

【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

C 0 7 F 9/553

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

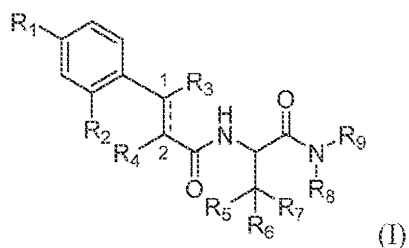
【補正方法】変更

【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：

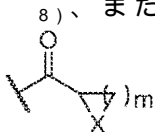


式中、

炭素1と2との間の結合は一重または二重結合であり；

R_1 はホスフェート、 $-OP(O)(OR_{10})(OR_{10'})$ 、 $-アルキル_{(C-6)}-P(O)(OR_{10})(OR_{10'})$ 、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 $_{(C-6)}$ 、アリール $_{(C-8)}$ 、アラルキル $_{(C-12)}$ 、 $-アルキル_{(C-6)}-O-C(O)-アルキル_{(C-6)}$ 、 $-アルキル_{(C-6)}-O-C(O)-アリール_{(C-8)}$ 、または



であり；ここで $m=0\sim 8$ であり；ここで X は $-CH_2-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、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_2 は水素であるか、または R_2 は以下に示すとおり R_{11} と一緒になり；

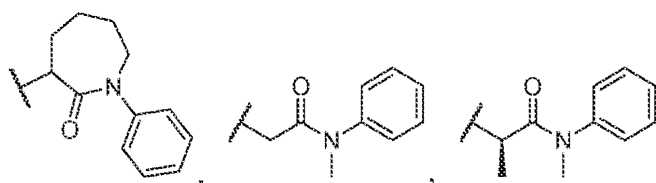
R_3 、 R_5 、 R_6 、および R_7 はそれぞれ独立に、水素、無置換アルキル $_{(C-6)}$ 、もしくは置換アルキル $_{(C-6)}$ であるか、または $(R_7$ および $R_8)$ は以下に示すとおり一緒になるか、または $(R_7$ 、 R_8 、および $R_9)$ は以下に示すとおり一緒になり；

R_4 は水素または $-N(R_{11})R_{12}$ であり；ここで、

R_{11} は、水素、アルキル $_{(C-6)}$ 、アリール $_{(C-8)}$ 、アシル $_{(C-6)}$ 、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 R_{11} は以下に示すとおり R_2 と一緒になり；

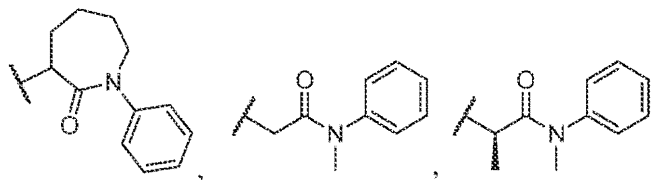
R_{12} は、水素、アルキル $_{(C-6)}$ 、アシル $_{(C-6)}$ であるか、または R_{12} は以下に示すとおり R_{11} と一緒になり；

R_8 は、水素、無置換アルキル $_{(C-6)}$ 、置換アルキル $_{(C-6)}$ 、無置換アリール $_{(C-8)}$ 、置換アリール $_{(C-8)}$ 、アミノ酸、 $-アルカンジイル_{(C-6)}-C(O)NX_1X_2$ 、 $-CH_2-C(O)NX_1X_2$ 、ここで、 X_1 および X_2 はそれぞれ独立に、アルキル $_{(C-6)}$ 、アリール $_{(C-12)}$ 、もしくは置換されたこれらのいずれかの基、



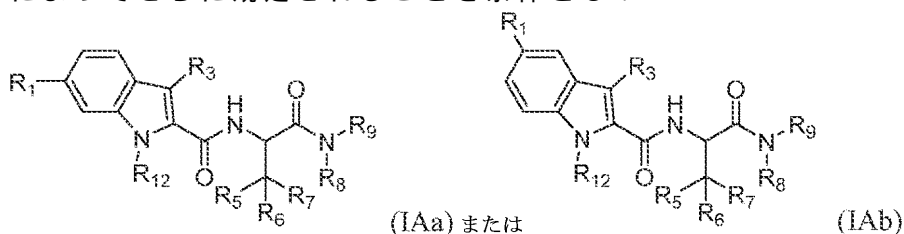
であるか、または R_8 は以下に示すとおり R_7 と一緒になるか、または R_8 は以下に示すとおり R_7 および R_9 と一緒になるか、または R_8 は以下に示すとおり R_9 と一緒になり；

R_9 は、水素、無置換アルキル(C_{6})、置換アルキル(C_{6})、無置換アリール(C_{8})、置換アリール(C_{8})、アミノ酸、-アルカンジイル(C_{6})- $C(O)NX_1X_2$ 、 $-CH_2-C(O)NX_1X_2$ 、ここで、 X_1 および X_2 はそれぞれ独立に、アルキル(C_{6})、アリール(C_{12})、もしくは置換されたこれらのいずれかの基、

