

【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】令和 3 年 11 月 25 日 (2021.11.25)

【公表番号】特表 2020-537671 (P2020-537671A)

【公表日】令和 2 年 12 月 24 日 (2020.12.24)

【年通号数】公開・登録公報 2020-052

【出願番号】特願 2020-521968 (P2020-521968)

【国際特許分類】

C 07D 401/12 (2006.01)

C 07D 405/14 (2006.01)

C 07D 498/08 (2006.01)

C 07D 491/048 (2006.01)

C 07D 471/08 (2006.01)

C 07D 453/02 (2006.01)

C 07D 413/14 (2006.01)

C 07D 405/12 (2006.01)

C 07D 401/14 (2006.01)

C 07D 471/10 (2006.01)

A 61P 43/00 (2006.01)

A 61P 35/00 (2006.01)

A 61P 31/04 (2006.01)

A 61P 29/00 (2006.01)

A 61P 19/02 (2006.01)

A 61P 19/10 (2006.01)

A 61P 17/06 (2006.01)

A 61P 13/12 (2006.01)

A 61P 25/00 (2006.01)

A 61P 3/10 (2006.01)

A 61P 1/04 (2006.01)

A 61P 7/00 (2006.01)

A 61P 19/06 (2006.01)

A 61P 9/10 (2006.01)

A 61P 25/28 (2006.01)

A 61P 25/16 (2006.01)

A 61P 37/02 (2006.01)

A 61K 31/506 (2006.01)

A 61K 31/541 (2006.01)

A 61K 31/5386 (2006.01)

A 61K 31/5377 (2006.01)

【 F I 】

C 07D 401/12

C 07D 405/14 C S P

C 07D 498/08

C 07D 491/048

C 07D 471/08

C 07D 453/02

C 07D 413/14

C 07D 405/12

C 07D 401/14

C 0 7 D	471/10	1 0 1
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	31/04	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	19/10	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	7/00	
A 6 1 P	19/06	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	37/02	
A 6 1 K	31/506	
A 6 1 K	31/541	
A 6 1 K	31/5386	
A 6 1 K	31/5377	

【手続補正書】

【提出日】令和3年10月15日(2021.10.15)

【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

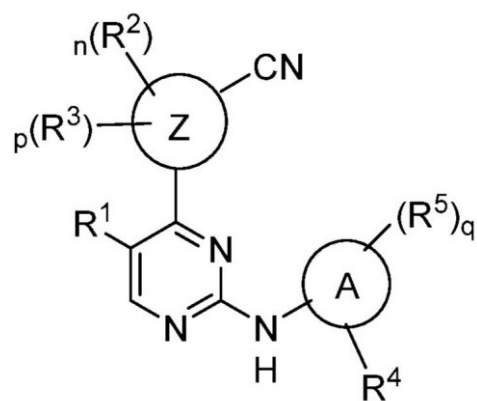
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I、

【化 1】



I

で表される化合物、またはその薬学的に許容し得る誘導体、溶媒和物、塩、水和物、もしくは立体異性体であって、式中：

R^1 は、水素、任意置換 $C_{1 \sim 6}$ 脂肪族、 $-OR$ 、またはハロゲンである；

環 Z は、フェニル、または 1 個、2 個、もしくは 3 個の窒素を有する 5 ~ 6 員ヘテロアリールである；

各 R^2 は、独立して、 $-R$ 、ハロゲン、 $-OR$ 、 $-SR$ 、 $-SO_2R$ 、 $-SOR$ 、 $-C(O)R$ 、 $-CO_2R$ 、 $-C(O)N(R)_2$ 、 $-NRC(O)R$ 、 $-NRC(O)N(R)_2$ 、 $-NRSO_2R$ 、または $-N(R)_2$ である；

各 R^3 は、独立して、 $-R$ 、ハロゲン、 $-OR$ 、 $-SR$ 、 $-SO_2R$ 、 $-SOR$ 、 $-C(O)R$ 、 $-CO_2R$ 、 $-C(O)N(R)_2$ 、 $-NRC(O)R$ 、 $-NRC(O)N(R)_2$ 、 $-NRSO_2R$ 、または $-N(R)_2$ である；

環 A は、フェニル、または 1 個、2 個、もしくは 3 個の窒素を有する 5 ~ 6 員ヘテロアリールである；

R^4 は、 $-R$ 、ハロゲン、 $-OR$ 、 $-SR$ 、 $-SO_2R$ 、 $-SOR$ 、 $-C(O)R$ 、 $-CO_2R$ 、 $-C(O)N(R)_2$ 、 $-NRC(O)R$ 、 $-NRC(O)N(R)_2$ 、 $-NRSO_2R$ 、または $-N(R)_2$ である；

各 R^5 は、独立して、 $-R$ 、ハロゲン、 $-OR$ 、 $-SR$ 、 $-SO_2R$ 、 $-SOR$ 、 $-C(O)R$ 、 $-CO_2R$ 、 $-C(O)N(R)_2$ 、 $-NRC(O)R$ 、 $-NRC(O)N(R)_2$ 、 $-NRSO_2R$ 、または $-N(R)_2$ である；

各 R は、独立して、水素、 $C_{1 \sim 6}$ 脂肪族、 $C_{3 \sim 10}$ アリール、飽和のもしくは部分的に不飽和の 3 ~ 8 員の炭素環式の環、1 ~ 4 個のヘテロ原子（独立して、窒素、酸素、もしくは硫黄から選択される）を有する 3 ~ 7 員のヘテロ環式の環、1 ~ 4 個のヘテロ原子（独立して、窒素、酸素、もしくは硫黄から選択される）を有する 5 ~ 6 員の単環式ヘテロアリール環；あるいは、1 ~ 4 個のヘテロ原子（独立して、窒素、酸素、もしくは硫黄から選択される）を有する 6 ~ 12 員のスピロ、縮合、もしくは架橋の、二環式の炭素環式またはヘテロ環式の環；これらの各々は、任意に置換されていてもよい；あるいは

同じ原子上の 2 個の R 基は、これらが付着している原子と一緒にあって、 $C_{3 \sim 10}$ アリール、飽和のもしくは部分的に不飽和の 3 ~ 8 員の炭素環式の環、1 ~ 4 個のヘテロ原子（独立して、窒素、酸素、もしくは硫黄から選択される）を有する 3 ~ 7 員のヘテロ環式の環、または 1 ~ 4 個のヘテロ原子（独立して、窒素、酸素、もしくは硫黄から選択される）を有する 5 ~ 6 員の単環式ヘテロアリール環を形成する；これらの各々は、任意に置換されていてもよい；

n は、1 または 2 である；

p は、0、1、または 2 である；および

q は、0、1、または 2 である、前記化合物。

【請求項 2】

R^1 が、 H または F である、請求項 1 に記載の化合物。

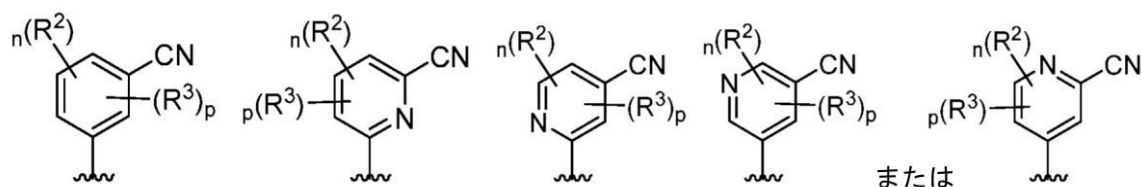
【請求項 3】

環 Z が、フェニル、ピリジン、またはピリミジンである、請求項 1 または請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

環 Z が、

【化 2】



である、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

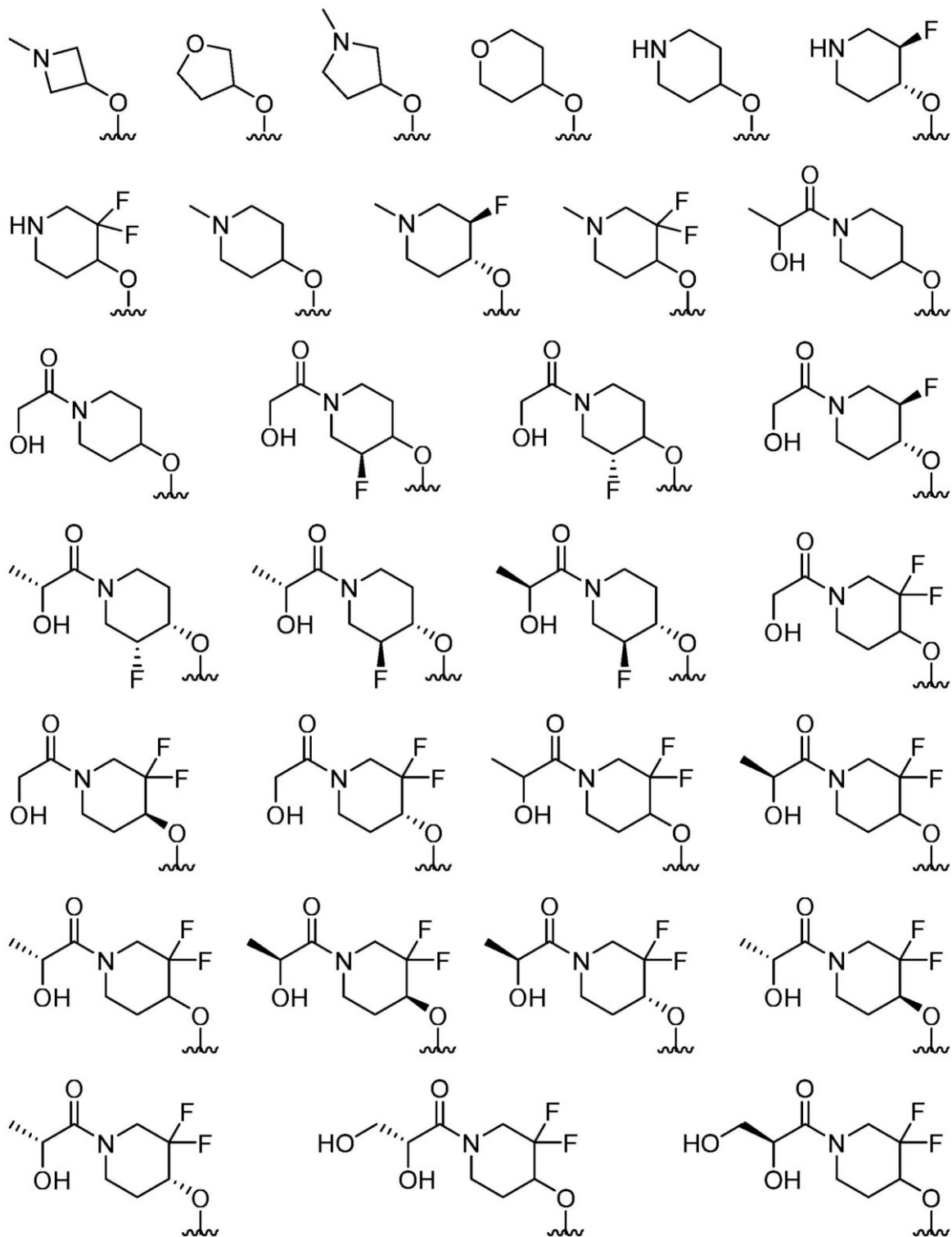
【請求項 5】

各 R^2 が、独立して、-R、ハロゲン、-OR、または -N(R)₂ である、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

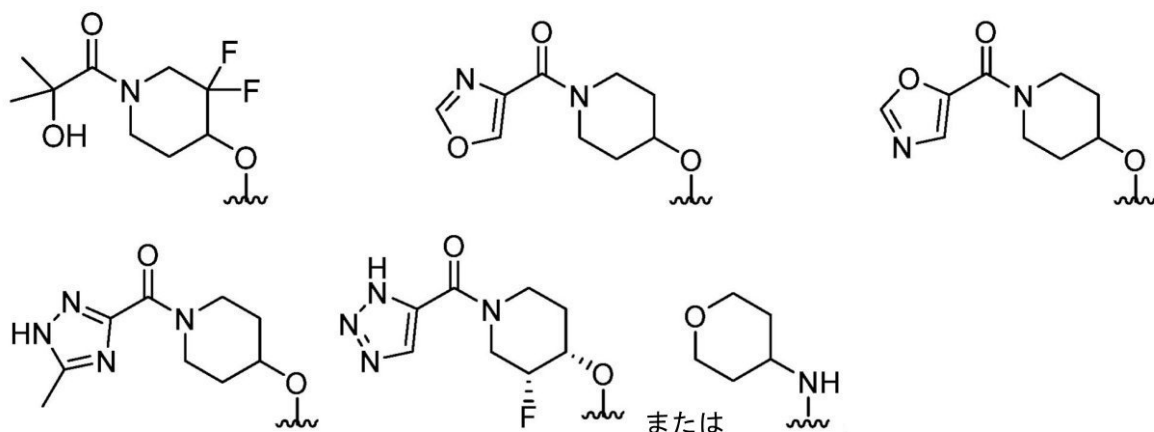
【請求項 6】

各 R^2 が、独立して、

【化 3】



【化 4】



である、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

各 R^3 が、独立して、- R、ハロゲン、- OR、または - N(R)₂ である、請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物。

