

【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21年12月17日 (2009.12.17)

【公表番号】特表2009-519218(P2009-519218A)

【公表日】平成21年5月14日 (2009.5.14)

【年通号数】公開・登録公報2009-019

【出願番号】特願2008-540093(P2008-540093)

【国際特許分類】

C 0 7 D 409/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

C 0 7 D 409/14 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/04 (2006.01)

A 6 1 P 7/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 409/04 C S P

A 6 1 K 31/506

C 0 7 D 409/14

C 0 7 D 417/14

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 3/00

A 6 1 P 31/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 3/04

A 6 1 P 7/00

A 6 1 P 9/00

【手続補正書】

【提出日】平成21年10月30日 (2009.10.30)

【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

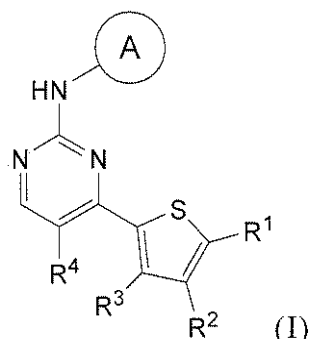
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式：

【化1】



で示される化合物：

[式中、

Aは R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアリールまたは R^{19} -置換もしくは非置換アリールであり；

R^1 はフッ素、臭素、 $-(CH_2)_nNR^6R^7$ 、 $-(CH_2)_nC(O)NR^{14}R^{15}$ 、 $-(CH_2)_nC(O)R^8$ 、 $-S(O)_wR^9$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、 R^{19} -置換もしくは非置換アルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換シクロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換アリールまたは R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、ここに、 n は0～5の整数であり、 w は0～2の整数であり；

R^2 は水素またはハロゲンであり；

R^3 は水素またはハロゲンであり；

R^4 は水素またはハロゲンであり；

R^6 および R^7 は独立して水素、 $-C(O)R^{10}$ 、 $-S(O)_2R^{11}$ 、 $-C(NH)R^{10}$ 、 R^{19} -置換もしくは非置換アルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換シクロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換アリール、 R^{19} -置換もしくは非置換アリールアルキルまたは R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；

R^{10} は水素、 $-NR^{12}R^{13}$ 、 $-OR^{16}$ 、 R^{19} -置換もしくは非置換アルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換シクロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換アリールまたは R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；

R^{11} は $-NR^{12}R^{13}$ 、 R^{19} -置換もしくは非置換アルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換シクロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換アリールまたは R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；

R^{12} および R^{13} は独立して水素、 R^{19} -置換もしくは非置換アルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換シクロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換アリールまたは R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；

R^8 は独立して水素、 $-OR^{16}$ 、 R^{19} -置換もしくは非置換アルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換シクロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換アリールまたは R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；

テロアリールであり；

R^{16} は水素、 R^{19} -置換もしくは非置換アルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換シクロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換アリール、 R^{19} -置換もしくは非置換アリールアルキルまたは R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；

R^{14} および R^{15} は独立して水素、 R^{19} -置換もしくは非置換アルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換シクロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換アリール、 R^{19} -置換もしくは非置換アリールアルキルまたは R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；

R^9 は独立して水素、 R^{19} -置換もしくは非置換アルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換シクロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換アリールまたは R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、ここに、 w が2である場合、 R^9 は適宜-NR¹⁷R¹⁸であってもよく；

R^{17} および R^{18} は独立して水素、 R^{19} -置換もしくは非置換アルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換シクロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換アリールまたは R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

ここに、 R^6 と R^7 、 R^6 と R^{10} 、 R^{12} と R^{13} 、 R^{14} と R^{15} 、および R^{17} と R^{18} は独立して適宜それらが結合している窒素と一緒にあって、 R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキルまたは R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよく、

R^{19} は独立してハロゲン、 $-L^1-C(X^2)R^{22}$ 、 $-L^1-OR^{23}$ 、 $-L^1-NR^{24}R^{25}$ 、 $-L^1-S(O)_mR^{26}$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-CF_3$ 、

- (1) 非置換 C_3-C_7 シクロアルキル；
- (2) 非置換3～7員ヘテロシクロアルキル；
- (3) 非置換ヘテロアリール；
- (4) 非置換アリール；
- (5) 置換 C_3-C_7 シクロアルキル；
- (6) 置換3～7員ヘテロシクロアルキル；
- (7) 置換アリール；
- (8) 置換ヘテロアリール；
- (9) 非置換 C_1-C_{20} アルキル；
- (10) 非置換2～20員ヘテロアルキル；
- (11) 置換 C_1-C_{20} アルキル；または
- (12) 置換2～20員ヘテロアルキルであり、