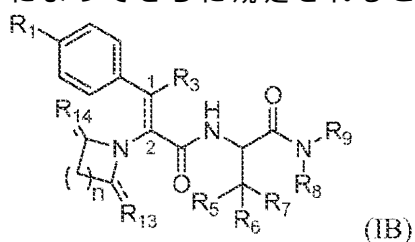


であるか、または R_9 は以下に示すとおり R_7 および R_8 と一緒になるか、または R_9 は以下に示すとおり R_8 と一緒になり；

ただし R_4 が $-N(R_{11})R_{12}$ であり、かつ(R_2 および R_{11})と一緒になる場合、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})と一緒になる場合、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；

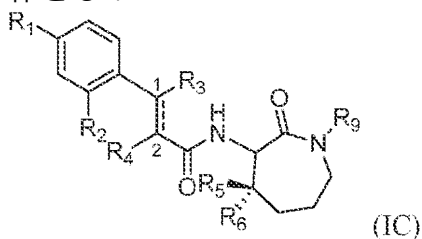


ここで、

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

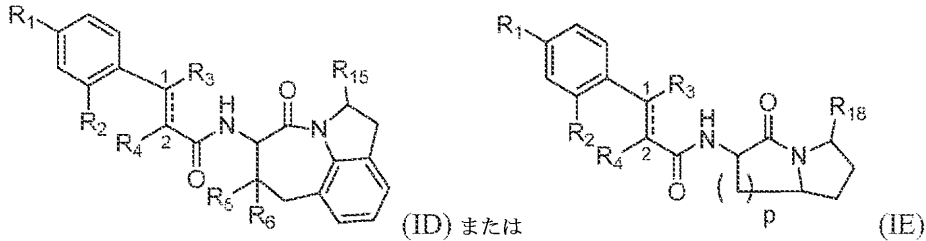
n は1、2、3、4、または5であり；

ただし R_7 および R_8 と一緒になる場合、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 と一緒になる場合、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：



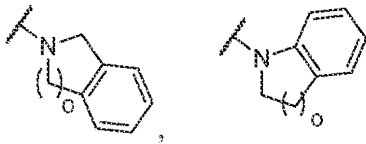
ここで、

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_(C 6)、アリール_(C 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_(C 6)-アリール_(C 8)、アラルキル_(C 12)、 $-C(O)$ -アルキル_(C 6)、 $-C(O)$ -ヘテロシクロアルキル_(C 12)、 $-C(O)$ -ヘテロアリール_(C 12)、



または $-C(O)NR_{19}R_{20}$ であり；

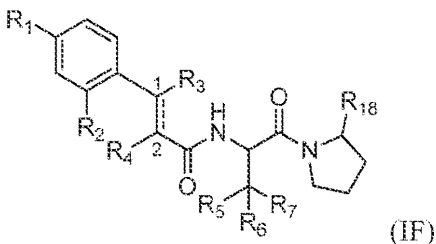
ここで、

R_{19} および R_{20} はそれぞれ独立に、水素、アルキル_(C 6)、アリール_(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 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_(C 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_(C 6)、アリール_(C 6)、もしくはアシル_(C 6) 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】

R_3 、 R_5 、 R_6 、および / または R_7 がアルキル (C_{1-6}) 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】

R_5 、 R_6 、および R_7 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】

R_8 が水素であるか、または R_8 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】

R_9 がアルキル (C_{1-6}) 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。

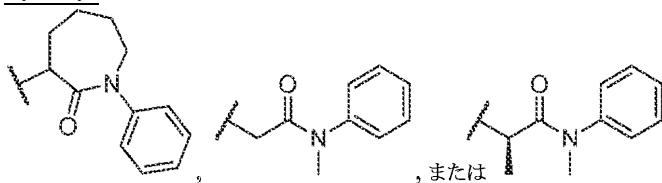
【請求項 12】

R_9 が

(a) ヘテロシクロアルキル (C_{1-12}) 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】

R_9 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】

R_{15} が $-C(O)NR_{16}R_{17}$ であるか、または R_{16} 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】

R_{16} がアルキル (C_{1-6}) である、請求項 14 記載の化合物。

【請求項 16】

R_{17} 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】

R_{17} がアリール (C_{1-8}) である、請求項 14 または 16 記載の化合物。

【請求項 18】

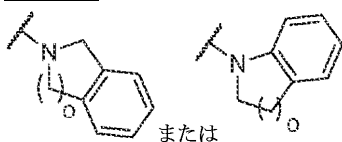
R_{18} が

(a) アルケンジイル (C_{1-6})-アリール (C_{1-8}) であるか、

(b) アラルキル (C_{1-12}) であるか、

(c) $-C(O)$ -ヘテロシクロアルキル (C_{1-12}) であるか

(d)



