

【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29年6月15日(2017.6.15)

【公表番号】特表2016-526023(P2016-526023A)

【公表日】平成28年9月1日(2016.9.1)

【年通号数】公開・登録公報2016-052

【出願番号】特願2016-513077(P2016-513077)

【国際特許分類】

C 0 7 F	9/09	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	11/02	(2006.01)
A 6 1 P	11/08	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	31/10	(2006.01)
A 6 1 P	37/08	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 K	9/72	(2006.01)
A 6 1 P	37/00	(2006.01)
A 6 1 K	38/00	(2006.01)
A 6 1 K	31/675	(2006.01)
A 6 1 K	45/06	(2006.01)
C 0 7 F	9/572	(2006.01)
C 0 7 F	9/553	(2006.01)
C 0 7 F	9/6533	(2006.01)
C 0 7 F	9/62	(2006.01)
C 0 7 F	9/6558	(2006.01)
C 0 7 F	9/6561	(2006.01)
C 0 7 K	14/47	(2006.01)

【F I】

C 0 7 F	9/09	C S P Z
A 6 1 P	11/06	Z N A
A 6 1 P	11/02	
A 6 1 P	11/08	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	31/10	
A 6 1 P	37/08	
A 6 1 P	43/00	1 1 3
A 6 1 P	43/00	1 2 1
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 K	9/72	
A 6 1 P	37/00	
A 6 1 K	37/02	
A 6 1 K	31/675	
A 6 1 K	45/06	
C 0 7 F	9/572	Z
C 0 7 F	9/572	A
C 0 7 F	9/6533	

C 0 7 F 9/62
 C 0 7 F 9/6558
 C 0 7 F 9/6561
 C 0 7 K 14/47

【手続補正書】

【提出日】平成29年4月24日(2017.4.24)

【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

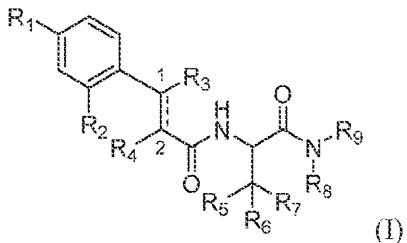
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

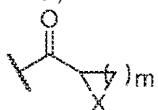
【請求項1】

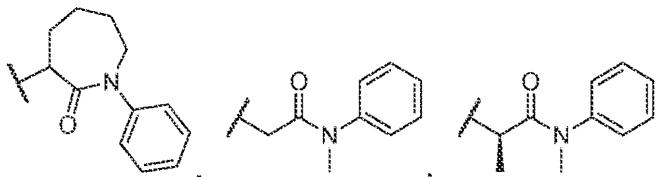
以下の式の化合物、またはその薬学的に許容される塩：



式中、

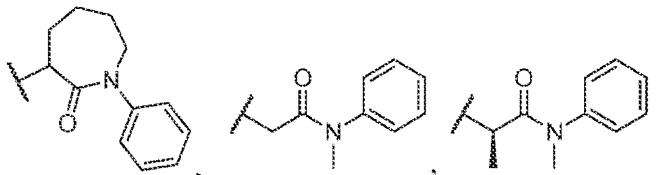
炭素1と2との間の結合は一重または二重結合であり；

R₁はホスフェート、-OP(0)(OR₁₀)(OR₁₀)₂、-アルキル_(C₆)-P(0)(OR₁₀)(OR₁₀)₂、または置換されたこれらのいずれかの基であり；ここでR₁₀およびR₁₀₂はそれぞれ独立に、水素、アルキル_(C₆)、アリール_(C₈)、アラルキル_(C₁₂)、-アルキル_(C₆)-O-C(0)-アルキル_(C₆)、-アルキル_(C₆)-O-C(0)-アリール_(C₈)、またはであり；ここでm=0~8であり；ここでXは-CH₂-、-O-、-S-、または-NH-であり；ただしR₁₀およびR₁₀₂は両方が水素ではないことを条件とし；R₂は水素であるか、またはR₂は以下に示すとおりR₁₁と一緒になり；R₃、R₅、R₆、およびR₇はそれぞれ独立に、水素、無置換アルキル_(C₆)、もしくは置換アルキル_(C₆)であるか、または(R₇およびR₈)は以下に示すとおり一緒になるか、または(R₇、R₈、およびR₉)は以下に示すとおり一緒になり；R₄は水素または-N(R₁₁)R₁₂であり；ここで、R₁₁は、水素、アルキル_(C₆)、アリール_(C₈)、アシル_(C₆)、もしくは置換されたこれらのいずれかの基であるか、またはR₁₁は以下に示すとおりR₂と一緒になり；R₁₂は、水素、アルキル_(C₆)、アシル_(C₆)であるか、またはR₁₂は以下に示すとおりR₁₁と一緒になり；R₈は、水素、無置換アルキル_(C₆)、置換アルキル_(C₆)、無置換アリール_(C₈)、置換アリール_(C₈)、アミノ酸、-アルカンジイル_(C₆)-C(0)NX₁X₂、-CH₂-C(0)NX₁X₂、ここで、X₁およびX₂はそれぞれ独立に、アルキル_(C₆)、アリール_(C₁₂)、もしくは置換されたこれらのいずれかの基、



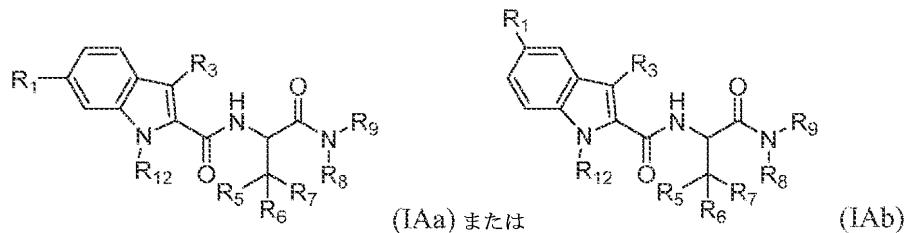
であるか、またはR₈は以下に示すとおりR₇と一緒になるか、またはR₈は以下に示すとおりR₇およびR₉と一緒になるか、またはR₈は以下に示すとおりR₉と一緒になり；

R₉は、水素、無置換アルキル_(C₁~6)、置換アルキル_(C₁~6)、無置換アリール_(C₁~8)、置換アリール_(C₁~8)、アミノ酸、-アルカンジイル_(C₁~6)-C(O)NX₁X₂、-CH₂-C(O)NX₁X₂、ここで、X₁およびX₂はそれぞれ独立に、アルキル_(C₁~6)、アリール_(C₁~12)、もしくは置換されたこれらのいずれかの基、

