

【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19年4月5日(2007.4.5)

【公表番号】特表2001-521532(P2001-521532A)

【公表日】平成13年11月6日(2001.11.6)

【年通号数】公開・登録公報999999

【出願番号】特願平10-544759

【国際特許分類】

C 07 D 257/04	(2006.01)
A 61 K 31/41	(2006.01)
A 61 K 31/4196	(2006.01)
A 61 K 31/4245	(2006.01)
A 61 K 31/4427	(2006.01)
A 61 P 1/04	(2006.01)
A 61 P 1/12	(2006.01)
A 61 P 3/00	(2006.01)
A 61 P 7/06	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)
A 61 P 9/12	(2006.01)
A 61 P 19/10	(2006.01)
A 61 P 27/06	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 37/08	(2006.01)
C 07 D 249/12	(2006.01)
C 07 D 271/10	(2006.01)
C 07 D 401/10	(2006.01)
C 07 D 409/10	(2006.01)

【F I】

C 07 D 257/04	E
A 61 K 31/41	
A 61 K 31/4196	
A 61 K 31/4245	
A 61 K 31/4427	
A 61 P 1/04	
A 61 P 1/12	
A 61 P 3/00	
A 61 P 7/06	
A 61 P 9/00	
A 61 P 9/12	
A 61 P 19/10	
A 61 P 27/06	
A 61 P 29/00	
A 61 P 37/08	
C 07 D 249/12	5 0 1
C 07 D 271/10	
C 07 D 401/10	
C 07 D 409/10	

【手続補正書】

【提出日】平成18年9月26日(2006.9.26)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】補正の内容のとおり

【補正方法】変更

【補正の内容】

手 続 補 正 書

平成 18 年 9 月 26 日

特許庁長官殿



1. 事件の表示

平成 10 年 特許願第 544759 号

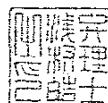
2. 補正をする者

事件との関係 特許出願人

名 称 ニューロサーチ・アクティーゼルスカブ

3. 代 理 人

居 所 〒100-0004 東京都千代田区大手町二丁目2番1号
 新 大 手 町 ビ ル デ ン グ 3 3 1
 電 話 (3211) 3651 (代表)
 氏 名 (6669) 浅 村 告



4. 補正対象書類名

請求の範囲

5. 補正対象項目名

請求の範囲

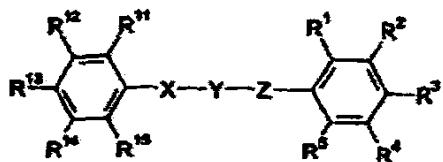


6. 補正の内容 別紙の通り



請求の範囲

1. 式



〔式中、

R^1 、 R^2 及び R^3 のうちの1つは3-ヒドロキシ-4-オキソピラニル、2-ヒドロキシ-4-オキソピリミジル、3, 5-ジオキソ-1, 2, 4-オキサジアゾリジニル、2, 4-ジオキソ-イミダゾリジニル、2, 5-ジオキソ-3-ヒドロキシピロリル、2, 5-ジオキソピロリジニル、2, 4-ジオキソ-1, 3-チアゾリジニル、3-ヒドロキシイソオキサゾリル、5-ヒドロキシイソオキサゾリル、3-ヒドロキシイソチアゾリル、3-ヒドロキシ-1, 2, 5-チアジアゾリル、テトラゾリル、3-ヒドロキシトリアゾリル、3-ヒドロキシピラゾリル、2-ヒドロキシ-1, 3, 4-オキサジアゾリル、4-ヒドロキシ-1, 2, 4-トリアゾリル、3-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 2, 4-トリアゾリル、2-オキソ-3H-1, 3, 4-オキサジアゾリル、3-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 2, 4-トリアゾリル及び2-ヒドロキシ-3, 4-ジオキソシクロブテニルであり、 R^4 、 R^5 並びに置換基 R^1 、 R^2 及び R^3 のうちの他の2つは、相互に独立して水素、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシ、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、アミノ、アルキルアミノ、 $-COOR^7$ 、 $-NH_2SO_2-$ アルキル、 $-SO_2N(R^7)_2$ 、 $-SO_2OR^7$ 、 $-CO-R^7$ 、フェニル、ナフチル、ビフェニル、フェニルアミノ、フェノキシ又は5-又は6-員成ヘテロ環状单環状基から選ばれ、この際フェニル、ナフチル、ビフェニル、フェニルアミノ、フェノキシ又は5-又は6-員成ヘテロ環状单環状基は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、アミノ及びアルキルアミノ、フェニル、ナフチル及び5-又は6-員成ヘテロ環状单環状基より成る群から選ばれた置換基