であるか

(e) $-C(O)NR_{19}R_{20}$ である、

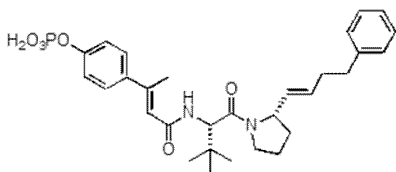
請求項1～9のいずれか一項記載の化合物。

【請求項 19】

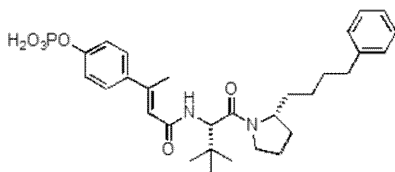
oが1、2または3である、請求項18記載の化合物。

【請求項 20】

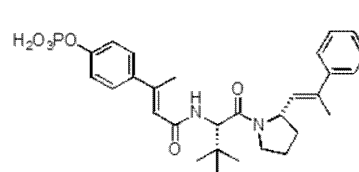
下記またはその薬学的に許容される塩としてさらに規定される、請求項1記載の化合物



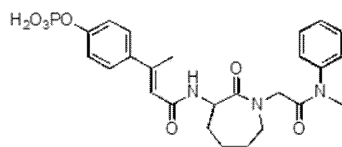
PM-9I



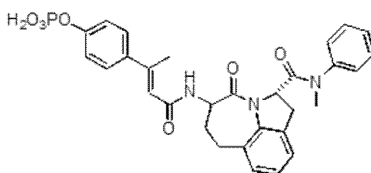
PM-10I



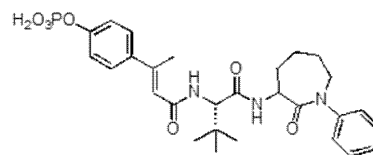
PM-15I



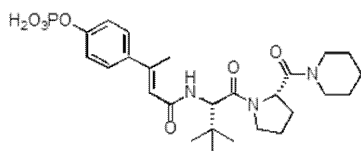
PM-28I



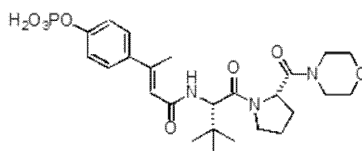
PM-34I



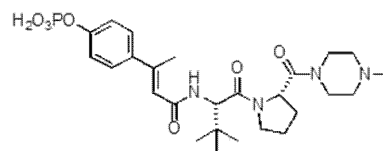
PM-60I



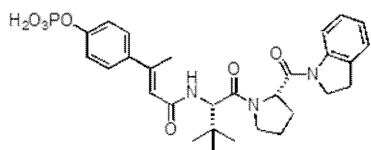
PM-67I-A



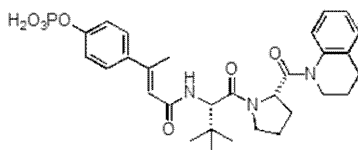
PM-67I-B



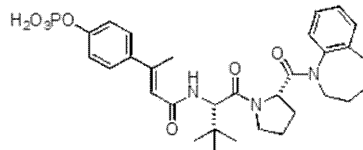
PM-67I-C



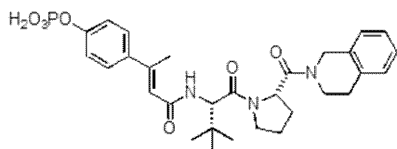
PM-59I



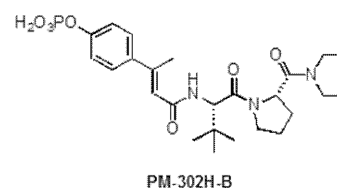
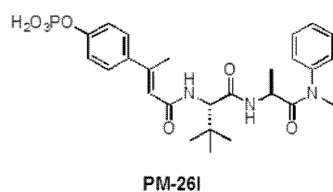
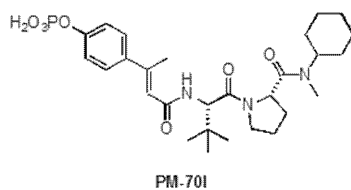
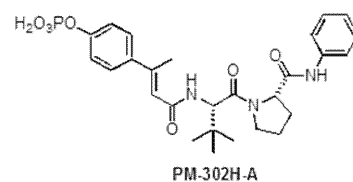
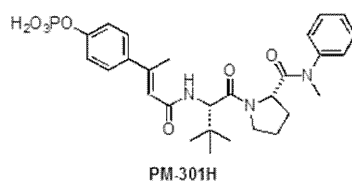
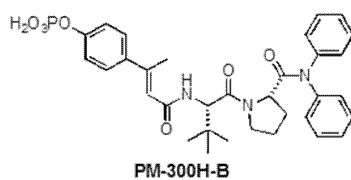
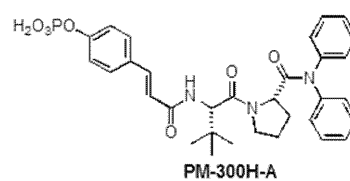
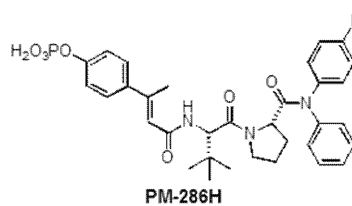
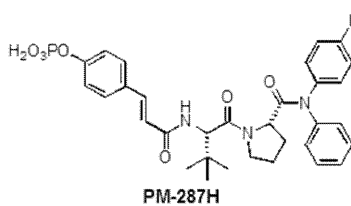
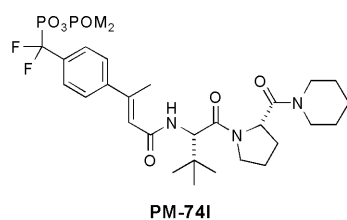
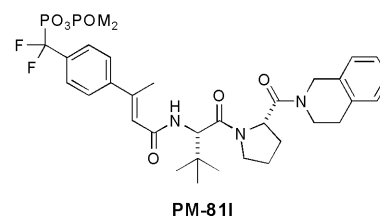
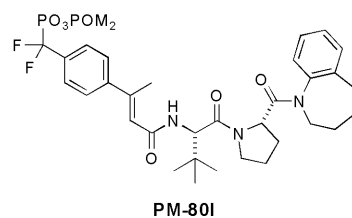
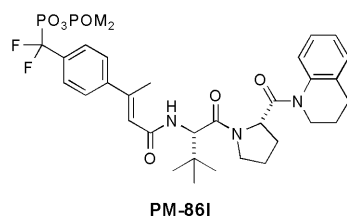
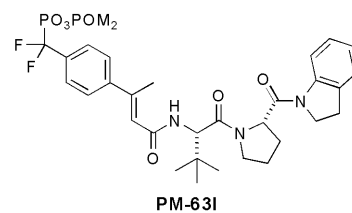
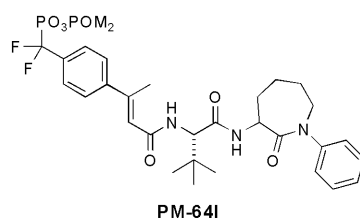
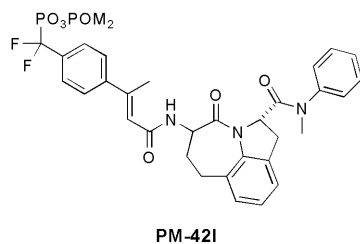
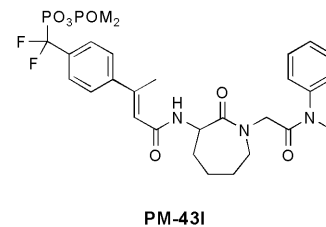
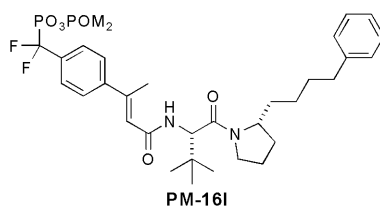
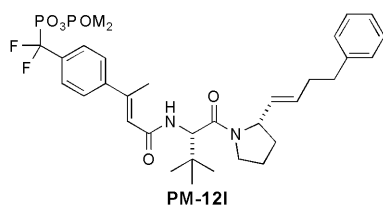
PM-87I



