

【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2年11月12日(2020.11.12)

【公表番号】特表2019-532071(P2019-532071A)

【公表日】令和1年11月7日(2019.11.7)

【年通号数】公開・登録公報2019-045

【出願番号】特願2019-520039(P2019-520039)

【国際特許分類】

C 07 J	71/00	(2006.01)
A 61 K	31/58	(2006.01)
A 61 P	5/44	(2006.01)
A 61 P	29/00	(2006.01)
A 61 P	37/02	(2006.01)
A 61 P	11/06	(2006.01)
A 61 P	19/02	(2006.01)
A 61 P	1/04	(2006.01)
A 61 P	1/18	(2006.01)
A 61 P	13/12	(2006.01)
A 61 P	17/10	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)
A 61 P	35/02	(2006.01)
C 12 N	15/12	(2006.01)

【F I】

C 07 J	71/00	C S P
A 61 K	31/58	
A 61 P	5/44	
A 61 P	29/00	
A 61 P	37/02	
A 61 P	11/06	
A 61 P	19/02	
A 61 P	1/04	
A 61 P	1/18	
A 61 P	13/12	
A 61 P	17/10	
A 61 P	35/00	
A 61 P	35/02	
C 12 N	15/12	Z N A

【手続補正書】

【提出日】令和2年9月30日(2020.9.30)

【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

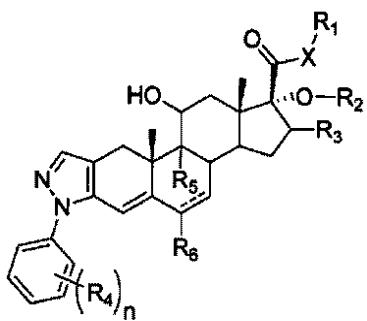
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物

【化36】



またはその薬学的に許容され得る塩であって、式中、
Xは、-O-または-S-であり；

【化37】

は、結合であるか、または存在せず；

R₁は、C₁₋₆アルキル、シクロアルキル、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキルまたはヘテロシクロアルキルから選択され、そのいずれもが、必要に応じて置換されており；

R₂は、-L-R'-であり、Lは、結合または-C(O)-であり、R'は、水素、C₁₋₆アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキルまたはヘテロシクロアルキルから選択され、R'は、必要に応じて置換されており；

R₃は、水素または必要に応じて置換されているC₁₋₆アルキルであり；

各R₄は、独立して、水素、C₁₋₆アルキル、-OH、ハロ、ハロアルキル、-CN、-NO₂、-C(O)(C₁₋₆アルキル)、-NHC(O)(C₁₋₆アルキル)、-OC(O)(C₁₋₆アルキル)、-C(O)NH(C₁₋₆アルキル)、-C(O)O(C₁₋₆アルキル)、-SO₂(C₁₋₆アルキル)または-SO₂NH(C₁₋₆アルキル)から選択され、R₄は、必要に応じて置換されており；

R₅およびR₆の各々は、独立して、水素、ハロまたはC₁₋₄アルキルであり；

nは、0、1、2、3、4または5である、

化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項2】

R₁が、C₁₋₆アルキルまたはシクロアルキルであり、該C₁₋₆アルキルまたはシクロアルキルは、必要に応じて置換されている、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R₁が、C₁₋₆アルキルであり、該C₁₋₆アルキルが、1~3つのハロで必要に応じて置換されている、請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

R₁が、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチルまたはtert-ブチルであり、そのいずれもが、1~3つのハロで必要に応じて置換されている、請求項3に記載の化合物。

【請求項5】

R₁が、フルオロメチルである、請求項4に記載の化合物。

【請求項6】

R₁が、非置換C₁₋₆アルキルである、請求項3に記載の化合物。

【請求項7】

R₁が、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチルまたはtert-

- プチルである、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

R₁ が、エチルである、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

R₁ が、イソプロピルである、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 10】

R₁ が、t e r t - プチルである、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 11】

R₁ が、必要に応じて置換されている 3 ~ 7 員のシクロアルキル、フェニルまたはナフチルであり、そのいずれもが、必要に応じて置換されている、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 12】

L が、- C (O) - であり、R' が、水素、C₁ ~ 6 アルキル、アラルキル、ヘテロアリールまたはヘテロアラルキルから選択され、R' は、ハロ、CN、カルボキシルまたはオキソで必要に応じて置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

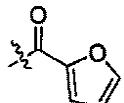
【請求項 13】

R' が、ヘテロアリールである、請求項 12 に記載の化合物。

【請求項 14】

R₂ が、

【化 38】



である、請求項 13 に記載の化合物。

【請求項 15】

R₃ が、必要に応じて置換されている C₁ ~ 6 アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 16】

