

【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25年12月26日 (2013.12.26)

【公表番号】特表2013-510077(P2013-510077A)

【公表日】平成25年3月21日 (2013.3.21)

【年通号数】公開・登録公報2013-014

【出願番号】特願2012-535688(P2012-535688)

【国際特許分類】

C 0 7 C 59/11 (2006.01)

C 0 7 C 69/73 (2006.01)

C 0 7 C 67/343 (2006.01)

C 0 7 C 69/732 (2006.01)

C 0 7 C 59/115 (2006.01)

C 0 7 C 69/708 (2006.01)

C 0 7 C 65/24 (2006.01)

C 0 7 C 47/565 (2006.01)

C 0 7 C 45/68 (2006.01)

C 0 7 C 37/11 (2006.01)

C 0 7 C 39/12 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/216 (2006.01)

A 6 1 K 31/192 (2006.01)

A 6 1 K 31/4418 (2006.01)

C 0 7 D 213/55 (2006.01)

A 6 1 K 31/11 (2006.01)

A 6 1 K 31/255 (2006.01)

C 0 7 D 213/48 (2006.01)

A 6 1 K 31/05 (2006.01)

C 0 7 D 213/38 (2006.01)

C 0 7 B 61/00 (2006.01)

C 0 7 K 7/06 (2006.01)

C 0 7 K 7/08 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C 59/11 C S P

C 0 7 C 69/73 Z N A

C 0 7 C 67/343

C 0 7 C 69/732 Z

C 0 7 C 59/115

C 0 7 C 69/708 Z

C 0 7 C 65/24

C 0 7 C 47/565

C 0 7 C 45/68

C 0 7 C 37/11

C 0 7 C 39/12

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 37/02
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 17/00
 A 6 1 K 31/216
 A 6 1 K 31/192
 A 6 1 K 31/4418
 C 0 7 D 213/55
 A 6 1 K 31/11
 A 6 1 K 31/255
 C 0 7 D 213/48
 A 6 1 K 31/05
 C 0 7 D 213/38
 C 0 7 B 61/00 3 0 0
 C 0 7 K 7/06
 C 0 7 K 7/08

【手続補正書】

【提出日】平成25年11月5日(2013.11.5)

【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

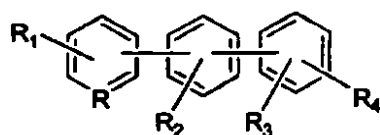
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

次式の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【化 1】

(ここで、RはNおよびC R₅から選択され、

R₅は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、C₁－C₆アルキル、C₂－C₆アルケニル、C₂－C₆アルキニル、ハロ(C₁－C₆アルキル)、C₁－C₆アルコキシ、ハロ(C₁－C₆アルコキシ)、アミノ、(C₁－C₆アルキル)アミノ、ジ(C₁－C₆アルキル)アミノ、ヒドロキシ(C₁－C₆アルキル)、(C₁－C₆アルコキシ)C₁－C₆アルキル、アミノ(C₁－C₆アルキル)、スルファニル(C₁－C₆アルキル)、(C₁－C₆アルキル)スルファニル(C₁－C₆アルキル)、－(CH₂)_{1－5}－C(O)(C₁－C₆アルコキシ)、－(CH₂)_{1－5}－C(O)NH₂、および(アリール)C₂－C₆アルキルからなる群から選択され、

R₁は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、C₁－C₆アルキル、ハロ(C₁－C₆アルキル)、C₁－C₆アルコキシ、ハロ(C₁－C₆アルコキシ)、ヒドロキシ(C₁－C₆アルキル)、(C₁－C₆アルコキシ)C₁－C₆アルキル、アミノ(C₁－C₆アルキル)、スルファニル(C₁－C₆アルキル)、または(C₁－C₆アルキル)スルファニル(C₁－C₆アルキル)であり、

R₂は、C₁－C₆アルキル、ハロ(C₁－C₆アルキル)、C₁－C₆アルコキシ、ハロ(C₁－C₆アルコキシ)、ヒドロキシ(C₁－C₆アルキル)、(C₁－C₆アルコキシ)C₁－C₆アルキル、ホルミル(C₀－C₆アルキル)、アミノ(C₁－C₆ア

ルキル), スルファニル (C_1-C_6 アルキル), (C_1-C_6 アルキル) スルファニル (C_1-C_6 アルキル), $-(CH_2)_{1-5}-C(O)OH$, $-(CH_2)_{1-5}-C(O)(C_1-C_6$ アルコキシ), $-(CH_2)_{1-5}-C(O)NH_2$, (アリール) C_1-C_6 アルキル, または (ヘテロアリール) C_1-C_6 アルキルであり、

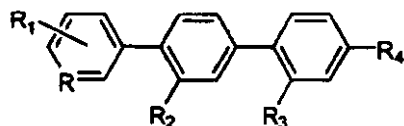
R_3 は、 C_1-C_6 アルキル, ハロ (C_1-C_6 アルキル), C_1-C_6 アルコキシ, ハロ (C_1-C_6 アルコキシ), ヒドロキシ (C_1-C_6 アルキル), (C_1-C_6 アルコキシ) C_1-C_6 アルキル, ホルミル (C_1-C_6 アルキル), アミノ (C_1-C_6 アルキル), スルファニル (C_1-C_6 アルキル), (C_1-C_6 アルキル) スルファニル (C_1-C_6 アルキル), $-(CH_2)_{1-5}-C(O)OH$, $-(CH_2)_{1-5}-C(O)(C_1-C_6$ アルコキシ), $-(CH_2)_{1-5}-C(O)NH_2$, $-(CH_2)_{1-5}-C(O)NH(C_1-C_6$ アルキル), $-(CH_2)_{1-5}-C(O)N(C_1-C_6$ アルキル) $_2$, $-CH=CH-C(O)OH$, $-CH=CH-C(O)(C_1-C_6$ アルコキシ), (アリール) C_1-C_6 アルキル, または (ヘテロアリール) C_1-C_6 アルキルであり、