ここに、(5)、(6)、(11)および(12)は独立してオキソ、 $-OH$ 、 $-CF_3$ 、 $-COOH$ 、シアノ、ハロゲン、 R^{20} -置換もしくは非置換 C_1-C_{10} アルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換2～10員ヘテロアルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換 C_3-C_7 シクロアルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換3～7員ヘテロシクロアルキル、 R^{21} -置換もしくは非置換アリール、 R^{21} -置換もしくは非置換ヘテロアリール、 $-L^1-C(X^2)R^{22}$ 、 $-L^1-OR^{23}$ 、 $-L^1-NR^{24}R^{25}$ または $-L^1-S(O)_mR^{26}$ で置換されており、

(7)および(8)は独立して $-OH$ 、 $-CF_3$ 、 $-COOH$ 、シアノ、ハロゲン、 R^{20} -置換もしくは非置換 C_1-C_{10} アルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換2～10員ヘテロアルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換 C_3-C_7 シクロアルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換3～7員ヘテロシクロアルキル、 R^{21} -置換もしくは非置換アリール、 R^{21} -置換もしくは非置換ヘテロアリール、 $-L^1-C(X^2)R^{22}$ 、 $-L^1-OR^{23}$ 、 $-L^1-NR^{24}R^{25}$ または $-L^1-S(O)_mR^{26}$ で置換されており、

ここに、(a) X^2 は独立して $=S$ 、 $=O$ または $=NR^{27}$ であり、ここに、 R^{27} は H 、 $-OR^{28}$ 、 R^{20} -置換もしくは非置換 C_1-C_{10} アルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換2～10員ヘテロアルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換 C_3-C_7 シクロアルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換3～7員ヘテロシクロアルキル、 R^{21} -置換もしくは非置換アリールまたは R^{21} -置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

ここに、 R^{28} は水素または R^{20} -置換もしくは非置換 C_1 - C_{10} アルキルであり、

(b) m は独立して0~2の整数であり；

(c) R^{22} は独立して水素、 R^{20} -置換もしくは非置換 C_1 - C_{10} アルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換2~10員ヘテロアルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換 C_3 - C_7 シクロアルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換3~7員ヘテロシクロアルキル、 R^{21} -置換もしくは非置換アリール、 R^{21} -置換もしくは非置換ヘテロアリール、 $-OR^{29}$ または $-NR^{30}R^{31}$ であり、

ここに、 R^{29} 、 R^{30} および R^{31} は独立して水素、 R^{20} -置換もしくは非置換 C_1 - C_{10} アルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換2~10員ヘテロアルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換 C_3 - C_7 シクロアルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換3~7員ヘテロシクロアルキル、 R^{21} -置換もしくは非置換アリールまたは R^{21} -置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、

ここに、 R^{30} および R^{31} は適宜それらが結合している窒素と一緒にあって、 R^{20} -置換もしくは非置換3~7員ヘテロシクロアルキルまたは R^{21} -置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよく；

(d) R^{23} 、 R^{24} および R^{25} は独立して水素、 $-CF_3$ 、 R^{20} -置換もしくは非置換 C_1 - C_{10} アルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換2~10員ヘテロアルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換 C_3 - C_7 シクロアルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換3~7員ヘテロシクロアルキル、 R^{21} -置換もしくは非置換アリール、 R^{21} -置換もしくは非置換ヘテロアリール、 $-C(X^3)R^{32}$ または $-S(O)_qR^{32}$ であり、ここに、 R^{24} および R^{25} は適宜それらが結合している窒素と一緒にあって、 R^{20} -置換もしくは非置換3~7員ヘテロシクロアルキルまたは R^{21} -置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよく、

ここに、(i) X^3 は独立して $=S$ 、 $=O$ または $=NR^{33}$ であり、ここに、 R^{33} は R^{20} -置換もしくは非置換 C_1 - C_{10} アルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換2~10員ヘテロアルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換 C_3 - C_7 シクロアルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換3~7員ヘテロシクロアルキル、 R^{21} -置換もしくは非置換アリールまたは R^{21} -置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；

(ii) q は独立して0~2の整数であり；

(iii) R^{32} は独立して水素、 R^{20} -置換もしくは非置換 C_1 - C_{10} アルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換2~10員ヘテロアルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換 C_3 - C_7 シクロアルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換3~7員ヘテロシクロアルキル、 R^{21} -置換もしくは非置換アリール、 R^{21} -置換もしくは非置換ヘテロアリールまたは $-NR^{34}R^{35}$ であり、