R₃ が、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、ブチル、イソブチルまたは t e r t - ブチルであり、そのいずれもが、必要に応じて置換されている、請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 17】

R₃ が、水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 18】

各 R₄ が、独立して、水素、C₁ ~ 6 アルキル、- OH、ハロ、- CN、- NO₂、- C (O) (C₁ ~ 6 アルキル)、- NH C (O) (C₁ ~ 6 アルキル)、- OC (O) (C₁ ~ 6 アルキル)、- C (O) NH (C₁ ~ 6 アルキル) または - C (O) O (C₁ ~ 6 アルキル) から選択され、R₄ のアルキル基は、ハロ、- CN、カルボキシルまたはオキソで必要に応じて置換されている、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 19】

各 R₄ が、独立して、水素、C₁ ~ 6 アルキル、ハロ、- CN、- NO₂、- C (O) (C₁ ~ 6 アルキル)、- C (O) NH (C₁ ~ 6 アルキル) または - C (O) O (C₁ ~ 6 アルキル) から選択され、ここで、R₄ のアルキル基は、ハロ、カルボキシルまたはオキソで必要に応じて置換されている、請求項 18 に記載の化合物。

【請求項 20】

各 R₄ が、独立して、水素、C₁ ~ 6 アルキルまたはハロである、請求項 19 に記載の化合物。

【請求項 21】

R₄ が、水素である、請求項 20 に記載の化合物。

【請求項 2 2】

R_4 が、水素であり、 R_1 が、 $C_{1\sim 6}$ アルキルまたはハロアルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 3】

n が、0、1 または 2 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 4】

n が、0 である、請求項 2 3 に記載の化合物。

【請求項 2 5】

X が、-O- である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 6】

X が、-S- である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 7】**【化 3 9】**

が、結合である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 8】**【化 4 0】**

が、存在しない、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 2 9】

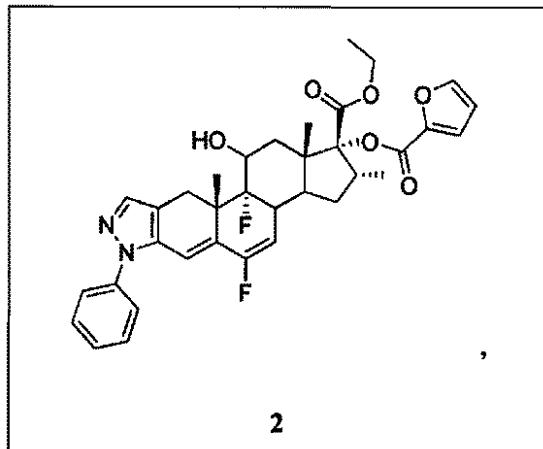
R_5 および R_6 が、各々独立して、水素またはハロである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3 0】