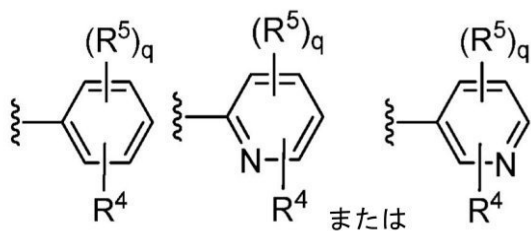
【請求項 8】

環 A が、フェニルまたはピリジルである、請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9】

環 A が、

【化 5】



である、請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 10】

R^4 が、- R または - OR である、請求項 1 ~ 9 のいずれか一項に記載の化合物。

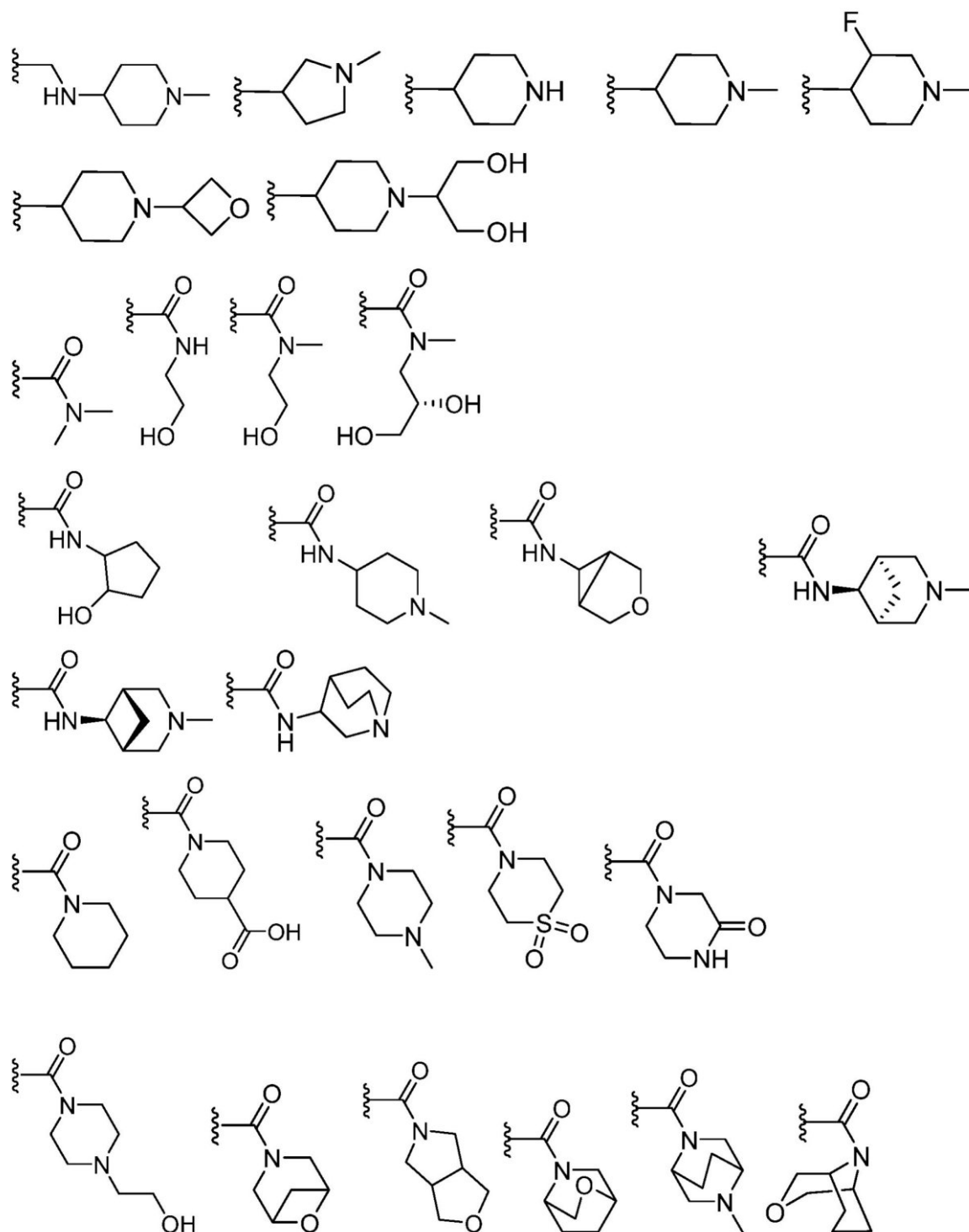
【請求項 11】

各 R^5 が、独立して、- R、- C(O)R、- CO₂R、- C(O)N(R)₂、- NR₂、- NRC(O)R、または - N(R)₂ である、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の化合物。

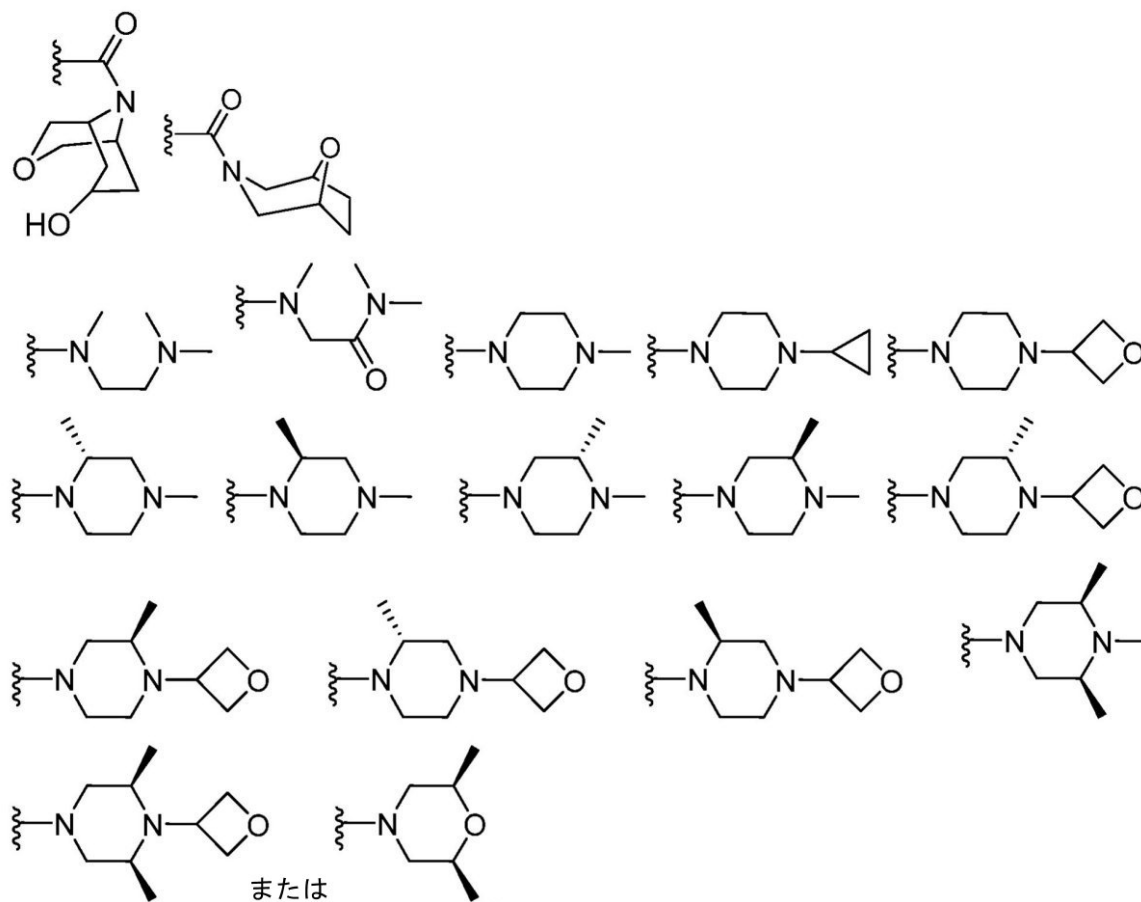
【請求項 12】

各 R^5 が、独立して、

【化 6】



【化 7】

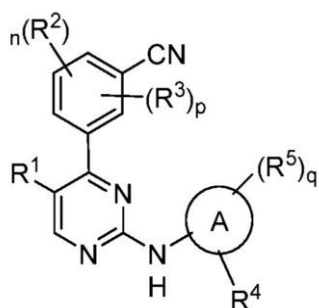


である、請求項 1 ~ 11 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 13】

式 I I、

【化 8】



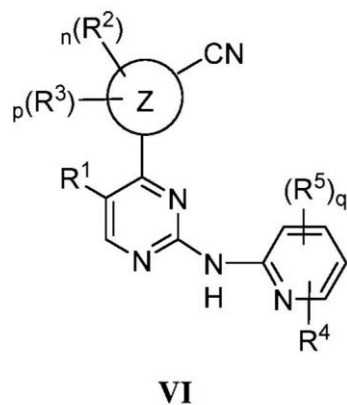
II

で表される化合物；またはその薬学的に許容し得る誘導体、溶媒和物、塩、水和物、もしくは立体異性体である、請求項1に記載の化合物。

【請求項 14】

式 V I、

【化 9】



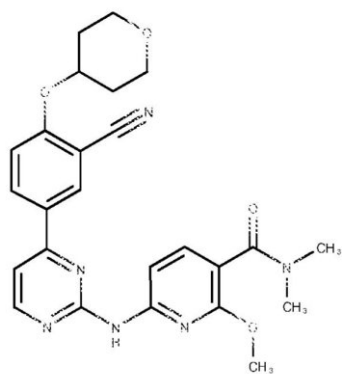
で表される化合物；またはその薬学的に許容し得る誘導体、溶媒和物、塩、水和物、もしくは立体異性体である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 15】

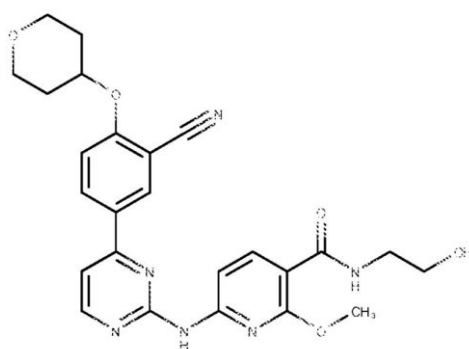
表 1 から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

