

【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 27 年 2 月 19 日 (2015.2.19)

【公表番号】特表 2014-501266 (P2014-501266A)

【公表日】平成 26 年 1 月 20 日 (2014.1.20)

【年通号数】公開・登録公報 2014-003

【出願番号】特願 2013-546672 (P2013-546672)

【国際特許分類】

C 07D 305/08 (2006.01)

C 07D 405/12 (2006.01)

C 07D 413/12 (2006.01)

C 07D 413/14 (2006.01)

C 07D 417/14 (2006.01)

A 61K 31/4439 (2006.01)

A 61K 31/506 (2006.01)

A 61K 31/337 (2006.01)

A 61K 31/42 (2006.01)

A 61K 31/41 (2006.01)

A 61K 31/4245 (2006.01)

A 61K 31/501 (2006.01)

A 61K 31/444 (2006.01)

A 61P 13/12 (2006.01)

【F I】

C 07D 305/08 C S P

C 07D 405/12

C 07D 413/12

C 07D 413/14

C 07D 417/14

A 61K 31/4439

A 61K 31/506

A 61K 31/337

A 61K 31/42

A 61K 31/41

A 61K 31/4245

A 61K 31/501

A 61K 31/444

A 61P 13/12

【手続補正書】

【提出日】平成 26 年 12 月 19 日 (2014.12.19)

【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

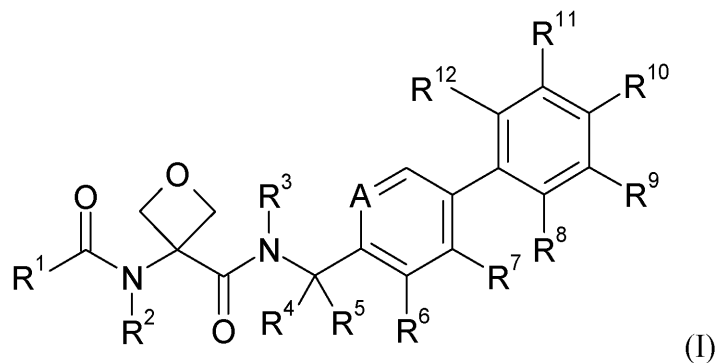
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 9 1】



(式中、

R^1 は、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルコキシアリル、シクロアルコキシアリル、ハロアルキル、ハロアルコキシアリル、ハロシクロアルキル、ハロシクロアルキルアルキル、ハロシクロアルコキシアリル、アリール、置換アリール、ヘテロアリール又は置換ヘテロアリールであり、前記置換アリール及び前記置換ヘテロアリールは、独立して、アルキル、シクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、シクロアルキルアルコキシアリル、シクロアルコキシ、シクロアルコキシアリル、アルキルシクロアルキルアルキル、ハロシクロアルキル、ハロシクロアルキルアルキル、ハロゲン、ハロアルキル、ヒドロキシ、ヒドロキシアリル、アルコキシ、アルコキシアリル、ハロアルコキシ、ヒドロキシアリル、アルコキシアリル、アルコキシアリル、ヒドロキシハロアルキル、アミノ及び置換アミノから選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されており、前記置換アミノは、独立して、アルキル、シクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルキルシクロアルキルアルキル、ヒドロキシアリル及びアルコキシアリルから選択される 1 ~ 2 個の置換基で置換されており；

R^2 は、水素、アルキル又はシクロアルキルであり；

R^3 は、水素、アルキル又はシクロアルキルであり；

R^4 は、水素、アルキル又はシクロアルキルであり；

R^5 は、水素、アルキル又はシクロアルキルであるか；

あるいは、 R^4 及び R^5 は、これらが結合している炭素と共にシクロアルキルを形成し；

R^6 は、水素、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、ハロゲン又はシアノであり；

R^7 は、水素、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、ハロゲン又はシアノであり；

R^8 は、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルコキシ、アルコキシアリル、シクロアルコキシ、シクロアルコキシアリル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルコキシアリル、ハロシクロアルキル、ハロシクロアルキルアルキル、ハロシクロアルコキシ、ハロシクロアルコキシアリル、アルコキシカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、ハロアルコキシカルボニル、ハロシクロアルコキシカルボニル、アリール、置換アリール、ヘテロアリール又は置換ヘテロアリールであり、前記置換アリール及び前記置換ヘテロアリールは、独立して、アルキル、シクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、シクロアルキルアルコキシアリル、シクロアルコキシ、シクロアルコキシアリル、アルキルシクロアルキルアルキル、ハロシクロアルキル、ハロシクロアルキルアルキル、ハロゲン、ハロアルキル、アルコキシ、アルコキシアリル、ハロアルコキシ、アルコキシアリル、アルコキシアリル、アルコキシアリル、アミノ及び置換アミノから選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されており、前記置換アミノは、独立して、アルキル、シクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルキルシクロアルキルアルキル、ヒドロキシアリル及びアルコキシアリルから選択される 1 ~ 2 個の置換基で置換されており；