ここに、 R^{34} および R^{35} は独立して水素、 R^{20} -置換もしくは非置換 C_1 - C_{10} アルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換2~10員ヘテロアルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換 C_3 - C_7 シクロアルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換3~7員ヘテロシクロアルキル、 R^{21} -置換もしくは非置換アリールまたは R^{21} -置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、ここに、 R^{34} および R^{35} は適宜それらが結合している窒素と一緒にあって、 R^{20} -置換もしくは非置換3~7員ヘテロシクロアルキルまたは R^{21} -置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよく；

(e) R^{26} は独立して水素、 R^{20} -置換もしくは非置換 C_1 - C_{10} アルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換2~10員ヘテロアルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換 C_3 - C_7 シクロアルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換3~7員ヘテロシクロアルキル、 R^{21} -置換もしくは非置換アリール、 R^{21} -置換もしくは非置換ヘテロアリールまたは $-NR^{36}R^{37}$ であり、

ここに、(i) R^{36} および R^{37} は独立して水素、 R^{20} -置換もしくは非置換 C_1 - C_{10} アルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換2~10員ヘテロアルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換 C_3 - C_7 シクロアルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換3~7員 R^{21} -置換もしくは非置換ヘテロアリールであり、ここに、 R^{36} および R^{37} は適宜それらが結合している窒素と一緒にあって、 R^{20} -置換もしくは非置換3~7員ヘテロシクロアルキルまたは R^{21} -置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよく；

(f) L^1 は独立して結合、非置換 C_1 - C_{10} アルキレンまたは非置換ヘテロアルキレンであり；

(g) R^{20} は独立してオキソ、 $-OH$ 、 $-COOH$ 、 $-CF_3$ 、 $-OCF_3$ 、 $-CN$ 、アミノ、ハロゲン、 R^{38} -置換もしくは非置換2~10員アルキル、 R^{38} -置換もしくは非置換2~10員ヘテロアルキル、

R^{38} -置換もしくは非置換 C_3 - C_7 シクロアルキル、 R^{38} -置換もしくは非置換3~7員ヘテロシクロアルキル、 R^{39} -置換もしくは非置換アリールまたは R^{39} -置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；

(h) R^{21} は独立して-OH、-COOH、アミノ、ハロゲン、-CF₃、-OCF₃、-CN、 R^{38} -置換もしくは非置換2~10員アルキル、 R^{38} -置換もしくは非置換2~10員ヘテロアルキル、 R^{38} -置換もしくは非置換 C_3 - C_7 シクロアルキル、 R^{38} -置換もしくは非置換3~7員ヘテロシクロアルキル、 R^{39} -置換もしくは非置換アリールまたは R^{39} -置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；

(i) R^{38} は独立してオキソ、-OH、-COOH、アミノ、ハロゲン、-CF₃、-OCF₃、-CN、非置換 C_1 - C_{10} アルキル、非置換2~10員ヘテロアルキル、非置換 C_3 - C_7 シクロアルキル、非置換3~7員ヘテロシクロアルキル、非置換アリール、非置換ヘテロアリールであり；

(j) R^{39} は独立して-OH、-COOH、アミノ、ハロゲン、-CF₃、-OCF₃、-CN、非置換 C_1 - C_{10} アルキル、非置換2~10員ヘテロアルキル、非置換 C_3 - C_7 シクロアルキル、非置換3~7員ヘテロシクロアルキル、非置換アリール、非置換ヘテロアリールである

但し、 R^1 が-C(O)NHR¹⁵である場合、Aは(C_1 - C_5)アルキル-ヒドロキシ置換フェニルである]。

【請求項 2】

Aが R^{19} -置換もしくは非置換フェニルである、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

A中 R^{19} がハロゲン、 R^{20} -置換もしくは非置換 C_1 - C_{20} アルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換 C_1 - C_{20} ヘテロアルキル、 $-L^1-C(X^2)R^{22}$ 、 $-L^1-OR^{23}$ 、 $-L^1-NR^{24}R^{25}$ 、 $-L^1-S(O)_mR^{26}$ 、-CNまたは-NO₂である、請求項 2 記載の化合物。

【請求項 4】

A中 L^1 が結合であり；A中 R^{23} が水素または非置換(C_1 - C_5)アルキルであり；A中 X^2 が=Oであり；A中 R^{22} が R^{20} -置換もしくは非置換 C_1 - C_{10} アルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換2~10員ヘテロアルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換3~7員ヘテロシクロアルキル、 $-OR^{29}$ または $-NR^{30}R^{31}$ であり；A中mが2であり、A中 R^{26} が R^{20} -置換もしくは非置換 C_1 - C_{10} アルキル、 R^{20} -置換もしくは非置換2~10員ヘテロアルキルである、請求項 3 記載の化合物。