表 1

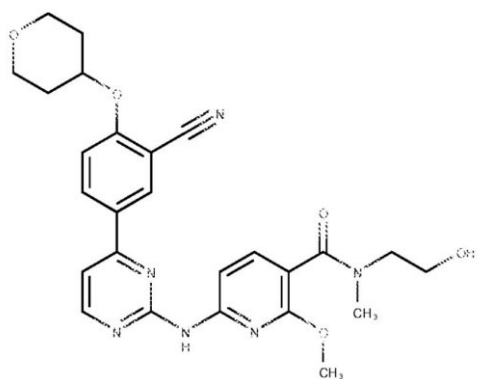
【化 10】



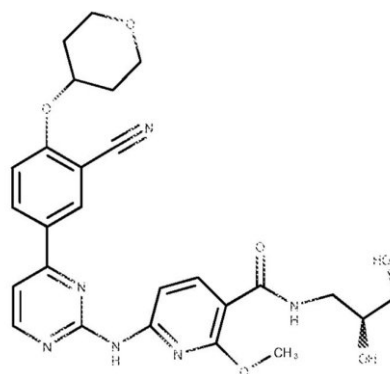
1



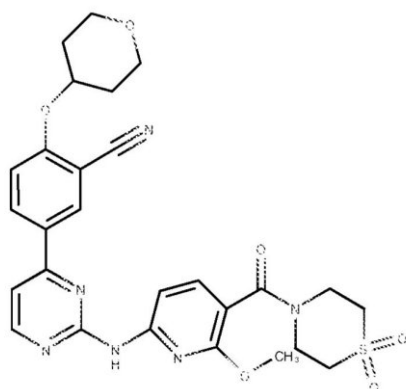
2



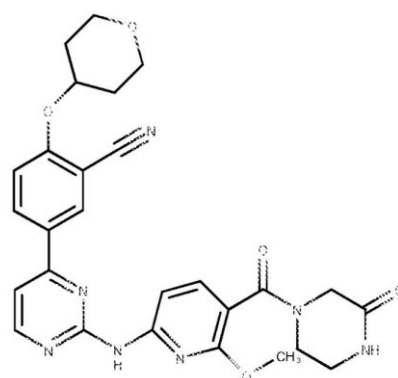
3



4

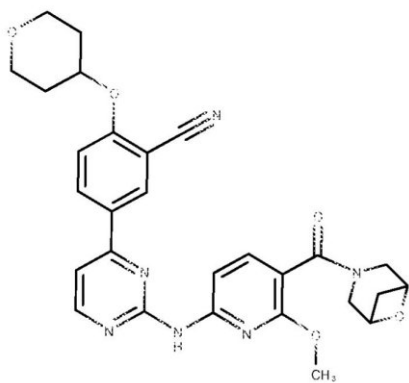


5

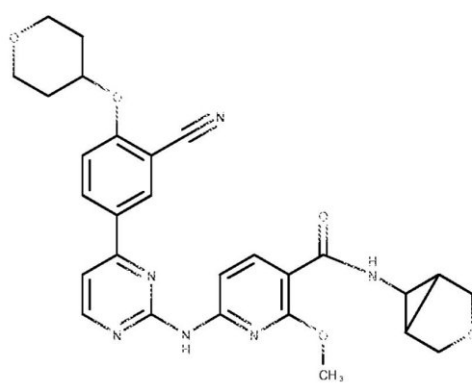


6

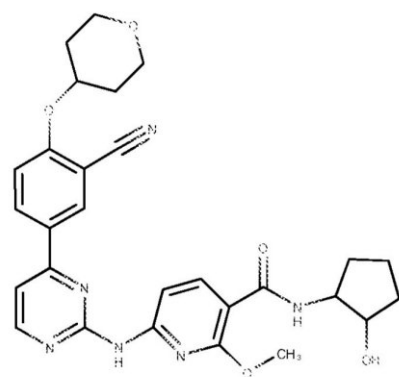
【化 1 1】



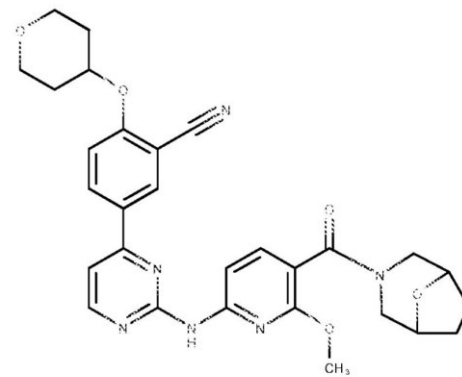
7



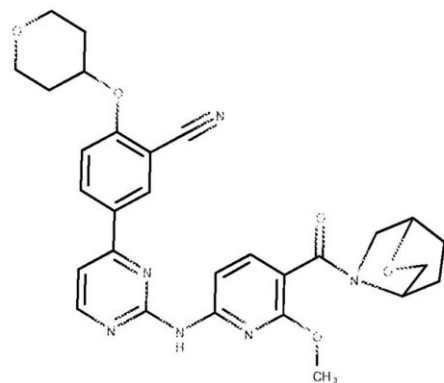
8



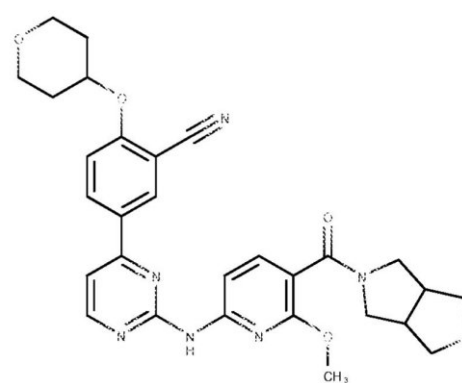
9



10

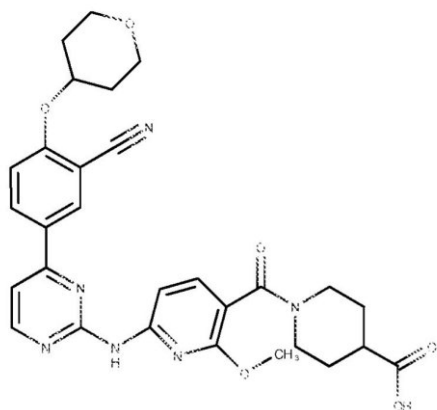


11

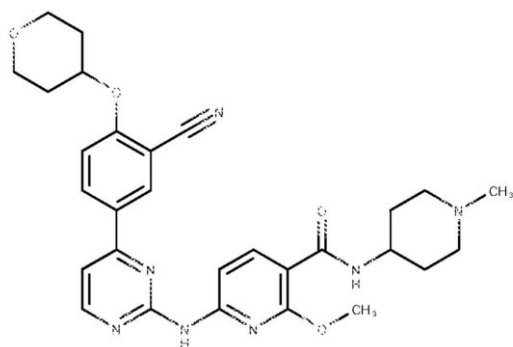


12

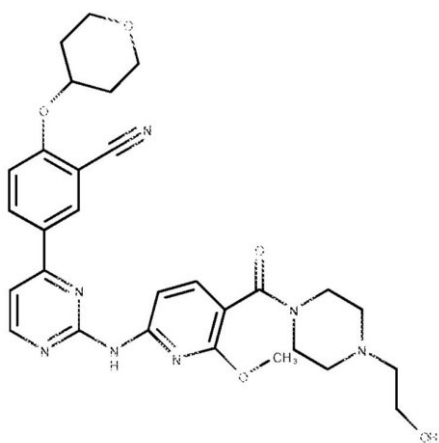
【化 1 2】



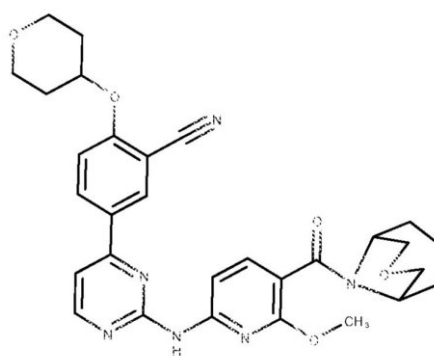
13



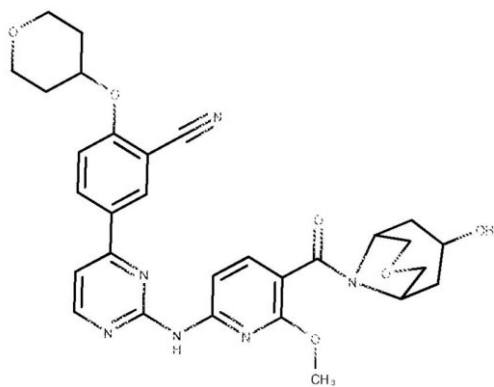
14



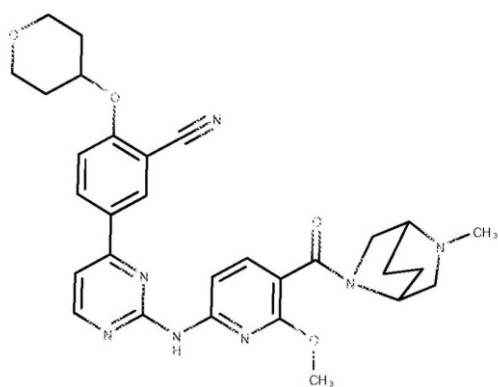
15



16



17

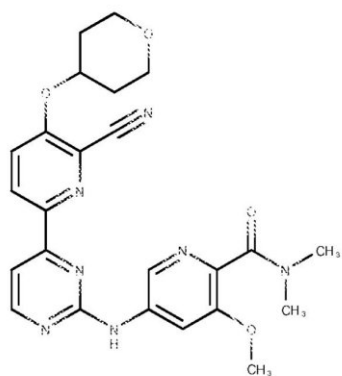


18

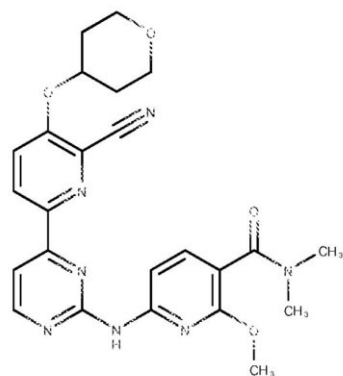
【化 1 3】



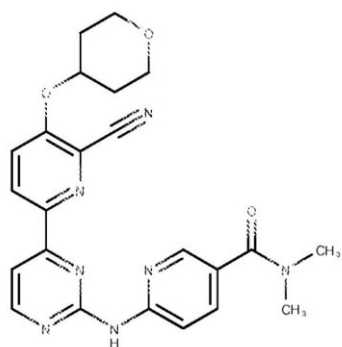
【化 1 4】



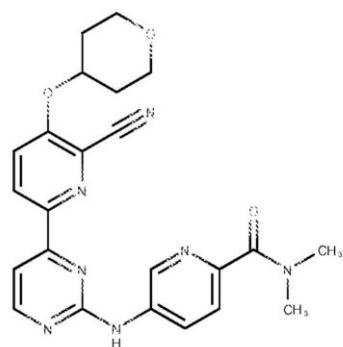
25



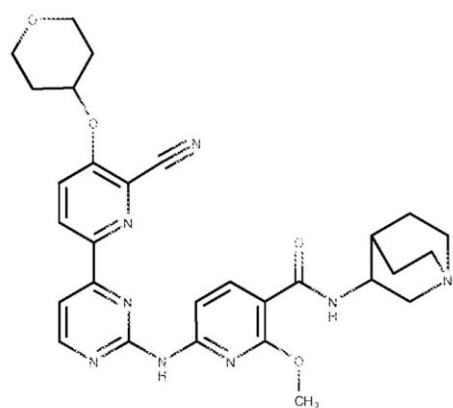
26



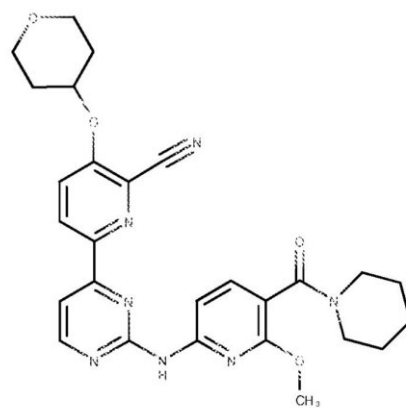
27



28

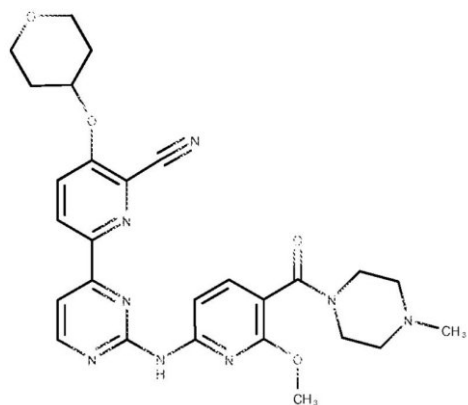


29

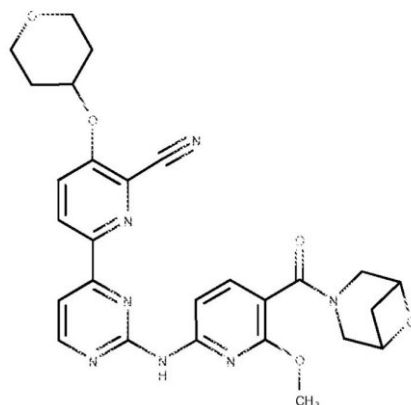


30

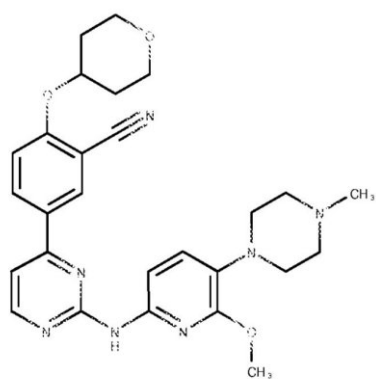
【化 1 5】



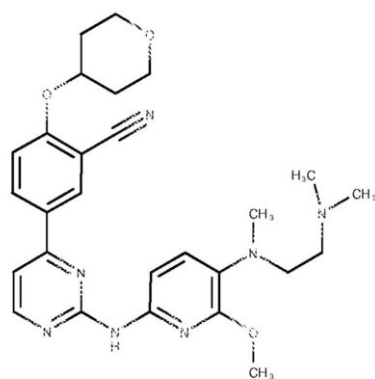