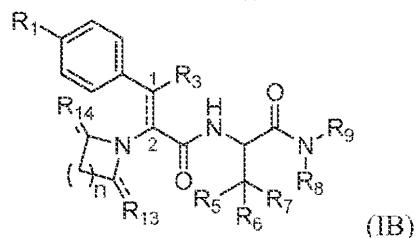


であるか、またはR₉は以下に示すとおりR₇およびR₈と一緒になるか、またはR₉は以下に示すとおりR₈と一緒になり；

ただしR₄が-N(R₁₁)R₁₂であり、かつ(R₂およびR₁₁)が一緒になる場合、化合物は式IAによってさらに規定されることを条件とし：



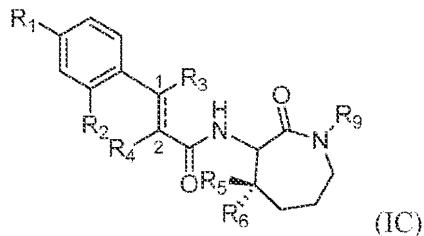
ただしR₄が-N(R₁₁)R₁₂であり、かつ(R₁₁およびR₁₂)が一緒になる場合、化合物は式IBによってさらに規定されることを条件とし：



ここで、

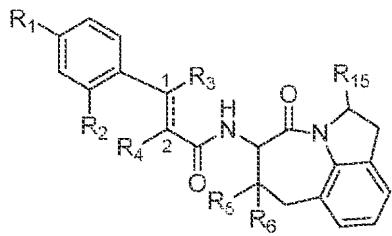
R₁₃およびR₁₄はそれぞれ独立に水素またはオキソであり；かつnは1、2、3、4、または5であり；

ただしR₇およびR₈が一緒になる場合、化合物は式ICによってさらに規定されることを条件とし：

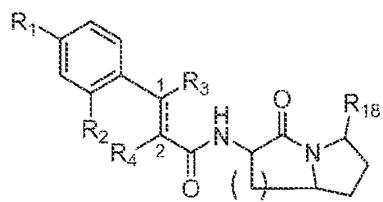


ただしR₇、R₈、およびR₉が一緒になる場合、化合物は式IDまたは式IEによってさらに規

定されることを条件とし：



(ID) または



(IE)

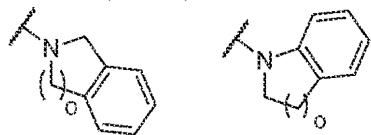
ここで、

R_{15} は水素または $-C(O)NR_{16}R_{17}$ であり；

ここで、

R_{16} および R_{17} はそれぞれ独立に、水素、アルキル_(C₁~6)、アリール_(C₆~8)、または置換されたこれらのいずれかの基であり；

R_{18} は、水素、-アルケンジイル_(C₆~8)-アリール_(C₆~8)、アラルキル_(C₇~12)、-C(O)-アルキル_(C₁~6)、-C(O)-ヘテロシクロアルキル_(C₅~12)、-C(O)-ヘテロアリール_(C₅~12)、



または $-C(O)NR_{19}R_{20}$ であり；

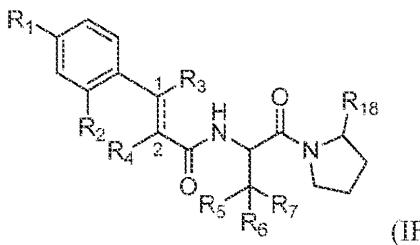
ここで、

R_{19} および R_{20} はそれぞれ独立に、水素、アルキル_(C₁~6)、アリール_(C₆~8)、または置換されたこれらのいずれかの基であり；

\circ は1、2、または3であり；かつ

p は1、2、3、4、または5であり；

ただし R_8 および R_9 が一緒になる場合、化合物は式IFによってさらに規定されることを条件とし：



(IF)

ここで R_{18} が $-C(O)NR_{19}R_{20}$ であり、かつ R_{19} がアリール_(C₆~8) である場合、 R_3 は水素ではない。

【請求項2】

式IEまたは式IFのいずれかを有し、かつ R_{18} が $-C(O)NR_{19}R_{20}$ であり、 R_{19} がアリール_(C₆~8) であり、かつ R_3 が $-CH_3$ である、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

R_1 が $-CF_2-P(O)(OR_{10})(OR_{10})$ であり、かつ R_{10} および / または R_{10} が $-CH_2OC(O)C(CH_3)_3$ である、請求項1~2のいずれか一項記載の化合物。

【請求項4】

R_4 が水素または $-N(R_{11})R_{12}$ である、請求項1~3のいずれか一項記載の化合物。

【請求項5】

R_{11} が水素であるか、または R_{12} が水素、アルキル_(C₁~6)、アリール_(C₆~8)、もしくはアシリル_(C₆~8) である、請求項5記載の化合物。

【請求項6】

前記化合物が式IBを有し、かつ R_{13} が水素もしくはオキソであり、および / または R_{14} が水素もしくはオキソである、請求項1記載の化合物。

【請求項 7】

前記化合物が式IBを有し、かつnが1、2、または3である、請求項1または6記載の化合物。

【請求項 8】

R₃、R₅、R₆、および/またはR₇がアルキル_(C₁~6)である、請求項1~7のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 9】

R₅、R₆、およびR₇が水素またはメチルである、請求項1~7のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 10】

R₈が水素であるか、またはR₈がカルボニルに対してトランスである、請求項1および3~9のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 11】

R₉がアルキル_(C₁~6)である、請求項1および3~10のいずれか一項記載の化合物。

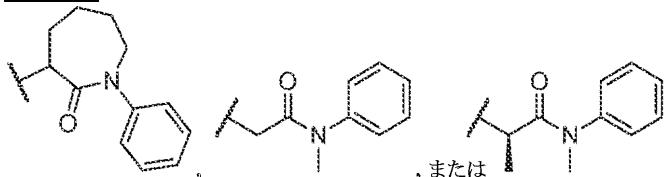
【請求項 12】

R₉が

(a) ヘテロシクロアルキル_(C₁~12)であるか、

(b) アミノ酸であるか、または

(c)



である、

請求項1および3~10のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 13】

R₉がカルボニルに対してシスである、請求項1記載の化合物。

【請求項 14】

R₁₅が-C(O)NR₁₆R₁₇であるか、またはR₁₆がカルボニルに対してトランスである、請求項1、および3~9のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 15】

R₁₆がアルキル_(C₁~6)である、請求項14記載の化合物。

【請求項 16】

R₁₇がカルボニルに対してシスである、請求項1、および3~9のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 17】

