

【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 26 年 10 月 30 日 (2014.10.30)

【公表番号】特表 2013-538825 (P2013-538825A)

【公表日】平成 25 年 10 月 17 日 (2013.10.17)

【年通号数】公開・登録公報 2013-057

【出願番号】特願 2013-530177 (P2013-530177)

【国際特許分類】

C 0 7 D 231/20 (2006.01)

A 6 1 K 31/415 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 231/20 C S P Z

A 6 1 K 31/415

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 29/00 1 0 1

【手続補正書】

【提出日】平成 26 年 9 月 10 日 (2014.9.10)

【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

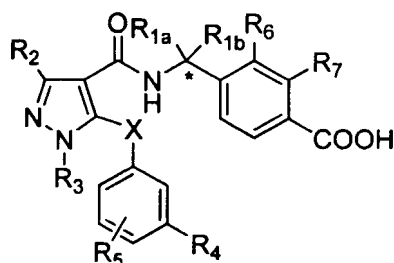
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I の化合物

【化 1】



I

[式中、

R_{1a} と R_{1b} の一方は水素であり、他方はメチルであり、または R_{1a} と R_{1b} は、一緒になってシクロプロピル環を形成しており、

R₂ は、メチルまたはフルオロメチルであり、

R₃ は、メチルであり、

R₄ は、水素、ハロ、フルオロメチル、メチル、メトキシ、またはフルオロメトキシで

あり、

R₅ は、水素、ハロ、フルオロメチル、メチル、メトキシ、またはフルオロメトキシであり、

R₆ は、水素、ハロ、メチル、またはメトキシであり、

R₇ は、水素、ハロ、メチル、またはメトキシであり、

X は、酸素である]

または製薬学的に許容されるその塩。

【請求項 2】

R_{1a} と R_{1b} の一方が水素であり、他方がメチルであり、R₂ が、メチル、ジフルオロメチル、またはトリフルオロメチルであり、

R₃ がメチルであり、

R₄ が、クロロ、フルオロ、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、メチル、メトキシ、ジフルオロメトキシ、またはトリフルオロメトキシであり、

R₅ が、水素、クロロ、フルオロ、メチル、またはメトキシであり、

R₆ および R₇ が水素である、請求項 1 に記載の化合物または製薬学的に許容されるその塩。

【請求項 3】

R₅ が水素である、請求項 2 に記載の化合物または製薬学的に許容されるその塩。

【請求項 4】

R₄ が、クロロ、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、ジフルオロメトキシ、およびトリフルオロメトキシから選択される、請求項 3 に記載の化合物または製薬学的に許容されるその塩。

【請求項 5】

R_{1a} と R_{1b} の一方が水素であり、他方がメチルであり、前記式 I の化合物が、立体異性体の混合物からなる、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物または製薬学的に許容されるその塩。

【請求項 6】

R_{1a} と R_{1b} の一方が水素であり、他方がメチルであり、前記式 I の化合物が、実質的に純粋な立体異性体からなる、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物または製薬学的に許容されるその塩。

【請求項 7】

R_{1a} と R_{1b} の一方が水素であり、他方がメチルであり、前記式 I の化合物の、* で印をつけた炭素が、実質的に S 立体配置を有する、請求項 6 に記載の化合物または製薬学的に許容されるその塩。

【請求項 8】

R_{1a} と R_{1b} の一方が水素であり、他方がメチルであり、前記式 I の化合物の、* で印をつけた炭素が、実質的に R 立体配置を有する、請求項 6 に記載の化合物または製薬学的に許容されるその塩。

