

【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24年11月29日 (2012.11.29)

【公表番号】特表2012-505892(P2012-505892A)

【公表日】平成24年3月8日 (2012.3.8)

【年通号数】公開・登録公報2012-010

【出願番号】特願2011-532177(P2011-532177)

【国際特許分類】

C 0 7 D 405/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/404 (2006.01)

A 6 1 K 31/4184 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/541 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 1/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 405/04 C S P

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 31/4184

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 471/04 1 0 4

A 6 1 K 31/437

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 413/14

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/541

A 6 1 K 31/4439

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 1/02

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 35/04

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成24年10月12日(2012.10.12)

【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

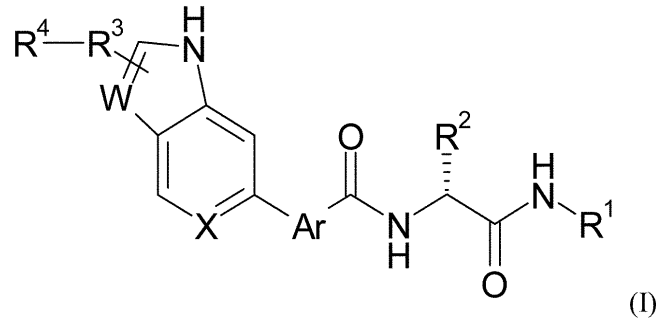
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化13】



[式中、

R^1 は、場合により、ヒドロキシル、 $C_1 - C_5$ アルコキシ、アリール及びヘテロアリールより選択される1～2個の置換基で置換されている、 $C_1 - C_5$ アルキルであり；

R^2 は、 $C_1 - C_5$ アルキル、カルボサイクル、ヘテロサイクル又はヘテロアリール（各々、場合により、アミノ、ヒドロキシル及び $C_1 - C_5$ アルコキシより選択される1～2個の置換基で独立に置換されている）であり；

R^3 は、結合、 $-(CH_2)_n$ 、 $-C(O)-$ 、 O 、 NH 又は $-S(O)_m-$ であり；

R^4 は、水素、 $C_1 - C_5$ アルキル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、ヘテロシクリル又はヘテロアリール（各々、場合により、 $C_1 - C_5$ アルキル、アシル、ハロゲン、ヒドロキシル、オキソ及び $C_1 - C_5$ アルコキシより選択される1～3個の置換基で独立に置換されている）であり；

W は、 N 、 O 又は CH であり、ここで、 CH は、場合により、ハロゲン、 $C_1 - C_5$ アルキル、 $C_1 - C_5$ アルコキシ又は $-C(O)-NH_2$ で置換されており、ここで、該窒素原子は、場合により、 $C_1 - C_3$ アルキル基で一置換又は二置換されており；

X は、 N 又は CH であり；

Ar は、フラニル、チアゾリル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピロリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピリダジニル及びキノリニルより選択される、ヘテロアリール環であり；各 m 、 n は、0～2であり；

ここで、各 $R^1 \sim R^4$ は、場合により、部分的又は完全にハロゲン化されている]で示される化合物、又はその薬学的に許容しうる塩。

【請求項2】

R^1 が、場合により、ヒドロキシル及び $C_1 - C_5$ アルコキシより選択される1～2個の置換基で置換されている、 $C_1 - C_5$ アルキルであり；

R^2 が、 $C_1 - C_5$ アルキル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、テトラヒドロピラニル、ピペリジニル又はピペラジニル（各々、場合により、アミノ、ヒドロキシル及び $C_1 - C_5$ アルコキシより選択される1～2個の置換基で独立に置換されている）であり；

R^3 が、結合、 CH_2 、 O 、 NH 、 $-C(O)-$ 、 $-S(O)_m-$ 又は $-SO_2-$ であり；

R^4 が、水素、 $C_1 - C_5$ アルキル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、モ

ルホルニル、チオモルホルニル、1, 1 - ジオキソ - 1⁶ - チオモルホルニル、ピペラジニル、ピペリジニル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピロリル、ピロリジニル又はピリジニル（各々、場合により、C₁ - C₅ アルキル、アシル、ハロゲン、ヒドロキシル、オキソ及び C₁ - C₅ アルコキシより選択される 1 ~ 3 個の置換基で独立に置換されている）であり；

W が、N、O 又は CH であり；

X が、N 又は CH であり；

Ar が、フラニル、チアゾリル、ピラゾリル、イミダゾリル、ピロリル、ピリジニル、ピリミジニル及びピリダジニルより選択される、ヘテロアリアル環である、
請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

R¹ が、C₁ - C₅ アルキルであり；

R² が、C₁ - C₅ アルキル又はシクロヘキシルであり；

R³ が、CH₂ 又は - C (O) - であり；

R⁴ が、水素、モルホルニル、チオモルホルニル、1, 1 - ジオキソ - 1⁶ - チオモルホルニル、ピペラジニル、ピペリジニル、ピラゾリル又はピリジニル（各々、場合により、1 ~ 3 個の置換基 C₁ - C₅ アルキルで独立に置換されている）であり；

