

【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 07 D 405/04	(2006.01)
A 61 K 31/404	(2006.01)
A 61 K 31/4184	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
C 07 D 471/04	(2006.01)
A 61 K 31/437	(2006.01)
C 07 D 405/14	(2006.01)
C 07 D 413/14	(2006.01)
A 61 K 31/496	(2006.01)
A 61 K 31/541	(2006.01)
A 61 K 31/4439	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 19/02	(2006.01)
A 61 P 19/10	(2006.01)
A 61 P 1/02	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 35/04	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 405/04	C S P
A 61 K 31/404	
A 61 K 31/4184	
A 61 K 31/5377	
C 07 D 471/04	1 0 4
A 61 K 31/437	
C 07 D 405/14	
C 07 D 413/14	
A 61 K 31/496	
A 61 K 31/541	
A 61 K 31/4439	
A 61 P 29/00	1 0 1
A 61 P 19/02	
A 61 P 19/10	
A 61 P 1/02	
A 61 P 9/00	
A 61 P 25/00	
A 61 P 35/04	
A 61 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

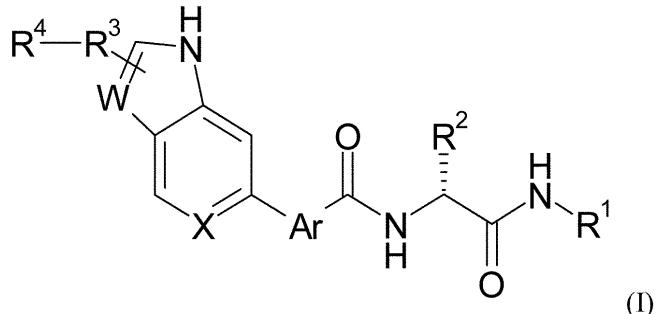
【補正の内容】

【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、C₁ - C₅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、C₁ - C₅アルキルであり；

*R*²は、C₁ - C₅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C₁ - C₅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、-(CH₂)_n、-C(O)-、O、NH又は-S(O)_m-であり；

*R*⁴は、水素、C₁ - C₅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、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*は、N、O又はCHであり、ここで、CHは、場合により、ハロゲン、C₁ - C₅アルキル、C₁ - C₅アルコキシ又は-C(O)-NH₂で置換されており、ここで、該窒素原子は、場合により、C₁ - C₃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~*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C₁ - C₅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、C₁ - C₅アルキルであり；

*R*²が、C₁ - C₅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C₁ - C₅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、CH₂、O、NH、-C(O)-、-S(O)_m-又は-SO₂-であり；

*R*⁴が、水素、C₁ - C₅アルキル、アミノ、アルキルアミノ、ジアルキルアミノ、モ

ルホリニル、チオモルホリニル、1,1-ジオキソ-1⁶-チオモルホリニル、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、ヘテロアリール環である、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、モルホリニル、チオモルホリニル、1,1-ジオキソ-1⁶-チオモルホリニル、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、モルホリ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。

