

【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28年4月21日(2016.4.21)

【公表番号】特表2015-517557(P2015-517557A)

【公表日】平成27年6月22日(2015.6.22)

【年通号数】公開・登録公報2015-040

【出願番号】特願2015-513186(P2015-513186)

【国際特許分類】

| | |
|----------------|-----------|
| C 07 D 207/16 | (2006.01) |
| A 61 P 43/00 | (2006.01) |
| A 61 P 7/02 | (2006.01) |
| C 07 D 403/04 | (2006.01) |
| C 07 D 401/14 | (2006.01) |
| C 07 D 403/14 | (2006.01) |
| C 07 D 403/06 | (2006.01) |
| A 61 K 31/496 | (2006.01) |
| A 61 K 31/5377 | (2006.01) |
| A 61 K 31/4025 | (2006.01) |
| A 61 K 31/454 | (2006.01) |
| A 61 K 31/4545 | (2006.01) |
| C 07 D 401/06 | (2006.01) |
| C 07 D 403/10 | (2006.01) |
| A 61 P 31/04 | (2006.01) |
| A 61 P 9/10 | (2006.01) |
| A 61 P 9/00 | (2006.01) |

【F I】

| | |
|----------------|-------|
| C 07 D 207/16 | |
| A 61 P 43/00 | 1 1 1 |
| A 61 P 7/02 | |
| C 07 D 403/04 | |
| C 07 D 401/14 | |
| C 07 D 403/14 | |
| C 07 D 403/06 | |
| A 61 K 31/496 | |
| A 61 K 31/5377 | |
| A 61 K 31/4025 | |
| A 61 K 31/454 | |
| A 61 K 31/4545 | |
| C 07 D 401/06 | |
| C 07 D 403/10 | |
| A 61 P 31/04 | |
| A 61 P 9/10 | |
| A 61 P 9/00 | |
| A 61 P 9/10 | 1 0 1 |

【手続補正書】

【提出日】平成28年3月1日(2016.3.1)

【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

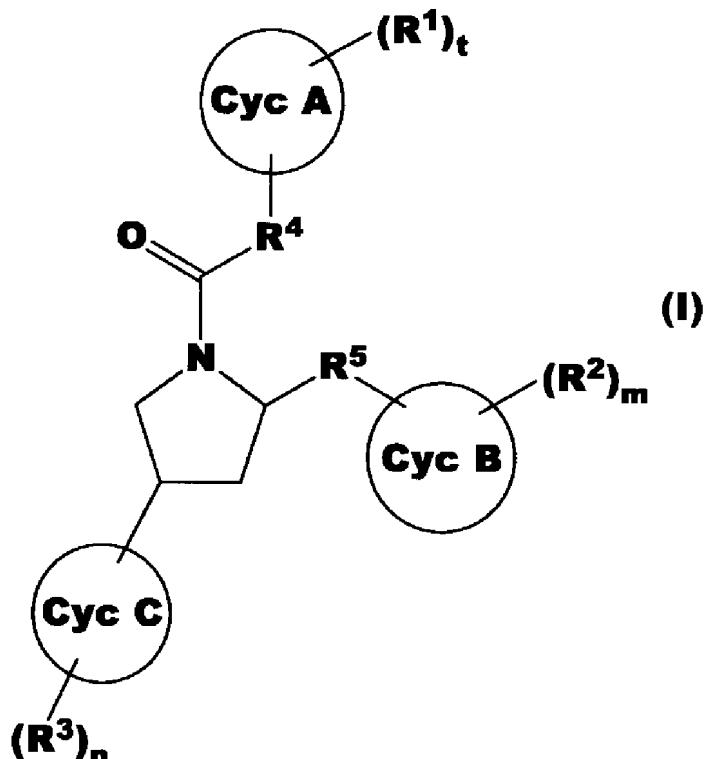
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式(Ⅰ)：