【請求項 9】

R_{1a} と R_{1b} が、一緒になってシクロプロピル環を形成しており、

R₂ が、メチル、トリフルオロメチル、またはジフルオロメチルであり、

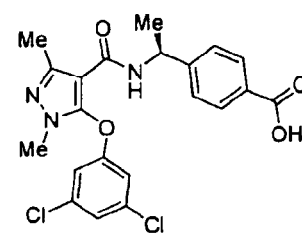
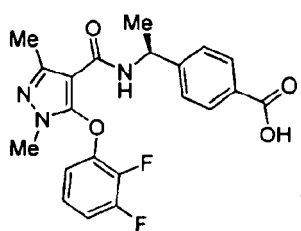
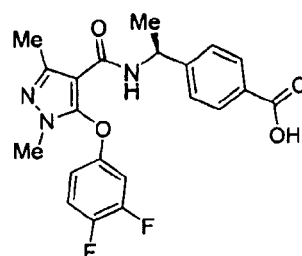
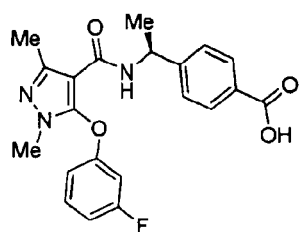
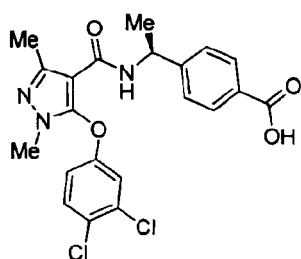
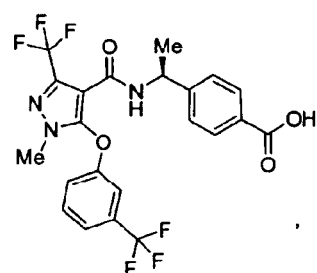
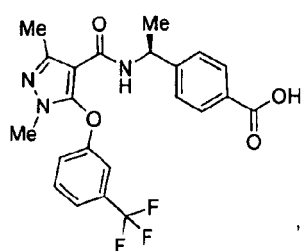
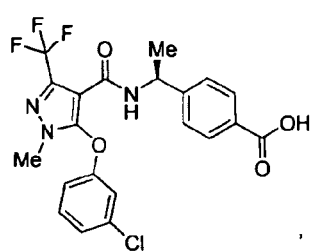
R₃ がメチルであり、