R₁₇がアリール_(C₆~8)である、請求項14または16記載の化合物。

【請求項 18】

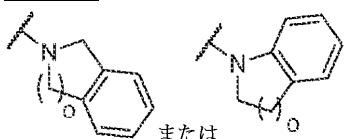
R₁₈が

(a) アルケンジイル_(C₁~6)-アリール_(C₆~8)であるか、

(b) アラルキル_(C₁~12)であるか、

(c) -C(O)-ヘテロシクロアルキル_(C₁~12)であるか

(d)



であるか

(e) -C(O)NR₁₉R₂₀である、

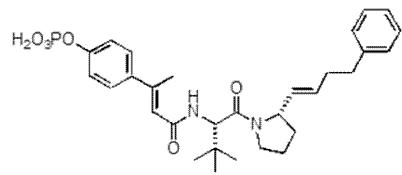
請求項1～9のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 19】

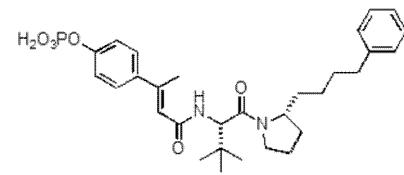
oが1、2または3である、請求項18記載の化合物。

【請求項 20】

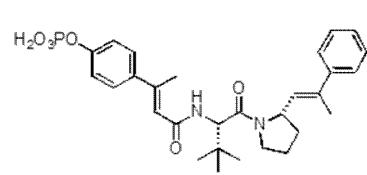
下記またはその薬学的に許容される塩としてさらに規定される、請求項1記載の化合物



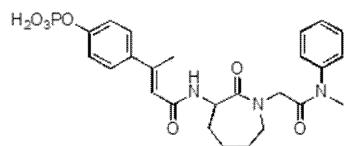
PM-91



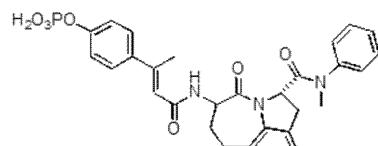
PM-10I



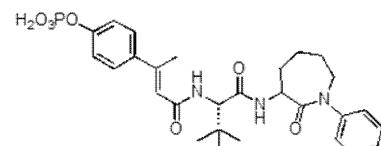
PM-151



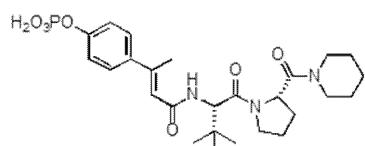
PM-281



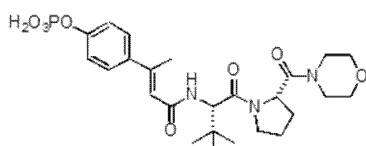
PM-341



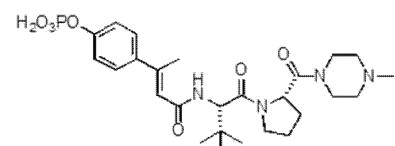
PM-601



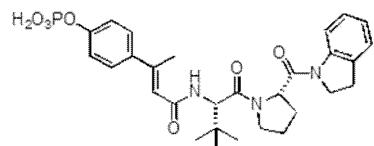
PM-671-A



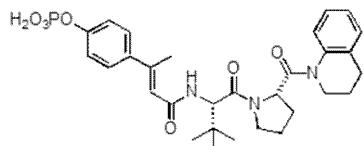
PM-671-B



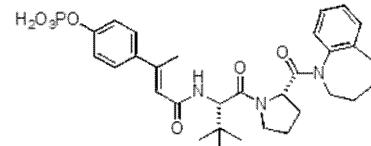
PM-671-C



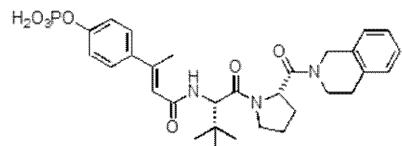
PM-591



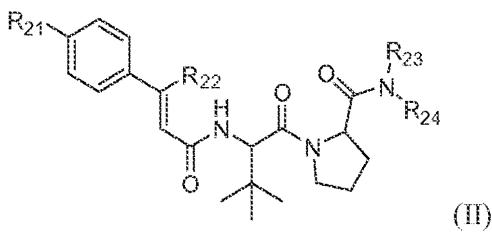
PM-871



PM-71I-B



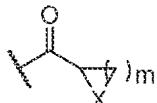
PM-711-A



式中、

R_{21} は、ホスフェート、-OP(0)(OR₁₀)(OR₁₀)、-アルキル_(C₆)-P(0)(OR₁₀)(OR₁₀)、または置換されたこれらのいずれかの基であり；ここで、

R_{10} および R_{10} はそれぞれ独立に、水素、アルキル_(C₆)、アリール_(C₈)、アラルキル_(C₁₂)、アルキル_(C₆)-O-C(0)-アルキル_(C₆)、アルキル_(C₆)-O-C(0)-アリール_(C₈)、または



であり；ここで $m=0 \sim 8$ であり；ここで X は-CH₂-、-O-、-S-、または-NH-であり；ただし R_{10} および R_{10} は両方が水素ではないことを条件とし；

R_{22} は水素またはアルキル_(C₆)であり；

R_{23} は、水素、アルキル_(C₁₂)、置換アルキル_(C₁₂)、アリール_(C₁₂)、または置換アリール_(C₁₂)であり；

R_{24} はアリール_(C₁₂)または置換アリール_(C₁₂)であり；

ただし R_{22} が水素である場合、 R_{23} および R_{24} はフェニルまたはヨードフェニルではないことを条件とする。

【請求項 2 2】

R_{21} が-アルキル_(C₆)-P(0)(OR₁₀)(OR₁₀)または置換-アルキル_(C₆)-P(0)(OR₁₀)(OR₁₀)である、請求項21記載の化合物。

【請求項 2 3】

R_{23} がフェニルである、および/または R_{24} がアリール_(C₈-C₁₂)である、請求項21または22記載の化合物。

【請求項 2 4】

請求項1～23のいずれか一項記載の化合物および賦形剤を含む薬学的組成物。

【請求項 2 5】

気管支拡張剤(bronchodilator)をさらに含む、請求項24記載の薬学的組成物。

【請求項 2 6】

対象におけるアレルギー疾患または炎症疾患の処置に用いるための、または対象におけるSTAT6の阻害に用いるための薬学的組成物であって、請求項1～23のいずれか一項記載の化合物の治療的有効量を含む、薬学的組成物。

【請求項 2 7】

疾患が肺疾患である、請求項26記載の薬学的組成物。

【請求項 2 8】

第二の治療化合物が、前記化合物と同時にもしくは並行して、または前記化合物に続いて対象に投与されるように用いられる、請求項26記載の薬学的組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 2 0