【化1】



[式中、Cyc AはC3-C8シクロアルキル、5から10員のヘテロシクロアルキル、C6-C10アリールまたは5から10員のヘテロアリールを表し；
 Cyc BはC3-C8シクロアルキル、5から10員のヘテロシクロアルキル、C6-C10アリールまたは5から10員のヘテロアリールを表し；
 Cyc CはC3-C8シクロアルキル、5から10員のヘテロシクロアルキル、C6-C10アリールまたは5から10員のヘテロアリールを表し；
 それぞれのR¹は同じでも異なっていてもよく、(1)-C(=NH)NH₂、(2)5から10員のヘテロアリール、(3)ハロゲン、C1-C4アルキル、C1-C4アルコキシ、-C1-C4アルケン-C1-C4アルコキシ、CN、-COOH、-COO-C1-C4アルキル、-CO-NH₂、-OC(=NH)₂、-OC(=NH)-C1-C4アルキル、-CONH-C1-C4アルキル、-NHC(=O)-C1-C4アルキルおよび-NHC(=O)-C1-C4アルキルから選択される1から5個の基で置換されたC6-C10アリールまたは5から10員のヘテロアリール、(4)C6-C10アリール、(5)-NH-C(=NH)NH₂、(6)C1-C4アルキル、(7)C2-C4アルケニル、(8)C2-C4アルキニル、(9)-C1-C4アルキレン-NH₂、(10)C1-C4アルコキシ、(11)CN、(12)-CO-C1-C4アルキル、(13)ハロゲンまたは(14)-R¹⁰-C(=NR¹¹)NR¹²R¹³を表し；
 R¹⁰は(1)結合手または(2)NHを表し；
 R¹¹、R¹²およびR¹³はそれぞれ独立して(1)水素、(2)OH、(3)C1-C4アル]

キル、(4)C₂-4アルケニル、(5)C₂-4アルキニル、(6)C₁-4アルコキシ、(7)-C₁-4アルキレン-C₁-4アルコキシ、(8)-COO-C₁-4アルキル、(9)-COO-C₁-4アルキル、(10)-OCO-C₁-4アルキル、(11)-CO-R¹⁴、(12)-COO-R¹⁵または(13)-OCO-R¹⁶を表し、ただしR¹¹、R¹²およびR¹³はすべて同時に水素を表さず；

R¹⁴、R¹⁵およびR¹⁶はそれぞれ独立してC₁-4アルキル、C₂-4アルケニルまたはC₂-4アルキニルを表し、これらはC₁-4アルキル、C₂-4アルケニル、C₂-4アルキニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、OH、-COO-C₁-4アルキル、COOH、オキソ、C₁-4アルコキシ、C₆-C₁₀アリール、5から10員のヘテロアリールおよびNR¹⁷R¹⁸から選択される1から5個の基で置換されており；

R¹⁷およびR¹⁸はそれぞれ独立して(1)水素、(2)C₁-4アルキル、(3)C₂-4アルケニルまたは(4)C₂-4アルキニルを表し；

tは0から6の整数を表し；

それぞれのR²は同じでも異なっていてもよく、(1)-COOH、(2)-COO-C₁-4アルキル、(3)-COO-C₁-4アルキレン-C₁-4アルコキシ、(4)-NH₂、(5)-NH-C₁-4アルキル、(6)-NH-C₁-4アルキレン-C₁-4アルコキシ、(7)-NHC₁-4アルキル、(8)-NHCO-C₁-4アルキレン-C₁-4アルコキシ、(9)-NHCOO-C₁-4アルキル、(10)-NHCOO-C₁-4アルキレン-C₁-4アルコキシ、(11)-CONH₂、(12)-CONH-C₁-4アルキル、(13)-CONH-C₂-4アルキレン-C₁-4アルコキシ、(14)ハロゲン、(15)-SO₂-C₁-4アルキル、(16)オキソ、(17)C₁-4アルコキシ、(18)-CO-C₁-4アルキル、(19)-CO-C₁-4アルキレン-C₁-4アルコキシまたは(20)C₁-4アルキル、C₂-4アルケニル、C₂-4アルキニル、ハロゲン、トリフルオロメチル、OH、-COO-C₁-4アルキル、COOH、オキソ、C₁-4アルコキシ、C₆-C₁₀アリール、5から10員のヘテロアリールおよびNR¹⁹R²⁰から選択される1から5個の基で置換された-COO-C₁-4アルキルを表し；