によって1回以上置換されていてよいか

あるいは

R^3 及び R^4 又は R^4 及び R^5 は一緒になって環構造を形成し、他の置換基 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び R^5 は上述の意味を有し；

R^7 は水素、アルキル、アミノ又はフェニルであり；

Y は $-CO-$ 、 $-CS-$ 、 $-SO_2-$ 、又は $-C(=N-R^8)-$ （式中、 R^8 は水素、アルキル又はシアノである。）であり；

X は $-NH-$ 、 $-CH_2-NH-$ 、又は $-SO_2-NH-$ であり；

Z は NR^6 、 O 、 $-CH=CH-$ 、 $-N=CH-$ 又は $-CH=N-$ （式中、 R^6 は水素又はアルキルである。）であり；

R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} のうちの1つは、水素、アルキル、アルコキシ、ヒドロキシ、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、アミノ、アルキルアミノ、 $-COOR^7$ 、 $-NHSO_2-$ アルキル、 $-SO_2N(R^7)_2$ 、 $-SO_2OR^7$ 及び $-CO-R^7$ 、フェニル、ナフチル、ビフェニル、フェニルアミノ、フェノキシ又は5-又は6-員成ヘテロ環状单環状基から選ばれ、この際フェニル、ナフチル、ビフェニル、フェニルアミノ、フェノキシ又は5-又は6-員成ヘテロ環状单環状基は、アルキル、ヒドロキシ、アルコキシ、ハロゲン、トリフルオロメチル、シアノ、ニトロ、アミノ及びアルキルアミノ、フェニル、ナフチル及び5-又は6-員成ヘテロ環状单環状基より成る群から選ばれた置換基によって1回以上置換されていてよく、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} のうちの他の4つは水素であり、

あるいは

R^{11} 及び R^{12} 、 R^{12} 及び R^{13} 、 R^{13} 及び R^{14} 又は R^{14} 及び R^{15} のうちの1つは一緒になって環構造を形成し、他の置換基 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} は上述の意味を有し、 R^7 は上述の意味を有する】

で表わされる化合物又はその薬学的に容認された塩。

2. Z は NR^6 そして Y は CO である、請求の範囲1記載の化合物。

3. 3-トリフルオロメチルフェニル-4-ニトロ-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；

3-トリフルオロメチルフェニル-4-(2-ナフチル)-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；
3-トリフルオロメチルフェニル-4-(3-ピリジル)-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；
3-トリフルオロメチルフェニル-4-(1-ナフチル)-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；
3-トリフルオロメチルフェニル-4-(4-トリフルオロメチルフェニル)-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；
3-トリフルオロメチルフェニル-4-(3-フリル)-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；
3-トリフルオロメチルフェニル-4-(3-チエニル)-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；
3-トリフルオロメチルフェニル-4-(3-ニトロフェニル)-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；
3-トリフルオロメチルフェニル-4-(4-エトキシカルボニルフェニル)-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；
3-トリフルオロメチルフェニル-4-(4-ジエチルアミノカルボニルフェニル)-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；
3-トリフルオロメチルフェニル-4-(4-アミノカルボニルフェニル)-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；
3-トリフルオロメチルフェニル-2-(4-ヒドロキシ-1, 2, 4-トリアゾール-3-イル)フェニル尿素；
3-トリフルオロメチルフェニル-2-(3-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)フェニル尿素；
3-トリフルオロメチルフェニル-2-(2-オキソ-3H-1, 3, 4-オキサジアゾール-5-イル)フェニル尿素；
3-トリフルオロメチルフェニル-4-ビフェニリル-2-(3-オキソ-1, 2-ジヒドロ-1, 2, 4-トリアゾール-1-イル)フェニル尿素；
3-トリフルオロメチルフェニル-4-アミノ-2-(5-テトラゾリル)フェ

