

【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21年10月8日(2009.10.8)

【公表番号】特表2009-511548(P2009-511548A)

【公表日】平成21年3月19日(2009.3.19)

【年通号数】公開・登録公報2009-011

【出願番号】特願2008-535039(P2008-535039)

【国際特許分類】

C 0 7 D	239/48	(2006.01)
A 6 1 K	31/505	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	9/06	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	25/22	(2006.01)
A 6 1 P	25/02	(2006.01)
A 6 1 P	17/14	(2006.01)
A 6 1 P	13/10	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	1/10	(2006.01)
A 6 1 P	25/08	(2006.01)
A 6 1 P	25/24	(2006.01)
A 6 1 P	3/10	(2006.01)
A 6 1 P	15/08	(2006.01)
A 6 1 P	27/16	(2006.01)
A 6 1 P	9/12	(2006.01)
A 6 1 P	37/06	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	15/10	(2006.01)
A 6 1 P	25/06	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	21/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/26	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/18	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	1/12	(2006.01)
A 6 1 P	17/02	(2006.01)
A 6 1 P	13/02	(2006.01)
A 6 1 P	15/00	(2006.01)
A 6 1 P	13/00	(2006.01)
A 6 1 P	27/00	(2006.01)
A 6 1 P	1/02	(2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D	239/48	C S P
A 6 1 K	31/505	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	9/06	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	25/22	
A 6 1 P	25/02	
A 6 1 P	17/14	
A 6 1 P	13/10	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	1/10	
A 6 1 P	25/08	
A 6 1 P	25/24	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	15/08	
A 6 1 P	27/16	
A 6 1 P	9/12	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	15/10	
A 6 1 P	25/06	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	21/04	
A 6 1 P	25/26	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/18	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	1/12	
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	13/02	
A 6 1 P	15/00	
A 6 1 P	13/00	
A 6 1 P	27/00	
A 6 1 P	1/02	

【手続補正書】

【提出日】平成21年8月19日(2009.8.19)

【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

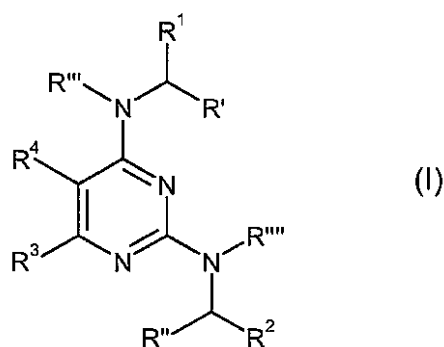
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I のピリミジン - 2 , 4 - ジアミン誘導体、
【化 1】



任意のその異性体若しくは任意のその異性体の混合物、又は薬学的に許容されるその塩
[式中、

R^1 は $-(CH_2)_v - R^5$ を表し；ここで、
 v は 0 又は 1 であり；

R^5 はアリール基を表し、このアリール基は、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、アルキル、アミノ又は N , N - ジアルキル - アミノからなる群から独立に選択される 1 つ又は複数の置換基により場合によって置換され；

R' 及び R'' は、互いに独立に、水素又は R^e - アルキルを表し；又は

R' は R'' と一緒になって $-(CH_2)_p -$ を形成し、ここで、 p は、3、4 又は 5 であり；又は

R' は R^1 のアリール基のオルト位に対して $-(CH_2)_q -$ 架橋を形成し、ここで、 q は、2、3 又は 4 であり； R'' は、水素又は R^e - アルキルを表し；

ここで、 R^e は、水素、ヒドロキシル、シアノ、アミノ又は N , N - ジアルキル - アミノを表し；

R^2 は $-(CH_2)_w - R^6$ を表し、ここで、
 w は 0 又は 1 であり；

R^6 はアリール基を表し、このアリール基は、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、アルキル、アミノ又は N , N - ジアルキル - アミノからなる群から独立に選択される 1 つ又は複数の置換基により場合によって置換され；

R'' 及び R''' は、互いに独立に、水素又は R^f - アルキルを表し；又は

R'' は R''' と一緒になって $-(CH_2)_s$ を形成し、ここで、 s は、3、4 又は 5 であり；又は

R'' は R^2 のアリール基のオルト位に対して $-(CH_2)_t$ 架橋を形成し、ここで、 t は、2、3 又は 4 であり； R''' は、水素又は R^f - アルキルを表し；

ここで、 R^f は、水素、ヒドロキシル、シアノ、アミノ又は N , N - ジアルキル - アミノを表し；

R^3 及び R^4 は、互いに独立に、水素、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、アルキル及びアルコキシからなる群から選択される]。