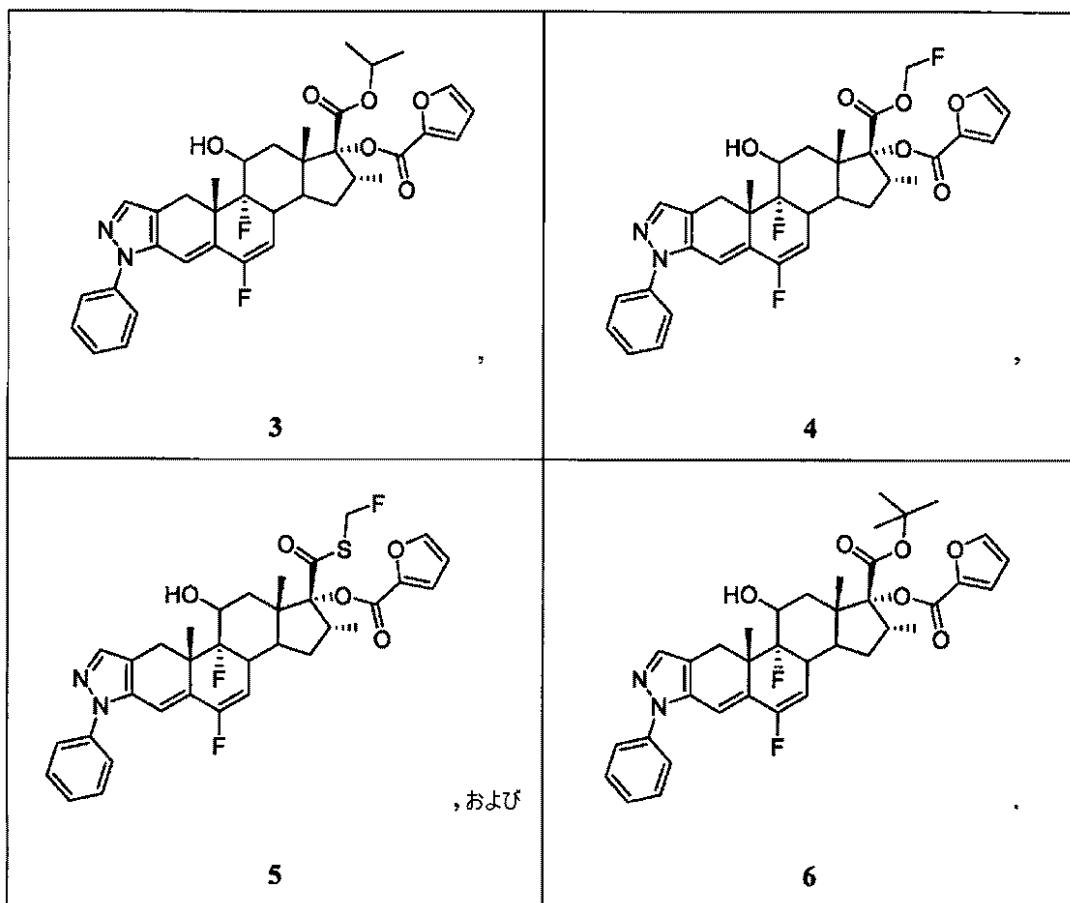
R_5 および R_6 が、両方とも -F である、請求項 2 9 に記載の化合物。

【請求項 3 1】

前記式 I の化合物が、

【化 4 1】

【化42】

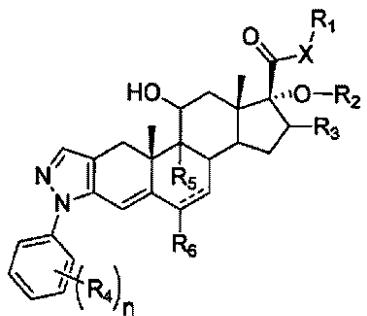


から選択される、請求項1に記載の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

【請求項32】

式Iの化合物

【化43】



I

またはその薬学的に許容され得る塩であつて、式中、

Xは、-O-または-S-であり；

【化44】

は、結合であるか、または存在せず；

R₁は、C₁₋₆アルキル、シクロアルキル、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキルまたはヘテロシクロアルキルから選択され、そのいずれもが、必要に応じて置換されており；

R₂は、-L-R'であり、Lは、結合または-C(O)-であり、R'は、水素、C₁₋₆アルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アラルキル、ヘテロアラルキルまたはヘテロシクロアルキルから選択され、R'は、必要に応じて置換されており；

R₃は、水素または必要に応じて置換されているC₁₋₆アルキルであり；

各R₄は、独立して、水素、C₁₋₆アルキル、-OH、ハロ、ハロアルキル、-CN、-NO₂、-C(O)(C₁₋₆アルキル)、-NHC(O)(C₁₋₆アルキル)、-OC(O)(C₁₋₆アルキル)、-C(O)NH(C₁₋₆アルキル)、-C(O)O(C₁₋₆アルキル)、-SO₂(C₁₋₆アルキル)または-SO₂NH(C₁₋₆アルキル)から選択され、R₄は、必要に応じて置換されており；

R₅およびR₆の各々は、独立して、水素、ハロまたはC₁₋₄アルキルであり；

nは、0、1、2、3、4または5である、

化合物またはその薬学的に許容され得る塩、

および薬学的に許容され得るキャリアまたはアジュバント

を含む、薬学的組成物。

【請求項33】

生物学的サンプル中の糖質コルチコイドレセプターの活性を調節する方法であって、該糖質コルチコイドレセプターを請求項1に記載の化合物または請求項32に記載の薬学的組成物と接触させる工程を含む、方法。

【請求項34】

患者において炎症性疾患を処置するかまたはその重症度を低下させるための、請求項1に記載の化合物を含む組成物または請求項32に記載の薬学的組成物。

【請求項35】

前記疾患が、喘息、関節炎、狼瘡、クローン病、炎症性腸疾患、セリック病、糸球体腎炎、尋常性ざ瘡、白血病および膵がんから選択される、請求項34に記載の組成物または薬学的組成物。

【請求項36】

前記疾患が、喘息および関節炎から選択される、請求項35に記載の組成物または薬学的組成物。