アミド
- (3 8) : 5 - フラン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (2 - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 1 - イル - エチル) - アミド
- (3 9) : 5 - フラン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (2 - ピラゾール - 1 - イル - エチル) - アミド
- (4 0) : 5 - フラン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (2 - [1 , 2 , 3] トリアゾール - 2 - イル - エチル) - アミド
- (4 1) : 5 - フラン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (2 - [1 , 2 , 3] トリアゾール - 1 - イル - エチル) - アミド
- (4 2) : 5 - フラン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (2 - テトラゾール - 2 - イル - エチル) - アミド
- (4 3) : 5 - フラン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (2 - テトラゾール - 1 - イル - エチル) - アミド
- (4 4) : 5 - フラン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 [3 - (2 - メチル - イミダゾール - 1 - イル) - プロピル] - アミド
- (4 8) : 5 - フラン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (3 - ピラゾール - 1 - イル - プロピル) - アミド
- (4 9) : 5 - フラン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (3 - [1 , 2 , 3] トリアゾール - 1 - イル - プロピル) - アミド
- (5 0) : 5 - フラン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (3 - [1 , 2 , 3] トリアゾール - 2 - イル - プロピル) - アミド
- (5 1) : 5 - フラン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (3 - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 1 - イル - プロピル) - アミド
- (5 2) : 5 - フラン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (3 - テトラゾール - 1 - イル - プロピル) - アミド
- (5 3) : 5 - フラン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (3 - テトラゾール - 2 - イル - プロピル) - アミド
- (5 6) : 5 - フラン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 [3 - (4 - メチル - イミダゾール - 1 - イル) - プロピル] - アミド
- (6 8) : 5 - フェニル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (3 - イミダゾール - 1 - イル - プロピル) - アミド
- (6 9) : 5 - フェニル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (2 - イミダゾール - 1 - イル - エチル) - アミド

[illegible]

- (1 3 2) : 5 - チオフェン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (3 - [1 , 2 , 4] - トリアゾール - 1 - イル - プロピル) - アミド
- (1 3 3) : 5 - チオフェン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (2 - イミダゾール - 1 - イル - エチル) - アミド
- (1 3 4) : 5 - チオフェン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (2 - ピラゾール - 1 - イル - エチル) - アミド
- (1 3 5) : 5 - チオフェン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (2 - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 1 - イル - エチル) - アミド
- (1 3 6) : 5 - チオフェン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (2 - [1 , 2 , 3] トリアゾール - 2 - イル - エチル) - アミド
- (1 3 7) : 5 - チオフェン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (2 - [1 , 2 , 3] トリアゾール - 1 - イル - エチル) - アミド
- (1 3 9) : 5 - チオフェン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (2 - ピリジン - 3 - イル - エチル) - アミド
- (1 4 0) : 5 - チオフェン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (2 - ピリジン - 4 - イル - エチル) - アミド
- (1 4 3) : 5 - (5 - ブロモ - チオフェン - 2 - イル) - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (3 - イミダゾール - 1 - イル - プロピル) - アミド
- (1 5 2) : 5 - フラン - 3 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (3 - イミダゾール - 1 - イル - プロピル) - アミド
- (1 5 3) : 5 - フラン - 3 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (3 - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 1 - イル - プロピル) - アミド
- (1 5 4) : 5 - フラン - 3 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (2 - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 1 - イル - エチル) - アミド
- (1 5 5) : 5 - チオフェン - 3 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (3 - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 1 - イル - プロピル) - アミド
- (1 5 6) : 5 - チオフェン - 3 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (3 - イミダゾール - 1 - イル - プロピル) - アミド
- (1 5 7) : 5 - チオフェン - 3 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (2 - イミダゾール - 1 - イル - エチル) - アミド
- (1 5 8) : 5 - チオフェン - 3 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 (2 - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 1 - イル - エチル) - アミド
- (2 1 6) : 5 - フラン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 [2 - (ピリジン - 2 - イルオキシ) - エチル] - アミド
- (2 1 7) : 5 - チオフェン - 2 - イル - イソキサゾール - 3 - カルボン酸 [2 - (ピリジン - 2 - イルオキシ) - エチル] - アミド

【請求項 3】

骨粗鬆症及び骨関節症の治療又は予防のために治療に効果的な量で請求項 1 又は 2 記載のイソキサゾール誘導体を含む、医薬剤組成物。

【請求項 4】

前記医薬剤組成物が、該組成物を経口、非経口、注射又は経皮製剤に処方するのに適当な医薬剂的に許容されるキャリアを含む、請求項 3 記載の医薬剤組成物。