R₄ が、トリフルオロメチル、ジフルオロメチル、クロロ、またはフルオロであり、

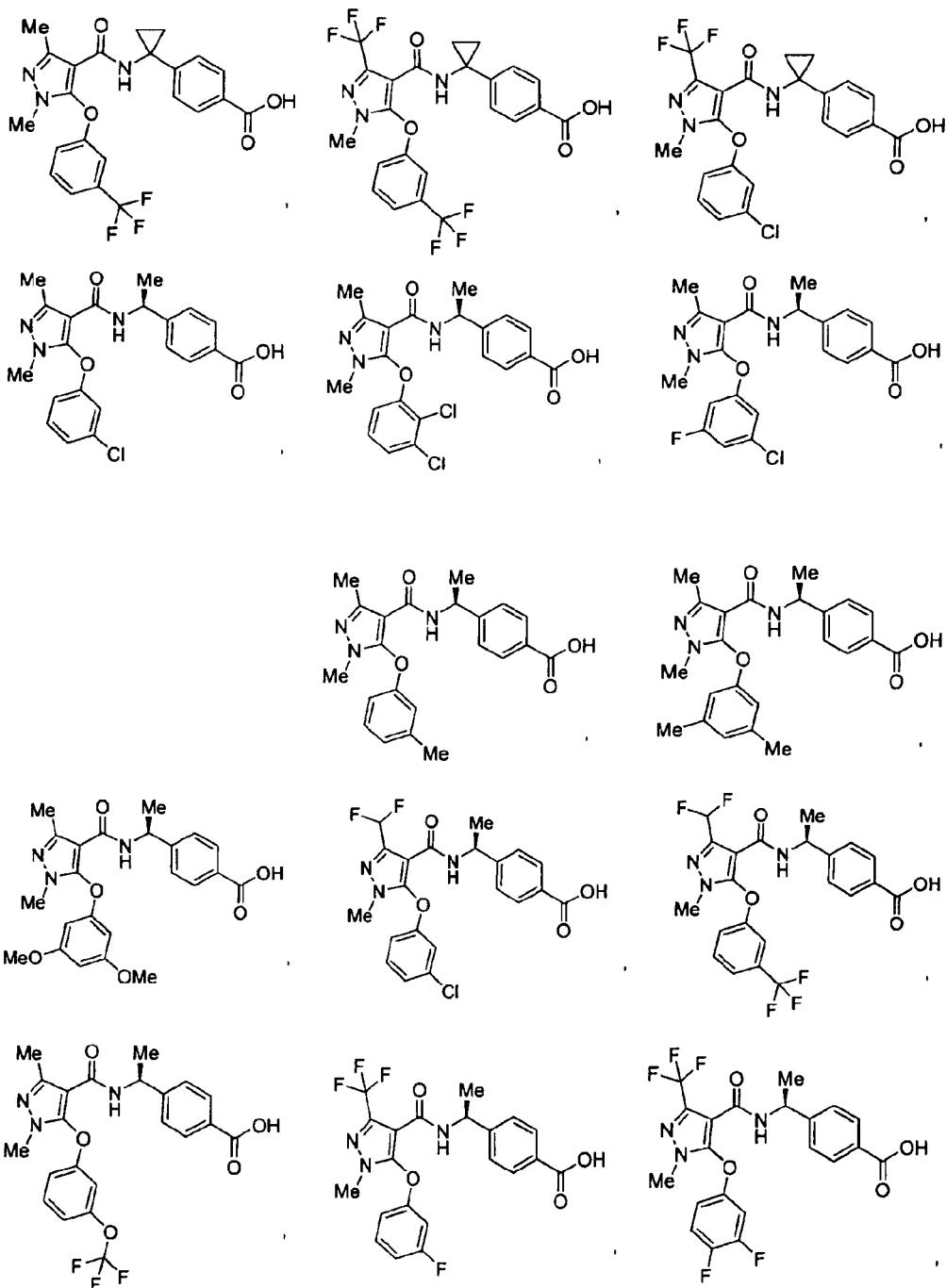
R₆ および R₇ が水素である、請求項 1 に記載の化合物または製薬学的に許容されるその塩。