R_4 は、ヒドロキシ, ハロゲン, C_1-C_6 アルコキシ, ハロ (C_1-C_6 アルコキシ), または ベンジルオキシである。)

【請求項 2】

次式の請求項 1 に記載の化合物。

【化 2】



(ここで、 R は N および CR_5 から選択され、

R_5 は、水素, ハロゲン, シアノ, ニトロ, ヒドロキシ, C_1-C_6 アルキル, C_2-C_6 アルケニル, C_2-C_6 アルキニル, ハロ (C_1-C_6 アルキル), C_1-C_6 アルコキシ, ハロ (C_1-C_6 アルコキシ), アミノ, (C_1-C_6 アルキル) アミノ, ジ (C_1-C_6 アルキル) アミノ, ヒドロキシ (C_1-C_6 アルキル), (C_1-C_6 アルコキシ) C_1-C_6 アルキル, アミノ (C_1-C_6 アルキル), スルファニル (C_1-C_6 アルキル), (C_1-C_6 アルキル) スルファニル (C_1-C_6 アルキル), $-(CH_2)_{1-5}-C(O)(C_1-C_6$ アルコキシ), および $-(CH_2)_{1-5}-C(O)NH_2$ からなる群から選択され、

R_1 は、水素, ハロゲン, ヒドロキシ, C_1-C_6 アルキル, ハロ (C_1-C_6 アルキル), C_1-C_6 アルコキシ, ハロ (C_1-C_6 アルコキシ), ヒドロキシ (C_1-C_6 アルキル), (C_1-C_6 アルコキシ) C_1-C_6 アルキル, アミノ (C_1-C_6 アルキル), スルファニル (C_1-C_6 アルキル), または (C_1-C_6 アルキル) スルファニル (C_1-C_6 アルキル) であり、

R_2 は、 C_1-C_6 アルキル, ハロ (C_1-C_6 アルキル), C_1-C_6 アルコキシ, ハロ (C_1-C_6 アルコキシ), ヒドロキシ (C_1-C_6 アルキル), (C_1-C_6 アルコキシ) C_1-C_6 アルキル, ホルミル (C_0-C_6 アルキル), アミノ (C_1-C_6 アルキル), スルファニル (C_1-C_6 アルキル), (C_1-C_6 アルキル) スルファニル (C_1-C_6 アルキル), $-(CH_2)_{1-5}-C(O)OH$, $-(CH_2)_{1-5}-C(O)(C_1-C_6$ アルコキシ), または $-(CH_2)_{1-5}-C(O)NH_2$ であり、

R_3 は、 C_1-C_6 アルキル, ハロ (C_1-C_6 アルキル), C_1-C_6 アルコキシ, ハロ (C_1-C_6 アルコキシ), ヒドロキシ (C_1-C_6 アルキル), (C_1-C_6 アルコキシ) C_1-C_6 アルキル, ホルミル (C_1-C_6 アルキル), アミノ (C_1-C_6 アルキル), スルファニル (C_1-C_6 アルキル), (C_1-C_6 アルキル) スルファニル (C_1-C_6 アルキル), $-(CH_2)_{1-5}-C(O)OH$, $-(CH_2)_{1-5}-C(O)(C_1-C_6$ アルコキシ), $-(CH_2)_{1-5}-C(O)NH_2$, $-(CH_2)_{1-5}-C(O)N(C_1-C_6$ アルキル) $_2$, $-CH=CH-C(O)OH$, $-CH=CH-C(O)(C_1-C_6$ アルコキシ), (アリール) C_1-C_6 アルキル, または (ヘテロアリール) C_1-C_6 アルキルであり、

$1-5-C(O)NH(C_1-C_6\text{アルキル})$, $-(CH_2)_{1-5}-C(O)N(C_1-C_6\text{アルキル})_2$, $-CH=CH-C(O)OH$, または $-CH=CH-C(O)(C_1-C_6\text{アルコキシ})$ であり、

R_4 は、ヒドロキシ、ハロゲン、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ(C_1-C_6 アルコキシ)、またはベンジルオキシである。)

【請求項 3】

R は N および CR_5 から選択され、

R_5 は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、ハロ(C_1-C_6 アルキル)、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ(C_1-C_6 アルコキシ)、アミノ、(C_1-C_6 アルキル)アミノ、ジ(C_1-C_6 アルキル)アミノ、ヒドロキシ(C_1-C_6 アルキル)、(C_1-C_6 アルコキシ) C_1-C_6 アルキル、およびアミノ(C_1-C_6 アルキル)からなる群から選択され、

R_1 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、 C_1-C_6 アルキル、ハロ(C_1-C_6 アルキル)、 C_1-C_6 アルコキシ、またはハロ(C_1-C_6 アルコキシ)であり、

R_2 は、 C_1-C_6 アルキル、ハロ(C_1-C_6 アルキル)、ヒドロキシ(C_1-C_6 アルキル)、(C_1-C_6 アルコキシ) C_1-C_6 アルキル、ホルミル(C_0-C_6 アルキル)、アミノ(C_1-C_6 アルキル)、スルファニル(C_1-C_6 アルキル)、または(C_1-C_6 アルキル)スルファニル(C_1-C_6 アルキル)であり、

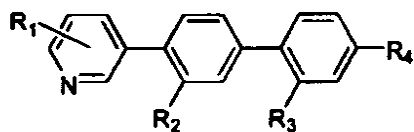
R_3 は、 C_1-C_6 アルキル、 $-(CH_2)_{1-5}-C(O)OH$, $-(CH_2)_{1-5}-C(O)(C_1-C_6\text{アルコキシ})$, $-(CH_2)_{1-5}-C(O)NH_2$, $-(CH_2)_{1-5}-C(O)NH(C_1-C_6\text{アルキル})$, $-(CH_2)_{1-5}-C(O)N(C_1-C_6\text{アルキル})_2$, $-CH=CH-C(O)OH$, または $-CH=CH-C(O)(C_1-C_6\text{アルコキシ})$ であり、