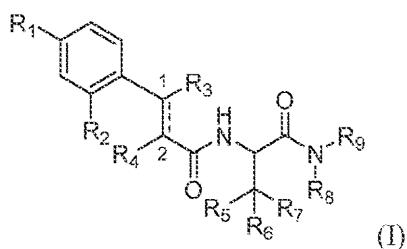
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 2 0】

【本発明1001】

以下の式の化合物、またはその薬学的に許容される塩：

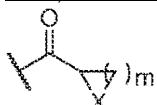


式中、

炭素1と2との間の結合は一重または二重結合であり；

R₁はホスフェート、-OP(0)(OR₁₀)(OR₁₀)、-アルキル_(C₆)-P(0)(OR₁₀)(OR₁₀)、または置換されたこれらのいずれかの基であり；ここで

R₁₀およびR₁₀はそれぞれ独立に、水素、アルキル_(C₆)、アリール_(C₈)、アラルキル_(C₁₂)、-アルキル_(C₆)-O-C(0)-アルキル_(C₆)、-アルキル_(C₆)-O-C(0)-アリール_(C₈)、または



であり；ここでm=0~8であり；ここでXは-CH₂-、-O-、-S-、または-NH-であり；ただしR₁₀およびR₁₀は両方が水素ではないことを条件とし；

R₂は水素であるか、またはR₂は以下に示すとおりR₁₁と一緒にになり；

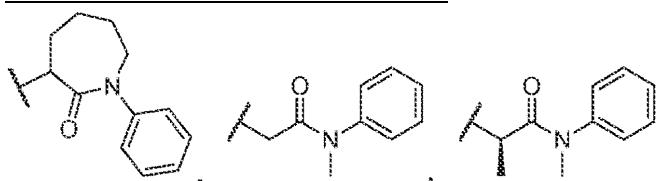
R₃、R₅、R₆、およびR₇はそれぞれ独立に、水素、無置換アルキル_(C₆)、もしくは置換アルキル_(C₆)であるか、または(R₇およびR₈)は以下に示すとおり一緒にになるか、または(R₇、R₈、およびR₉)は以下に示すとおり一緒になり；

R₄は水素または-N(R₁₁)R₁₂であり；ここで、

R₁₁は、水素、アルキル_(C₆)、アリール_(C₈)、アシル_(C₆)、もしくは置換されたこれらのいずれかの基であるか、またはR₁₁は以下に示すとおりR₂と一緒になり；

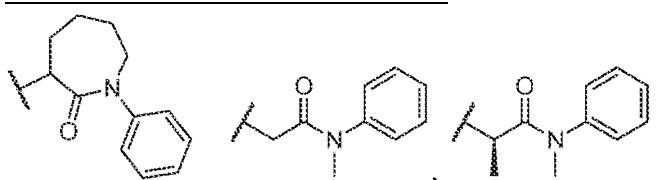
R₁₂は、水素、アルキル_(C₆)、アシル_(C₆)であるか、またはR₁₂は以下に示すとおりR₁₁と一緒になり；

R₈は、水素、無置換アルキル_(C₆)、置換アルキル_(C₆)、無置換アリール_(C₈)、置換アリール_(C₈)、アミノ酸、-アルカンジイル_(C₆)-C(0)NX₁X₂、-CH₂-C(0)NX₁X₂、ここで、X₁およびX₂はそれぞれ独立に、アルキル_(C₆)、アリール_(C₁₂)、もしくは置換されたこれらのいずれかの基、



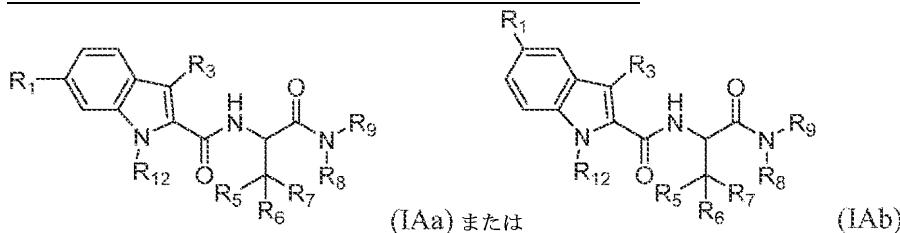
であるか、またはR₈は以下に示すとおりR₇と一緒になるか、またはR₈は以下に示すとおりR₇およびR₉と一緒になるか、またはR₈は以下に示すとおりR₉と一緒になり；

R₉は、水素、無置換アルキル_(C₆)、置換アルキル_(C₆)、無置換アリール_(C₈)、置換アリール_(C₈)、アミノ酸、-アルカンジイル_(C₆)-C(0)NX₁X₂、-CH₂-C(0)NX₁X₂、ここで、X₁およびX₂はそれぞれ独立に、アルキル_(C₆)、アリール_(C₁₂)、もしくは置換されたこれらのいずれかの基、

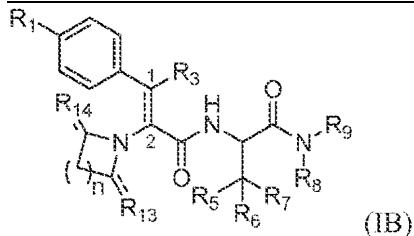


であるか、またはR₉は以下に示すとおりR₇およびR₈と一緒になるか、またはR₉は以下に示すとおりR₈と一緒になり；

ただし R_4 が $-N(R_{11})R_{12}$ であり、かつ (R_2 および R_{11}) が一緒になる場合、化合物は式 IA によってさらに規定されることを条件とし：



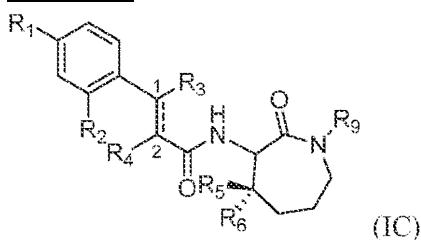
ただし R_4 が $-N(R_{11})R_{12}$ であり、かつ (R_{11} および R_{12}) が一緒になる場合、化合物は式 IB によってさらに規定されることを条件とし：