31



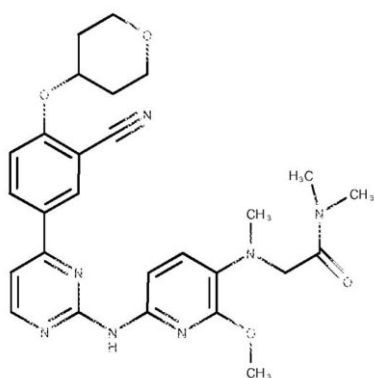
32



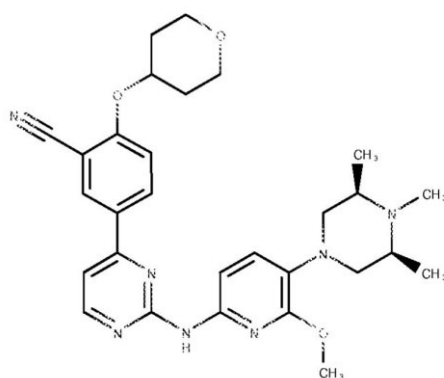
33



34

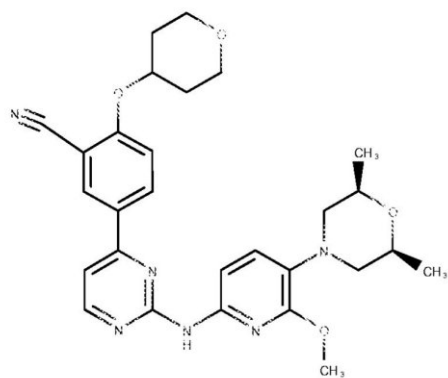


35

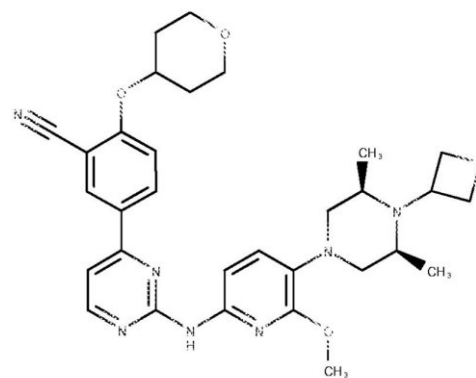


36

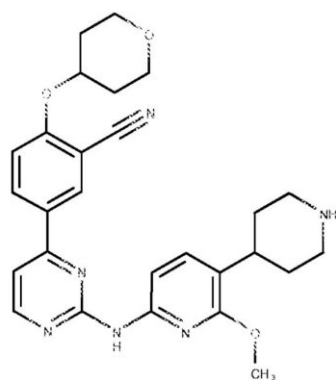
【化 1 6】



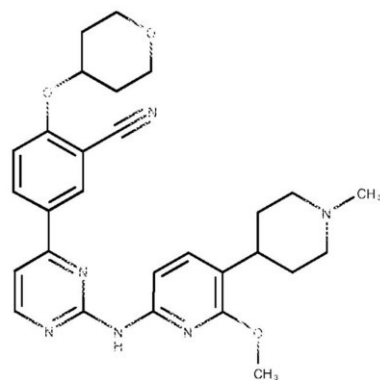
37



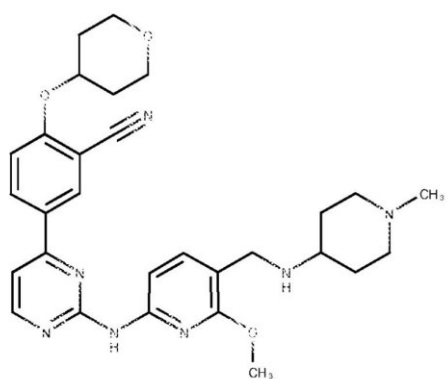
38



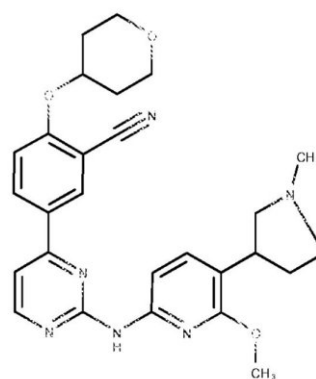
39



40

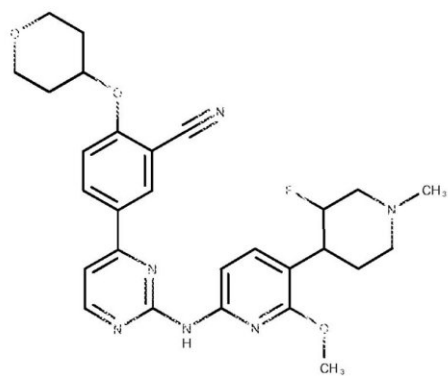


41

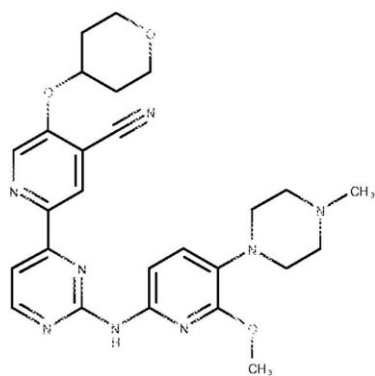


42

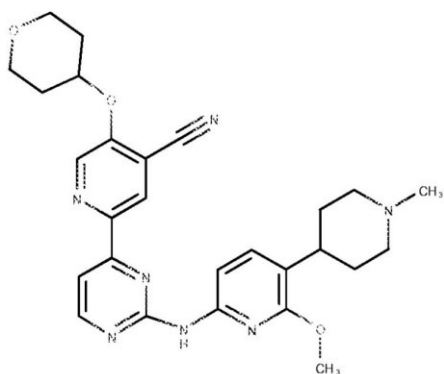
【化 17】



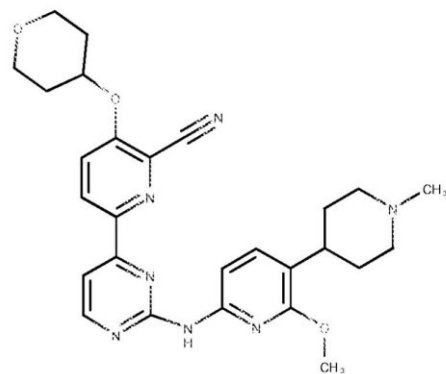
43



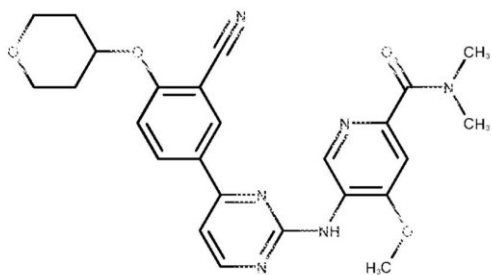
44



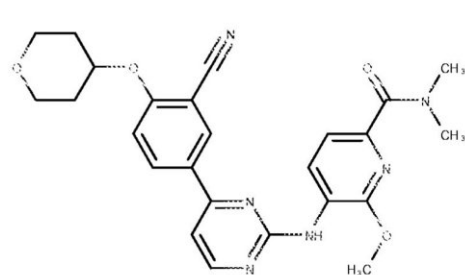
45



46

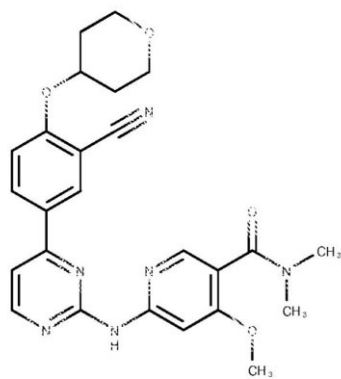


47

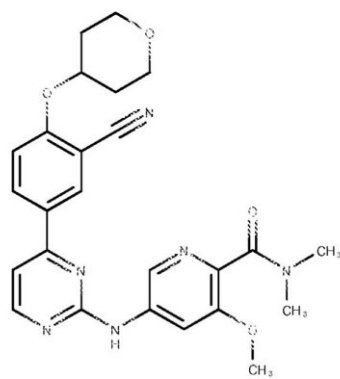


48

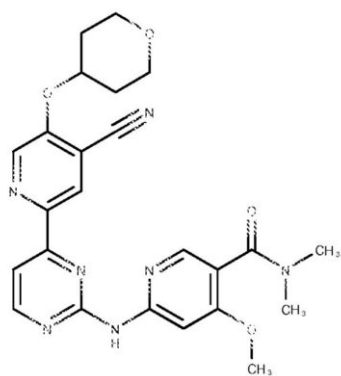
【化 1 8】



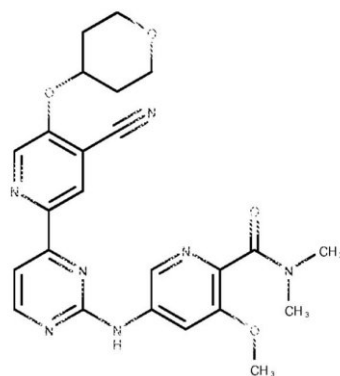
49



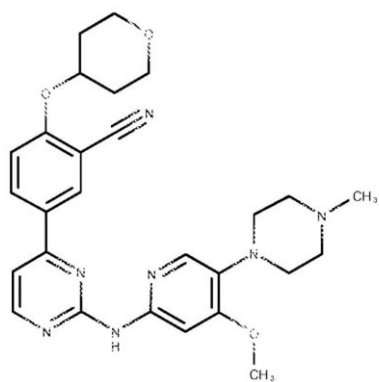
50



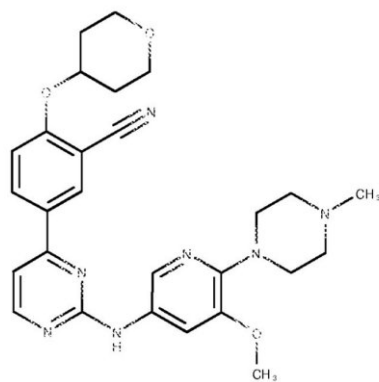
51



52

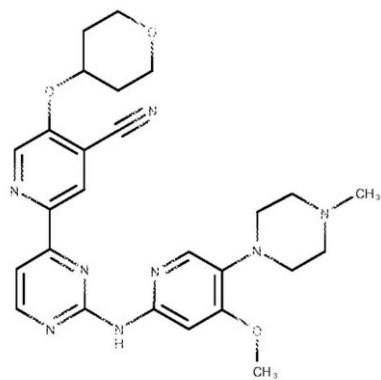


53

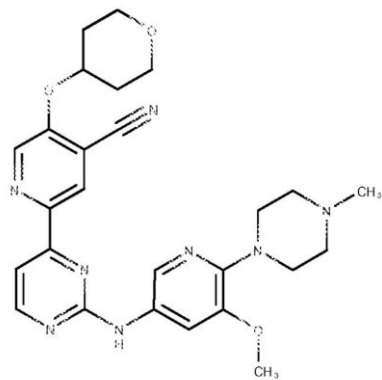


54

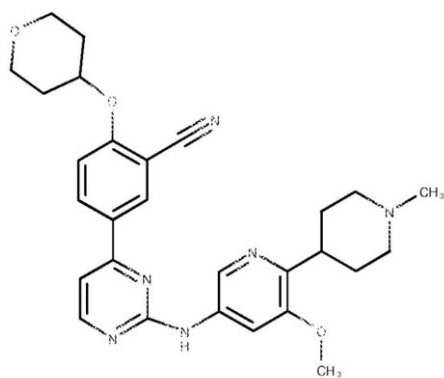
【化 19】



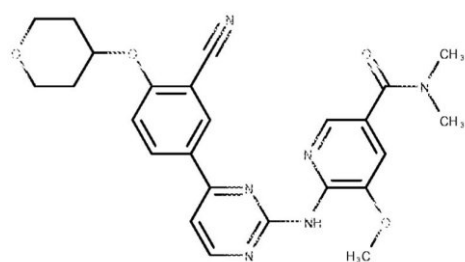
55



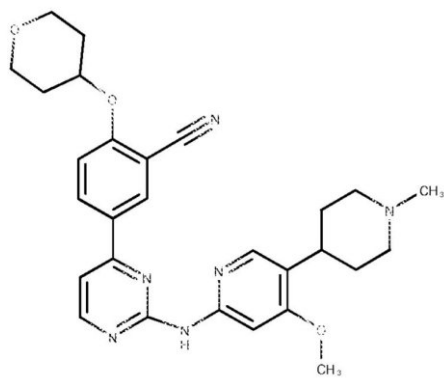
56