R_4 は、ヒドロキシ、ハロゲン、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ(C_1-C_6 アルコキシ)、またはベンジルオキシである、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

次式の請求項 1～3 のいずれか一項に記載の化合物。

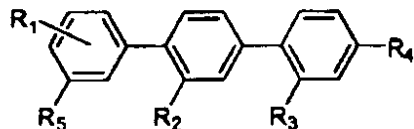
【化 3】



【請求項 5】

次式の請求項 1～3 のいずれか一項に記載の化合物。

【化 4】



【請求項 6】

R_1 は水素である請求項 1～5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

R_2 は、 C_1-C_6 アルキル、ハロ(C_1-C_6 アルキル)、ヒドロキシ(C_1-C_6 アルキル)、ホルミル(C_0-C_6 アルキル)、アミノ(C_1-C_6 アルキル)、またはスルファニル(C_1-C_6 アルキル)である請求項 1～6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 8】

R_2 は、 C_1-C_6 アルキル、ハロ (C_1-C_6 アルキル)、またはヒドロキシ (C_1-C_6 アルキル) である請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

R_3 は、 C_1-C_6 アルキル、 $-(CH_2)_{1-5}-C(O)OH$ 、 $-(CH_2)_{1-5}-C(O)(C_1-C_6$ アルコキシ)、 $-CH=CH-C(O)OH$ 、または $-CH=CH-C(O)(C_1-C_6$ アルコキシ) 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】

R_3 は、 $-(CH_2)_{1-2}-C(O)OH$ または $-(CH_2)_{1-2}-C(O)(C_1-C_6$ アルコキシ) である請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

R_4 は、ヒドロキシ または C_1-C_6 アルコキシ 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】

R_5 は、 C_1-C_6 アルキル、ハロ (C_1-C_6 アルキル)、 C_1-C_6 アルコキシ、またはハロ (C_1-C_6 アルコキシ) である請求項 1, 2 および 4～11 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 13】

R_5 は、存在する場合、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、ハロ (C_1-C_6 アルキル)、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ (C_1-C_6 アルコキシ)、アミノ、(C_1-C_6 アルキル) アミノ、ジ (C_1-C_6 アルキル) アミノ、ヒドロキシ (C_1-C_6 アルキル)、(C_1-C_6 アルコキシ) C_1-C_6 アルキル、およびアミノ (C_1-C_6 アルキル) からなる群から選択され、

R_1 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、 C_1-C_6 アルキル、ハロ (C_1-C_6 アルキル)、 C_1-C_6 アルコキシ、またはハロ (C_1-C_6 アルコキシ) であり、

R_2 は、 C_1-C_6 アルキル、ハロ (C_1-C_6 アルキル)、ヒドロキシ (C_1-C_6 アルキル)、(C_1-C_6 アルコキシ) C_1-C_6 アルキル、ホルミル (C_0-C_6 アルキル)、アミノ (C_1-C_6 アルキル)、スルファニル (C_1-C_6 アルキル)、または (C_1-C_6 アルキル) チオ (C_1-C_6 アルキル) であり、

R_3 は、 $-(CH_2)_{1-2}-C(O)OH$ 、 $-(CH_2)_{1-2}-C(O)(C_1-C_6$ アルコキシ)、 $-(CH_2)_{1-2}-C(O)NH_2$ 、 $-(CH_2)_{1-2}-C(O)NH(C_1-C_6$ アルキル)、 $-(CH_2)_{1-2}-C(O)N(C_1-C_6$ アルキル) $_2$ 、 $-CH=CH-C(O)OH$ 、または $-CH=CH-C(O)(C_1-C_6$ アルコキシ) であり、

R_4 は、ヒドロキシ、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ (C_1-C_6 アルコキシ)、またはベンジルオキシである、請求項 1～5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 14】

R_1 は、水素であり、

R_2 は、 C_1-C_6 アルキル、ハロ (C_1-C_6 アルキル)、ヒドロキシ (C_1-C_6 アルキル)、またはホルミル (C_1-C_6 アルキル) であり、

R_3 は、 $-(CH_2)_{1-2}-C(O)OH$ 、 $-(CH_2)_{1-2}-C(O)(C_1-C_6$ アルコキシ)、または $-(CH_2)_{1-2}-C(O)NH_2$ であり、

R_4 は、ヒドロキシまたは C_1-C_6 アルコキシであり、

R_5 は、存在する場合、 C_1-C_6 アルキル、ハロ (C_1-C_6 アルキル)、 C_1-C_6 アルコキシ、またはハロ (C_1-C_6 アルコキシ) である、請求項 1～5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 15】

R は、N および CR_5 から選択され、

R_5 は、存在する場合、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 C_1-C_6 ア

ルキル, C_2-C_6 アルケニル, C_2-C_6 アルキニル, ハロ (C_1-C_6 アルキル), C_1-C_6 アルコキシ, ハロ (C_1-C_6 アルコキシ), アミノ, (C_1-C_6 アルキル) アミノ, ジ (C_1-C_6 アルキル) アミノ, ヒドロキシ (C_1-C_6 アルキル), (C_1-C_6 アルコキシ) C_1-C_6 アルキル, およびアミノ (C_1-C_6 アルキル) からなる群から選択され、

R_1 は、水素であり、

R_2 は、 C_1-C_6 アルキルであり、

R_3 は、 $-(CH_2)_{1-2}-C(O)OH$ であり、

R_4 は、 C_1-C_6 アルコキシである、請求項 1～5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 16】

