

【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 0 7 D 257/04 (2006.01)
A 6 1 K 31/41 (2006.01)
A 6 1 K 31/4196 (2006.01)
A 6 1 K 31/4245 (2006.01)
A 6 1 K 31/4427 (2006.01)
A 6 1 P 1/04 (2006.01)
A 6 1 P 1/12 (2006.01)
A 6 1 P 3/00 (2006.01)
A 6 1 P 7/06 (2006.01)
A 6 1 P 9/00 (2006.01)
A 6 1 P 9/12 (2006.01)
A 6 1 P 19/10 (2006.01)
A 6 1 P 27/06 (2006.01)
A 6 1 P 29/00 (2006.01)
A 6 1 P 37/08 (2006.01)
C 0 7 D 249/12 (2006.01)
C 0 7 D 271/10 (2006.01)
C 0 7 D 401/10 (2006.01)
C 0 7 D 409/10 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 257/04 E
 A 6 1 K 31/41
 A 6 1 K 31/4196
 A 6 1 K 31/4245
 A 6 1 K 31/4427
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 1/12
 A 6 1 P 3/00
 A 6 1 P 7/06
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 9/12
 A 6 1 P 19/10
 A 6 1 P 27/06
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 37/08
 C 0 7 D 249/12 5 0 1
 C 0 7 D 271/10
 C 0 7 D 401/10
 C 0 7 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 ニューロサーアチ・アクティージェルスカブ

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 ィ ン グ 3 3 1

電 話 (3 2 1 1) 3 6 5 1 (代 表)

氏 名 (6 6 6 9) 浅 村 皓



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

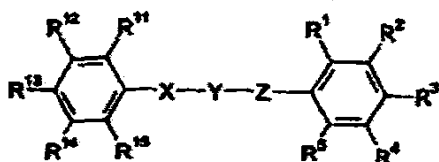


6. 補正の内容 別紙の通り



請求の範囲

1. 式



[式中、

R¹, R²及びR³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、R⁴, R⁵並びに置換基R¹, R²及びR³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、-COOR⁷、-NH-SO₂-アルキル、-SO₂N(R⁷)₂、-SO₂OR⁷、-CO-R⁷、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-員成ヘテロ環状単環状基から選ばれ、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-員成ヘテロ環状単環状基は、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-員成ヘテロ環状単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 $-\text{CO}-$ 、 $-\text{CS}-$ 、 $-\text{SO}_2-$ 、又は $-\text{C}(=\text{N}-\text{R}^8)-$ (式中、 R^8 は水素、アルキル又はシアノである。) であり;

Xは $-\text{NH}-$ 、 $-\text{CH}_2-\text{NH}-$ 、又は $-\text{SO}_2-\text{NH}-$ であり;

Zは NR^6 、O、 $-\text{CH}=\text{CH}-$ 、 $-\text{N}=\text{CH}-$ 又は $-\text{CH}=\text{N}-$ (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、 $-\text{COOR}^7$ 、 $-\text{NH}\text{SO}_2$ -アルキル、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^7)_2$ 、 $-\text{SO}_2\text{OR}^7$ 及び $-\text{CO}-\text{R}^7$ 、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-員成ヘテロ環状単環状基から選ばれ、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-員成ヘテロ環状単環状基は、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-員成ヘテロ環状単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-ビフェニル-2-(5-テトラゾリル)フェニル尿素；

3-ビフェニル-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-ブロモフェニル-4-ブロモ-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-ビフェニル-4-ブロモ-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-ブロモ-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-ブロモ-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。

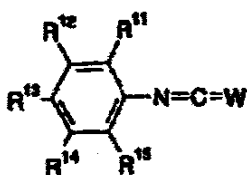
4. 請求の範囲1ないし3のいずれか1つに記載の化合物又はその薬学的に容認

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ア又は希釈剤と共に含有する薬剤。

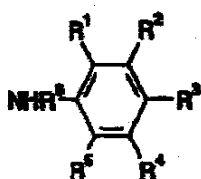
5. ヒトを含めた動物生体の障害又は疾病——その障害又は疾病はクロライドチャンネルの遮断に応答する——の治療用薬剤の製造に、請求の範囲1ないし3のいずれか1つに記載の化合物を使用する方法。

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、緑内障、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に記載の化合物を使用する方法。

7. a) 式

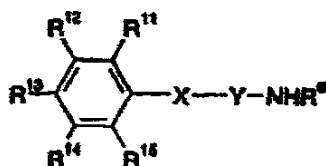


(式中WはO又はSであり、 R^{11} , R^{12} , R^{13} , R^{14} 及び R^{15} は上述の意味を有する。)の化合物を式



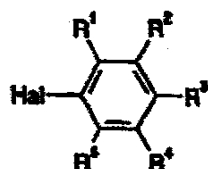
(式中、 R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 及び R^6 は上述の意味を有する。)の化合物と反応させるか又は

b) 式



(式中、X、Y、 R^6 、 R^{11} 、 R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 及び R^{15} 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、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 及び R^5 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。