R¹⁹およびR²⁰はそれぞれ独立して(1)水素、(2)C₁-4アルキル、(3)C₂-4アルケニルまたは(4)C₂-4アルキニルを表し；

mは0から6の整数を表し；

それぞれのR³は同じでも異なっていてもよく、(1)-SO₂-R⁶-R⁷、(2)オキソ、(3)-CO-C₁-4アルキル、(4)-CO-NH₂、(5)-SO₂-NH₂または(6)-COO-C₁-4アルキルを表し；

nは0から6の整数を表し；

R⁶は(1)結合手または(2)NHを表し；

R⁷は(1)C₁-4アルキル、(2)CycDまたは(3)1から5個のR⁸で置換されたC₁-4アルキルまたはCycDを表し；

CycDはC₃-C₈シクロアルキル、5から10員のヘテロシクロアルキル、C₆-C₁₀アリールまたは5から10員のヘテロアリールを表し；

それぞれのR⁸は同じでも異なっていてもよく、(1)-COOH、(2)-COO-C₁-4アルキル、(3)-COO-C₁-4アルキレン-C₁-4アルコキシ、(4)-NH₂、(5)-NH-C₁-4アルキル、(6)-NHCO-C₁-4アルキル、(8)-CONH₂、(12)-CONH-C₁-4アルキル(13)OHまたは(14)ハロゲンを表し；

R⁴は(1)結合手、(2)C₁-4アルキレン、(3)C₂-4アルケニレンまたは(4)C₂-4アルキニレンを表し；

R⁵は(1)-CONH-、(2)CycEまたは(3)1から5個のR⁹で置換されたCycEを表し；

CycEはC₃-C₈シクロアルキル、5から10員のヘテロシクロアルキル、C₆-C₁₀アリールまたは5から10員のヘテロアリールを表し；

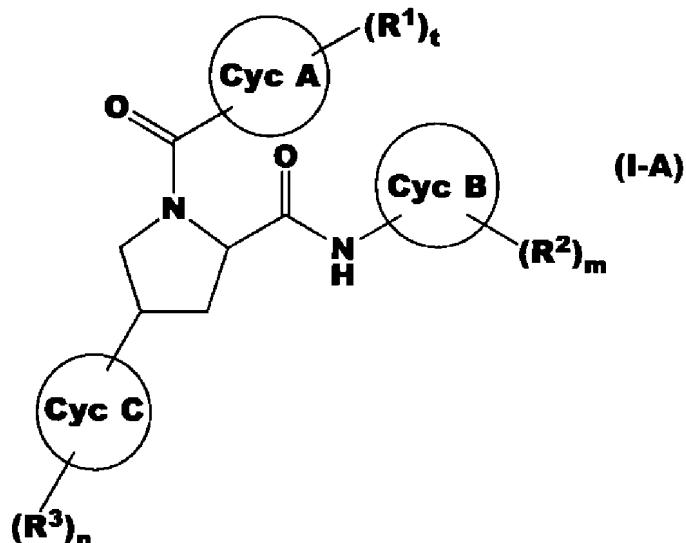
それぞれの R⁹は同じでも異なっていてもよく、C 1 - 4 アルキルまたはハロゲンを表す。】