R は、N および CR_5 から選択され、

R_5 は、存在する場合、水素, ハロゲン, シアノ, ニトロ, ヒドロキシ, C_1-C_6 アルキル, C_2-C_6 アルケニル, C_2-C_6 アルキニル, ハロ (C_1-C_6 アルキル), C_1-C_6 アルコキシ, ハロ (C_1-C_6 アルコキシ), アミノ, (C_1-C_6 アルキル) アミノ, ジ (C_1-C_6 アルキル) アミノ, ヒドロキシ (C_1-C_6 アルキル), (C_1-C_6 アルコキシ) C_1-C_6 アルキル, およびアミノ (C_1-C_6 アルキル) からなる群から選択され、

R_1 は、水素であり、

R_2 は、メチルであり、

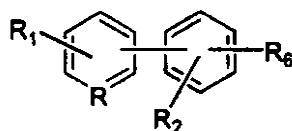
R_3 は、 $-(CH_2)_2-C(O)OH$ であり、

R_4 は、メトキシである、請求項 1～5 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 17】

次式の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【化 5】



(ここで、 R は N および CR_5 から選択され、

R_5 は、水素, ハロゲン, シアノ, ニトロ, ヒドロキシ, C_1-C_6 アルキル, C_2-C_6 アルケニル, C_2-C_6 アルキニル, ハロ (C_1-C_6 アルキル), C_1-C_6 アルコキシ, ハロ (C_1-C_6 アルコキシ), アミノ, (C_1-C_6 アルキル) アミノ, ジ (C_1-C_6 アルキル) アミノ, ヒドロキシ (C_1-C_6 アルキル), (C_1-C_6 アルコキシ) C_1-C_6 アルキル, アミノ (C_1-C_6 アルキル), スルファニル (C_1-C_6 アルキル), (C_1-C_6 アルキル) スルファニル (C_1-C_6 アルキル), $-(CH_2)_{1-5}-C(O)OH$, $-(CH_2)_{1-5}-C(O)(C_1-C_6$ アルコキシ), $-(CH_2)_{1-5}-C(O)NH_2$, (アリール) C_1-C_6 アルキル, および (ヘテロアリール) C_1-C_6 アルキル からなる群から選択され、

R_1 は、水素, ハロゲン, ヒドロキシ, C_1-C_6 アルキル, ハロ (C_1-C_6 アルキル), C_1-C_6 アルコキシ, ハロ (C_1-C_6 アルコキシ), ヒドロキシ (C_1-C_6 アルキル), (C_1-C_6 アルコキシ) C_1-C_6 アルキル, アミノ (C_1-C_6 アルキル), スルファニル (C_1-C_6 アルキル), または (C_1-C_6 アルキル) スルファニル (C_1-C_6 アルキル) であり、

R_2 は C_1-C_6 アルキル, ハロ (C_1-C_6 アルキル), C_1-C_6 アルコキシ, ハロ (C_1-C_6 アルコキシ), ヒドロキシ (C_1-C_6 アルキル), (C_1-C_6 アルコキシ) C_1-C_6 アルキル, ホルミル (C_0-C_6 アルキル), アミノ (C_1-C_6 アルキル), スルファニル (C_1-C_6 アルキル), (C_1-C_6 アルキル) スルファニル (C_1-C_6 アルキル), $-(CH_2)_{1-5}-C(O)OH$, $-(CH_2)_{1-5}-C(O)(C_1-C_6$ アルコキシ), $-(CH_2)_{1-5}-C(O)NH_2$, $-(CH_2)_1$

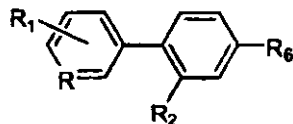
— 5 —C(O)NH(C₁—C₆アルキル), —(CH₂)₁₋₅—C(O)N(C₁—C₆アルキル)₂, —CH=CH—C(O)OH, —CH=CH—C(O)(C₁—C₆アルコキシ), (アリール)C₁—C₆アルキル, または(ヘテロアリール)C₁—C₆アルキルであり、

R₆は—OS(O)₂CF₃である。))

【請求項18】

次式の請求項17に記載の化合物。

【化6】



【請求項19】

RはNおよびCR₅から選択され、

R₅は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、C₁—C₆アルキル、C₂—C₆アルケニル、C₂—C₆アルキニル、ハロ(C₁—C₆アルキル)、C₁—C₆アルコキシ、ハロ(C₁—C₆アルコキシ)、アミノ、(C₁—C₆アルキル)アミノ、ジ(C₁—C₆アルキル)アミノ、ヒドロキシ(C₁—C₆アルキル)、(C₁—C₆アルコキシ)C₁—C₆アルキル、アミノ(C₁—C₆アルキル)、スルファニル(C₁—C₆アルキル)、(C₁—C₆アルキル)スルファニル(C₁—C₆アルキル)、—(CH₂)₁₋₅—C(O)OH, —(CH₂)₁₋₅—C(O)(C₁—C₆アルコキシ), および—(CH₂)₁₋₅—C(O)NH₂からなる群から選択され、

R₁は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、C₁—C₆アルキル、ハロ(C₁—C₆アルキル)、C₁—C₆アルコキシ、ハロ(C₁—C₆アルコキシ)、ヒドロキシ(C₁—C₆アルキル)、(C₁—C₆アルコキシ)C₁—C₆アルキル、アミノ(C₁—C₆アルキル)、スルファニル(C₁—C₆アルキル)、または(C₁—C₆アルキル)スルファニル(C₁—C₆アルキル)であり、

R₂は、C₁—C₆アルキル、ハロ(C₁—C₆アルキル)、C₁—C₆アルコキシ、ハロ(C₁—C₆アルコキシ)、ヒドロキシ(C₁—C₆アルキル)、(C₁—C₆アルコキシ)C₁—C₆アルキル、ホルミル(C₀—C₆アルキル)、アミノ(C₁—C₆アルキル)、スルファニル(C₁—C₆アルキル)、(C₁—C₆アルキル)スルファニル(C₁—C₆アルキル)、—(CH₂)₁₋₅—C(O)OH, —(CH₂)₁₋₅—C(O)(C₁—C₆アルコキシ), —(CH₂)₁₋₅—C(O)NH₂, —CH=CH—C(O)OH, または—CH=CH—C(O)(C₁—C₆アルコキシ)である、