【請求項 10】

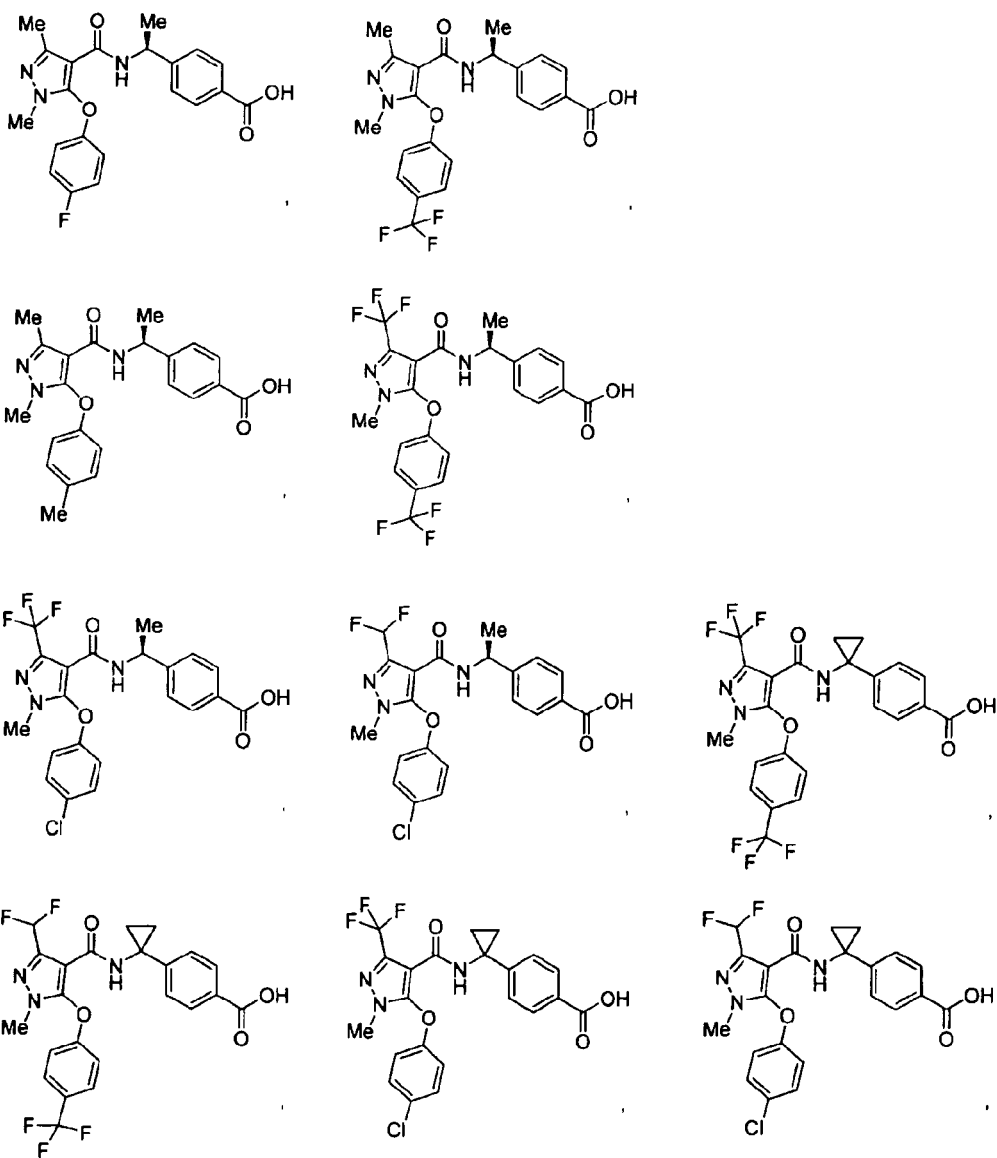
【化 2 A】



【化 2 B】



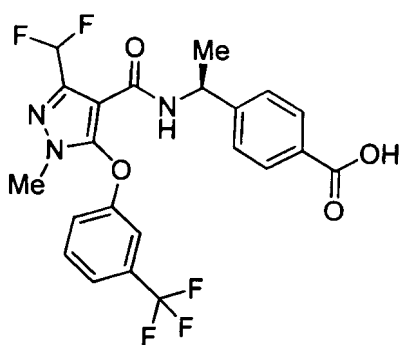
【化 2 D】



およびこれらの製薬学的に許容される塩からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

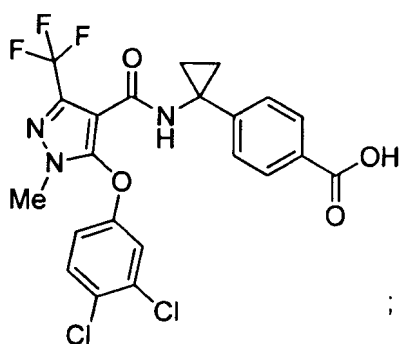
【化 3】



である、請求項 1 に記載の化合物または製薬学的に許容されるその塩。

【請求項 1 2】

【化 4】

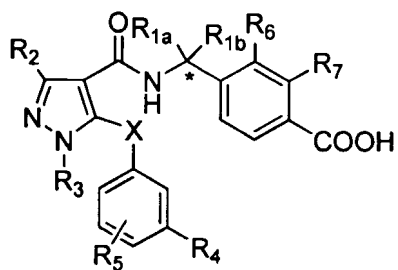


である、請求項 1 に記載の化合物または製薬学的に許容されるその塩。

【請求項 1 3】

式 I の化合物

【化 5】



I

[式中、

R_{1a} と R_{1b} の一方は水素であり、他方はメチルであり、または R_{1a} と R_{1b} は、一緒になってシクロプロピル環を形成しており、

R₂ は、メチルまたはフルオロメチルであり、

R₃ は、メチルであり、

R₄ は、水素、ハロ、フルオロメチル、メチル、メトキシ、またはフルオロメトキシで

あり、

R₅ は、水素、ハロ、フルオロメチル、メチル、メトキシ、またはフルオロメトキシであり、

R₆ は、水素、ハロ、メチル、またはメトキシであり、

R₇ は、水素、ハロ、メチル、またはメトキシであり、

X は、酸素である]