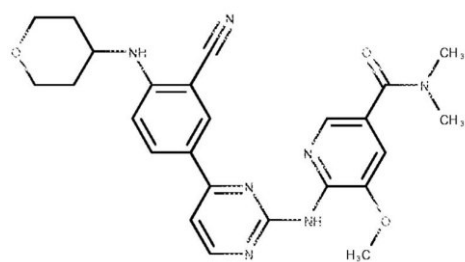
57



58

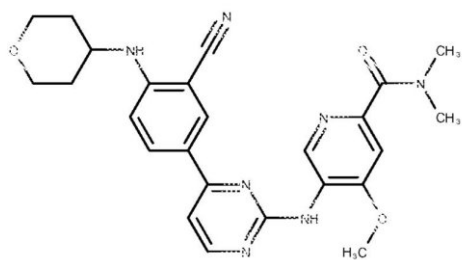


59

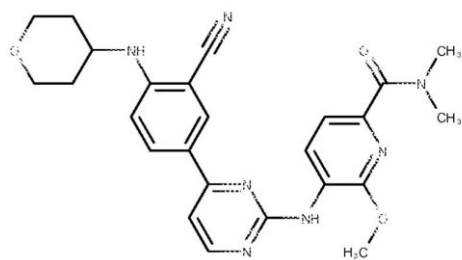


60

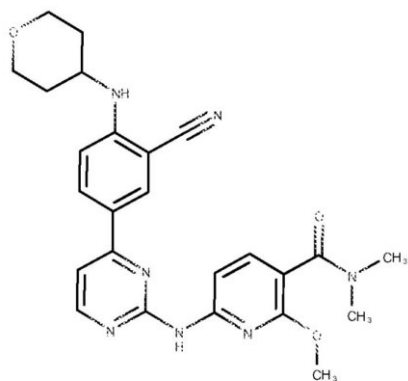
【化 20】



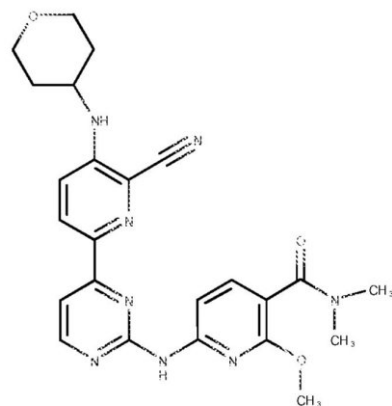
61



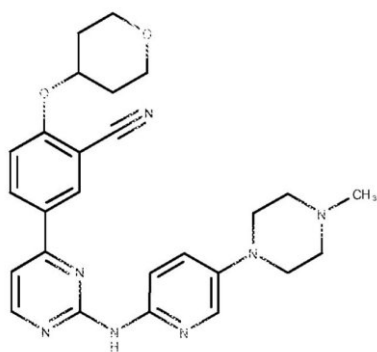
62



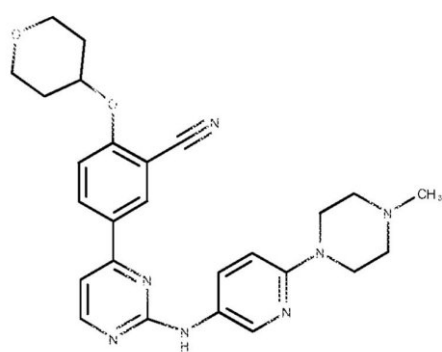
63



64

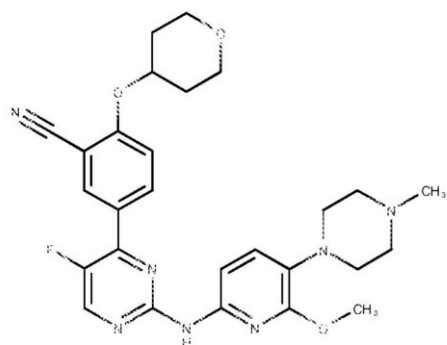


65

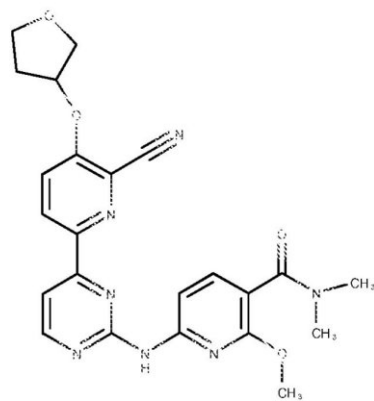


66

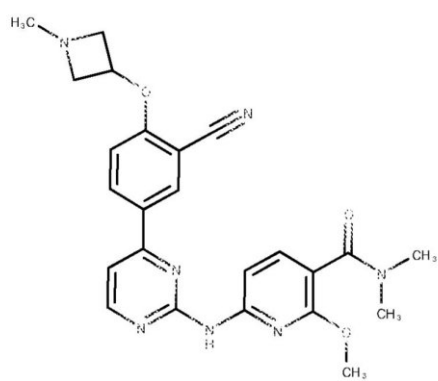
【化 2 1】



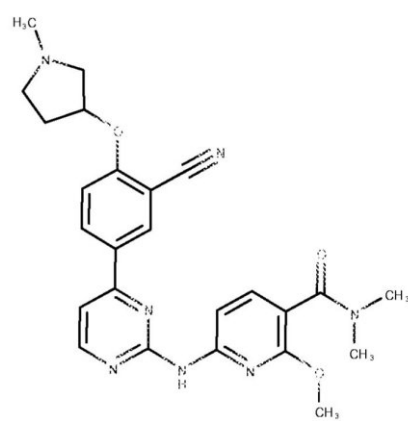
67



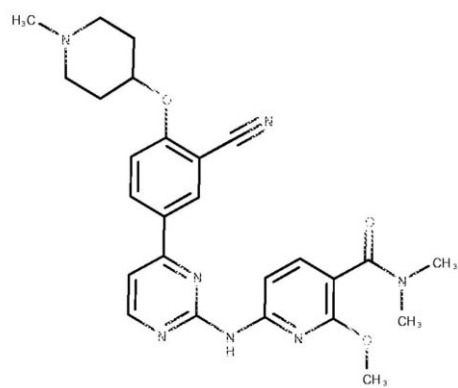
68



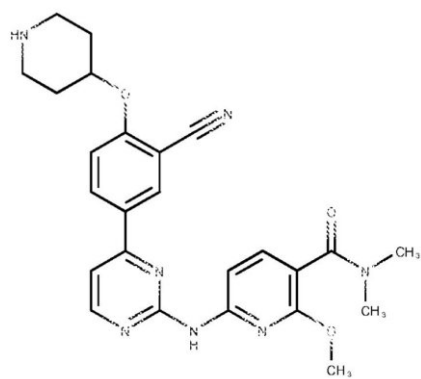
69



70

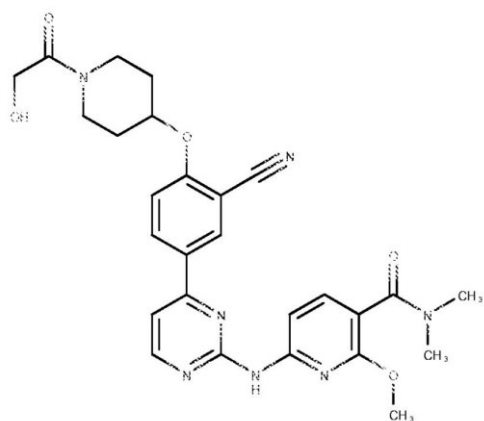


71

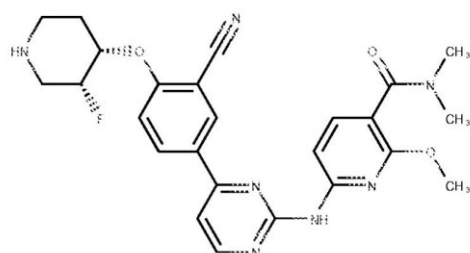


72

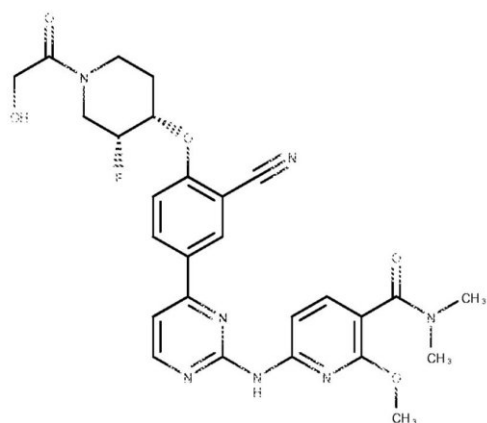
【化 2 2】



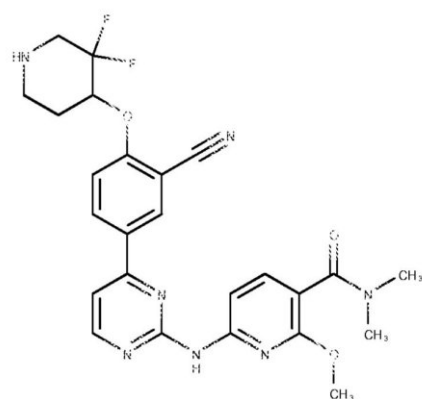
73



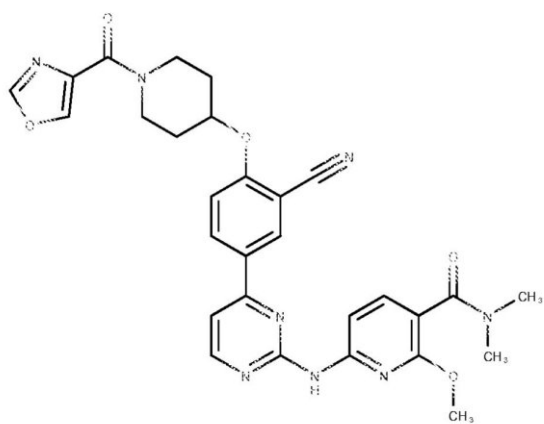
74



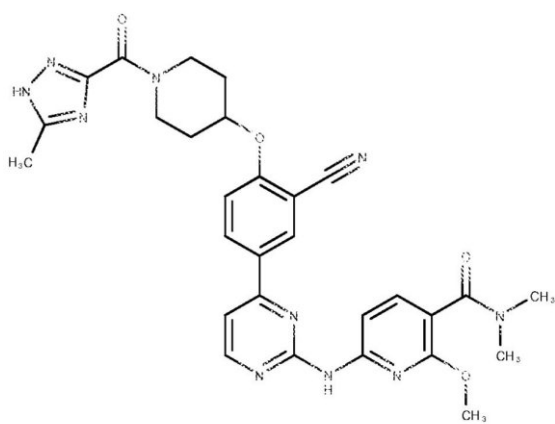
75



76

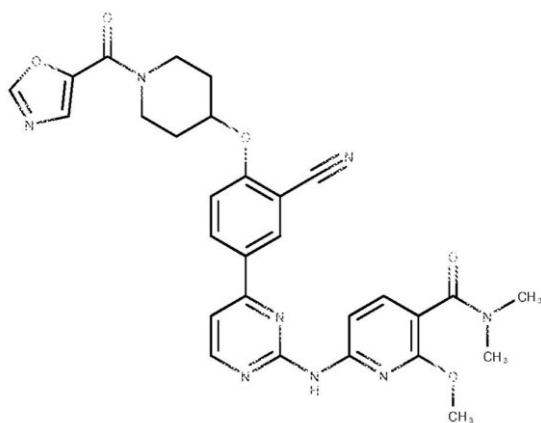


77

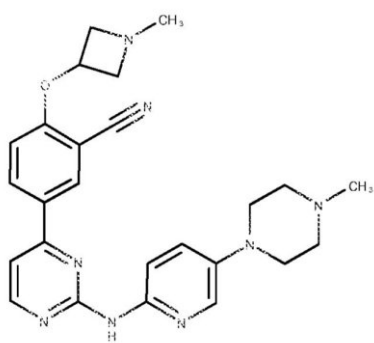


78

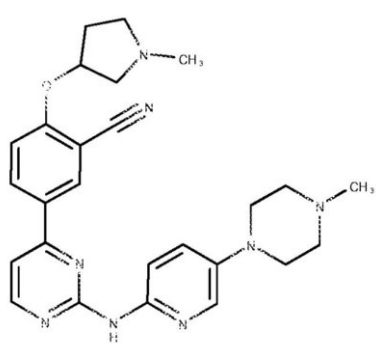
【化 2 3】



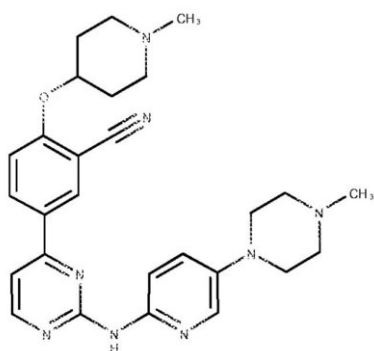
79



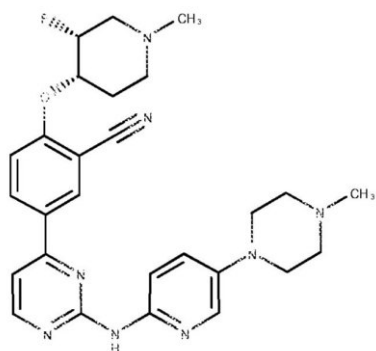
81



82

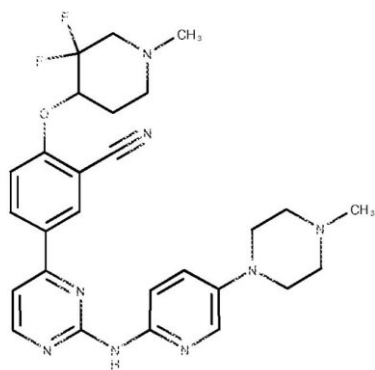


83

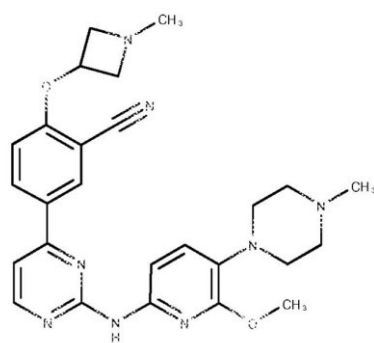


84