で示される化合物、その塩、そのN-オキシド、その溶媒和物、またはそれらのプロドラッグ。

【請求項 2】

式(I)で示される化合物が、式(I-A)：

【化 2】

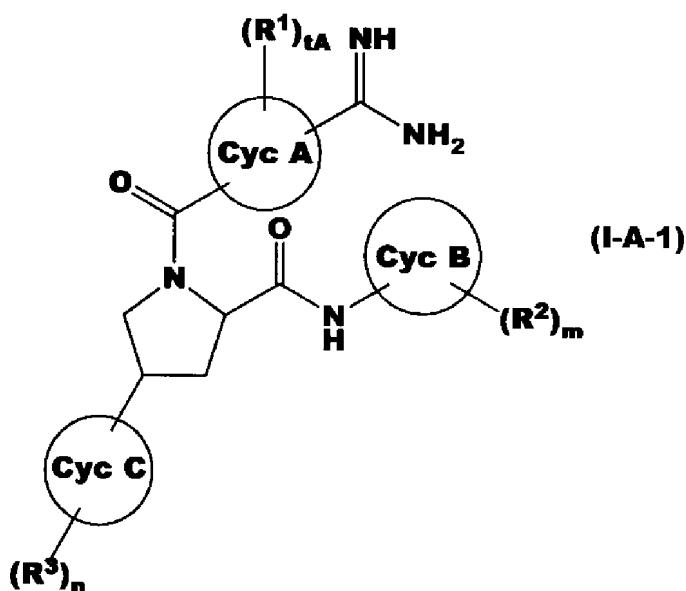


[式中、すべての記号は請求項1に記載されたものと同じ意味を有する。] で示される化合物をである、請求項1記載の化合物。

【請求項 3】

式(I-A)で示される化合物が、式(I-A-1)：

【化 3】



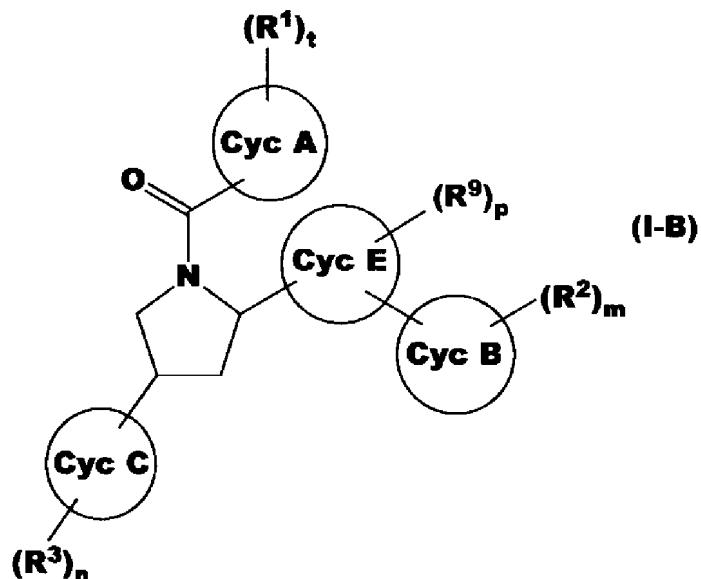
[式中、tAは0から5の整数を表し；

その他の記号は請求項 1 に記載されたものと同じ意味を有する。] で示される化合物である、請求項 2 記載の化合物。

【請求項 4】

式 (I) で示される化合物が、式 (I - B) :

【化 4】

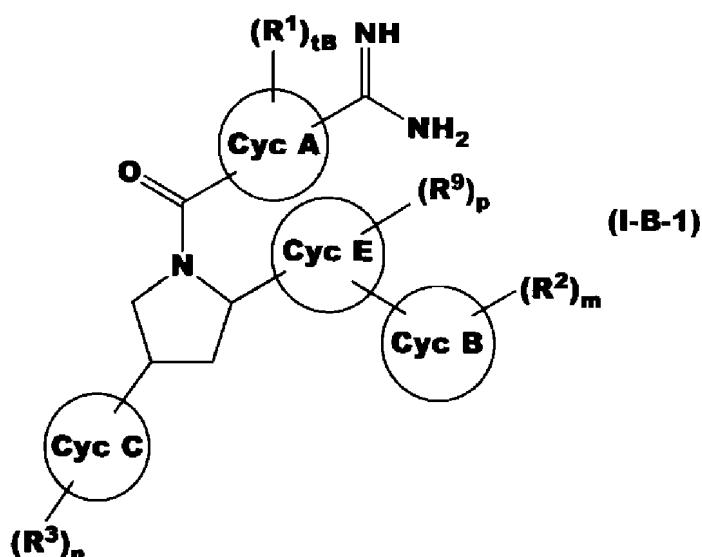


[式中、 p は 0 から 5 の整数を表し ;
その他の記号は請求項 1 に記載のものと同じ意味を有する。] で示される化合物である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 5】

式 (I - B) で示される化合物が、式 (I - B - 1) :

【化 5】



[式中、 t B は 0 から 5 の整数を表し ;
その他の記号は請求項 1 に記載ものと同じ意味を有する。]

で示される化合物である、請求項4記載の化合物。

【請求項6】

CycEがイミダゾリルである、請求項4または5に記載の化合物。

【請求項7】

CycAがC3-C6シクロアルキル、C6-C10アリールまたは5から6員のヘテロシクロアルキルである、請求項1から6のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項8】

CycAがシクロヘキシリル、フェニル、ピペリジニルまたはピペラジニルである、請求項7記載の化合物。

【請求項9】

CycBがC6-C10アリールまたは5-6員のヘテロアリールである、請求項1から8のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項10】