または製薬学的に許容されるその塩と、

製薬学的に許容される担体と

を含む医薬組成物。

【請求項 14】

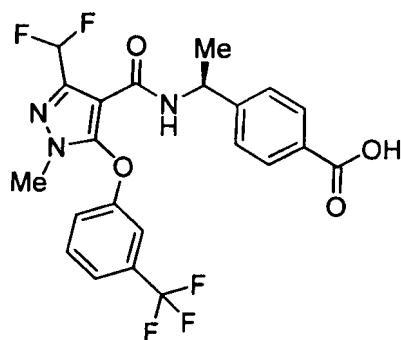
請求項 10 に記載の化合物または製薬学的に許容されるその塩と、

製薬学的に許容される担体と

を含む医薬組成物。

【請求項 15】

【化 6】



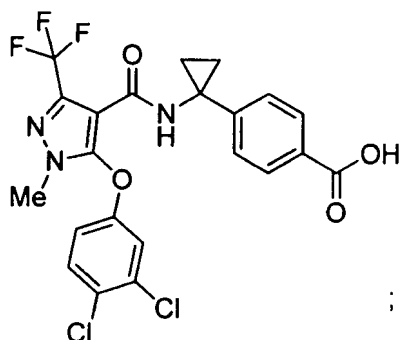
である化合物または製薬学的に許容されるその塩と、

製薬学的に許容される担体と

を含む医薬組成物。

【請求項 16】

【化 7】



である化合物または製薬学的に許容されるその塩と、

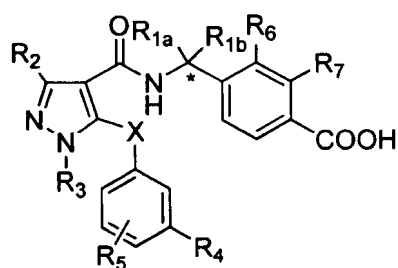
製薬学的に許容される担体と

を含む医薬組成物。

【請求項 17】

哺乳動物における多発性硬化症の治療のための、式 I の化合物

【化 8】



I

[式中、

R_{1a} と R_{1b} の一方は水素であり、他方はメチルであり、または R_{1a} と R_{1b} は、一緒になってシクロプロピル環を形成しており、

R_2 は、メチルまたはフルオロメチルであり、

R_3 は、メチルであり、

R_4 は、水素、ハロ、フルオロメチル、メチル、メトキシ、またはフルオロメトキシであり、

R_5 は、水素、ハロ、フルオロメチル、メチル、メトキシ、またはフルオロメトキシであり、

R_6 は、水素、ハロ、メチル、またはメトキシであり、

R_7 は、水素、ハロ、メチル、またはメトキシであり、

X は、酸素である]