【請求項 2】

R^1 が $-(CH_2)_v - R^5$ を表し；式中、
 v は 0 又は 1 であり；

R^5 はアリール基を表し、このアリール基は、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ、アルキル、アミノ又は N , N - ジアルキル - アミノからなる群から独立に選択される 1 つ又は複数の置換基により場合によって置換される、請求項 1 に記載のピリミジン - 2 , 4 - ジアミン誘導体。

【請求項 3】

R' 及び R'' が、互いに独立に、水素又は R^e - アルキルを表し；又は
 R' が R'' と一緒になって $-(CH_2)_p-$ を形成し、ここで、 p は、3、4 又は 5
 であり；又は

R' が、 R^1 のアリール基のオルト位に対して $-(CH_2)_q-$ 架橋を形成し、ここで、
 q は、2、3 又は 4 であり； R'' が水素又は R^e - アルキルを表し；
 ここで、 R^e は、水素、ヒドロキシル、シアノ、アミノ又は N, N - ジアルキル - アミノ
 を表す、請求項 1 又は 2 に記載のピリミジン - 2, 4 - ジアミン誘導体。

【請求項 4】

R^2 が $-(CH_2)_w-R^6$ を表し；式中、
 w は 0 又は 1 であり；

R^6 はアリール基を表し、このアリール基は、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロ
 メトキシ、シアノ、アルキル、アミノ又は N, N - ジアルキル - アミノからなる群から独
 立に選択される 1 つ又は複数の置換基により場合によって置換される、請求項 1 から 3 ま
 でのいずれか一項に記載のピリミジン - 2, 4 - ジアミン誘導体。

【請求項 5】

R' 及び R'' が、互いに独立に、水素又は R^f - アルキルを表し；又は
 R' が R'' と一緒になって $-(CH_2)_s-$ を形成し、ここで、 s は、3、4 又
 は 5 であり；又は
 R' が R^2 のアリール基のオルト位に対して $-(CH_2)_t-$ 架橋を形成し、ここで、
 t は、2、3 又は 4 であり； R'' が水素又は R^f - アルキルを表し；ここで、
 R^f が水素、ヒドロキシル、シアノ、アミノ又は N, N - ジアルキル - アミノを表す、請
 求項 1 から 4 までのいずれか一項に記載のピリミジン - 2, 4 - ジアミン誘導体。

【請求項 6】

R^3 及び R^4 が、互いに独立に、水素、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメ
 トキシ、シアノ、アルキル及びアルコキシからなる群から選択される、請求項 1 から 5 ま
 でのいずれか一項に記載のピリミジン - 2, 4 - ジアミン誘導体。

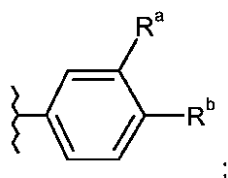
【請求項 7】

R' 、 R'' 、 R''' 及び R'''' が、互いに独立に、水素又はアルキルであり；
 R' がアリール基を表し；
 このアリール基は、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ及びアル
 キルからなる群から独立に選択される 1 つ又は複数の置換基により場合によって置換され
 ；
 R^2 がアリール基を表し；
 このアリール基は、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ及びアル
 キルからなる群から独立に選択される 1 つ又は複数の置換基により場合によって置換され
 ；
 R^3 及び R^4 が、互いに独立に、水素、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメ
 トキシ、シアノ、アルキル及びアルコキシからなる群から選択される、請求項 1 から 6 ま
 でのいずれか一項に記載のピリミジン - 2, 4 - ジアミン誘導体。

【請求項 8】

R^1 が、

【化 2】



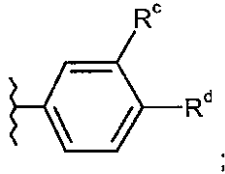
を表し、式中、

R^a 及び R^b が、互いに独立に、水素、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ及びアルキルからなる群から選択される、請求項 1 又は 7 に記載のピリミジン - 2 , 4 - ジアミン誘導体。

【請求項 9】

R^2 が

【化 3】



を表し、式中、

R^c 及び R^d が、互いに独立に、水素、ハロ、トリフルオロメチル、トリフルオロメトキシ、シアノ及びアルキルからなる群から選択される、請求項 1、7 及び 8 のいずれか一項に記載のピリミジン - 2 , 4 - ジアミン誘導体。

【請求項 10】

R^3 が水素又はアルキルを表す、請求項 1 及び 7 から 9 までのいずれか一項に記載のピリミジン - 2 , 4 - ジアミン誘導体。

【請求項 11】

R^4 が水素又はアルキルを表す、請求項 1 及び 7 から 10 までのいずれか一項に記載のピリミジン - 2 , 4 - ジアミン誘導体。

【請求項 12】

R^1 が水素又はアルキルを表す、請求項 1 及び 7 から 11 までのいずれか一項に記載のピリミジン - 2 , 4 - ジアミン誘導体。

【請求項 13】

$R^{1'}$ が水素又はアルキルを表す、請求項 1 及び 7 から 12 までのいずれか一項に記載のピリミジン - 2 , 4 - ジアミン誘導体。

【請求項 14】

$R^{1''}$ 及び $R^{1'''}$ が水素を表す、請求項 1 及び 7 から 13 までのいずれか一項に記載のピリミジン - 2 , 4 - ジアミン誘導体。