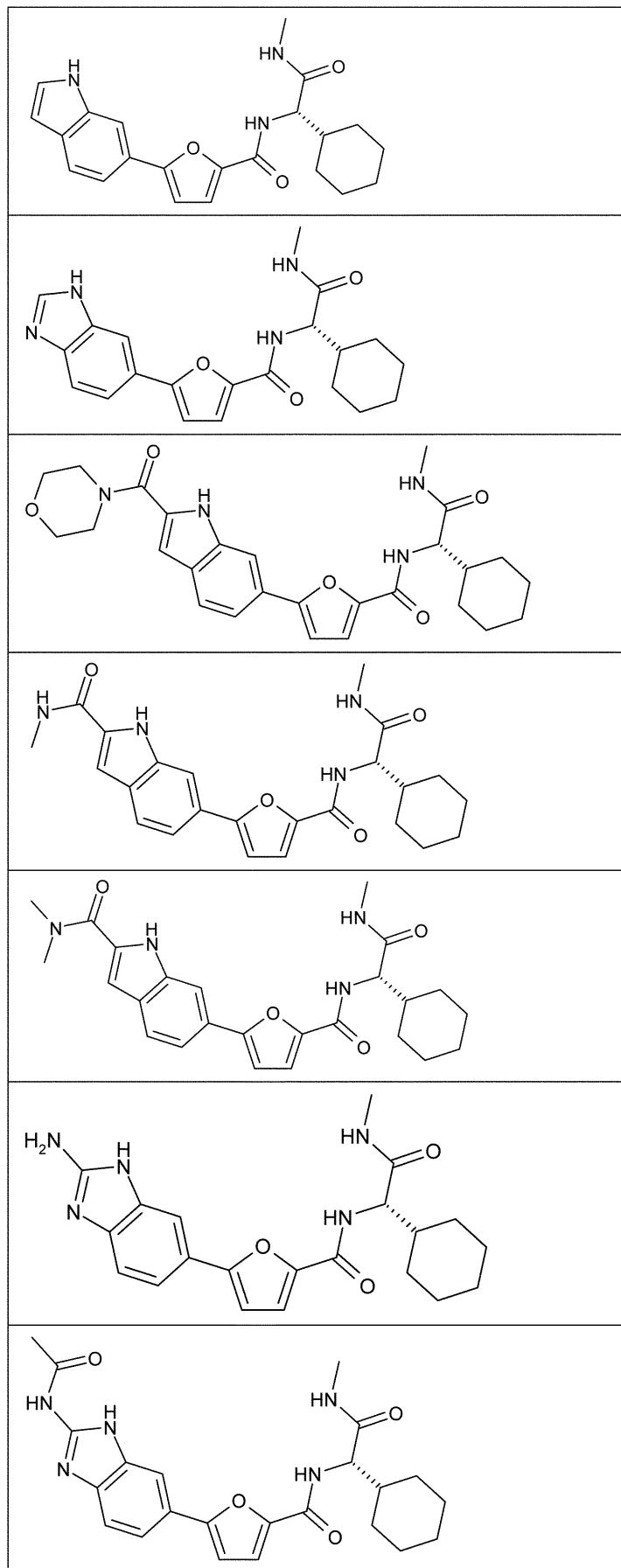
【請求項6】

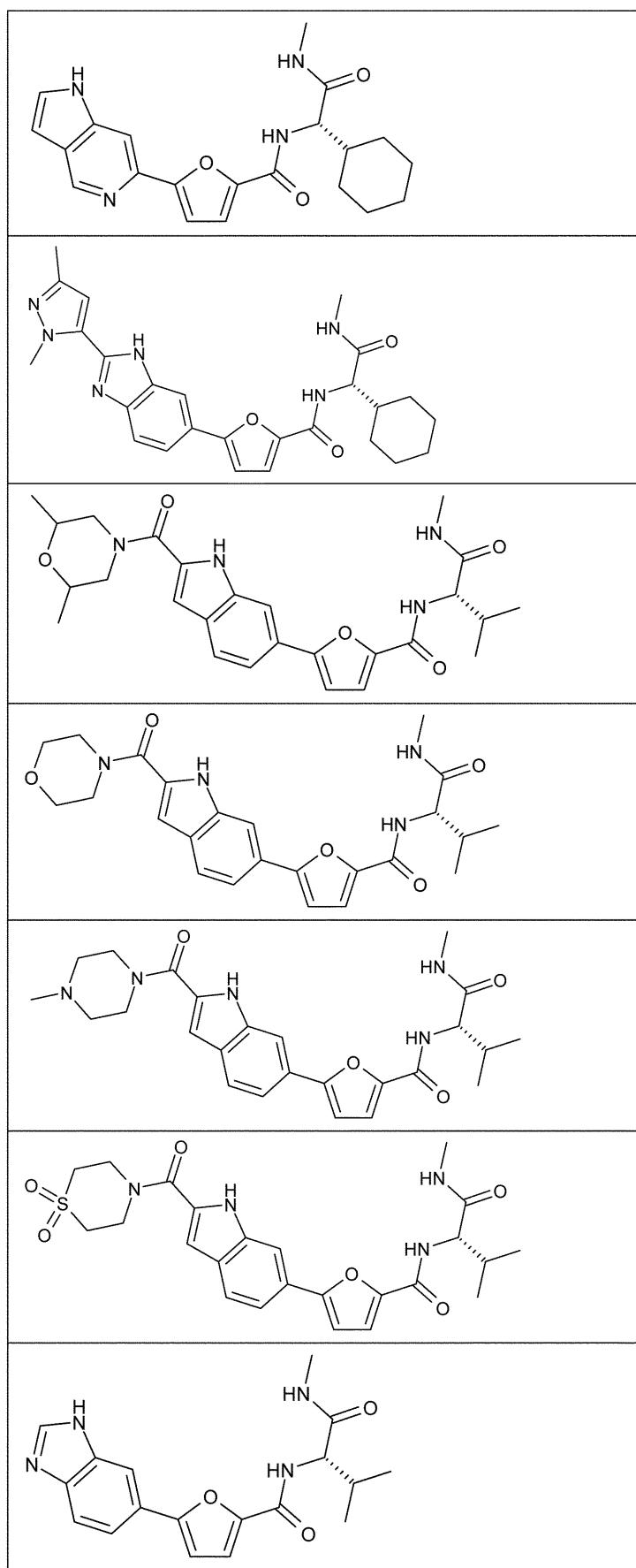
Xが、Nである、請求項1~4のいずれか一項記載の化合物。

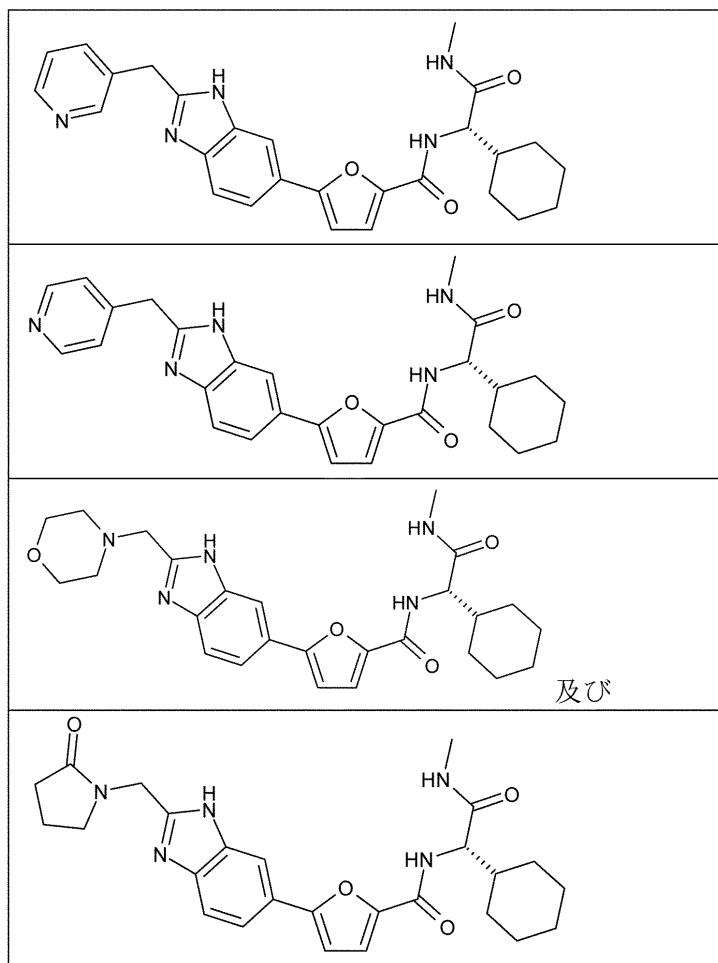
【請求項7】

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、うつ血性心不全、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。