R⁹ は、水素、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、ハロゲン又はシアノであり；
R¹⁰ は、水素、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、ハロゲン又はシアノであり；
R¹¹ は、水素、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、ハロゲン又はシアノであり；
R¹² は、水素、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、ハロゲン又はシアノであり；
R¹³ は、水素、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、ハロゲン又はシアノであり；

A は、C R¹³ 又は N である)

で表される化合物、又はその薬学的に許容しうる塩。

【請求項 2】

R¹ が、アルコキシアルキル、シクロアルコキシアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシアルキル、ハロシクロアルキル、ハロシクロアルキルアルキル、ハロシクロアルコキシアルキル、アリール、置換アリール、ヘテロアリール又は置換ヘテロアリールであり、前記置換アリール及び前記置換ヘテロアリールが、独立して、アルキル、シクロアルキル、ハロゲン、ハロアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、アミノ、及び置換アミノから選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されており、前記置換アミノが、独立して、アルキル及びシクロアルキルから選択される 1 ~ 2 個の置換基で置換されている請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R¹ が、アルコキシアルキル、ハロアルキル、置換フェニル、ヘテロアリール又は置換ヘテロアリールであり、前記置換フェニル及び置換ヘテロアリールが、独立して、アルキル、ハロゲン、ハロアルキル、アルコキシ、及びアミノから選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されている請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R¹ が、アルコキシアルキル、ハロアルキル、イミダゾリル、イソキサゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニルであるか、又は、独立してアルキル、ハロゲン、ハロアルキル、アルコキシ及びアミノから選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されている、フェニル、イミダゾリル、イソキサゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリジニル、ピリダジニル、ピリミジニルから選択される請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5】

R¹ が、アルコキシアルキル、ハロアルキル、イソキサゾリル、ピリダジニル、ピリミジニル、ハロ - ハロアルキルフェニル、アルキルイミダゾリル、アルキルイソキサゾリル、アルコキシイソキサゾリル、アルキルオキサジアゾリル、アルキルチアジアゾリル、アミノピリジニル及びアルコキシピリミジニルである請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

R⁸ が、ハロアルコキシ、アルコシカルボニル、シクロアルコシカルボニル、ハロアルコシカルボニル、ヘテロアリール又は置換ヘテロアリールであり、前記置換ヘテロアリールが 1 ~ 3 個のアルキルで置換されている請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

R⁸ が、ハロアルコキシ、アルコシカルボニル、又は置換ヘテロアリールであり、前記置換ヘテロアリールが 1 ~ 3 個のアルキルで置換されている請求項 1 ~ 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 8】

R⁸ が、ハロアルコキシ、アルコシカルボニル、アルキルテトラゾリル、又はアルキルオキサジアゾリルである請求項 1 ~ 7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9】

R⁴ 及び R⁵ のうちの一方が水素であり、他方がアルキルである請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 10】

R⁴ 及び R⁵ が、これらが結合している炭素と共にシクロアルキルを形成する請求項 1 ~ 8 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 11】

A が C R^{1 3} 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】

A が N 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】

3 - (3 - フルオロ - 5 - トリフルオロメチル - ベンゾイルアミノ) - オキセタン - 3 - カルボン酸 ((R) - 1 - { 5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (5 - メチル - [1 , 2 , 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチル) - アミド ;

3 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - アセチルアミノ) - オキセタン - 3 - カルボン酸 ((R) - 1 - { 5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (5 - メチル - [1 , 2 , 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチル) - アミド ;

イソオキサゾール - 5 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - { 5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (5 - メチル - [1 , 2 , 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド ;

3 - メチル - イソオキサゾール - 5 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - { 5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (5 - メチル - [1 , 2 , 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド ;