請求項17または18に記載の化合物。

【請求項20】

RはNおよびCR₅から選択され、

R₅は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、C₁—C₆アルキル、C₂—C₆アルケニル、C₂—C₆アルキニル、ハロ(C₁—C₆アルキル)、C₁—C₆アルコキシ、ハロ(C₁—C₆アルコキシ)、アミノ、(C₁—C₆アルキル)アミノ、ジ(C₁—C₆アルキル)アミノ、ヒドロキシ(C₁—C₆アルキル)、(C₁—C₆アルコキシ)C₁—C₆アルキル、およびアミノ(C₁—C₆アルキル)からなる群から選択され、

R₁は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、C₁—C₆アルキル、ハロ(C₁—C₆アルキル)、C₁—C₆アルコキシ、またはハロ(C₁—C₆アルコキシ)であり、

R₂は、C₁—C₆アルキル、ハロ(C₁—C₆アルキル)、ヒドロキシ(C₁—C₆アルキル)、(C₁—C₆アルコキシ)C₁—C₆アルキル、ホルミル(C₀—C₆アルキル)、アミノ(C₁—C₆アルキル)、スルファニル(C₁—C₆アルキル)、(C₁—C₆アルキル)スルファニル(C₁—C₆アルキル)、—CH=CH—C(O)OH,

または $-CH=CH-C(O)(C_1-C_6 \text{ アルコキシ})$ である、請求項 17 または 18 に記載の化合物。

【請求項 21】

R_1 は水素である請求項 17 ~ 20 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 22】

R_2 は、 C_1-C_6 アルキル、ハロ (C_1-C_6 アルキル)、ヒドロキシ (C_1-C_6 アルキル)、ホルミル (C_0-C_6 アルキル)、アミノ (C_1-C_6 アルキル)、スルファニル (C_1-C_6 アルキル)、 $-CH=CH-C(O)OH$ 、または $-CH=CH-C(O)(C_1-C_6 \text{ アルコキシ})$ である請求項 17 ~ 21 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 23】

R_2 は、 C_1-C_6 アルキル、ハロ (C_1-C_6 アルキル)、ヒドロキシ (C_1-C_6 アルキル)、または $-CH=CH-C(O)(C_1-C_6 \text{ アルコキシ})$ である請求項 22 に記載の化合物。

【請求項 24】

R_5 は、 C_1-C_6 アルキル、ハロ (C_1-C_6 アルキル)、 C_1-C_6 アルコキシ、またはハロ (C_1-C_6 アルコキシ) である請求項 17 ~ 23 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 25】

R_5 は、 C_1-C_6 アルキルまたはハロ (C_1-C_6 アルキル) である、請求項 24 に記載の化合物。

【請求項 26】

R は N および CR_5 から選択され、

R_5 は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、 C_1-C_6 アルキル、 C_2-C_6 アルケニル、 C_2-C_6 アルキニル、ハロ (C_1-C_6 アルキル)、 C_1-C_6 アルコキシ、ハロ (C_1-C_6 アルコキシ)、アミノ、(C_1-C_6 アルキル) アミノ、ジ (C_1-C_6 アルキル) アミノ、ヒドロキシ (C_1-C_6 アルキル)、(C_1-C_6 アルコキシ) C_1-C_6 アルキル、およびアミノ (C_1-C_6 アルキル) からなる群から選択され、

R_1 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、 C_1-C_6 アルキル、ハロ (C_1-C_6 アルキル)、 C_1-C_6 アルコキシ、またはハロ (C_1-C_6 アルコキシ) であり、

R_2 は、 C_1-C_6 アルキル、ハロ (C_1-C_6 アルキル)、ヒドロキシ (C_1-C_6 アルキル)、(C_1-C_6 アルコキシ) C_1-C_6 アルキル、ホルミル (C_0-C_6 アルキル)、アミノ (C_1-C_6 アルキル)、スルファニル (C_1-C_6 アルキル)、(C_1-C_6 アルキル) チオ (C_1-C_6 アルキル)、または $-CH=CH-C(O)(C_1-C_6 \text{ アルコキシ})$ である、請求項 17 ~ 20 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 27】

R は N および CR_5 から選択され、

R_1 は、水素であり、

R_2 は、 C_1-C_6 アルキル、ハロ (C_1-C_6 アルキル)、ヒドロキシ (C_1-C_6 アルキル)、ホルミル (C_0-C_6 アルキル)、または $-CH=CH-C(O)(C_1-C_6 \text{ アルコキシ})$ であり、

R_5 は、 C_1-C_6 アルキル、ハロ (C_1-C_6 アルキル)、 C_1-C_6 アルコキシ、またはハロ (C_1-C_6 アルコキシ) である、請求項 17 ~ 20 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 28】

エチル (E) - 3 - [4' - (ベンジルオキシ) - 2' - ホルミル - 3 - メチル - (1, 1' ; 4', 1'') テルフェニル - 2' - イル] アクリラート ;

エチル 3 - [4' - ヒドロキシ - 2' - (ヒドロキシメチル) - 3 - メチル - (1, 1' ; 4', 1'') テルフェニル - 2' - イル] プロピオナート ;

3-[4'-'-ヒドロキシ-2'--(ヒドロキシメチル)-3-メチル-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2'-'-イル] プロパン酸;

エチル 3-[2'--(フルオロメチル)-4'-'-ヒドロキシ-3-メチル-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2'-'-イル] プロピオナート;

エチル 3-[2'--(ヒドロキシメチル)-4'-'-メトキシ-3-メチル-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2'-'-イル] プロピオナート;

3-[4'-'-ヒドロキシ-2'--(ヒドロキシメチル)-3-(トリフルオロメチル)-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2'-'-イル] プロパン酸;