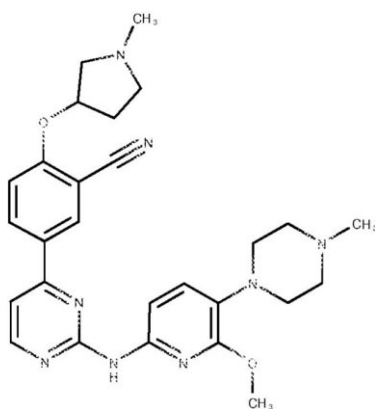
【化 2 4】



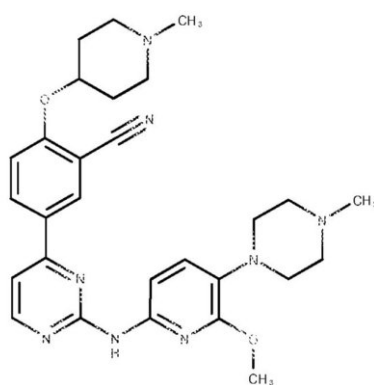
85



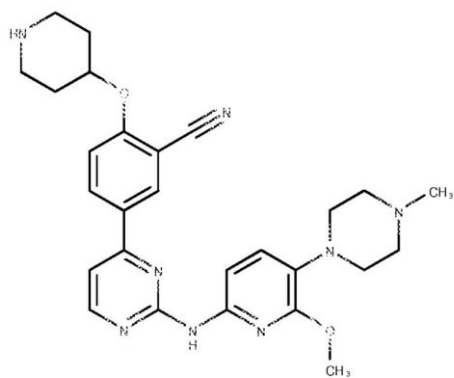
86



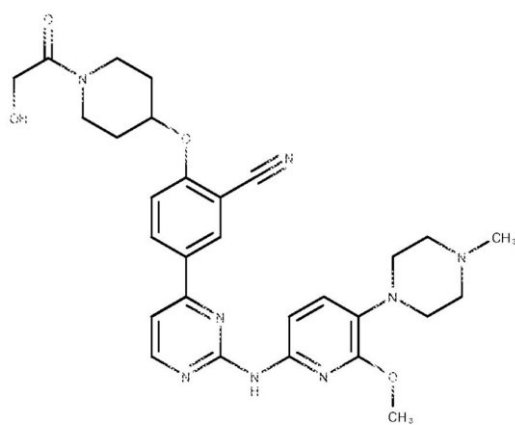
87



88

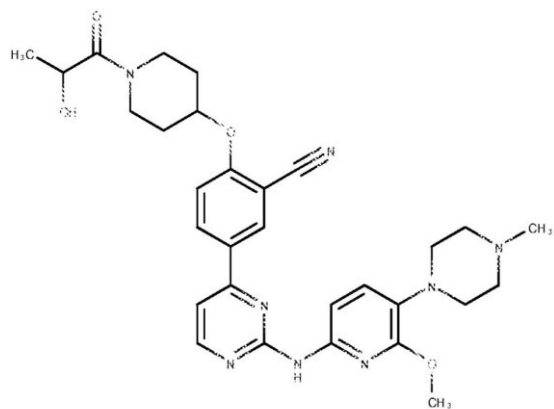


89

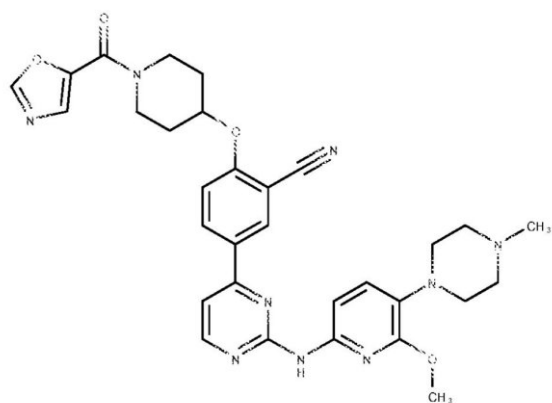


90

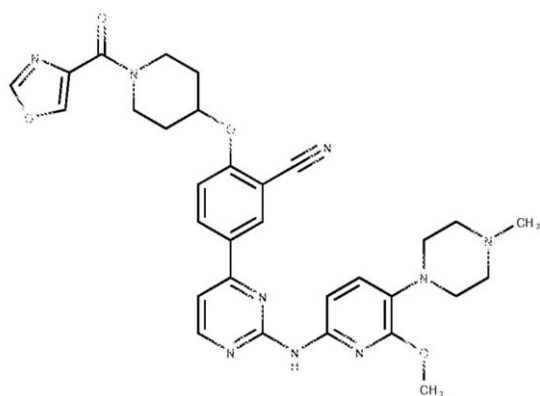
【化 2 5】



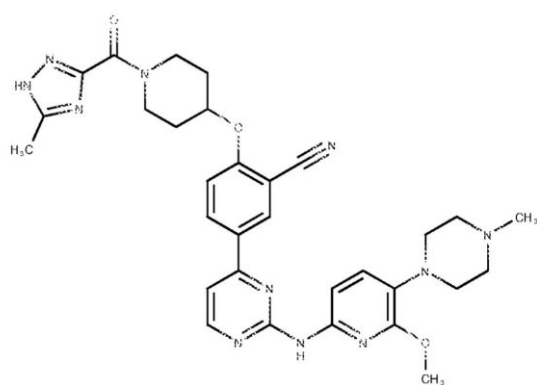
91



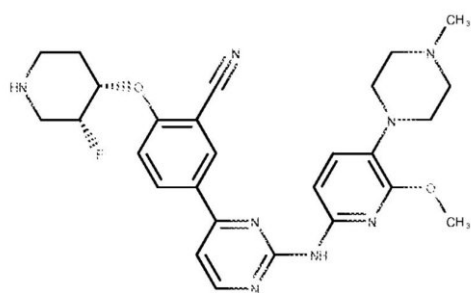
92



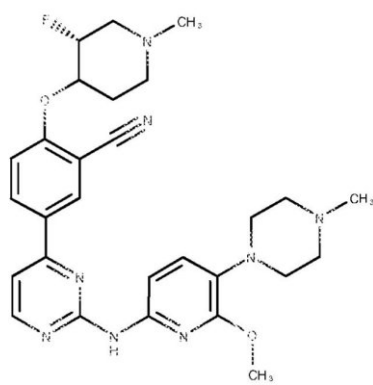
93



94

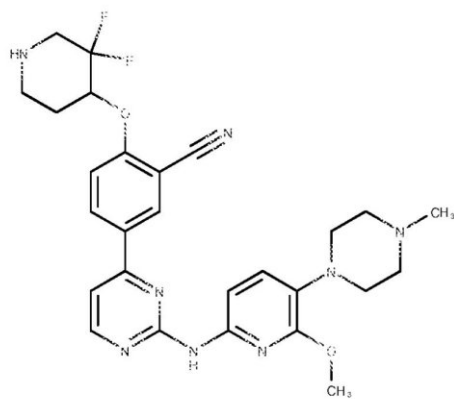


95

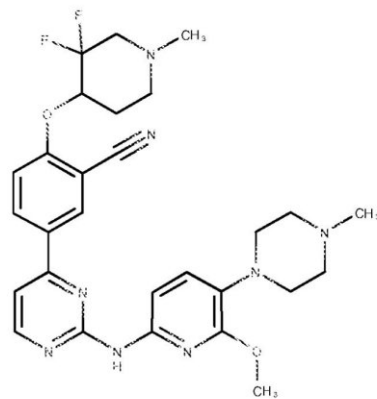


96

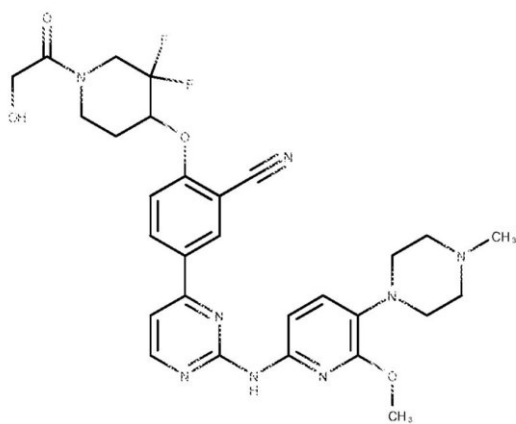
【化 2 6】



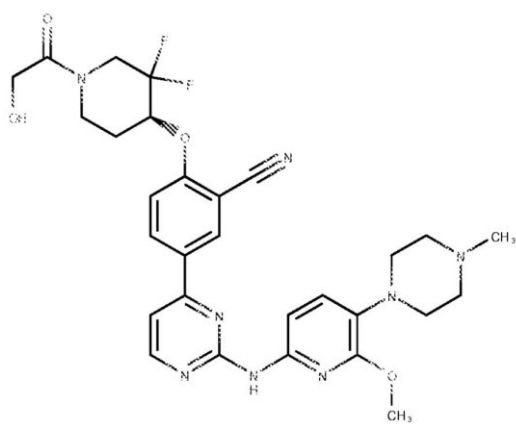
97



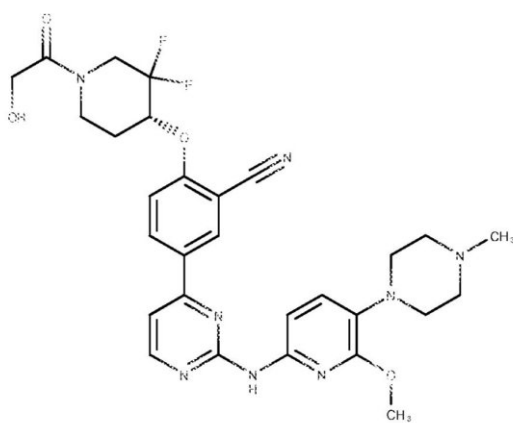
98



99

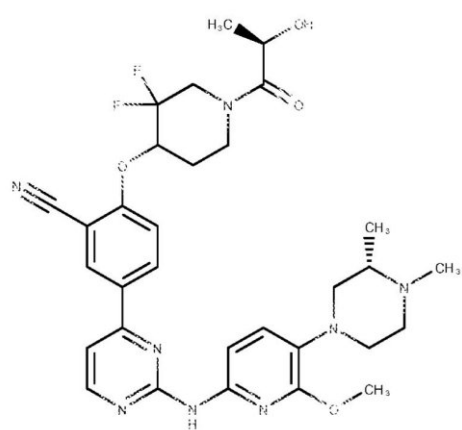


100

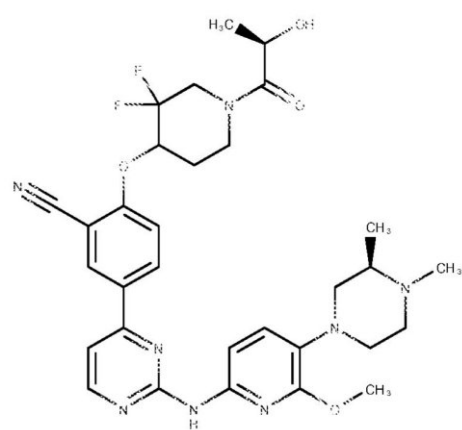


101

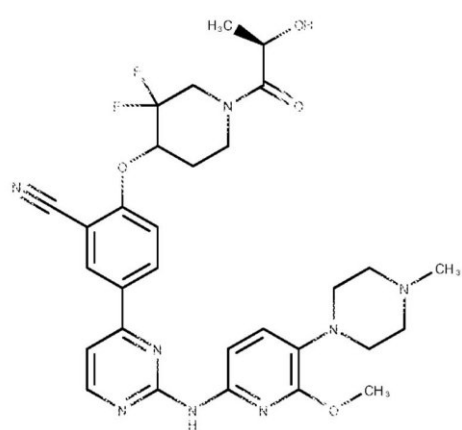
【化 2 7】



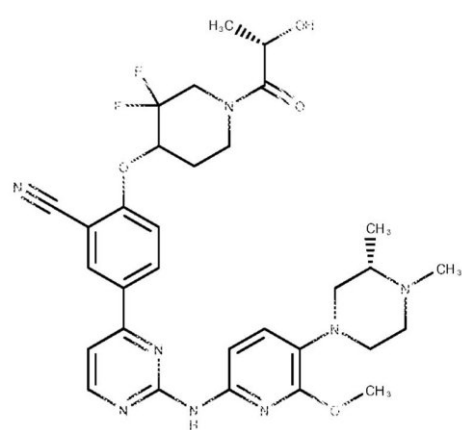
102



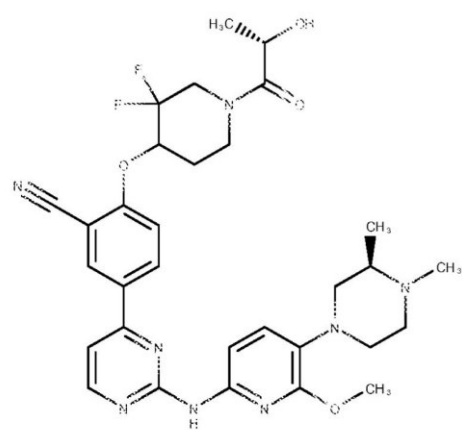
103



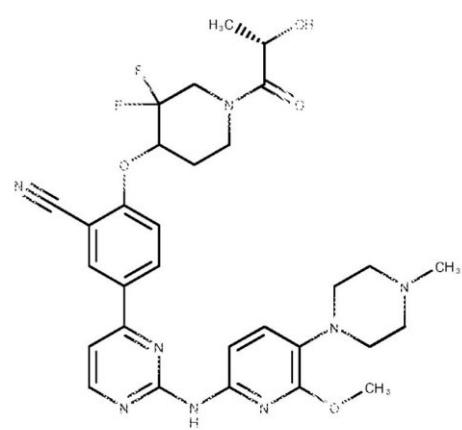
104



105

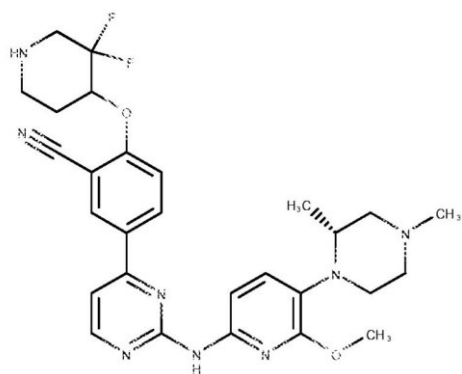


106

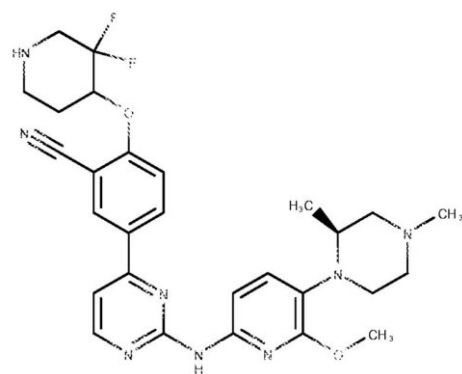


107

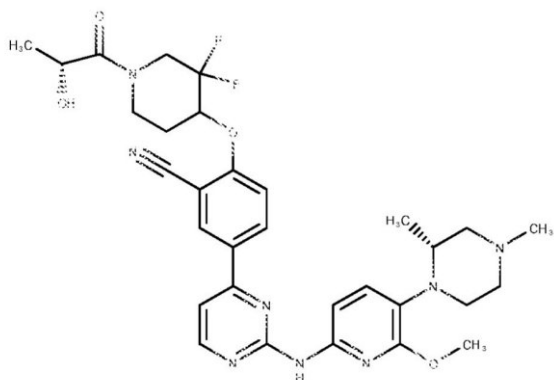
【化 2 8】



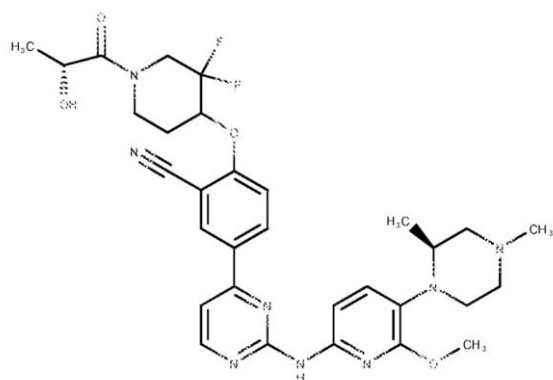
108



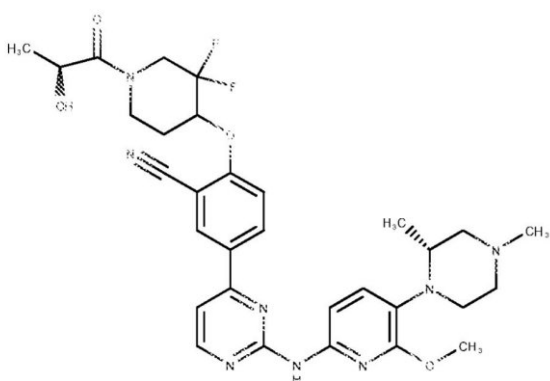