PM-71I-B



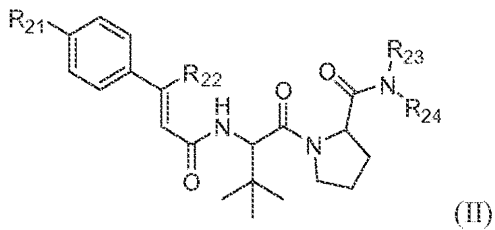
PM-71I-A



。

【請求項 2 1】

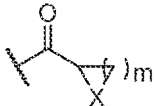
以下の式の化合物またはその薬学的に許容される塩：



式中、

R_{21} は、ホスフェート、 $-OP(O)(OR_{10})(OR_{10'})$ 、 $-アルキル_{(C-6)}-P(O)(OR_{10})(OR_{10'})$ 、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 $_{(C-6)}$ 、アリール $_{(C-8)}$ 、アラールキル $_{(C-12)}$ 、アルキル $_{(C-6)}-O-C(O)-アルキル_{(C-6)}$ 、アルキル $_{(C-6)}-O-C(O)-アリール_{(C-8)}$ 、または



であり；ここで $m = 0 \sim 8$ であり；ここで X は $-CH_2-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、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 $_{(C-6)}$ であり；

R_{23} は、水素、アルキル $_{(C-12)}$ 、置換アルキル $_{(C-12)}$ 、アリール $_{(C-12)}$ 、または置換アリール $_{(C-12)}$ であり；

R_{24} はアリール $_{(C-12)}$ または置換アリール $_{(C-12)}$ 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 22】

R_{21} が $-アルキル_{(C-6)}-P(O)(OR_{10})(OR_{10'})$ または置換-アルキル $_{(C-6)}-P(O)(OR_{10})(OR_{10'})$ である、請求項 21 記載の化合物。

【請求項 23】

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 24】

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 25】

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 26】

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の有効量を含む、薬学的組成物。

【請求項 27】

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 28】

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】0020

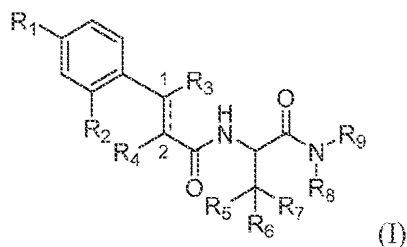
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0020】

[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：

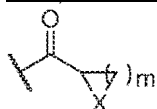


式中、

炭素1と2との間の結合は一重または二重結合であり；

R_1 はホスフェート、 $-OP(O)(OR_{10})(OR_{10})$ 、 $-アルキル_{(C-6)}-P(O)(OR_{10})(OR_{10})$ 、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 $_{(C-6)}$ 、アリール $_{(C-8)}$ 、アラルキル $_{(C-12)}$ 、 $-アルキル_{(C-6)}-O-C(O)-アルキル_{(C-6)}$ 、 $-アルキル_{(C-6)}-O-C(O)-アリール_{(C-8)}$ 、または