または製薬学的に許容されるその塩を含む医薬組成物。

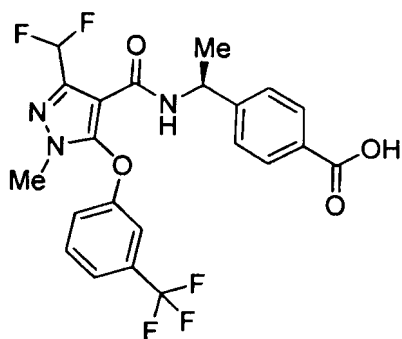
【請求項 18】

哺乳動物における多発性硬化症の治療のための、請求項 10 に記載の化合物または製薬学的に許容されるその塩を含む医薬組成物。

【請求項 19】

哺乳動物における多発性硬化症の治療のための、

【化 9】

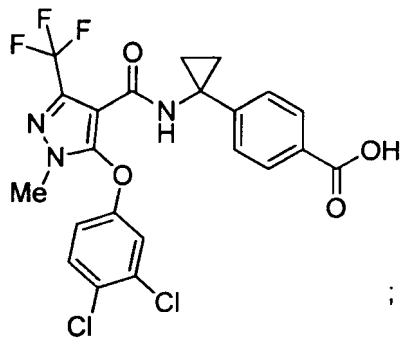


である請求項 1 に記載の化合物または製薬学的に許容されるその塩を含む医薬組成物。

【請求項 20】

哺乳動物における多発性硬化症の治療のための、

【化 1 0】



である請求項 1 に記載の化合物または製薬学的に許容されるその塩を含む医薬組成物。

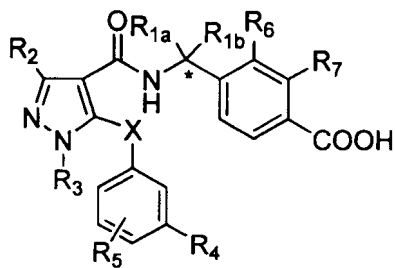
【請求項 2 1】

多発性硬化症を治療するための医薬の製造における、請求項 1 に記載の化合物の使用。

【請求項 2 2】

哺乳動物におけるリウマチ様関節炎の治療のための、式 I の化合物

【化 1 1】



I

[式中、

R_{1a} と R_{1b} の一方は水素であり、他方はメチルであり、または R_{1a} と R_{1b} は、一緒になってシクロプロピル環を形成しており、

R_2 は、メチルまたはフルオロメチルであり、

R_3 は、メチルであり、

R_4 は、水素、ハロ、フルオロメチル、メチル、メトキシ、またはフルオロメトキシであり、

R_5 は、水素、ハロ、フルオロメチル、メチル、メトキシ、またはフルオロメトキシであり、

R_6 は、水素、ハロ、メチル、またはメトキシであり、

R_7 は、水素、ハロ、メチル、またはメトキシであり、

X は、酸素である]