CycBがフェニルまたはピリジルである、請求項9記載の化合物。

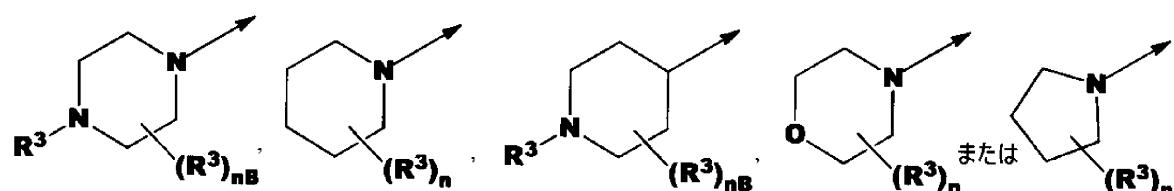
【請求項11】

CycCがピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニルまたはモルホリニルである、請求項1から10のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項12】

- CycC-(R³)_nが、

【化6】



[式中、nBは0から5の整数を表し；

矢印は結合位置を表し；

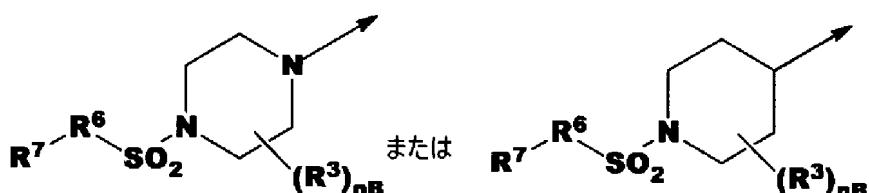
その他の記号は請求項1に記載のものと同じ意味を有する。]

である、請求項1から11のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項13】

- CycC-(R³)_nが、

【化7】



[式中、矢印は結合位置を表し；

その他の記号は請求項1に記載のものと同じ意味を有する。]

である、請求項12に記載の化合物。

【請求項14】

(1) 4-[({(2S,4S)-1-[((1-カルバムイミドイル-4-ピペリジニル)カルボニル]-4-[4-(メチルスルホニル)-1-ピペラジニル]-2-ピロリ

ジニル } カルボニル) アミノ] 安息香酸、

(2) 4 - [({ (2 S , 4 S) - 1 - (4 - カルバムイミドイルベンゾイル) - 4 - [4 - (メチルスルホニル) - 1 - ピペラジニル] - 2 - ピロリジニル } カルボニル) アミノ] 安息香酸、

(3) 4 - ({ [(2 S , 4 S) - 1 - { (2 E) - 3 - [5 - クロロ - 2 - (1 H - テトラゾール - 1 - イル) フェニル] - 2 - プロペノイル } - 4 - (4 - モルホリニル) - 2 - ピロリジニル] カルボニル) アミノ) 安息香酸、

(4) (2 S , 4 S) - 1 - { (2 E) - 3 - [5 - クロロ - 2 - (1 H - テトラゾール - 1 - イル) フェニル] - 2 - プロペノイル } - N - フェニル - 4 - [4 - (フェニルスルホニル) - 1 - ピペラジニル] - 2 - ピロリジンカルボキサミド、

(5) (2 S , 4 S) - N - (1 H - ベンゾトリアゾール - 6 - イル) - 1 - { (2 E) - 3 - [5 - クロロ - 2 - (1 H - テトラゾール - 1 - イル) フェニル] - 2 - プロペノイル } - 4 - (4 - モルホリニル) - 2 - ピロリジンカルボキサミド、

(6) 4 - [({ (2 S , 4 S) - 1 - { [トランス - 4 - (アミノメチル) シクロヘキシル] カルボニル } - 4 - [4 - (シクロプロピルスルホニル) - 1 - ピペラジニル] - 2 - ピロリジニル } カルボニル) アミノ] 安息香酸、

(7) (2 S , 4 S) - 1 - { (2 E) - 3 - [5 - クロロ - 2 - (1 H - テトラゾール - 1 - イル) フェニル] - 2 - プロペノイル } - 4 - [(3 S) - 3 - メチル - 4 - スルファモイル - 1 - ピペラジニル] - N - フェニル - 2 - ピロリジンカルボキサミド、

(8) メチル [4 - (2 - { (2 S , 4 R) - 1 - [(1 - カルバムイミドイル - 4 - ピペリジニル) カルボニル] - 4 - [1 - (メチルスルホニル) - 4 - ピペリジニル] - 2 - ピロリジニル } - 1 H - イミダゾール - 5 - イル) フェニル] カルバマート、

(9) メチル [4 - (2 - { (2 S , 4 R) - 1 - (4 - カルバムイミドイルベンゾイル) - 4 - [1 - (メチルスルホニル) - 4 - ピペリジニル] - 2 - ピロリジニル } - 1 H - イミダゾール - 5 - イル) フェニル] カルバマート、