であり；ここで $m=0\sim 8$ であり；ここでXは $-CH_2-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、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_2 は水素であるか、または R_2 は以下に示すとおり R_{11} と一緒になり；

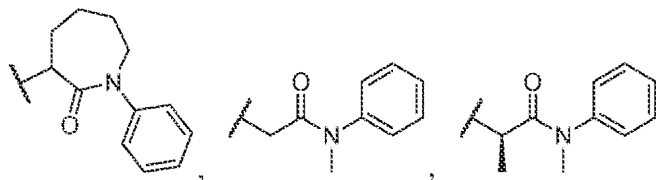
R_3 、 R_5 、 R_6 、および R_7 はそれぞれ独立に、水素、無置換アルキル $_{(C-6)}$ 、もしくは置換アルキル $_{(C-6)}$ であるか、または(R_7 および R_8)は以下に示すとおり一緒になるか、または(R_7 、 R_8 、および R_9)は以下に示すとおり一緒になり；

R_4 は水素または $-N(R_{11})R_{12}$ であり；ここで、

R_{11} は、水素、アルキル $_{(C-6)}$ 、アリール $_{(C-8)}$ 、アシル $_{(C-6)}$ 、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 R_{11} は以下に示すとおり R_2 と一緒になり；

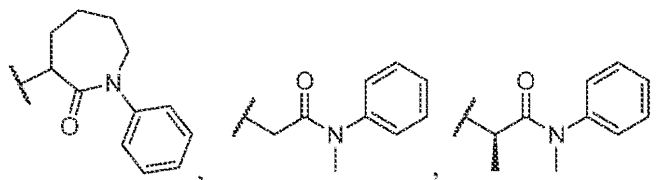
R_{12} は、水素、アルキル $_{(C-6)}$ 、アシル $_{(C-6)}$ であるか、または R_{12} は以下に示すとおり R_{11} と一緒になり；

R_8 は、水素、無置換アルキル $_{(C-6)}$ 、置換アルキル $_{(C-6)}$ 、無置換アリール $_{(C-8)}$ 、置換アリール $_{(C-8)}$ 、アミノ酸、 $-アルカンジイル_{(C-6)}-C(O)NX_1X_2$ 、 $-CH_2-C(O)NX_1X_2$ 、ここで、 X_1 および X_2 はそれぞれ独立に、アルキル $_{(C-6)}$ 、アリール $_{(C-12)}$ 、もしくは置換されたこれらのいずれかの基、



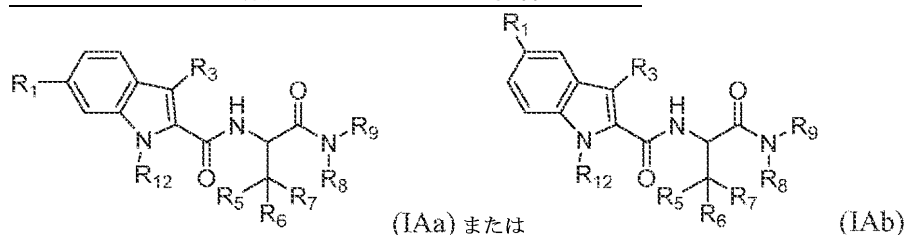
であるか、または R_8 は以下に示すとおり R_7 と一緒になるか、または R_8 は以下に示すとおり R_7 および R_9 と一緒になるか、または R_8 は以下に示すとおり R_9 と一緒になり；

R_9 は、水素、無置換アルキル $_{(C-6)}$ 、置換アルキル $_{(C-6)}$ 、無置換アリール $_{(C-8)}$ 、置換アリール $_{(C-8)}$ 、アミノ酸、 $-アルカンジイル_{(C-6)}-C(O)NX_1X_2$ 、 $-CH_2-C(O)NX_1X_2$ 、ここで、 X_1 および X_2 はそれぞれ独立に、アルキル $_{(C-6)}$ 、アリール $_{(C-12)}$ 、もしくは置換されたこれらのいずれかの基、

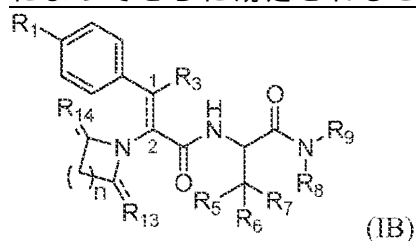


であるか、または R_9 は以下に示すとおり R_7 および R_8 と一緒になるか、または R_9 は以下に示すとおり R_8 と一緒になり；

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：

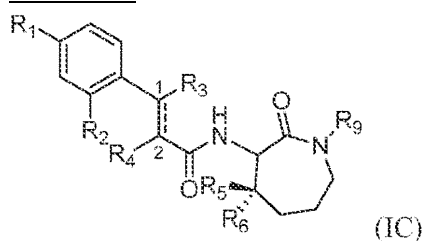


ここで、

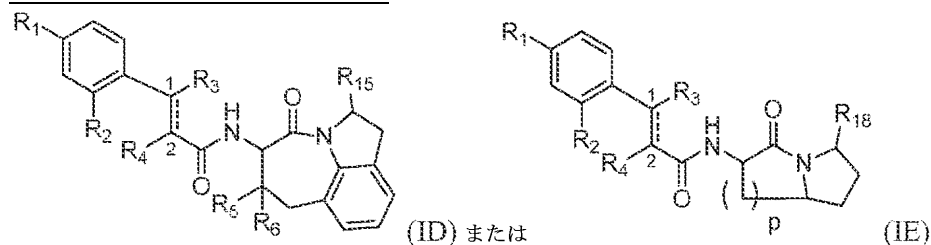
R_{13} および R_{14} はそれぞれ独立に水素またはオキソであり；かつ