ピリミジン - 5 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - { 5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (5 - メチル - [1 , 2 , 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド ;

3 - クロロ - 3 ' - フルオロ - 4 ' - ((R) - 1 - { [3 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - アセチルアミノ) - オキセタン - 3 - カルボニル] - アミノ } - エチル) - ビフェニル - 2 - カルボン酸メチルエステル ;

3 - クロロ - 3 ' - フルオロ - 4 ' - [(R) - 1 - ({ 3 - [(ピリミジン - 5 - カルボニル) - アミノ] - オキセタン - 3 - カルボニル } - アミノ) - エチル] - ビフェニル - 2 - カルボン酸メチルエステル ;

3 - クロロ - 3 ' - フルオロ - 4 ' - ((R) - 1 - { [3 - (3 , 3 , 3 - トリフルオロ - プロピオニルアミノ) - オキセタン - 3 - カルボニル] - アミノ } - エチル) - ビフェニル - 2 - カルボン酸メチルエステル ;

3 - メチル - イソオキサゾール - 5 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - { 5 - [3 , 5 - ジクロロ - 2 - (2 , 2 - ジフルオロ - エトキシ) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド ;

イソオキサゾール - 5 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - { 5 - [3 , 5 - ジクロロ - 2 - (2 , 2 - ジフルオロ - エトキシ) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド ;

ピリミジン - 5 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - { 5 - [3 , 5 - ジクロロ - 2 - (2 , 2 - ジフルオロ - エトキシ) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド ;

3 - クロロ - 3 ' - フルオロ - 4 ' - [(R) - 1 - ({ 3 - [(イソオキサゾール -

5 - カルボニル) - アミノ] - オキセタン - 3 - カルボニル} - アミノ) - エチル] - ビフェニル - 2 - カルボン酸メチルエステル;

3 - クロロ - 3' - フルオロ - 4' - [(R) - 1 - {3 - [(3 - メチル - イソオキサゾール - 5 - カルボニル) - アミノ] - オキセタン - 3 - カルボニル} - アミノ) - エチル] - ビフェニル - 2 - カルボン酸メチルエステル;

3 - メトキシ - イソオキサゾール - 5 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - {5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (5 - メチル - [1, 2, 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル} - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド;

2 - メトキシ - ピリミジン - 5 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - {5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (5 - メチル - [1, 2, 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル} - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド;

4 - メチル - [1, 2, 3] チアジアゾール - 5 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - {5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (5 - メチル - [1, 2, 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル} - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド;

3 - (2 - メトキシ - アセチルアミノ) - オキセタン - 3 - カルボン酸 ((R) - 1 - {5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (5 - メチル - [1, 2, 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル} - エチル) - アミド;

3 - メトキシ - イソオキサゾール - 5 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - {5 - [3, 5 - ジクロロ - 2 - (2, 2 - ジフルオロ - エトキシ) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル} - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド;

5 - メチル - [1, 3, 4] オキサジアゾール - 2 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - {5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (5 - メチル - [1, 2, 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル} - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド;

3 - メチル - イソオキサゾール - 5 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - {5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (2 - メチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル} - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド;

3 - (2, 2, 2 - トリフルオロ - アセチルアミノ) - オキセタン - 3 - カルボン酸 ((R) - 1 - {5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (2 - メチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル} - エチル) - アミド;

3 - (2, 2, 2 - トリフルオロ - アセチルアミノ) - オキセタン - 3 - カルボン酸 {(R) - 1 - [5' - クロロ - 3, 3' - ジフルオロ - 2' - (2 - メチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル) - ビフェニル - 4 - イル] - エチル} - アミド;

3 - メチル - イソオキサゾール - 5 - カルボン酸 (3 - {(R) - 1 - [5' - クロロ - 3, 3' - ジフルオロ - 2' - (2 - メチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル) - ビフェニル - 4 - イル] - エチルカルバモイル} - オキセタン - 3 - イル) - アミド;

3 - メチル - イソオキサゾール - 5 - カルボン酸 (3 - {(R) - 1 - [5' - クロロ - 3, 3' - ジフルオロ - 2' - (5 - メチル - [1, 2, 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - ビフェニル - 4 - イル] - エチルカルバモイル} - オキセタン - 3 - イル) - アミド;

ピリダジン - 4 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - {5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (5 - メチル - [1, 2, 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル} - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド;