(10) メチル [4 - (2 - { (2 S , 4 R) - 1 - (4 - カルバムイミダミドベンゾイル) - 4 - [1 - (メチルスルホニル) - 4 - ピペリジニル] - 2 - ピロリジニル } - 4 - クロロ - 1 H - イミダゾール - 5 - イル) フェニル] カルバマート、

(11) メチル [4 - (2 - { (2 S , 4 R) - 1 - ({ トランス - 4 - [(1 S) - 1 - アミノエチル] シクロヘキシル } カルボニル) - 4 - [1 - (メチルスルホニル) - 4 - ピペリジニル] - 2 - ピロリジニル } - 4 - クロロ - 1 H - イミダゾール - 5 - イル) フェニル] カルバマート、

(12) メチル [4 - (2 - { (2 S , 4 R) - 1 - [(4 - カルバムイミドイル - 1 - ピペラジニル) カルボニル] - 4 - [1 - (メチルスルホニル) - 4 - ピペリジニル] - 2 - ピロリジニル } - 4 - クロロ - 1 H - イミダゾール - 5 - イル) フェニル] カルバマート、

(13) 4 - [({ (2 S , 4 R) - 1 - [(3 - クロロ - 4 - フルオロ - 1 - メチル - 1 H - インドール - 5 - イル) カルボニル] - 4 - [1 - (メチルスルホニル) - 4 - ピペリジニル] - 2 - ピロリジニル } カルボニル) アミノ] 安息香酸、

(14) メチル [4 - (4 - クロロ - 2 - { (2 S , 4 R) - 1 - { (2 E) - 3 - [5 - クロロ - 2 - (1 H - テトラゾール - 1 - イル) フェニル] - 2 - プロペノイル } - 4 - [1 - (メチルスルホニル) - 4 - ピペリジニル] - 2 - ピロリジニル } - 1 H - イミダゾール - 5 - イル) フェニル] カルバマート、

(15) メチル [4 - (2 - { (2 S , 4 R) - 1 - { [4 - (アミノメチル) シクロヘキシル } カルボニル } - 4 - [1 - (メチルスルホニル) - 4 - ピペリジニル] - 2 - ピロリジニル } - 4 - クロロ - 1 H - イミダゾール - 5 - イル) フェニル] カルバマート、

(16) メチル [4 - (2 - { (2 S , 4 S) - 1 - [(1 - カルバムイミドイル - 4 - ピペリジニル) カルボニル] - 4 - [4 - (メチルスルホニル) - 1 - ピペラジニル] - 2 - ピロリジニル } - 1 H - イミダゾール - 5 - イル) フェニル] カルバマート、

(17) メチル [4 - (2 - { (2S, 4R) - 1 - [(1 - カルバムイミドイル - 4 - ピペリジニル) カルボニル] - 4 - [1 - (メチルスルホニル) - 4 - ピペリジニル] - 2 - ピロリジニル} - 4 - クロロ - 1H - イミダゾール - 5 - イル) フェニル] カルバマート、

(18) メチル [4 - (2 - { (2S, 4R) - 1 - (4 - カルバムイミドイルベンゾイル) - 4 - [1 - (メチルスルホニル) - 4 - ピペリジニル] - 2 - ピロリジニル} - 4 - クロロ - 1H - イミダゾール - 5 - イル) フェニル] カルバマート、

(19) メチル [4 - (2 - { (2S, 4S) - 1 - (4 - カルバムイミドイルベンゾイル) - 4 - [4 - (メチルスルホニル) - 1 - ピペラジニル] - 2 - ピロリジニル} - 1H - イミダゾール - 5 - イル) フェニル] カルバマート、

(20) メチル [4 - (2 - { (2S, 4S) - 1 - [(1 - カルバムイミドイル - 4 - ピペリジニル) カルボニル] - 4 - [4 - (メチルスルホニル) - 1 - ピペラジニル] - 2 - ピロリジニル} - 4 - クロロ - 1H - イミダゾール - 5 - イル) フェニル] カルバマート および

(21) 4 - [({ (2S, 4R) - 1 - (4 - カルバムイミドイルベンゾイル) - 4 - [1 - (メチルスルホニル) - 4 - ピペリジニル] - 2 - ピロリジニル} カルボニル) アミノ] 安息香酸

からなる群から選択される請求項 1 から 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。