109



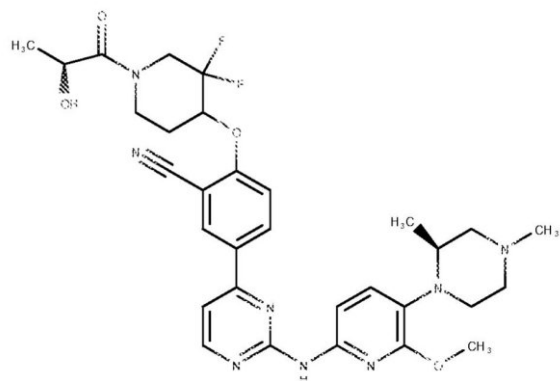
110



111

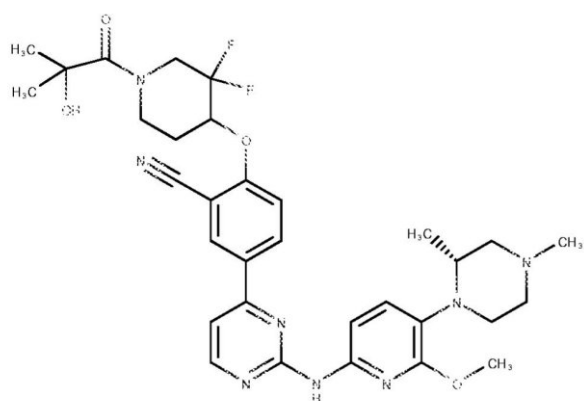


112

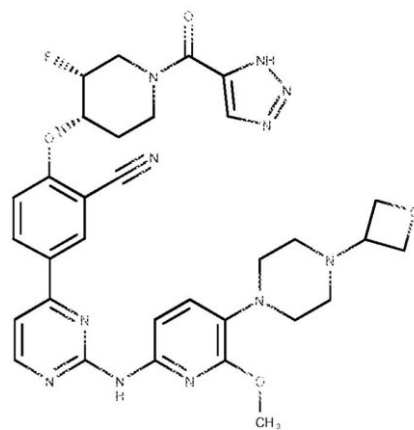


113

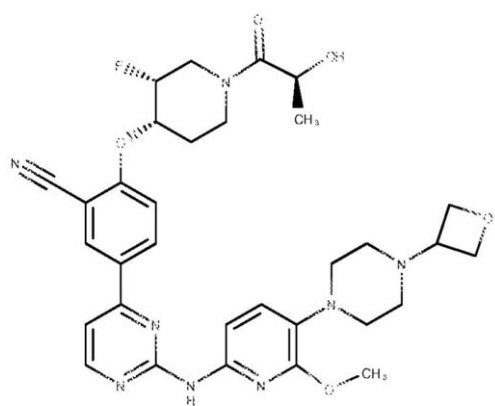
【化 29】



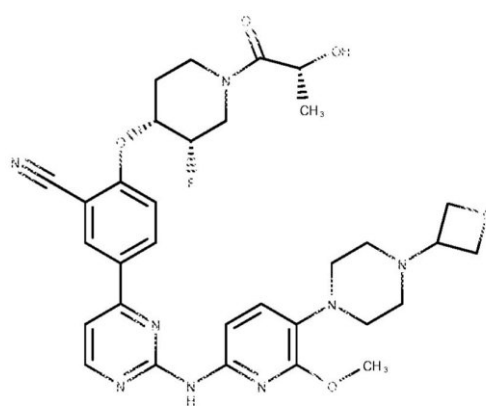
114



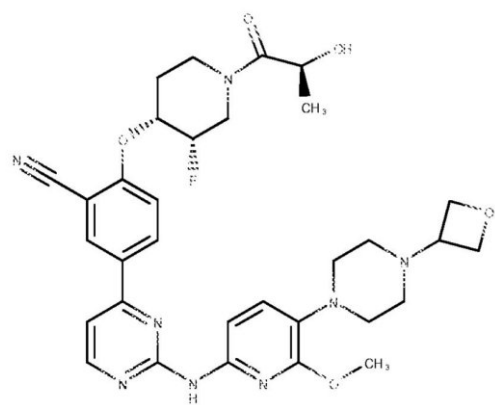
115



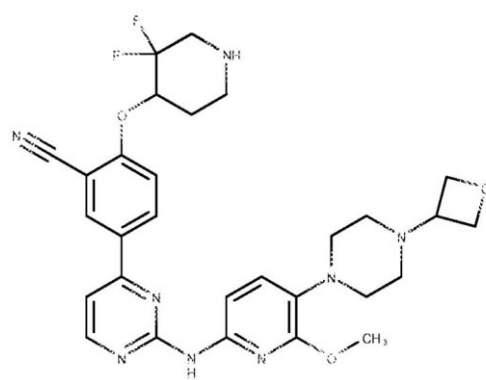
116



117

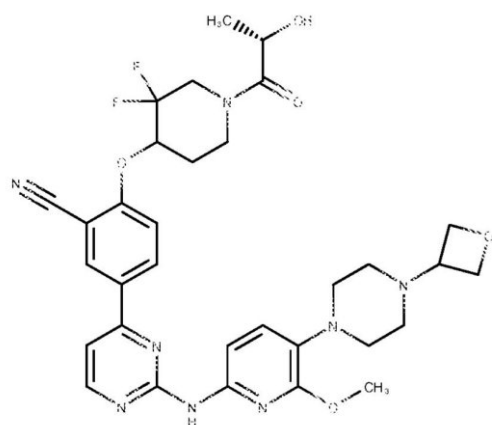


118

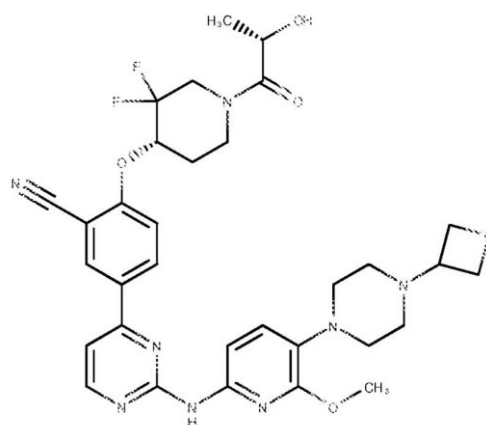


119

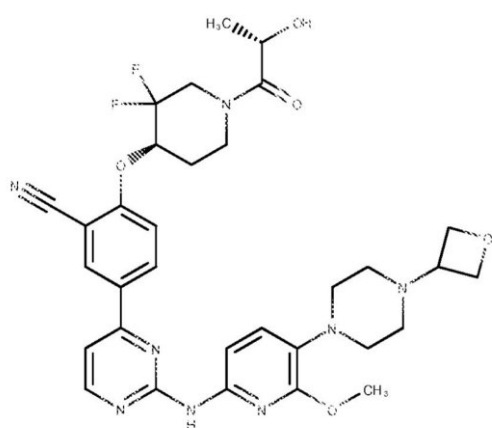
【化 30】



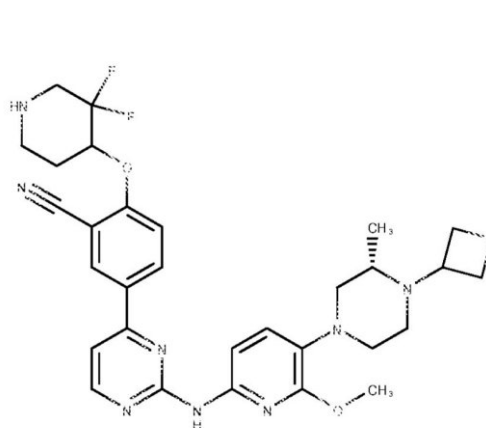
120



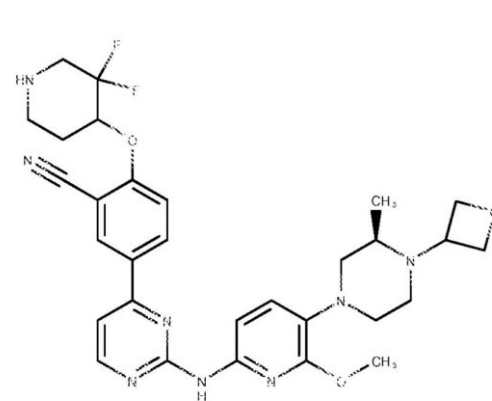
121



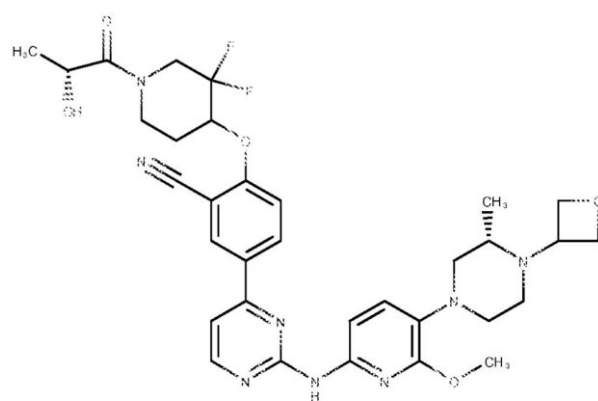
122



123

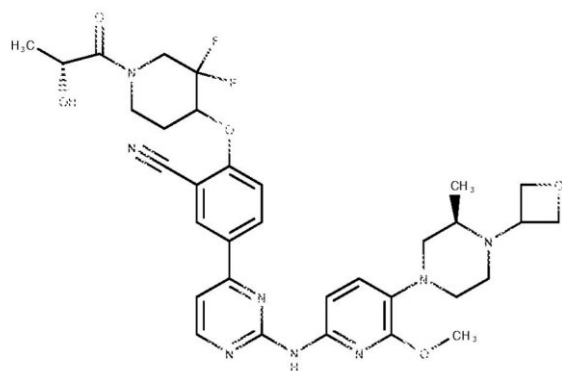


124

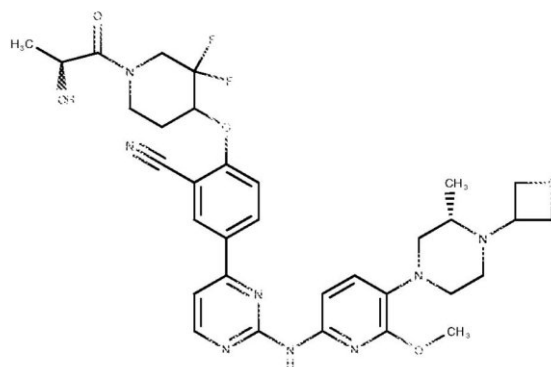


125

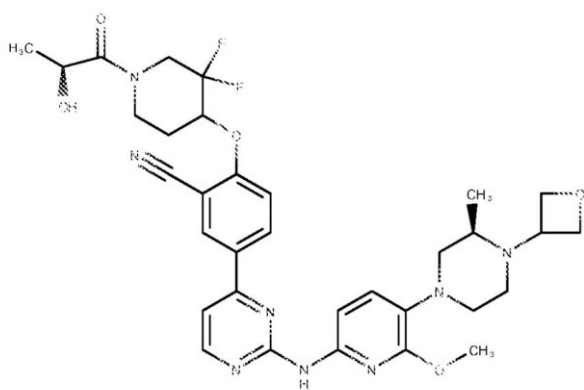
【化 3 1】



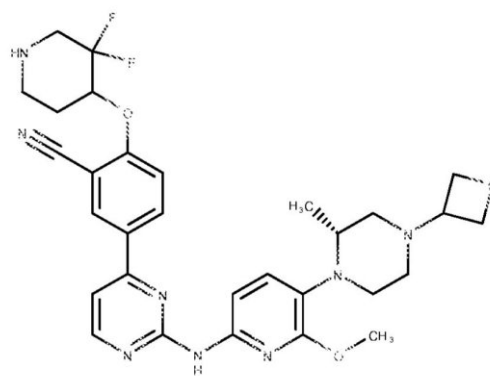
126



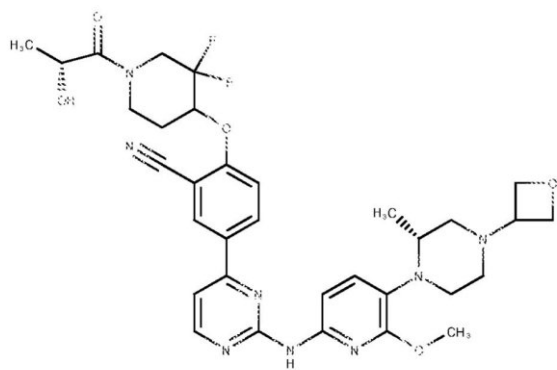
127



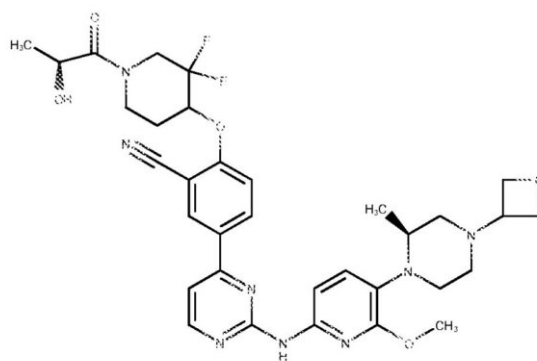
128



129

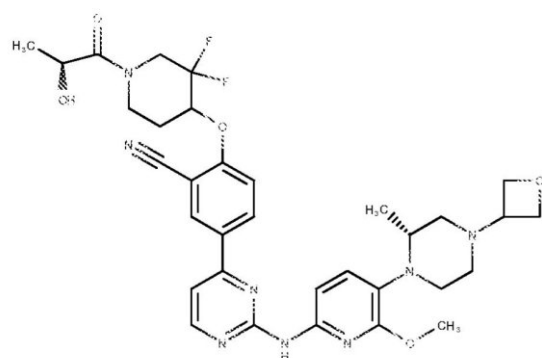


130

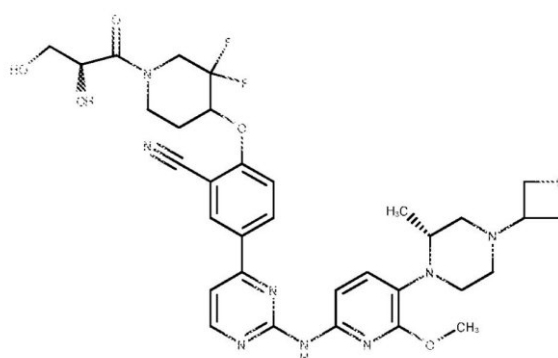


131

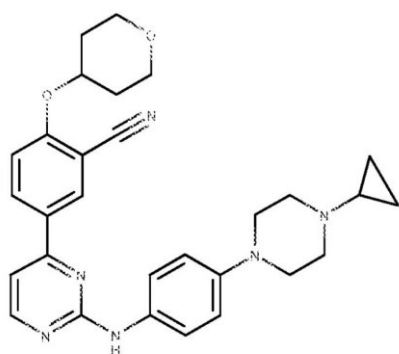
【化 3 2】



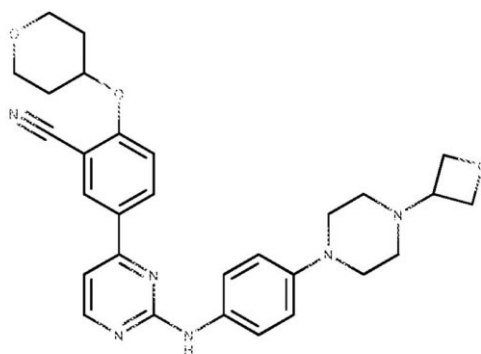
132



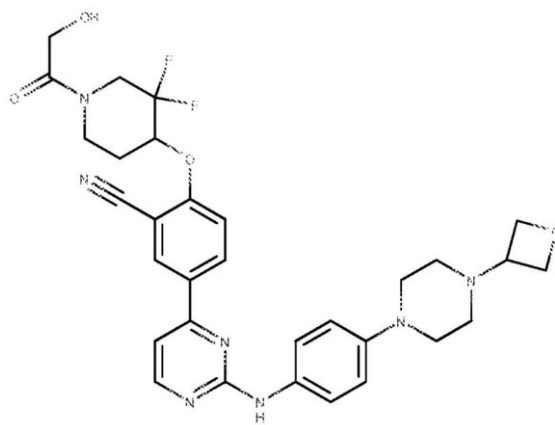
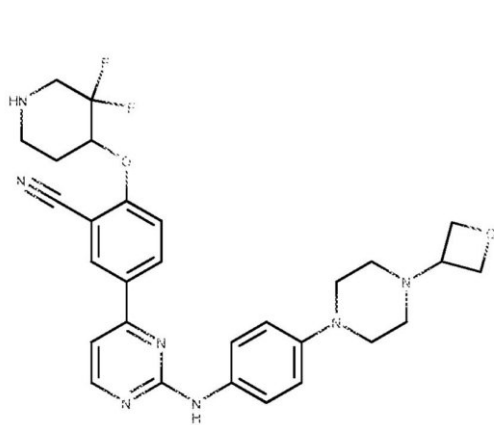
133



