

【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30年9月27日 (2018.9.27)

【公開番号】特開2018-87210(P2018-87210A)

【公開日】平成30年6月7日 (2018.6.7)

【年通号数】公開・登録公報2018-021

【出願番号】特願2018-13591(P2018-13591)

【国際特許分類】

C 0 7 D 239/48 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/505 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/02 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/14 (2006.01)

A 6 1 P 27/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 239/48 C S P

C 0 7 D 471/04 1 1 7 N

C 0 7 D 403/12

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 487/04 1 4 4

A 6 1 K 31/519

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/505

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 11/02

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 27/14

A 6 1 P 27/04

【手続補正書】

【提出日】平成30年7月30日 (2018.7.30)

【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】

以下からなる群から選択される化合物：

2 - { [(1 R ^{*} , 2 S ^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 4 - { [1 - (3 - フェノキシベンジル) - 1 H - インドール - 4 - イル] アミノ } ピリミジン - 5 - カルボキサミド；

2 - { [(1 R ^{*} , 2 S ^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 4 - { [1 - (ビフェニル - 4 - イルメチル) - 1 H - インドール - 4 - イル] アミノ } ピリミジン - 5 - カルボキサミド；

2 - { [(1 R ^{*} , 2 S ^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 4 - { [1 - (2 - フェノキシベンジル) - 1 H - インドール - 4 - イル] アミノ } ピリミジン - 5 - カルボキサミド；

2 - { [(1 R ^{*} , 2 S ^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 4 - { [2 - (ベンジルスルホニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル] アミノ } ピリミジン - 5 - カルボキサミド；

2 - { [(1 R ^{*} , 2 S ^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 4 - [(2 - ピリジン - 2 - イル - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル) アミノ] ピリミジン - 5 - カルボキサミド；

2 - { [(1 R ^{*} , 2 S ^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 4 - { [2 - (3 - メトキシベンゾイル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル] アミノ } ピリミジン - 5 - カルボキサミド；

2 - { [(1 R ^{*} , 2 S ^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 4 - { [2 - (2 - メトキシベンゾイル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル] アミノ } ピリミジン - 5 - カルボキサミド；

2 - { [(1 R ^{*} , 2 S ^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 4 - { [2 - (4 - メトキシベンゾイル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル] アミノ } ピリミジン - 5 - カルボキサミド；

2 - { [(1 R ^{*} , 2 S ^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 4 - { [2 - (フェニルスルホニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロイソキノリン - 7 - イル] アミノ } ピリミジン - 5 - カルボキサミド；

2 - { [(1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 4 - [(3 ' - ヒドロキシビフェニル - 3 - イル) アミノ] - 6 - メチルピリミジン - 5 - カルボキサミド；

2 - { [(1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 4 - [(4 ' - ヒドロキシビフェニル - 3 - イル) アミノ] - 6 - メチルピリミジン - 5 - カルボキサミド；

2 - { [(1 R ^{*} , 2 S ^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 4 - { [1 - (シクロプロピルカルボニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 7 - イル] アミノ } ピリミジン - 5 - カルボキサミド；

2 - { [(1 R ^{*} , 2 S ^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 4 - { [1 - (シクロプロピルカルボニル) - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロキノリン - 5 - イル] アミノ } ピリミジン - 5 - カルボキサミド；

2 - { [(1 R ^{*} , 2 S ^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 4 - [(3 , 5 - ジメトキシフェニル) アミノ] - 6 - ヒドロキシピリミジン - 5 - カルボキサミド；

2 - { [(1 R ^{*} , 2 S ^{*}) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 4 - { [3 - (フェノキシメチル) フェニル] アミノ } ピリミジン - 5 - カルボキサミド；

2 - { [(1 R , 2 S) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 4 - ({ 3 - [2 - (メチルアミノ) - 2 - オキソエトキシ] フェニル } アミノ) ピリミジン - 5 - カルボキ

サミド；

5 - { [(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 7 - (ビフェニル - 3 - イルアミノ) イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 8 - カルボキサミド；

5 - { [(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 7 - [(3 ' - メチルビフェニル - 3 - イル) アミノ] イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 8 - カルボキサミド；または

5 - { [(1 R * , 2 S *) - 2 - アミノシクロヘキシル] アミノ } - 7 - [(2 - メトキシ - 3 ' - メチルビフェニル - 4 - イル) アミノ] イミダゾ [1 , 2 - c] ピリミジン - 8 - カルボキサミド；

もしくはその薬学的に許容される塩、または前記化合物もしくは薬学的に許容される塩の薬学的に許容される溶媒和物。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の化合物と、薬学的に許容される医薬品添加物とを含む医薬組成物。

【請求項 3】

治療を必要とする対象における、SYK 阻害剤の適応疾患または症状を治療するために用いられる、請求項 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

請求項 3 に記載の使用のための医薬組成物であって、前記疾患または症状が、アレルギー性鼻炎、鼻閉、鼻漏、通年性鼻炎、鼻の炎症、喘息、慢性閉塞性肺疾患（COPD）、慢性または急性気管支収縮、慢性気管支炎、末梢気道閉塞、肺気腫、慢性好酸球性肺炎、成人呼吸窮迫症候群、他の薬物療法の結果として起こる気道反応亢進の増悪、肺血管疾患（肺動脈高血圧症を含む）、急性肺損傷、気管支拡張症、副鼻腔炎、アレルギー性結膜炎、特発性肺線維症またはアトピー性皮膚炎、特に、喘息またはアレルギー性鼻炎またはアトピー性皮膚炎またはアレルギー性結膜炎、炎症、関節炎、疼痛、発熱、肺サルコイドーシス、珪肺症、心血管疾患（アテローム性動脈硬化症、心筋梗塞、血栓症、うっ血性心不全および心臓再灌流障害を含む）、心筋症、脳卒中、虚血、再灌流障害、脳浮腫、脳外傷、神経変性、肝疾患、炎症性腸疾患（クローン病および潰瘍性大腸炎を含む）、腎炎、網膜炎、網膜症、黄斑変性、緑内障、糖尿病（1 型および 2 型糖尿病を含む）、ドライアイ症、糖尿病性神経障害、ウイルスおよび細菌感染、筋痛症、内毒素ショック、中毒性ショック症候群、自己免疫疾患、骨粗鬆症、多発性硬化症、子宮内膜症、月経性痙攣、膣炎、カンジダ症、癌、結膜炎、食物アレルギー、線維症、肥満、筋ジストロフィー、多発筋炎、アルツハイマー病、皮膚潮紅、湿疹、乾癬、アトピー性皮膚炎、酒さ、円板状エリテマトーデス、結節性痒疹、脱毛症ならびに日焼けから選択される、
医薬組成物。

【請求項 5】

請求項 3 に記載の使用のための医薬組成物であって、前記疾患または症状が、喘息、COPD、アレルギー性鼻炎、慢性副鼻腔炎、アトピー性皮膚炎、乾癬、酒さ、脱毛症、アレルギー性結膜炎およびドライアイ症から選択される、
医薬組成物。