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：



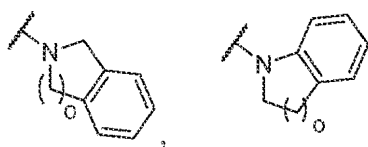
ここで、

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 (C_{6}) 、アリール (C_{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 (C_{6}) -アリール (C_{8}) 、アラルキル (C_{12}) 、 $-C(O)$ -アルキル (C_{6}) 、 $-C(O)$ -ヘテロシクロアルキル (C_{12}) 、 $-C(O)$ -ヘテロアリール (C_{12}) 、



または $-C(O)NR_{19}R_{20}$ であり；

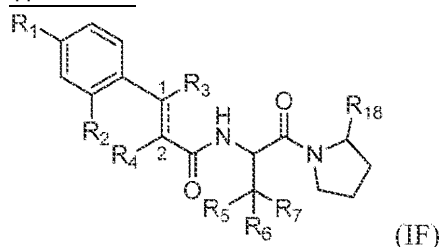
ここで、

R_{19} および R_{20} はそれぞれ独立に、水素、アルキル_(C₆)、アリール_(C₈)、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_(C₈)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_(C₈)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 $-CF_2-P(O)(OR_{10})(OR_{10})$ 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} 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} 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]

R_3 が水素である、本発明1001～1015のいずれかの化合物。

[本発明1017]

R_3 がアルキル_(C₆)である、本発明1001～1015のいずれかの化合物。

[本発明1018]

R_3 がメチルである、本発明1017の化合物。

[本発明1019]

R_4 が水素である、本発明1001～1018のいずれかの化合物。

[本発明1020]

R_4 が $-N(R_{11})R_{12}$ である、本発明1001～1018のいずれかの化合物。

[本発明1021]

R_{11} が水素である、本発明1020の化合物。

[本発明1022]

R_{12} が水素である、本発明1020の化合物。

[本発明1023]

R_{12} がアルキル_(C₆)である、本発明1020の化合物。

[本発明1024]

R_{12} がアリール_(C₆)である、本発明1020の化合物。

[本発明1025]

R_{12} がアシル_(C₆)である、本発明1020の化合物。

[本発明1026]

R_{13} が水素である、本発明1004の化合物。

[本発明1027]

R_{13} がオキソである、本発明1004の化合物。

[本発明1028]

R_{14} 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]

R_{14} 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]

R_5 が水素である、本発明1001～1032のいずれかの化合物。

[本発明1034]

R_5 がアルキル_(C₆)である、本発明1001～1032のいずれかの化合物。

[本発明1035]

R_5 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]

R_6 が水素である、本発明1001～1035のいずれかの化合物。

[本発明1037]

R_6 がアルキル_(C₆)である、本発明1001～1035のいずれかの化合物。

[本発明1038]

R_6 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]

R_7 がアルキル_(C₆)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]

R_7 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]

R_5 、 R_6 、および R_7 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]

R_5 、 R_6 、および R_7 が水素である、本発明1041の化合物。

[本発明1043]

R_5 、 R_6 、および R_7 がメチルである、本発明1041の化合物。

[本発明1044]

R_8 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]

R_8 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]

R_9 がアルキル(C_{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]

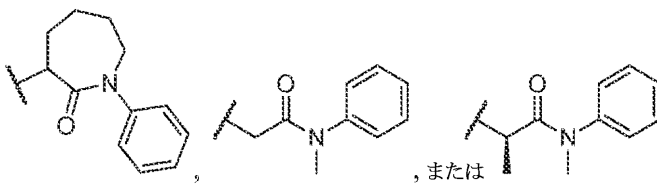
R_9 がヘテロシクロアルキル(C_{12})である、本発明1001～1004および1010～1044のいずれかの化合物。

[本発明1048]

R_9 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]

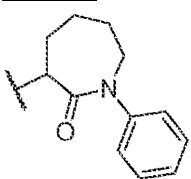
R_9 が



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]

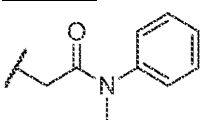
R_9 が



である、本発明1049の化合物。

[本発明1051]

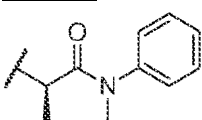
R_9 が



である、本発明1049の化合物。

[本発明1052]

R_9 が



である、本発明1049の化合物。

[本発明1053]

R_9 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]

R_{15} が $-C(O)NR_{16}R_{17}$ 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]

R_{16} 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]

R_{16} がアルキル (C_{6}) である、本発明1054～1055のいずれかの化合物。

[本発明1057]

R_{16} がメチルである、本発明1056の化合物。

[本発明1058]

R_{17} 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]

R_{17} がアリール (C_{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]

R_{17} がフェニルである、本発明1059の化合物。

[本発明1061]

R_{18} がアルケンジイル (C_{6})-アリール (C_{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]