134

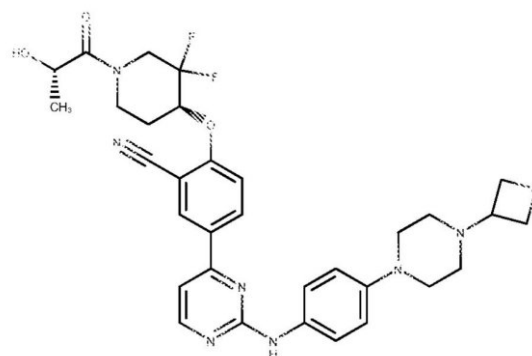


135

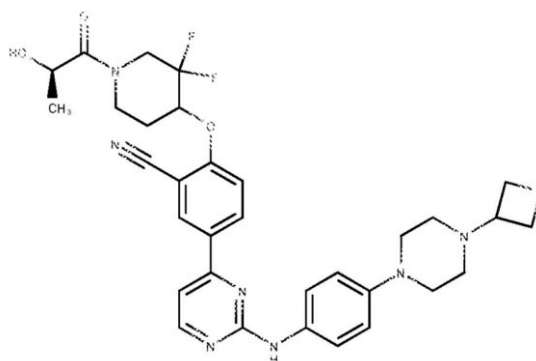


【化 3 3】

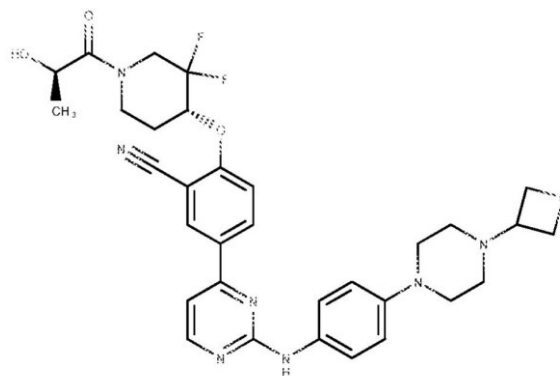
137



139

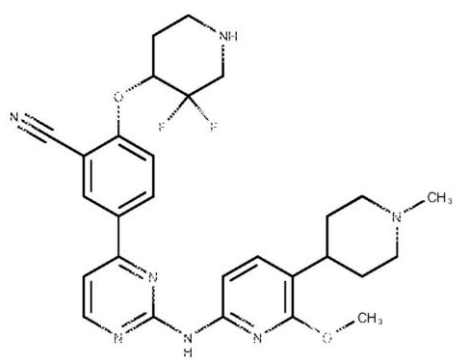


141

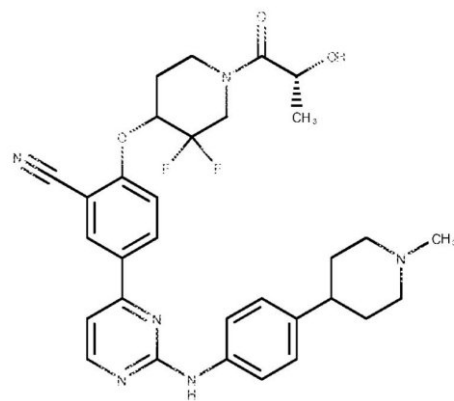


143

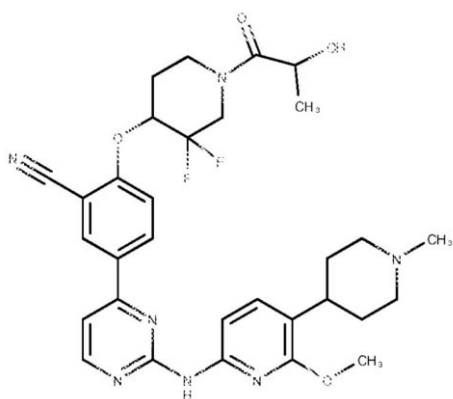
【化 3 4】



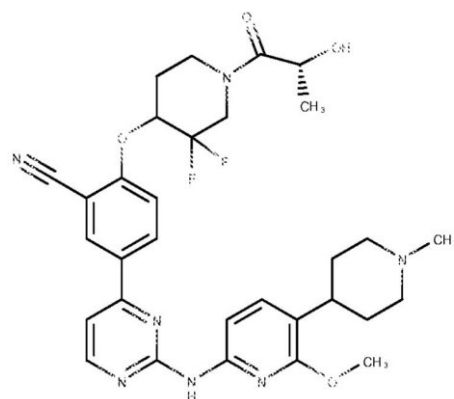
144



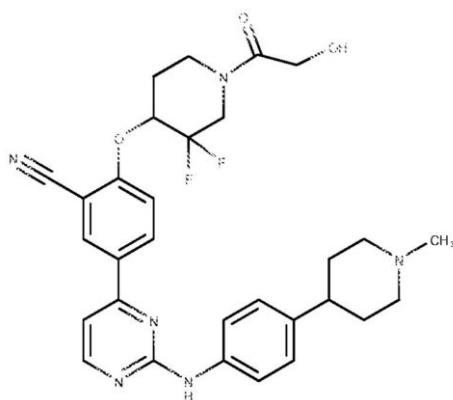
145



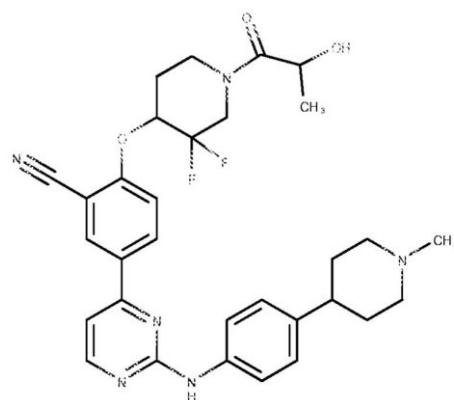
146



147

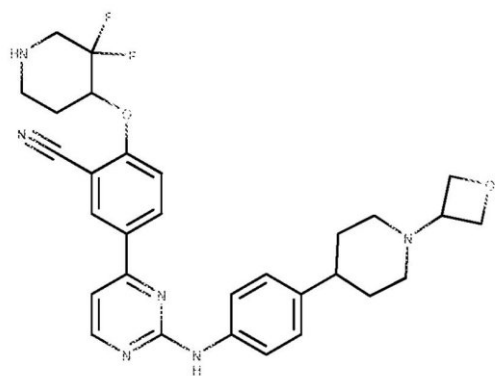


148

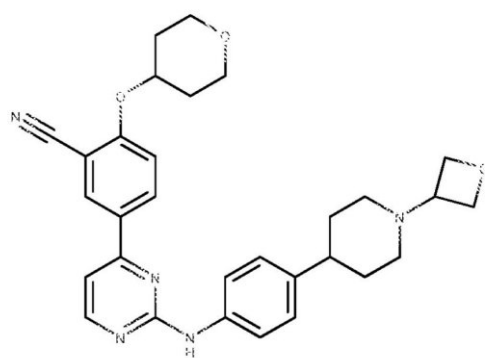


149

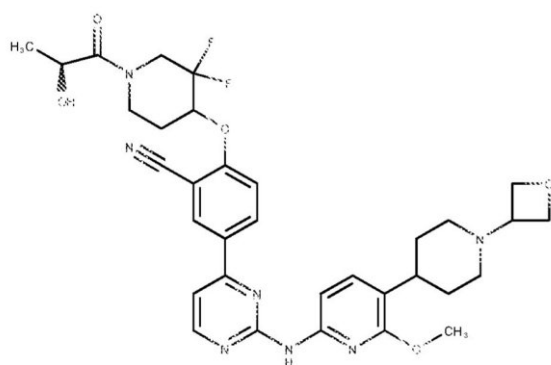
【化 3 5】



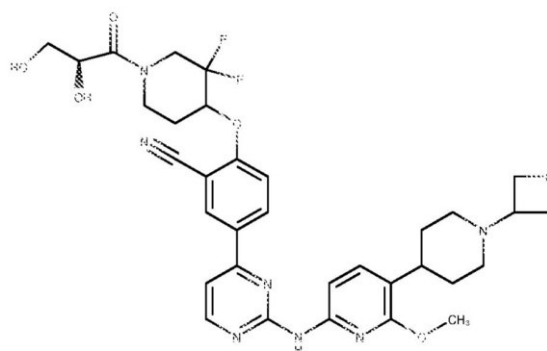
150



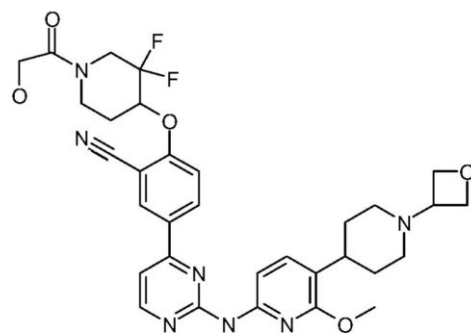
151



152

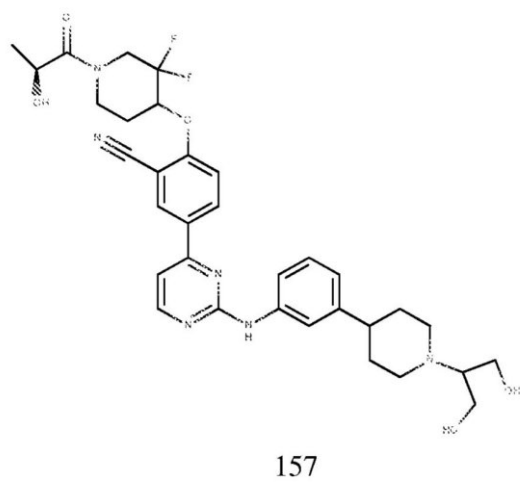
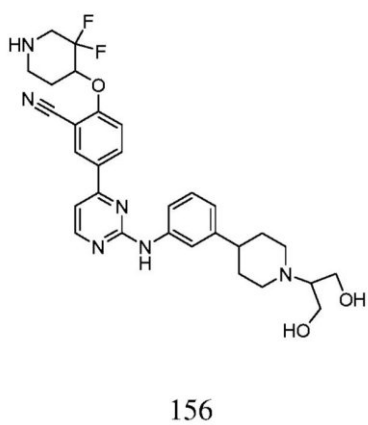
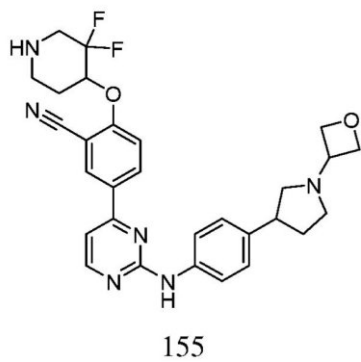


153

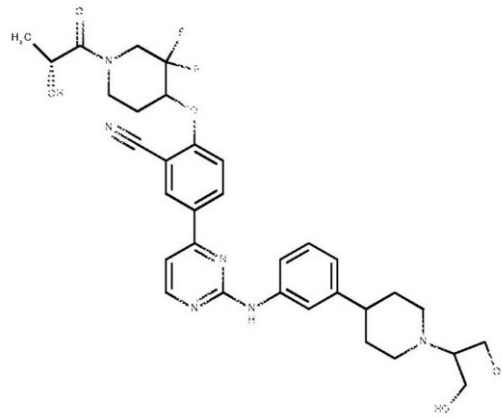


154

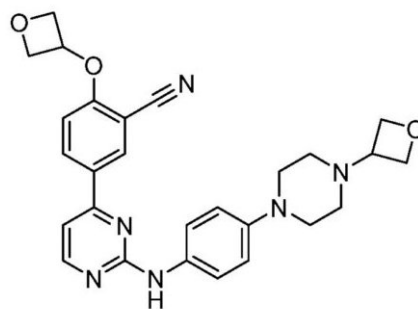
【化 3 6】



【化 3 7】



158



159

【請求項 1 6】

請求項 1 ~ 1 5 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容し得る誘導体、溶媒和物、塩、水和物、もしくは立体異性体と、薬学的に許容し得るアジュバント、担体、またはビヒクルとを含む、医薬組成物。

【請求項 1 7】

T B K および I K K 活性を阻害するための、請求項 1 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

T B K / I K K に関する障害の処置のための、請求項 1 6 または 1 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 9】

障害が、リウマチ性関節炎、乾癬性関節炎、骨関節炎、全身性エリテマトーデス、ループス腎炎、強直性脊椎炎、骨粗鬆症、全身性硬化症、多発性硬化症、乾癬、I 型糖尿病、II 型糖尿病、炎症性腸疾患（クローン病および潰瘍性大腸炎）、高 Ig D 血症および周期熱症候群、クリオピリン関連周期性症候群、シュニッツラー症候群、全身性若年性特発性関節炎、成人発症スチル病、痛風、偽痛風、S A P H O 症候群、キャスルマン病、敗血症、脳卒中、アテローム性動脈硬化、セリアック病、D I R A（IL - 1 受容体アンタゴニスト欠損症）、アルツハイマー病、パーキンソン病、ならびにがんから選択される、請求項 1 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 0】

障害が、全身性エリテマトーデスである、請求項 1 9 に記載の医薬組成物。