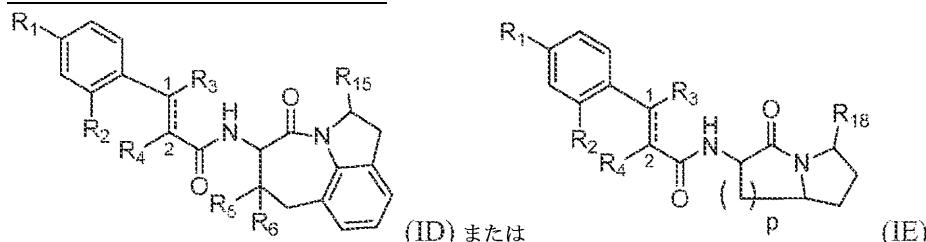
ここで、

R_{13} および R_{14} はそれぞれ独立に水素またはオキソであり；かつ
 n は 1、2、3、4、または 5 であり；

ただし R_7 および R_8 が一緒になる場合、化合物は式 IC によってさらに規定されることを条件とし：



ただし R_7 、 R_8 、および R_9 が一緒になる場合、化合物は式 ID または式 IE によってさらに規定されることを条件とし：



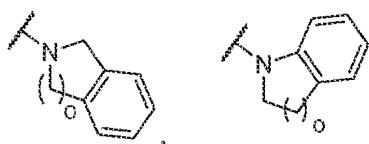
ここで、

R_{15} は水素または $-C(O)NR_{16}R_{17}$ であり；

ここで、

R_{16} および R_{17} はそれぞれ独立に、水素、アルキル_(C₁₋₆)、アリール_(C₆₋₈)、または置換されたこれらのいずれかの基であり；

R_{18} は、水素、-アルケンジイル_(C₆₋₈)-アリール_(C₆₋₈)、アラルキル_(C₇₋₁₂)、-C(O)-アルキル_(C₆₋₈)、-C(O)-ヘテロシクロアルキル_(C₇₋₁₂)、-C(O)-ヘテロアリール_(C₇₋₁₂)、



または $-C(O)NR_{19}R_{20}$ であり；

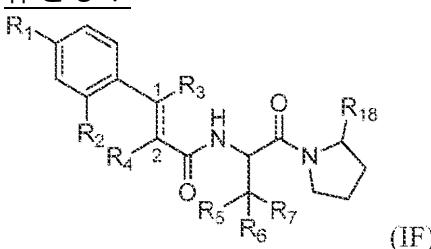
ここで、

R_{19} および R_{20} はそれぞれ独立に、水素、アルキル $(C_1\sim C_6)$ 、アリール $(C_6\sim C_8)$ 、または置換されたこれらのいずれかの基であり；

o は1、2、または3であり；かつ

p は1、2、3、4、または5であり；

ただし R_8 および R_9 が一緒になる場合、化合物は式IFによってさらに規定されることを条件とし：



ここで R_{18} が $-C(O)NR_{19}R_{20}$ であり、かつ R_{19} がアリール $(C_6\sim C_8)$ である場合、 R_3 は水素ではない。

[本発明1002]

式Iを有する、本発明1001の化合物。

[本発明1003]

式IAを有する、本発明1001の化合物。

[本発明1004]

式IBを有する、本発明1001の化合物。

[本発明1005]

式ICを有する、本発明1001の化合物。

[本発明1006]

式IDを有する、本発明1001の化合物。

[本発明1007]

式IEを有する、本発明1001の化合物。

[本発明1008]

式IFを有する、本発明1001の化合物。

[本発明1009]

R_{18} が $-C(O)NR_{19}R_{20}$ であり、 R_{19} がアリール $(C_6\sim C_8)$ であり、かつ R_3 が $-CH_3$ である、本発明1007および1008のいずれかの化合物。

[本発明1010]

炭素1と2との間の結合が二重結合である、本発明1001～1007のいずれかの化合物。

[本発明1011]

R_1 がホスフェートである、本発明1001～1010のいずれかの化合物。

[本発明1012]

R_1 が $-CF_2-P(O)(OR_{10})(OR_{10}\cdot)$ である、本発明1001～1010のいずれかの化合物。

[本発明1013]

R_{10} または $R_{10}\cdot$ が $-CH_2OC(O)C(CH_3)_3$ である、本発明1012のいずれかの化合物。

[本発明1014]

R_{10} および $R_{10}\cdot$ が $-CH_2OC(O)C(CH_3)_3$ である、本発明1013の化合物。

[本発明1015]

R_2 が水素である、本発明1001～1012のいずれかの化合物。

[本発明1016]

R₃が水素である、本発明1001～1015のいずれかの化合物。

[本発明1017]

R₃がアルキル_(C₁～6)である、本発明1001～1015のいずれかの化合物。

[本発明1018]

R₃がメチルである、本発明1017の化合物。

[本発明1019]

R₄が水素である、本発明1001～1018のいずれかの化合物。

[本発明1020]

R₄が-N(R₁₁)R₁₂である、本発明1001～1018のいずれかの化合物。

[本発明1021]

R₁₁が水素である、本発明1020の化合物。

[本発明1022]

R₁₂が水素である、本発明1020の化合物。

[本発明1023]

R₁₂がアルキル_(C₁～6)である、本発明1020の化合物。

[本発明1024]

R₁₂がアリール_(C₁～6)である、本発明1020の化合物。

[本発明1025]

R₁₂がアシル_(C₁～6)である、本発明1020の化合物。

[本発明1026]

R₁₃が水素である、本発明1004の化合物。

[本発明1027]

R₁₃がオキソである、本発明1004の化合物。

[本発明1028]

R₁₄が水素である、本発明1004および1026～1027のいずれかの化合物。

[本発明1029]

R₁₄がオキソである、本発明1004および1026～1027のいずれかの化合物。

[本発明1030]

nが1である、本発明1004および1026～1029のいずれかの化合物。

[本発明1031]

nが2である、本発明1004および1026～1029のいずれかの化合物。

[本発明1032]

nが3である、本発明1004および1026～1029のいずれかの化合物。

[本発明1033]

R₅が水素である、本発明1001～1032のいずれかの化合物。

[本発明1034]

R₅がアルキル_(C₁～6)である、本発明1001～1032のいずれかの化合物。

[本発明1035]

R₅がメチルである、本発明1001～1032および1034のいずれかの化合物。

[本発明1036]

R₆が水素である、本発明1001～1035のいずれかの化合物。

[本発明1037]

R₆がアルキル_(C₁～6)である、本発明1001～1035のいずれかの化合物。

[本発明1038]

R₆がメチルである、本発明1001～1035および1037のいずれかの化合物。

[本発明1039]

R₇がアルキル_(C₁～6)である、本発明1001～1004および1007～1038のいずれかの化合物。

[本発明1040]

R₇がメチルである、本発明1001～1004および1007～1039のいずれかの化合物。

[本発明1041]

R₅、R₆、およびR₇が水素またはメチルである、本発明1001～1004および1007～1032のいずれかの化合物。

[本発明1042]

R₅、R₆、およびR₇が水素である、本発明1041の化合物。

[本発明1043]

R₅、R₆、およびR₇がメチルである、本発明1041の化合物。

[本発明1044]