R_{18} が $-C(H)C(H)CH_2CH_2C_6H_5$ または $-C(H)C(CH_3)C_6H_5$ である、本発明1061の化合物。

[本発明1063]

R_{18} がアラルキル (C_{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]

R_{18} が $-(CH_2)_4-C_6H_5$ である、本発明1063の化合物。

[本発明1065]

R_{18} が $-C(O)$ -ヘテロシクロアルキル (C_{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]

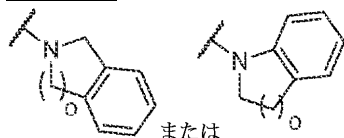
ヘテロシクロアルキルが、ピペリジン、N-メチルピペラジン、およびモルホリンから選択される、本発明1065の化合物。

[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]

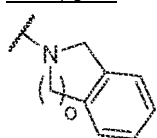
R_{18} が



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

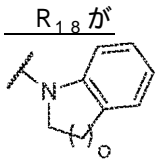
[本発明1069]

R_{18} 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]

R_{18} が $-C(O)NR_{19}R_{20}$ 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]

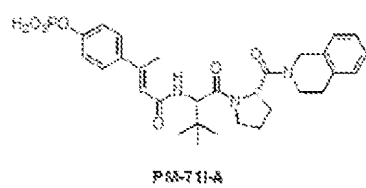
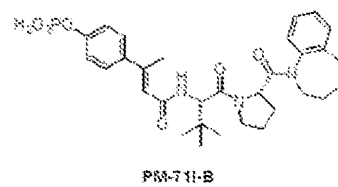
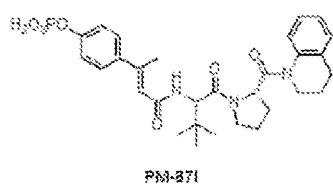
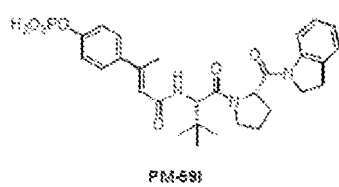
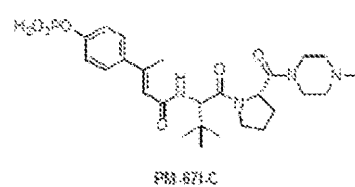
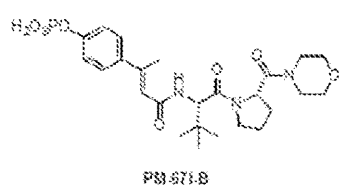
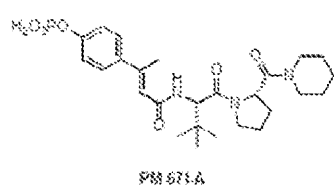
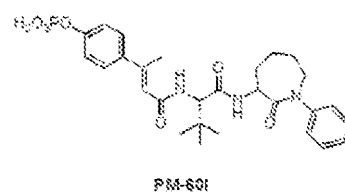
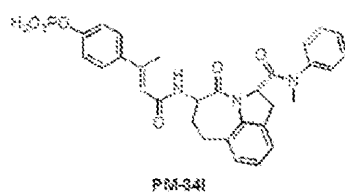
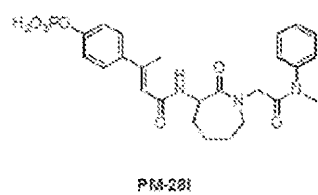
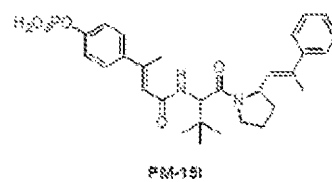
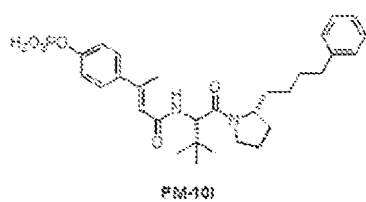
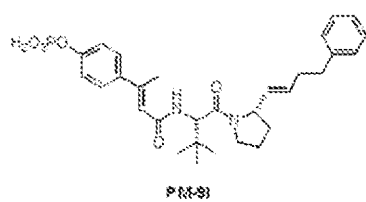
R_{19} がカルボニルに対してトランスである、本発明1074の化合物。