3-[4-ヒドロキシ-3'--(ヒドロキシメチル)-4'--(ピリジン-3-イル) ビフェニル-2-イル] プロパン酸;

3-[4'-'-ヒドロキシ-2'-'-イソプロピル-3-メチル-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2'-'-イル] プロパン酸;

(E)-エチル 3-[4'-'--(ベンジルオキシ)-2'-ホルミル-3-(トリフルオロメチル)-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2'-'-イル] アクリラート;

(E)-エチル 3-[4-(ベンジルオキシ)-3'-ホルミル-4'-(ピリジン-3-イル) ビフェニル-2-イル] アクリラート;

エチル 3-[4'-'-ヒドロキシ-2', 3-ジメチル-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2'-'-イル] プロピオナート;

エチル 3-[4'-'-ヒドロキシ-2'-メチル-3-(トリフルオロメチル)-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2'-'-イル] プロピオナート;

3-[4'-'-ヒドロキシ-2', 3-ジメチル-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2'-'-イル] プロパン酸;

3-[4'-'-ヒドロキシ-2'-メチル-3-(トリフルオロメチル)-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2'-'-イル] プロパン酸;

エチル 3-[4'-'-ヒドロキシ-2'--(ヒドロキシメチル)-3-(トリフルオロメチル)-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2'-'-イル] プロピオナート;

エチル 3-[4-ヒドロキシ-3'--(ヒドロキシメチル)-4'-(ピリジン-3-イル) ビフェニル-2-イル] プロピオナート;

エチル 3-[2'--(フルオロメチル)-4'-'-ヒドロキシ-3-(トリフルオロメチル)-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2'-'-イル] プロピオナート;

エチル 3-[3'--(フルオロメチル)-4-ヒドロキシ-4'-(ピリジン-3-イル) ビフェニル-2-イル] プロピオナート;

3-[2'--(フルオロメチル)-4'-'-ヒドロキシ-3-メチル-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2'-'-イル] プロパン酸;

3-[2'--(フルオロメチル)-4'-'-ヒドロキシ-3-(トリフルオロメチル)-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2'-'-イル] プロパン酸;

3-[3'--(フルオロメチル)-4-ヒドロキシ-4'-(ピリジン-3-イル) ビフェニル-2-イル] プロパン酸;

エチル (E)-3-[4'-'--(ベンジルオキシ)-2'-(ジフルオロメチル)-3-メチル-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2'-'-イル] アクリラート;

エチル (E)-3-[4'-'--(ベンジルオキシ)-2'-(ジフルオロメチル)-3-(トリフルオロメチル)-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2'-'-イル] アクリラート;

(E)-エチル 3-[4-(ベンジルオキシ)-3'-(ジフルオロメチル)-4'-(ピリジン-3-イル) ビフェニル-2-イル] アクリラート;

エチル 3-[2'-(ジフルオロメチル)-4'-'-ヒドロキシ-3-メチル-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2'-'-イル] プロピオナート;

エチル 3-[2'-(ジフルオロメチル)-4'-'-ヒドロキシ-3-(トリフルオロメチル)-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2'-'-イル] プロピオナート;

エチル 3- [3'- (ジフルオロメチル) - 4- ヒドロキシ- 4'- (ピリジン- 3- イル) ビフェニル- 2- イル] プロピオナート ;

3- [2'- (ジフルオロメチル) - 4'- - ヒドロキシ- 3- メチル- (1, 1' ; 4', 1'') テルフェニル- 2'- - イル] プロパン酸 ;

3- [2'- (ジフルオロメチル) - 4'- - ヒドロキシ- 3- (トリフルオロメチル) - (1, 1' ; 4', 1'') テルフェニル- 2'- - イル] プロパン酸 ;

3- [3'- (ジフルオロメチル) - 4- ヒドロキシ- 4'- (ピリジン- 3- イル) ビフェニル- 2- イル] プロパン酸 ;

エチル 3- [4'- - メトキシ- 3, 2'- ジメチル- (1, 1' ; 4', 1'') テルフェニル- 2'- - イル] プロピオナート ;

エチル 3- [2'- (フルオロメチル) - 4'- - メトキシ- 3- メチル- (1, 1' ; 4', 1'') テルフェニル- 2'- - イル] プロピオナート ;

エチル 3- [2'- (ジフルオロメチル) - 4'- - メトキシ- 3- メチル- (1, 1' ; 4', 1'') テルフェニル- 2'- - イル] プロピオナート ;

エチル 3- [2'- (ヒドロキシメチル) - 4'- - メトキシ- 3- (トリフルオロメチル) - (1, 1' ; 4', 1'') テルフェニル- 2'- - イル] プロピオナート ;

エチル 3- [2'- メチル- 4'- - メトキシ- 3- (トリフルオロメチル) - (1, 1' ; 4', 1'') テルフェニル- 2'- - イル] プロピオナート ;

エチル 3- [2'- (フルオロメチル) - 4'- - メトキシ- 3- (トリフルオロメチル) - (1, 1' ; 4', 1'') テルフェニル- 2'- - イル] プロピオナート ;

エチル 3- [2'- (ジフルオロメチル) - 4'- - メトキシ- 3- (トリフルオロメチル) - (1, 1' ; 4', 1'') テルフェニル- 2'- - イル] プロピオナート ;

エチル 3- [3'- (ヒドロキシメチル) - 4- メトキシ- 4'- (ピリジン- 3- イル) ビフェニル- 2- イル] プロピオナート ;

エチル 3- [4- メトキシ- 3'- メチル- 4'- (ピリジン- 3- イル) ビフェニル- 2- イル] プロピオナート ;

エチル 3- [3'- (フルオロメチル) - 4- メトキシ- 4'- (ピリジン- 3- イル) ビフェニル- 2- イル] プロピオナート ;

エチル 3- [3'- (ジフルオロメチル) - 4- メトキシ- 4'- (ピリジン- 3- イル) ビフェニル- 2- イル] プロピオナート ;