W が、N 又は CH であり；

Ar が、フラニルである、

請求項 2 記載の化合物。

【請求項 4】

R¹ が、メチルであり；

R² が、イソプロピル又はシクロヘキシルであり；

R³ が、CH₂ 又は - C (O) - であり；

R⁴ が、水素、モルホルニル又はピリジニル（各々、場合により、1 ~ 3 個のメチル基で置換されている）である、

請求項 3 記載の化合物。

【請求項 5】

X が、CH である、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項記載の化合物。

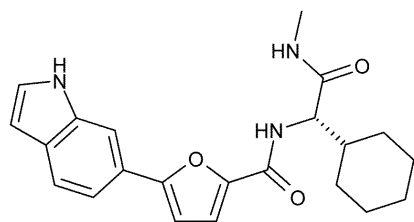
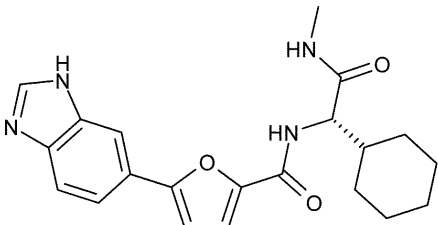
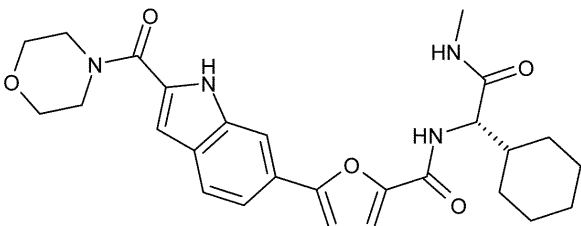
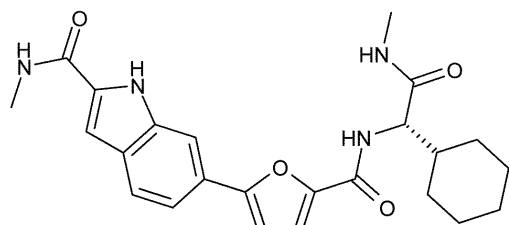
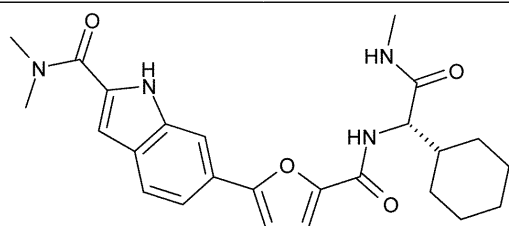
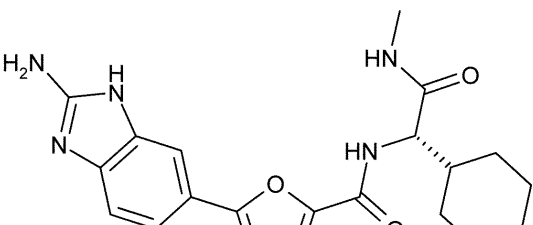
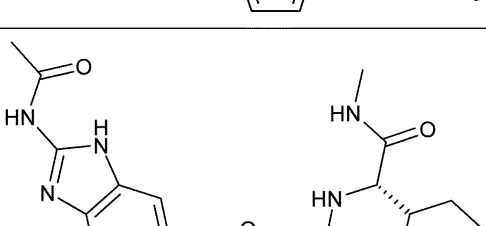
【請求項 6】