ニル尿素；

3-トリフルオロメチルフェニル-4-アセチルアミノ-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；

3-トリフルオロメチルフェニル-4-ベンゾイルアミノ-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；

3-トリフルオロメチルフェニル-4-(4-カルボキシフェニル)-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；

3-トリフルオロメチルフェニル-4-(4-アニリノカルボニルフェニル)-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；

4-ビフェニリル-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；

3-ビフェニリル-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；

5-インダニル-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；

3-プロモフェニル-4-プロモ-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；

3-アセチルフェニル-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；

3-ビフェニリル-4-プロモ-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；

3-(3-ピリジル)フェニル-4-プロモ-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；

3-トリフルオロメチルフェニル-4-プロモ-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；

3-トリフルオロメチルフェニル-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；

3-トリフルオロメチルフェニル-4-フェニル-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；

4-トリフルオロメチルフェニル-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；

3-クロロフェニル-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；

フェニル-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；

3-トリフルオロメチルフェニル-4-アミノ-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素

である、請求の範囲1記載の化合物。

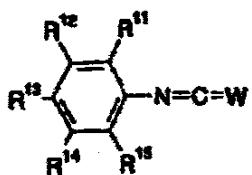
4. 請求の範囲1ないし3のいずれか1つに記載の化合物又はその薬学的に容認

された塩の治療上有効な量を少なくとも1種の薬学的に容認されたキャリヤー又は希釈剤と共に含有する薬剤。

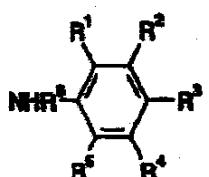
5. ヒトを含めた動物生体の障害又は疾病——その障害又は疾病はクロライドチャレンネルの遮断に応答する——の治療用薬剤の製造に、請求の範囲1ないし3のいずれか1つに記載の化合物を使用する方法。

6. 鎌状血球貧血、虚血又は腫瘍による脳水腫、下痢、高血圧（利尿）、骨粗鬆症、縁内障、アレルギー又は炎症病態及び潰瘍の治療用薬剤の製造に、請求の範囲1記載の化合物を使用する方法。

7. a) 式

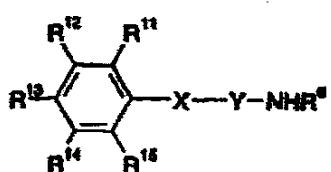


（式中WはO又はSであり、R¹¹、R¹²、R¹³、R¹⁴及びR¹⁵は上述の意味を有する。）の化合物を式



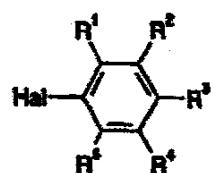
（式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵及びR⁶は上述の意味を有する。）の化合物と反応させるか又は

b) 式



(式中、X, Y, R⁶, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴及びR¹⁵は上述の意味を有する。)

の化合物を式



(式中、Halはハロゲンであり、R¹, R², R³, R⁴及びR⁵は上述の意味を有する。)

の化合物と反応させ、その後得られた化合物を場合により本発明の他の化合物に変換するか及び（又は）その薬学的に容認された塩を常法で生成することを特徴とする、請求の範囲1～3のいずれか1つに記載の化合物の製造方法。