3- [2'- (ヒドロキシメチル) - 4'- - メトキシ- 3- メチル- (1, 1' ; 4', 1'') テルフェニル- 2'- - イル] プロパン酸 ;

3- [4'- - メトキシ- 3, 2'- ジメチル- (1, 1' ; 4', 1'') テルフェニル- 2'- - イル] プロパン酸 ;

3- [2'- (フルオロメチル) - 4'- - メトキシ- 3- メチル- (1, 1' ; 4', 1'') テルフェニル- 2'- - イル] プロパン酸 ;

3- [2'- (ジフルオロメチル) - 4'- - メトキシ- 3- メチル- (1, 1' ; 4', 1'') テルフェニル- 2'- - イル] プロパン酸 ;

3- [2'- (ヒドロキシメチル) - 4'- - メトキシ- 3- (トリフルオロメチル) - (1, 1' ; 4', 1'') テルフェニル- 2'- - イル] プロパン酸 ;

3- [2'- メチル- 4'- - メトキシ- 3- (トリフルオロメチル) - (1, 1' ; 4', 1'') テルフェニル- 2'- - イル] プロパン酸 ;

3- [2'- (フルオロメチル) - 4'- - メトキシ- 3- (トリフルオロメチル) - (1, 1' ; 4', 1'') テルフェニル- 2'- - イル] プロパン酸 ;

3- [2'- (ジフルオロメチル) - 4'- - メトキシ- 3- (トリフルオロメチル) - (1, 1' ; 4', 1'') テルフェニル- 2'- - イル] プロパン酸 ;

3- [3'- (ヒドロキシメチル) - 4- メトキシ- 4'- (ピリジン- 3- イル) - ビフェニル- 2- イル] プロパン酸 ;

3- [4- メトキシ- 3'- メチル- 4'- (ピリジン- 3- イル) ビフェニル- 2- イル] プロパン酸 ;

3-[3'-(フルオロメチル)-4-メトキシ-4'-(ピリジン-3-イル)-ビフェニル-2-イル]プロパン酸；

3-[3'-(ジフルオロメチル)-4-メトキシ-4'-(ピリジン-3-イル)-ビフェニル-2-イル]プロパン酸；

エチル 3-[3, 2'-ジメチル-4'-プロポキシ-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2''-イル]プロピオナート；

エチル 3-[4''-(エトキシカルボニルメトキシ)-3, 2'-ジメチル-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2''-イル]プロピオナート；

エチル 3-[2'-メチル-4'-プロポキシ-3-(トリフルオロメチル)-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2''-イル]プロピオナート；

3-[3, 2'-ジメチル-4'-プロポキシ-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2''-イル]プロパン酸；

3-[4''-(カルボキシメトキシ)-3, 2'-ジメチル-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2''-イル]プロパン酸；

3-[2'-メチル-4'-プロポキシ-3-(トリフルオロメチル)-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2''-イル]プロパン酸；

エチル 3-[3'-ホルミル-4-メトキシ-4'-(ピリジン-3-イル) ビフェニル-2-イル]プロピオナート；

エチル 3-[4, 4''-ジメトキシ-3, 2'-ジメチル-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2''-イル]プロピオナート；

3-[4, 4''-ジメトキシ-3, 2'-ジメチル-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2''-イル]プロパン酸；

エチル (E)-3-[4''-(ベンジルオキシ)-3-ホルミル-2''-イソプロピル-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2''-イル]アクリラート；

エチル 3-[4''-ヒドロキシ-2''-イソプロピル-3-メチル-(1, 1'; 4', 1'') テルフェニル-2''-イル]プロピオナート；

4-ヒドロキシ-3'-メチルビフェニル-2-カルバルデヒド；

2-ホルミル-3'-メチルビフェニル-4-イルトリフルオロメタンスルホナート；

4-ヒドロキシ-3'-(トリフルオロメチル) ビフェニル-2-カルバルデヒド；

5-ヒドロキシ-2-(ピリジン-3-イル) ベンズアルデヒド；

2-ホルミル-3'-(トリフルオロメチル) ビフェニル-4-イルトリフルオロメタンスルホナート；

3-ホルミル-4-(ピリジン-3-イル) フェニルトリフルオロメタンスルホナート；

2-(ジフルオロメチル)-3'-メチルビフェニル-4-オール；

2-(ジフルオロメチル)-3'-(トリフルオロメチル) ビフェニル-4-オール；

2-(ジフルオロメチル)-3'-メチルビフェニル-4-イルトリフルオロメタンスルホナート；

2-(ジフルオロメチル)-3'-(トリフルオロメチル) ビフェニル-4-イルトリフルオロメタンスルホナート；

3-メチル-4-(ピリジン-3-イル) フェノール；

4'-メトキシ-2, 3'-ジメチルビフェニル-4-オール；

3-メチル-4-(ピリジン-3-イル) フェニルトリフルオロメタンスルホナート；

4'-メトキシ-2-メチルビフェニル-4-イルトリフルオロメタンスルホナート；

エチル (E)-3-[3'-ホルミル-4-(ヒドロキシビフェニル)-2-イル]アクリラート；または

エチル (E)-3-[3'-ホルミル-4-(トリフルオロメタノスルホニルオキシ) ビフェニル-2-イル]アクリラート；

である化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 29】

請求項 1 ～ 28 のいずれか一項に記載の化合物と、1 つ以上の薬学的に許容されるキャリア、溶媒、アジュバント、または希釈剤とを含む医薬組成物。

【請求項 30】

抗体媒介性の疾患、薬剤耐性の癌、炎症、タンパク質のミスフォールディングおよび ER ストレスを媒介とした疾患、およびアポトーシス変異の治療薬の製造のための請求項 1 ～ 28 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