または製薬学的に許容されるその塩を含む医薬組成物。

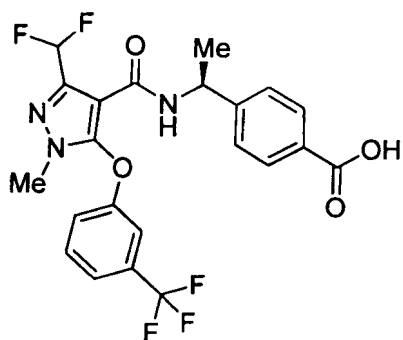
【請求項 2 3】

哺乳動物におけるリウマチ様関節炎の治療のための、請求項 1 0 に記載の化合物または製薬学的に許容されるその塩を含む医薬組成物。

【請求項 2 4】

哺乳動物におけるリウマチ様関節炎の治療のための、

【化 1 2】

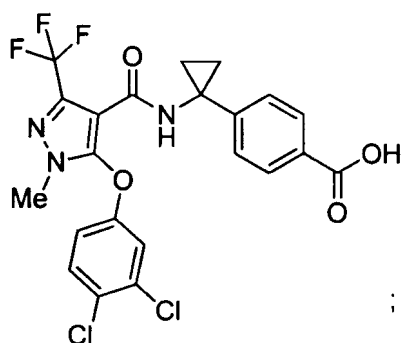


である請求項 1 に記載の化合物または製薬学的に許容されるその塩を含む医薬組成物。

【請求項 2 5】

哺乳動物におけるリウマチ様関節炎の治療のための、

【化 1 3】



である請求項 1 に記載の化合物または製薬学的に許容されるその塩を含む医薬組成物。

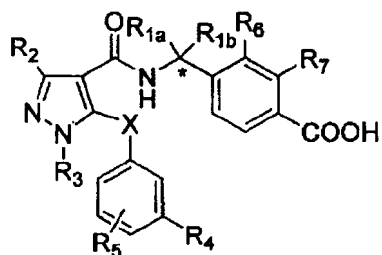
【請求項 2 6】

リウマチ様関節炎を治療するための医薬の製造における、請求項 1 に記載の化合物の使用。

【請求項 2 7】

哺乳動物におけるがんの治療のための、式 I の化合物

【化 1 4】



[式中、

R_{1a} と R_{1b} の一方は水素であり、他方はメチルであり、または R_{1a} と R_{1b} は、一緒になってシクロプロピル環を形成しており、

R_2 は、メチルまたはフルオロメチルであり、

R_3 は、メチルであり、

R₄ は、水素、ハロ、フルオロメチル、メチル、メトキシ、またはフルオロメトキシであり、

R₅ は、水素、ハロ、フルオロメチル、メチル、メトキシ、またはフルオロメトキシであり、

R₆ は、水素、ハロ、メチル、またはメトキシであり、

R₇ は、水素、ハロ、メチル、またはメトキシであり、

X は、酸素である]

または製薬学的に許容されるその塩を含む医薬組成物。

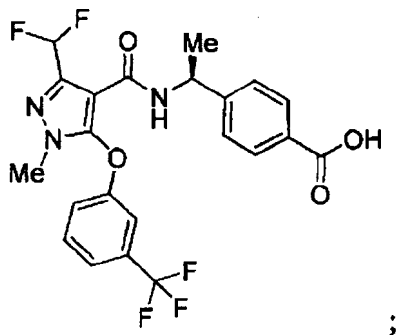
【請求項 28】

哺乳動物におけるがんの治療のための、請求項 10 に記載の化合物または製薬学的に許容されるその塩を含む医薬組成物。

【請求項 29】

哺乳動物におけるがんの治療のための、

【化 15】

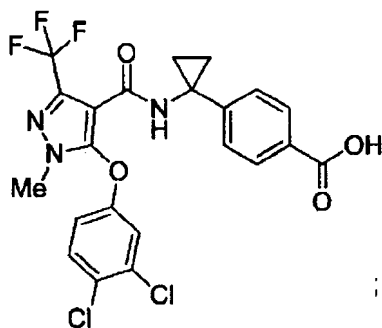


である請求項 1 に記載の化合物または製薬学的に許容されるその塩を含む医薬組成物。

【請求項 30】

哺乳動物におけるがんの治療のための、

【化 16】



である請求項 1 に記載の化合物または製薬学的に許容されるその塩を含む医薬組成物。

【請求項 31】

がんを治療するための医薬の製造における、請求項 1 に記載の化合物の使用。

【請求項 32】

前記がんが、皮膚がん、乳がん、結腸直腸がん、前立腺がん、腎臓がん、卵巣がん、子宮頸がん、子宮内膜がん、神経膠芽腫、肺がん、頭頸部がん、髄芽細胞腫、および尿路がんからなる群から選択される、請求項 27 ~ 30 のいずれかに記載の医薬組成物、または請求項 31 に記載の使用。

【請求項 3 3】

前記がんが皮膚がんである、請求項 3 2 の医薬組成物。

【請求項 3 4】

前記がんが乳がんである、請求項 3 2 の医薬組成物。

【請求項 3 5】

前記がんが結腸直腸がんである、請求項 3 2 の医薬組成物。

【請求項 3 6】

前記がんが前立腺がんである、請求項 3 2 の医薬組成物。

【請求項 3 7】

前記がんが腎臓がんである、請求項 3 2 の医薬組成物。

【請求項 3 8】

前記がんが卵巣がんである、請求項 3 2 の医薬組成物。

【請求項 3 9】

前記がんが子宮頸がんである、請求項 3 2 の医薬組成物。

【請求項 4 0】

前記がんが子宮内膜がんである、請求項 3 2 の医薬組成物。

【請求項 4 1】

前記がんが神経膠芽腫である、請求項 3 2 の医薬組成物。

【請求項 4 2】

前記がんが肺がんである、請求項 3 2 の医薬組成物。

【請求項 4 3】

前記がんが頭頸部がんである、請求項 3 2 の医薬組成物。

【請求項 4 4】

前記がんが髄芽細胞腫である、請求項 3 2 の医薬組成物。

【請求項 4 5】

前記がんが尿路がんである、請求項 3 2 の医薬組成物。