1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 2 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - { 5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (5 - メチル - [1 , 2 , 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド ;

1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - { 5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (5 - メチル - [1 , 2 , 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド ;

5 - アミノ - N - [3 - ((R) - 1 - { 5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (5 - メチル - [1 , 2 , 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - ニコチンアミド ;

ピリダジン - 3 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - { 5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (5 - メチル - [1 , 2 , 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド ;

N - [3 - ((R) - 1 - { 5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (5 - メチル - [1 , 2 , 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - ニコチンアミド ;

2 - メトキシ - ピリミジン - 5 - カルボン酸 (3 - { (R) - 1 - [5 ' - クロロ - 3 , 3 ' - ジフルオロ - 2 ' - (5 - メチル - [1 , 2 , 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - ビフェニル - 4 - イル] - エチルカルバモイル } - オキセタン - 3 - イル) - アミド ;

イソオキサゾール - 5 - カルボン酸 (3 - { (R) - 1 - [3 ' , 5 ' - ジクロロ - 2 ' - (2 , 2 - ジフルオロ - エトキシ) - 3 - フルオロ - ビフェニル - 4 - イル] - エチルカルバモイル } - オキセタン - 3 - イル) - アミド ;

3 - (2 , 2 , 2 - トリフルオロ - アセチルアミノ) - オキセタン - 3 - カルボン酸 { (R) - 1 - [3 ' , 5 ' - ジクロロ - 2 ' - (2 , 2 - ジフルオロ - エトキシ) - 3 - フルオロ - ビフェニル - 4 - イル] - エチル } - アミド ;

3 - メトキシ - イソオキサゾール - 5 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - { 5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (2 - メチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド ;

2 - メトキシ - ピリミジン - 5 - カルボン酸 (3 - { (R) - 1 - [3 ' , 5 ' - ジクロロ - 2 ' - (2 , 2 - ジフルオロ - エトキシ) - 3 - フルオロ - ビフェニル - 4 - イル] - エチルカルバモイル } - オキセタン - 3 - イル) - アミド ;

2 - メトキシ - ピリミジン - 5 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - { 5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (2 - メチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド ;

3 - メトキシ - イソオキサゾール - 5 - カルボン酸 (3 - { (R) - 1 - [3 ' , 5 ' - ジクロロ - 2 ' - (2 , 2 - ジフルオロ - エトキシ) - 3 - フルオロ - ビフェニル - 4 - イル] - エチルカルバモイル } - オキセタン - 3 - イル) - アミド ;

5 - メチル - [1 , 3 , 4] オキサジアゾール - 2 - カルボン酸 (3 - { (R) - 1 - [3 ' , 5 ' - ジクロロ - 2 ' - (2 , 2 - ジフルオロ - エトキシ) - 3 - フルオロ - ビフェニル - 4 - イル] - エチルカルバモイル } - オキセタン - 3 - イル) - アミド ;

5 - メチル - [1 , 3 , 4] オキサジアゾール - 2 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - { 5 - [3 , 5 - ジクロロ - 2 - (2 , 2 - ジフルオロ - エトキシ) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド ;

2 - メトキシ - ピリミジン - 5 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - { 5 - [3 , 5 - ジクロロ - 2 - (2 , 2 - ジフルオロ - エトキシ) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド ;

4 - メチル - [1 , 2 , 3] チアジアゾール - 5 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - { 5 - [3 , 5 - ジクロロ - 2 - (2 , 2 - ジフルオロ - エトキシ) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド ;

3 - (2 - メトキシ - アセチルアミノ) - オキセタン - 3 - カルボン酸 ((R) - 1 - { 5 - [3 , 5 - ジクロロ - 2 - (2 , 2 - ジフルオロ - エトキシ) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチル) - アミド ;

3 - メトキシ - イソオキサゾール - 5 - カルボン酸 (3 - { (R) - 1 - [5 ' - クロロ - 3 , 3 ' - ジフルオロ - 2 ' - (2 - メチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル) - ビフェニル - 4 - イル] - エチルカルバモイル } - オキセタン - 3 - イル) - アミド ;

2 - メトキシ - ピリミジン - 5 - カルボン酸 (3 - { (R) - 1 - [5 ' - クロロ - 3 , 3 ' - ジフルオロ - 2 ' - (2 - メチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル) - ビフェニル - 4 - イル] - エチルカルバモイル } - オキセタン - 3 - イル) - アミド ;