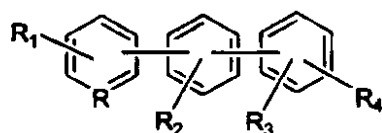
【請求項 31】

抗体媒介性の疾患は、IgA ネフロパシー、全身性紅斑狼瘡、およびグッドパスチャー自己免疫症候群からなる群から選択される、請求項 30 に記載の使用。

【請求項 32】

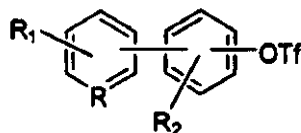
次式の化合物またはその薬学的に許容可能な塩を製造する方法であって、

【化 7】



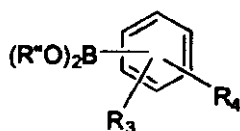
次式の化合物を

【化 8】



次式の化合物と反応させる工程を備える方法。

【化 9】



(ここで、R は N および C R₅ から選択され、

R₅ は、水素、ハロゲン、シアノ、ニトロ、ヒドロキシ、C₁ - C₆ アルキル、C₂ - C₆ アルケニル、C₂ - C₆ アルキニル、ハロ (C₁ - C₆ アルキル)、C₁ - C₆ アルコキシ、ハロ (C₁ - C₆ アルコキシ)、アミノ、(C₁ - C₆ アルキル) アミノ、ジ (C₁ - C₆ アルキル) アミノ、ヒドロキシ (C₁ - C₆ アルキル)、(C₁ - C₆ アルコキシ) C₁ - C₆ アルキル、アミノ (C₁ - C₆ アルキル)、スルファニル (C₁ - C₆ アルキル)、(C₁ - C₆ アルキル) スルファニル (C₁ - C₆ アルキル)、- (CH₂)₁₋₅ - C (O) OH、- (CH₂)₁₋₅ - C (O) (C₁ - C₆ アルコキシ)、- (CH₂)₁₋₅ - C (O) NH₂、(アリール) C₁ - C₆ アルキル、および (ヘテロアリール) C₁ - C₆ アルキルからなる群から選択され、

R₁ は、水素、ハロゲン、ヒドロキシ、C₁ - C₆ アルキル、ハロ (C₁ - C₆ アルキル)、C₁ - C₆ アルコキシ、ハロ (C₁ - C₆ アルコキシ)、ヒドロキシ (C₁ - C₆ アルキル)、(C₁ - C₆ アルコキシ) C₁ - C₆ アルキル、アミノ (C₁ - C₆ アルキル)、スルファニル (C₁ - C₆ アルキル)、または (C₁ - C₆ アルキル) スルファニル (C₁ - C₆ アルキル) であり、

R₂ は、C₁ - C₆ アルキル、ハロ (C₁ - C₆ アルキル)、C₁ - C₆ アルコキシ、ハロ (C₁ - C₆ アルコキシ)、ヒドロキシ (C₁ - C₆ アルキル)、(C₁ - C₆ アルコキシ) C₁ - C₆ アルキル、ホルミル (C₀ - C₆ アルキル)、アミノ (C₁ - C₆ アルキル)、スルファニル (C₁ - C₆ アルキル)、(C₁ - C₆ アルキル) スルファニル

($C_1 - C_6$ アルキル), $-(CH_2)_{1-5}-C(O)OH$, $-(CH_2)_{1-5}-C(O)(C_1 - C_6$ アルコキシ), $-(CH_2)_{1-5}-C(O)NH_2$, (アリール) $C_1 - C_6$ アルキル, または (ヘテロアリール) $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R_3 は、 $C_1 - C_6$ アルキル, ハロ ($C_1 - C_6$ アルキル), $C_1 - C_6$ アルコキシ, ハロ ($C_1 - C_6$ アルコキシ), ヒドロキシ ($C_1 - C_6$ アルキル), ($C_1 - C_6$ アルコキシ) $C_1 - C_6$ アルキル, ホルミル ($C_1 - C_6$ アルキル), アミノ ($C_1 - C_6$ アルキル), スルファニル ($C_1 - C_6$ アルキル), ($C_1 - C_6$ アルキル) スルファニル ($C_1 - C_6$ アルキル), $-(CH_2)_{1-5}-C(O)OH$, $-(CH_2)_{1-5}-C(O)(C_1 - C_6$ アルコキシ), $-(CH_2)_{1-5}-C(O)NH_2$, $-(CH_2)_{1-5}-C(O)NH(C_1 - C_6$ アルキル), $-(CH_2)_{1-5}-C(O)N(C_1 - C_6$ アルキル) $_2$, $-CH=CH-C(O)OH$, $-CH=CH-C(O)(C_1 - C_6$ アルコキシ), (アリール) $C_1 - C_6$ アルキル, または (ヘテロアリール) $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R_4 は、ヒドロキシ, ハロゲン, $C_1 - C_6$ アルキル, $C_1 - C_6$ アルコキシ, ハロ ($C_1 - C_6$ アルコキシ), ベンジルオキシ, $-(CH_2)_{1-5}-C(O)OH$, $-(CH_2)_{1-5}-C(O)(C_1 - C_6$ アルコキシ), $-(CH_2)_{1-5}-C(O)NH_2$, $-(CH_2)_{1-5}-C(O)NH(C_1 - C_6$ アルキル), $-(CH_2)_{1-5}-C(O)N(C_1 - C_6$ アルキル) $_2$, $-CH=CH-C(O)OH$, $-CH=CH-C(O)(C_1 - C_6$ アルコキシ), $-O(CH_2)_{1-5}-C(O)OH$, $-O(CH_2)_{1-5}-C(O)(C_1 - C_6$ アルコキシ), (アリール) $C_1 - C_6$ アルキル, または (ヘテロアリール) $C_1 - C_6$ アルキルであり、

各 R' が独立に水素または $C_1 - C_6$ アルキルであるか、または2つの R' がそれらの結合している原子とともに随意で $C_1 - C_6$ アルキルによって置換されるジオキサボロラニルまたはジオキサボリナニル環を形成する。)