【請求項 15】

N^2 , N^4 - ビス (3 , 4 - ジフルオロベンジル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン ;
 N^2 , N^4 - ビス (3 , 4 - ジフルオロベンジル) - 6 - メチルピリミジン - 2 , 4 - ジアミン ;
 N^2 , N^4 - ビス [3 - (トリフルオロメチル) ベンジル] ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン ;
 N^2 , N^4 - ビス (3 , 4 - ジクロロベンジル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン ;
 N^2 , N^4 - ビス [1 - (4 - フルオロフェニル) エチル] ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン ;
 N^2 , N^4 - ビス [4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル) ベンジル] ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン ;
 N^2 , N^4 - ビス (4 - クロロベンジル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン ;
 N^2 , N^4 - ビス (4 - クロロベンジル) - N^2 , N^4 - ジメチル - ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン ;
2 - { ベンジル [4 - (4 - クロロベンジルアミノ) ピリミジン - 2 - イル] アミノ } エタノール ;
 N^2 , N^4 - ビス - [2 - (4 - フルオロ - フェニル) - エチル] - ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン ;

N^2 , N^4 - ビス - [2 - (4 - クロロ - フェニル) - エチル] - ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン ;

N^2 , N^4 - ジ - (R) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロナフタレン - 1 - イル - ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン ;

N^2 , N^4 - ジベンジル - N^2 , N^4 - ビス (2 - ジメチルアミノエチル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン ; 又は

N^2 , N^4 - ビス (4 - ジメチルアミノベンジル) ピリミジン - 2 , 4 - ジアミン ;

又は薬学的に許容されるその塩である、請求項 1 に記載のピリミジン - 2 , 4 - ジアミン誘導体。

【請求項 1 6】

請求項 1 から 1 5 までのいずれか一項に記載のピリミジン - 2 , 4 - ジアミン誘導体、又はその任意の異性体若しくはその任意の異性体の混合物、又は薬学的に許容されるその塩の治療有効量を、少なくとも 1 つの薬学的に許容される担体、賦形剤又は希釈剤と一緒に含む薬剤組成物。

【請求項 1 7】

請求項 1 から 1 5 までのいずれか一項に記載のピリミジン - 2 , 4 - ジアミン誘導体、又はその任意の異性体若しくはその任意の異性体の混合物、又は薬学的に許容されるその塩を含む、薬剤。

【請求項 1 8】

疾患又は障害又は状態が S K チャネルの調節に対して応答性である、ヒトを含む哺乳動物の疾患又は障害又は状態の処置、予防又は軽減のための、請求項 1 7 に記載の薬剤。

【請求項 1 9】

S K チャネルの調節に対して応答性である疾患、障害又は状態が、欠神発作、加齢による記憶喪失、アルツハイマー病、狭心症、不整脈、ぜんそく、不安症、運動失調、注意欠陥、脱毛症、双極性障害、膀胱興奮性亢進、膀胱流出障害、膀胱けいれん、脳腫瘍、脳虚血、慢性閉塞性肺疾患、癌、循環器疾患、認知機能障害、結腸炎、便秘、けいれん、冠動脈攣縮、冠動脈性心臓病、嚢胞性線維症、認知症、抑鬱症、I I 型糖尿病、月経困難症、てんかん、胃腸障害、胃食道逆流疾患、胃腸低運動性障害、胃腸運動性機能不全、聴力損失、高インスリン血症、高血圧、免疫抑制症、炎症性腸疾患、炎症性疼痛、間欠性跛行、過敏性腸症候群、虚血、虚血性心疾患、学習障害、男性機能障害、躁鬱病、記憶障害、偏頭痛、気分障害、運動ニューロン疾患、筋波動症、筋強直性ジストロフィー症、筋緊張症、睡眠発作、神経障害性疼痛、疼痛、パーキンソン病、多発性嚢胞腎、術後腸閉塞、早期分娩、精神病、神経異常、腎機能異常、レイノー病、鼻漏、分泌性下痢、発作、ショーグレン症候群、睡眠時無呼吸症、痙攣、睡眠障害、脳卒中、外傷性脳損傷、三叉神経痛、尿失禁、泌尿生殖器疾患、血管けいれん、失明、又は口内乾燥である、請求項 1 8 に記載の薬剤。