から選択される請求項 1 ~ 12 のいずれか一項に記載の化合物及びこれらの薬学的に許容しうる塩。

【請求項 14】

3 - メチル - イソオキサゾール - 5 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - { 5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (5 - メチル - [1 , 2 , 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド ;

3 - メトキシ - イソオキサゾール - 5 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - { 5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (5 - メチル - [1 , 2 , 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド ;

2 - メトキシ - ピリミジン - 5 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - { 5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (5 - メチル - [1 , 2 , 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド ;

5 - メチル - [1 , 3 , 4] オキサジアゾール - 2 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - { 5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (5 - メチル - [1 , 2 , 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド ;

3 - メチル - イソオキサゾール - 5 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - { 5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (2 - メチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド ;

ピリダジン - 3 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - { 5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (5 - メチル - [1 , 2 , 4] オキサジアゾール - 3 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド ;

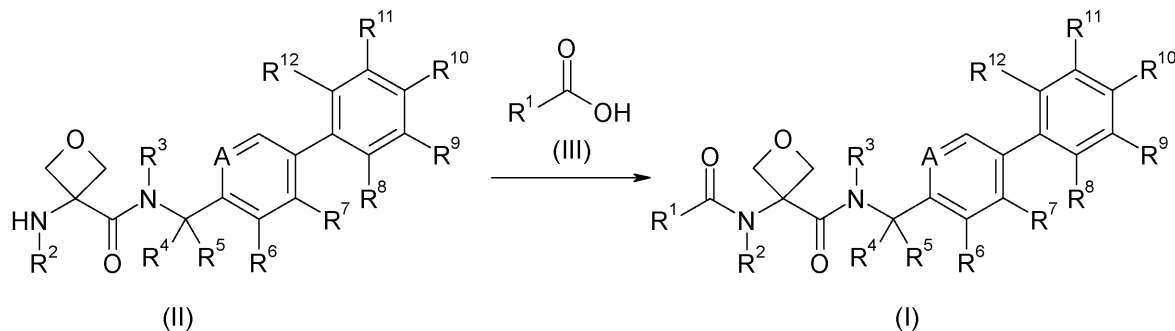
2 - メトキシ - ピリミジン - 5 - カルボン酸 [3 - ((R) - 1 - { 5 - [5 - クロロ - 3 - フルオロ - 2 - (2 - メチル - 2 H - テトラゾール - 5 - イル) - フェニル] - 3 - フルオロ - ピリジン - 2 - イル } - エチルカルバモイル) - オキセタン - 3 - イル] - アミド ;

から選択される請求項 1 ~ 13 のいずれか一項に記載の化合物及びこれらの薬学的に許容しうる塩。

【請求項 15】

式(III)で表される化合物の存在下で式(II)で表される化合物を反応させることを含む請求項1～14のいずれか一項に記載の化合物を調製する方法：

【化92】



(式中、A、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷、R⁸、R⁹、R¹⁰及びR¹¹は、請求項1に記載の通りである)。

【請求項16】

請求項15に記載の方法に従って製造される請求項1～14のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項17】

治療活性物質として使用するための請求項1～14のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項18】

請求項1～14のいずれか一項に記載の化合物と治療上不活性の担体とを含む医薬組成物。

【請求項19】

糸球体腎炎、ヘノッホ-シェーンライン紫斑病性腎症、ANCA関連半月形糸球体腎炎、ループス腎炎及びIgA腎炎を治療又は予防するための請求項1～14のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項20】

糸球体腎炎、ヘノッホ-シェーンライン紫斑病性腎症、ANCA関連半月形糸球体腎炎、ループス腎炎及びIgA腎炎を治療又は予防する医薬を調製するための請求項1～14のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項21】

糸球体腎炎、ヘノッホ-シェーンライン紫斑病性腎症、ANCA関連半月形糸球体腎炎、ループス腎炎及びIgA腎炎を治療又は予防するための請求項1～14のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項22】

糸球体腎炎、ヘノッホ-シェーンライン紫斑病性腎症、ANCA関連半月形糸球体腎炎、ループス腎炎及びIgA腎炎を治療又は予防するための方法であって、有効量の請求項1～14のいずれか一項に記載の化合物を投与することを含む方法。