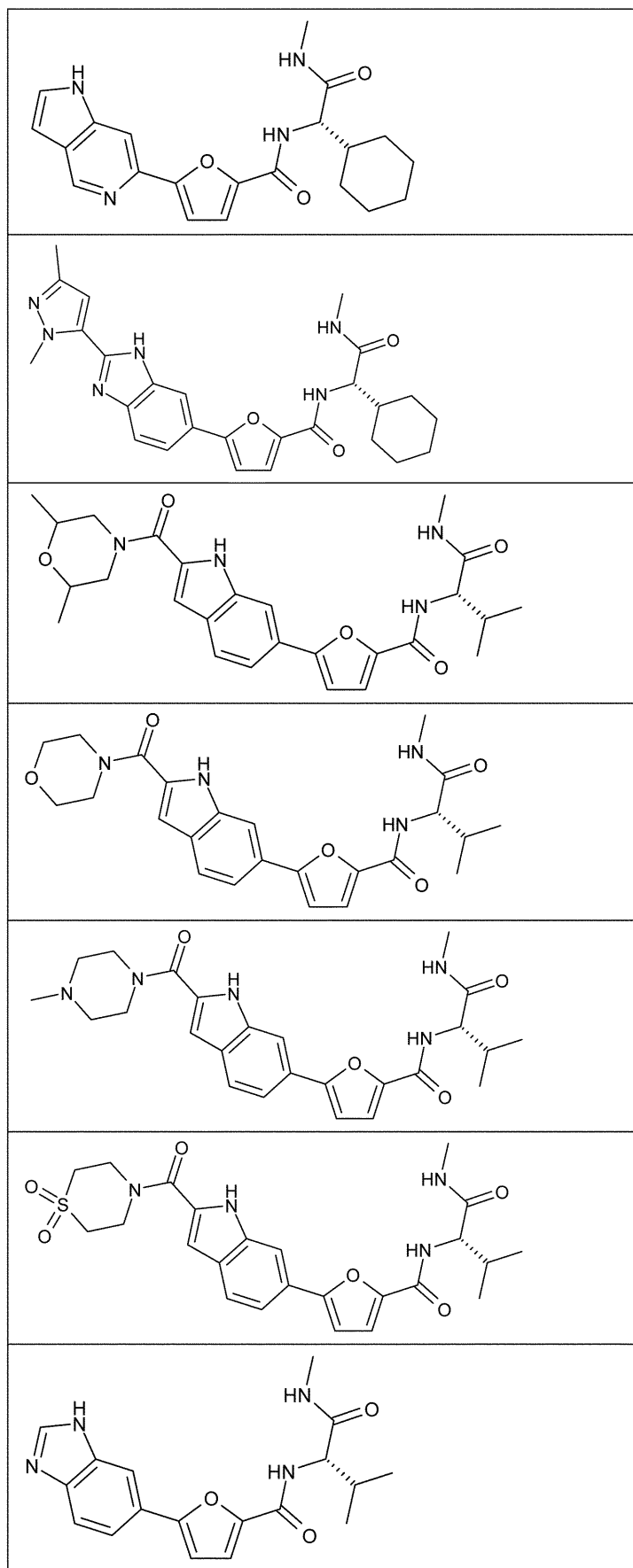
X が、N である、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項記載の化合物。

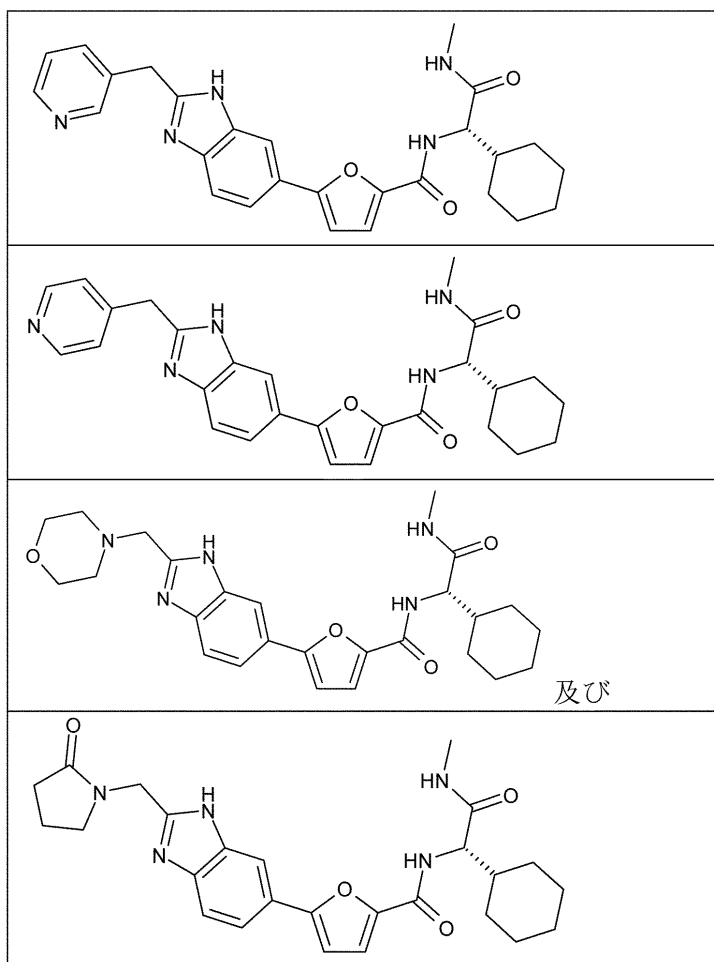
【請求項 7】

下記：

【表 3】





より選択される化合物、又はその薬学的に許容しうる塩。

【請求項 8】

治療有効量の請求項 1 ～ 7 のいずれか一項記載の化合物ならびに 1 つ以上の薬学的に許容しうる担体及び / 又は佐剤を含む、医薬組成物。

【請求項 9】

関節リウマチ、変形性関節症、骨粗鬆症、歯周炎、アテローム性動脈硬化、うっ血性心不全、多発性硬化症及び腫瘍転移より選択される疾患を処置するための、請求項 8 に記載の医薬組成物。