R₈が水素である、本発明1001～1004および1010～1042のいずれかの化合物。

[本発明1045]

R₈がカルボニルに対してトランスである、本発明1001～1004および1010～1044のいずれかの化合物。

[本発明1046]

R₉がアルキル_(C₁～6)である、本発明1001～1004および1010～1045のいずれかの化合物。

[本発明1047]

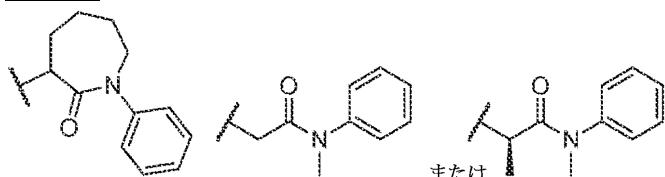
R₉がヘテロシクロアルキル_(C₁～12)である、本発明1001～1004および1010～1044のいずれかの化合物。

[本発明1048]

R₉がアミノ酸である、本発明1001～1004および1010～1044のいずれかの化合物。

[本発明1049]

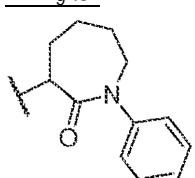
R₉が



である、本発明1001～1004および1010～1044のいずれかの化合物。

[本発明1050]

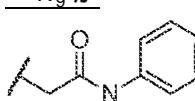
R₉が



である、本発明1049の化合物。

[本発明1051]

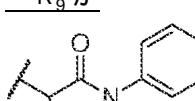
R₉が



である、本発明1049の化合物。

[本発明1052]

R₉が



である、本発明1049の化合物。

[本発明1053]

R₉がカルボニルに対してシスである、本発明1001～1004のいずれかの化合物。

[本発明1054]

R₁₅が-C(O)NR₁₆R₁₇である、本発明1001～1004、1006、および1010～1043のいずれかの化合物。

[本発明1055]

R₁₆がカルボニルに対してトランスである、本発明1001～1004、1006、および1010～1043のいずれかの化合物。

[本発明1056]

R₁₆がアルキル_(C₁～6)である、本発明1054～1055のいずれかの化合物。

[本発明1057]

R₁₆がメチルである、本発明1056の化合物。

[本発明1058]

R₁₇がカルボニルに対してシスである、本発明1001～1004、1006、および1010～1043のいずれかの化合物。

[本発明1059]

R₁₇がアリール_(C₆～8)である、本発明1054および1058のいずれかの化合物。

[本発明1060]

R₁₇がフェニルである、本発明1059の化合物。

[本発明1061]

R₁₈がアルケンジイル_(C₆～8)-アリール_(C₆～8)である、本発明1001～1004および1007～1043のいずれかの化合物。

[本発明1062]

R₁₈が-C(H)C(H)CH₂CH₂C₆H₅または-C(H)C(CH₃)C₆H₅である、本発明1061の化合物。

[本発明1063]

R₁₈がアラルキル_(C₆～12)である、本発明1001～1004および1007～1043のいずれかの化合物。

[本発明1064]

R₁₈が-(CH₂)₄-C₆H₅である、本発明1063の化合物。

[本発明1065]

R₁₈が-C(O)-ヘテロシクロアルキル_(C₆～12)である、本発明1001～1004および1007～1043のいずれかの化合物。

[本発明1066]

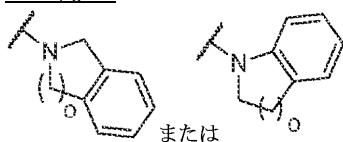
ヘテロシクロアルキルが、ピペリジン、N-メチルピペラジン、およびモルホリンから選択される、本発明1065の化合物。

[本発明1067]

ヘテロシクロアルキルが、ピロリジン、ピペリジン、およびアゼパンから選択される、本発明1065の化合物。

[本発明1068]

R₁₈が

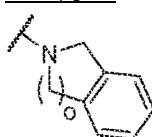


または

である、本発明1001～1004および1007～1043のいずれかの化合物。

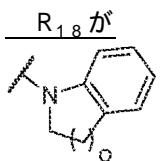
[本発明1069]

R₁₈が



である、本発明1068の化合物。

[本発明1070]



である、本発明1068の化合物。

[本発明1071]

oが1である、本発明1069または1070のいずれかの化合物。

[本発明1072]

oが2である、本発明1069または1070のいずれかの化合物。

[本発明1073]

oが3である、本発明1069または1070のいずれかの化合物。

[本発明1074]

R₁₈が-C(O)NR₁₉R₂₀である、本発明1001～1004および1007～1043のいずれかの化合物。

[本発明1075]

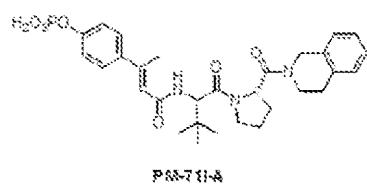
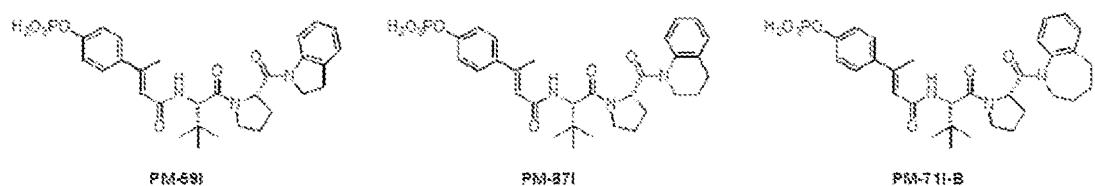
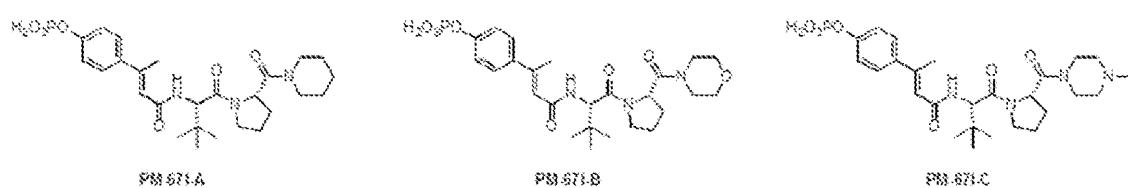
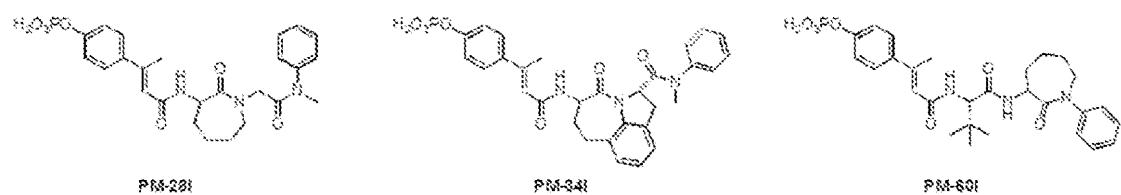
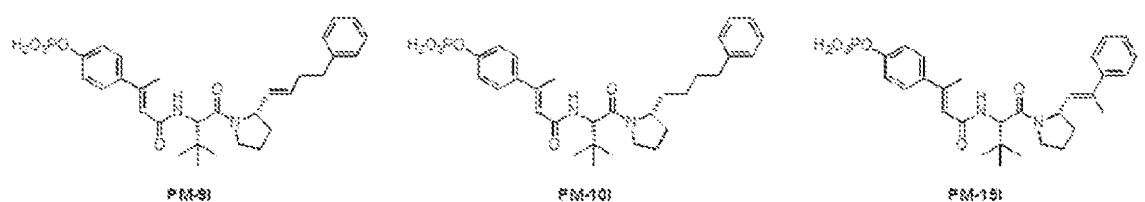
R₁₉がカルボニルに対してトランスである、本発明1074の化合物。