【請求項23】

本明細書に記載する発明。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0002

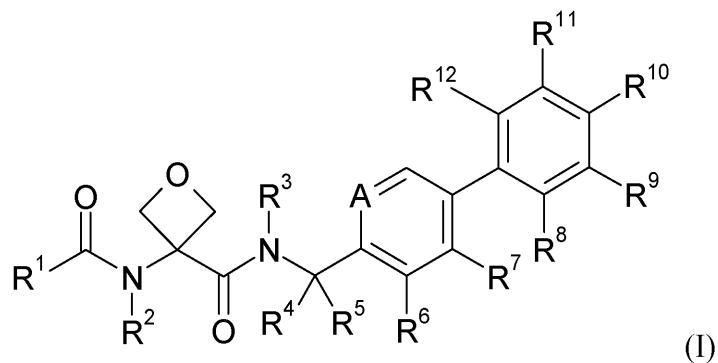
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0002】

本発明は、式(I)：

【化 1】



(式中、

R^1 は、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルコキシアルキル、シクロアルコキシアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシアルキル、ハロシクロアルキル、ハロシクロアルキルアルキル、ハロシクロアルコキシアルキル、アリール、置換アリール、ヘテロアリール又は置換ヘテロアリールであり、前記置換アリール及び前記置換ヘテロアリールは、独立して、アルキル、シクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、シクロアルキルアルコキシアルキル、シクロアルコキシ、シクロアルコキシアルキル、アルキルシクロアルキルアルキル、ハロシクロアルキル、ハロシクロアルキルアルキル、ハロゲン、ハロアルキル、ヒドロキシ、ヒドロキシアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、ハロアルコキシ、ヒドロキシアルコキシ、アルコキシアルコキシ、アルコキシアルコキシアルキル、ヒドロキシハロアルキル、アミノ及び置換アミノから選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されており、前記置換アミノは、独立して、アルキル、シクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルキルシクロアルキルアルキル、ヒドロキシアルキル及びアルコキシアルキルから選択される 1 ~ 2 個の置換基で置換されており；

R^2 は、水素、アルキル又はシクロアルキルであり；

R^3 は、水素、アルキル又はシクロアルキルであり；

R^4 は、水素、アルキル又はシクロアルキルであり；

R^5 は、水素、アルキル又はシクロアルキルであるか；

あるいは、 R^4 及び R^5 は、これらが結合している炭素と共にシクロアルキルを形成し；

R^6 は、水素、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、ハロゲン又はシアノであり；

R^7 は、水素、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、ハロゲン又はシアノであり；

R^8 は、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、シクロアルコキシ、シクロアルコキシアルキル、ハロアルキル、ハロアルコキシ、ハロアルコキシアルキル、ハロシクロアルキル、ハロシクロアルキルアルキル、ハロシクロアルコキシ、ハロシクロアルコキシアルキル、アルコキシカルボニル、シクロアルコキシカルボニル、ハロアルコキシカルボニル、ハロシクロアルコキシカルボニル、アリール、置換アリール、ヘテロアリール又は置換ヘテロアリールであり、前記置換アリール及び前記置換ヘテロアリールは、独立して、アルキル、シクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、シクロアルキルアルコキシ、シクロアルキルアルコキシアルキル、シクロアルコキシ、シクロアルコキシアルキル、アルキルシクロアルキルアルキル、ハロシクロアルキル、ハロシクロアルキルアルキル、ハロゲン、ハロアルキル、アルコキシ、アルコキシアルキル、ハロアルコキシ、アルコキシアルコキシ、アルコキシアルコキシアルキル、アミノ及び置換アミノから選択される 1 ~ 3 個の置換基で置換されており、前記置換アミノは、独立して、アルキル、シクロアルキル、アルキルシクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アルキルシクロアルキルアルキル、ヒドロキシアルキル及びアルコキシアルキルから選択される 1 ~ 2 個の置換基で置換されており；

R⁹ は、水素、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、ハロゲン又はシアノであり；

R¹⁰ は、水素、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、ハロゲン又はシアノであり

；

R¹¹ は、水素、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、ハロゲン又はシアノであり

；

R¹² は、水素、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、ハロゲン又はシアノであり

；

R¹³ は、水素、アルキル、アルコキシ、シクロアルキル、ハロゲン又はシアノであり

；

A は、C R¹³ 又はNである）

で表される新規化合物、又はその薬学的に許容しうる塩を提供する。