【請求項 5】

A中 R^{20} が $-L^1-OR^{23}$ 、 $-L^1-NR^{24}R^{25}$ 、非置換ヘテロシクロアルキル、 R^{38} -置換もしくは非置換ピペリジニルまたは R^{38} -置換もしくは非置換モルホリノである、請求項 4 記載の化合物。

【請求項 6】

A中 L^1 が結合であり；A中 R^{23} が水素、非置換 C_1 - C_5 アルキルまたは非置換2~5員ヘテロアルキルであり；A中 R^{24} が水素であり、Aに結合している R^{25} が R^{20} -置換もしくは非置換 C_1 - C_5 アルキルまたは R^{20} -置換もしくは非置換2~5員ヘテロアルキルである、請求項 5 記載の化合物。

【請求項 7】

R^1 が臭素、 $-NR^6R^7$ 、 $-S(O)_wR^9$ 、 R^{19} -置換もしくは非置換(C_1 - C_{10})アルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換2~10員ヘテロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換(C_3 - C_7)シクロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換3~7員ヘテロシクロアルキル、 R^{19} -置換もしくは非置換アリールまたは R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアリールである、請求項 1 ~ 6 のいずれか記載の化合物。

【請求項 8】

R^1 が-C(O)NR¹⁴R¹⁵である（ここに、 R^1 中、 R^{14} および R^{15} は独立して水素、 R^{19} -置換もしくは非置換アルキルまたは R^{19} -置換もしくは非置換アリールであり、 R^{19} は置換もしくは非置換2~10員アルキルであるか、または R^{14} および R^{15} は適宜それらが結合している窒素と一緒にあって R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキルまたは R^{19} -置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成してもよい）、請求項 1 ~ 7 のいずれか記載の化合物。

【請求項 9】

R¹がR¹⁹-置換もしくは非置換フェニル、R¹⁹-置換もしくは非置換ピリジニル、R¹⁹-置換もしくは非置換ピリミジニル、R¹⁹-置換もしくは非置換ベンゾチオフェニルであり、R¹中R¹⁹がハロゲン、-L¹-C(X²)R²²、-L¹-OR²³、-L¹-NR²⁴R²⁵、置換もしくは非置換C₁-C₂₀アルキルまたは置換もしくは非置換アリールである、請求項1～7のいずれか記載の化合物。

【請求項10】

R¹中R¹⁹が-C(O)R²²であり、R¹中R²²が-NR³⁰R³¹であり、R¹中R³⁰およびR³¹が独立して水素、R²⁰-置換もしくは非置換アルキル、R²⁰-置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキルまたはR²¹-置換もしくは非置換アリールである、請求項9記載の化合物。

【請求項11】

R¹中R¹⁹が-L¹-OR²³であり、R¹中L¹が結合または非置換C₁-C₁₀アルキレンであり、R¹中R²³がR²⁰-置換もしくは非置換アルキルまたはR²¹-置換もしくは非置換アリールであるか、あるいはR¹中R¹⁹が-L¹-NR²⁴R²⁵であり、R¹中L¹が結合であり、R¹中R²⁴およびR²⁵が独立して水素またはR²⁰-置換もしくは非置換アルキルである、請求項9記載の化合物。

【請求項12】

R¹が-NR⁶R⁷であり、R¹中R⁶が水素または非置換C₁-C₅アルキルであり、R¹中R⁷が-C(O)R¹⁰であり、R⁶およびR¹⁰がそれらが結合している窒素と一緒にあってR¹⁹-置換もしくは非置換ヘテロシクロアルキルまたはR¹⁹-置換もしくは非置換ヘテロアリールを形成し、R¹中R¹⁰が-OR¹⁶、R¹⁹-置換もしくは非置換アルキルまたはR¹⁹-置換もしくは非置換アリールである、請求項1～7のいずれか記載の化合物。

【請求項13】

R¹が-S(O)_wR⁹である、請求項1～7のいずれか記載の化合物。

【請求項14】

R¹のwが2であり、R¹中R⁹が-NR¹⁷R¹⁸であり、R¹中R¹⁷およびR¹⁸が独立してR¹⁹-置換もしくは非置換アルキル、R¹⁹置換もしくは非置換ヘテロアルキルであるか、またはR¹⁷およびR¹⁸がそれらが結合している窒素と一緒にあって、R¹⁹-置換もしくは非置換ピペリジニルまたはR¹⁹-置換もしくは非置換ピペラジニルを形成する、請求項13記載の化合物。

【請求項15】

以下の式で示される、請求項1記載の化合物：

【化 2】