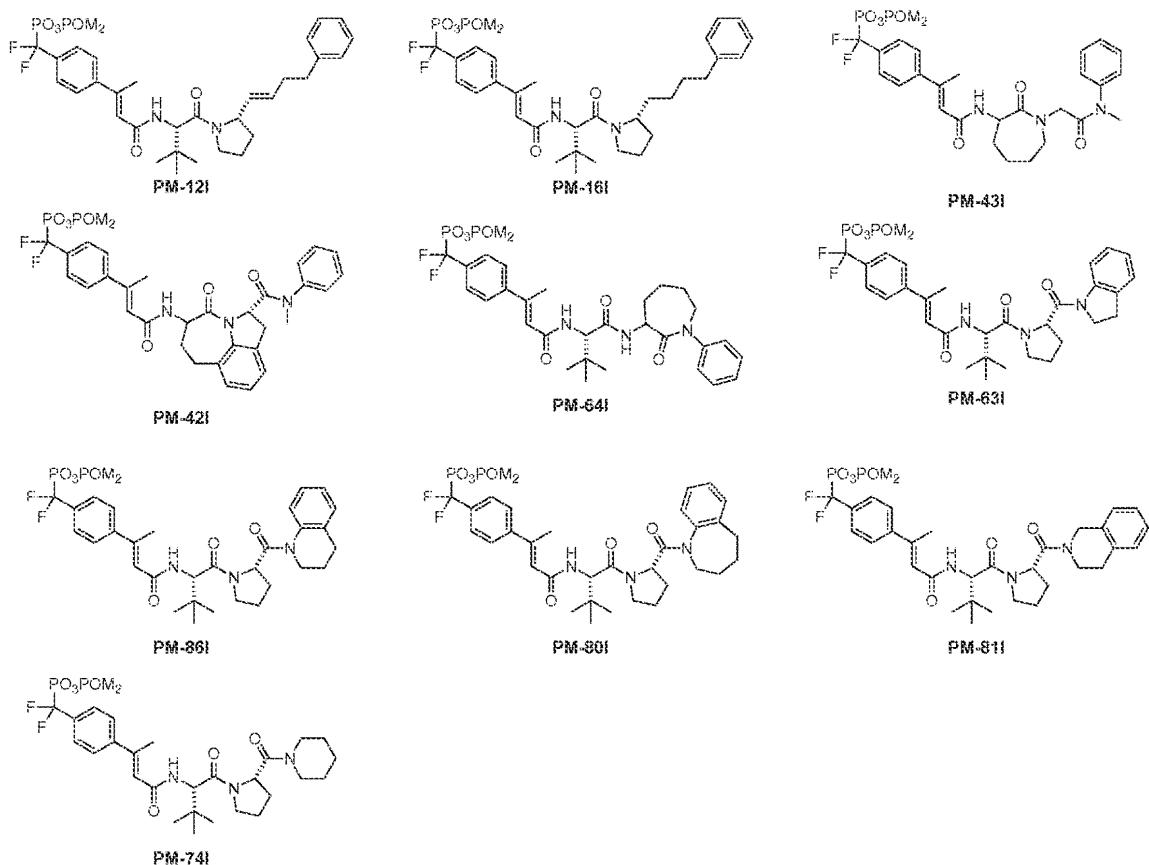
[本発明1076]

R₂₀がカルボニルに対してシスである、本発明1074の化合物。

[本発明1077]

下記またはその薬学的に許容される塩としてさらに規定される、本発明1001の化合物：



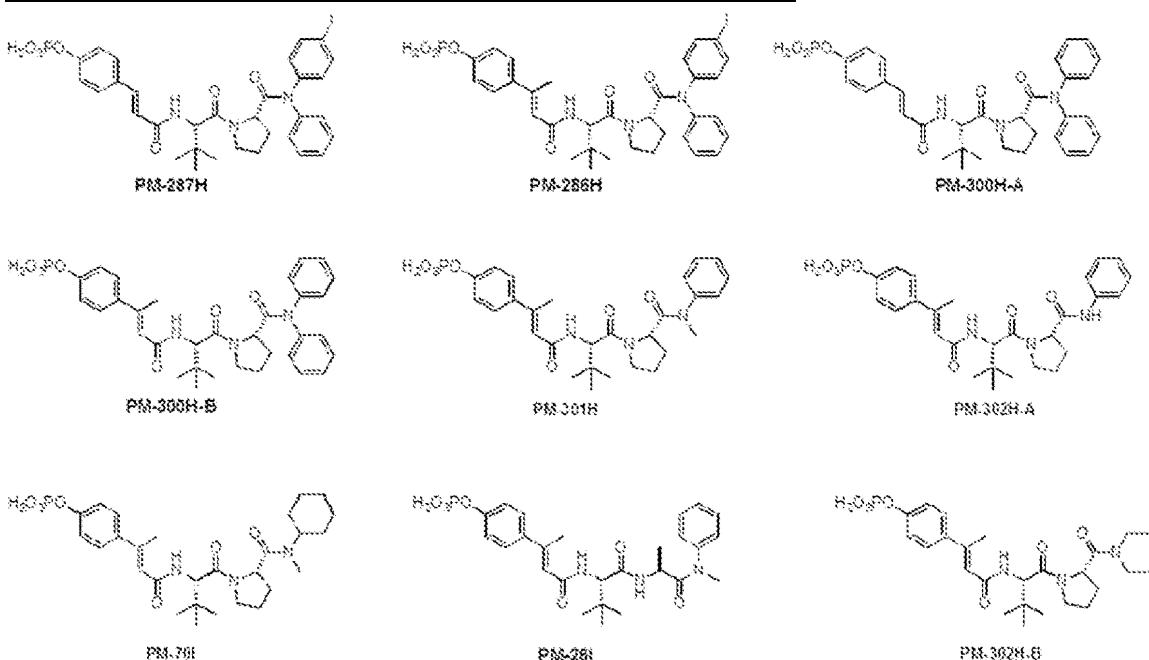


[本発明 1078]

PM-43Iまたはその薬学的に許容される塩である、本発明1077の化合物。

[本発明1079]

以下の式の化合物またはその薬学的に許容される塩：

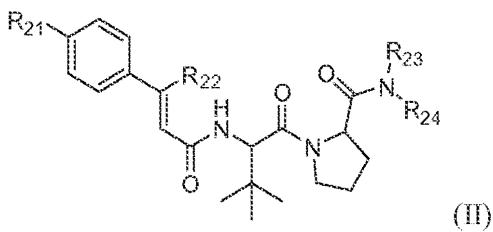


〔本発明1080〕

PM-287HまたはPM-300H-Aではない、本発明1079の化合物。

[本発明1081]

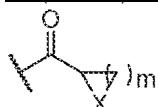
以下の式の化合物またはその薬学的に許容される塩：



式中、

R₂₁は、ホスフェート、-OP(O)(OR₁₀)(OR₁₀·)、-アルキル_(C₆)-P(O)(OR₁₀)(OR₁₀·)、または置換されたこれらのいずれかの基であり；ここで、

R₁₀およびR₁₀·はそれぞれ独立に、水素、アルキル_(C₆)、アリール_(C₈)、アラルキル_(C₁₂)、アルキル_(C₆)-O-C(O)-アルキル_(C₆)、アルキル_(C₆)-O-C(O)-アリール_(C₈)、または



であり；ここでm=0~8であり；ここでXは-CH₂-、-O-、-S-、または-NH-であり；ただしR₁₀およびR₁₀·は両方が水素ではないことを条件とし；

R₂₂は水素またはアルキル_(C₆)であり；

R₂₃は、水素、アルキル_(C₁₂)、置換アルキル_(C₁₂)、アリール_(C₁₂)、または置換アリール_(C₁₂)であり；

R₂₄はアリール_(C₁₂)または置換アリール_(C₁₂)であり；

ただしR₂₂が水素である場合、R₂₃およびR₂₄はフェニルまたはヨードフェニルではないことを条件とする。

[本発明1082]

R₂₁が-アルキル_(C₆)-P(O)(OR₁₀)(OR₁₀·)または置換-アルキル_(C₆)-P(O)(OR₁₀)(OR₁₀·)である、本発明1081の化合物。

[本発明1083]

R₂₁が-CF₂-P(O)(OCH₂OC(O)C(CH₃)₃)₂である、本発明1082の化合物。

[本発明1084]

R₂₂が水素である、本発明1081~1083のいずれかの化合物。

[本発明1085]

R₂₃がアリール_(C₁₂)である、本発明1081~1084のいずれかの化合物。

[本発明1086]

R₂₃がフェニルである、本発明1085の化合物。

[本発明1087]

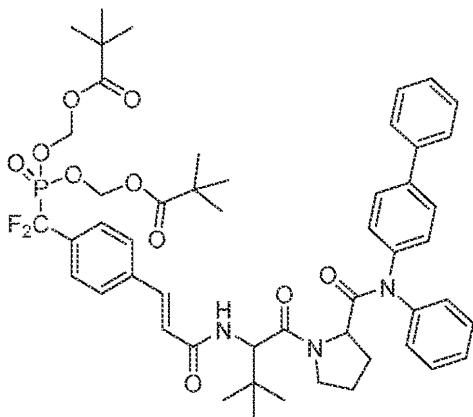
R₂₄がアリール_(C₈-C₁₂)である、本発明1081~1086のいずれかの化合物。

[本発明1088]

R₂₄がビフェニルである、本発明1087の化合物。

[本発明1089]

以下の式を有する本発明1081の化合物、またはその薬学的に許容される塩：



〔本発明1090〕

本発明1001～1089のいずれかの化合物および賦形剤を含む薬学的組成物。

[本発明1091]

経口、静脈内、鼻腔内、または吸入投与のために製剤化される、本発明1090の薬学的組成物。

[本発明1092]

ネブライザー、吸入器、または鼻噴霧器中に含まれる、本発明1091の薬学的組成物。

[本発明1093]

気管支拡張剤 (bronchodilator) をさらに含む、本発明1090～1092のいずれかの薬学的組成物。

[本発明1094]

気管支拡張剤が長時間作用型 2アゴニストである、本発明1093の薬学的組成物。

[本発明 1095]

対象のアレルギー疾患または炎症疾患を処置する方法であって、対象に対する本発明1001～1090のいずれかの化合物の治療的有効量を対象に投与する段階を含む、方法。

[本発明1096]

疾患が肺疾患である、本発明1095の方法。

[本発明1097]

肺疾患が喘息である、本発明1096の方法。

[本発明 1098]

肺疾患が気道過敏である、本発明1096の方法。

[本発明 1099]

肺疾患が、アレルギー疾患、アレルギー性鼻炎、肺気腫、慢性閉塞性肺疾患（COPD）、反応性気道疾患、または慢性鼻副鼻腔炎である、本発明1096の方法。

[本発明1100]

対象に第二の治療化合物を投与する段階をさらに含む、本発明1095の方法。

[本発明1101]

第二の治療化合物が、気管支拡張剤、抗炎症性ステロイド、抗ヒスタミン剤、または抗真菌抗生物質である、本発明1100の方法。

[本発明1102]

第二の治療化合物が気管支拡張剤であり、ここで気管支拡張剤は短時間作用型 -2アゴニスト、長時間作用型 2アゴニスト、または抗コリン作用薬である、本発明1101の方法

o

[本発明1103] 第二の治療化合物を前記化合物と同時にまたは並行して投与する、本発明1100～1102の

いずれかの方

本発明11041

[本発明1105]

対象においてSTAT6を阻害する方法であって、対象に対する本発明1001～1095のいずれかの化合物をSTAT6を阻害するのに有効な量で対象に投与する段階を含む方法。

本発明の他の目的、特徴および利点は、以下の詳細な説明から明らかになるであろう。しかし、詳細な説明および具体的な実施例は、本発明の好ましい態様を示しているが、この詳細な説明から当業者には本発明の精神および範囲内で様々な変更および改変が明らかになるとと考えられるため、例示のために示すにすぎないことが理解されるべきである。