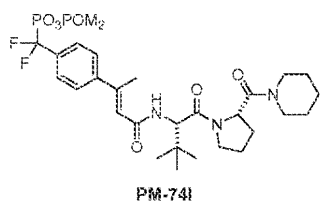
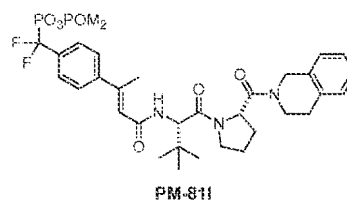
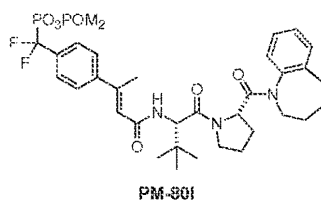
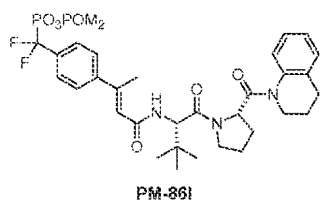
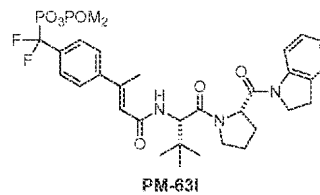
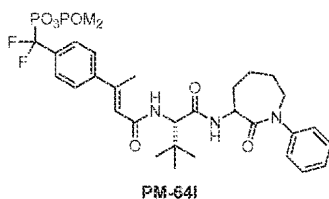
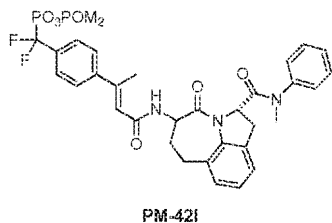
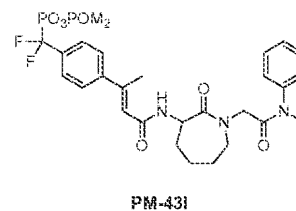
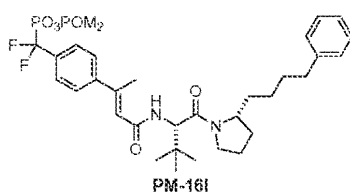
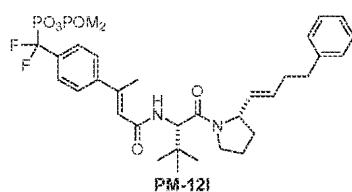
[本発明1076]

R_{20} 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：





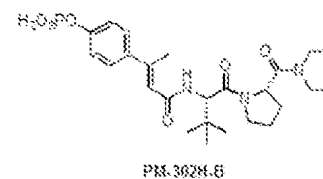
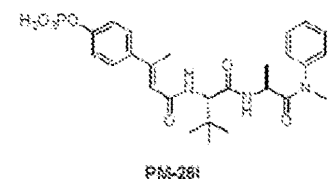
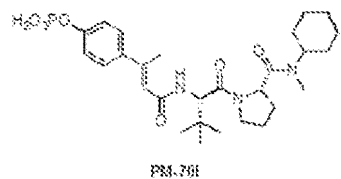
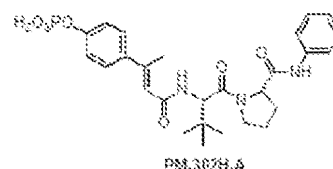
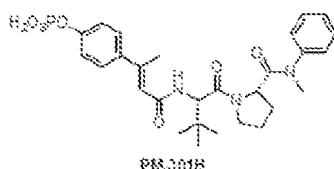
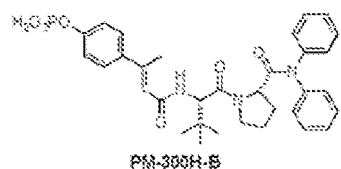
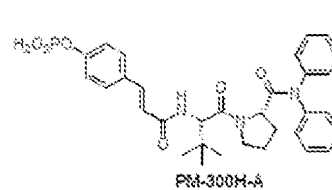
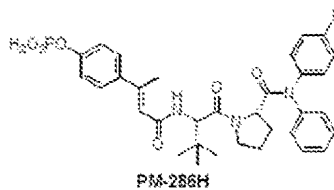
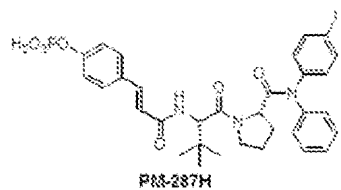
○

[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：



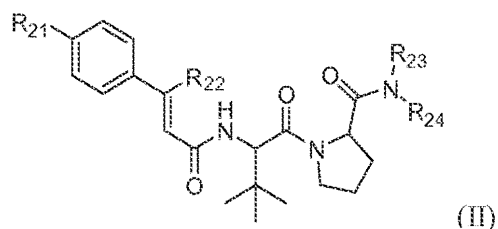
○

[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]

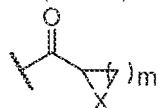
以下の式の化合物またはその薬学的に許容される塩：



式中、

R_{21} は、ホスフェート、 $-OP(O)(OR_{10})(OR_{10'})$ 、 $-アルキル_{(C-6)}-P(O)(OR_{10})(OR_{10'})$ 、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 $_{(C-6)}$ 、アリール $_{(C-8)}$ 、アラルキル $_{(C-12)}$ 、アルキル $_{(C-6)}-O-C(O)-アルキル_{(C-6)}$ 、アルキル $_{(C-6)}-O-C(O)-アリール_{(C-8)}$ 、または



であり；ここで $m=0\sim 8$ であり；ここで X は $-CH_2-$ 、 $-O-$ 、 $-S-$ 、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 $_{(C-6)}$ であり；

R_{23} は、水素、アルキル $_{(C-12)}$ 、置換アルキル $_{(C-12)}$ 、アリール $_{(C-12)}$ 、または置換アリール $_{(C-12)}$ であり；

R_{24} はアリール $_{(C-12)}$ または置換アリール $_{(C-12)}$ 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。

[本発明1082]

R_{21} が $-アルキル_{(C-6)}-P(O)(OR_{10})(OR_{10'})$ または置換-アルキル $_{(C-6)}-P(O)(OR_{10})(OR_{10'})$ である、本発明1081の化合物。

[本発明1083]

R_{21} が $-CF_2-P(O)(OCH_2OC(O)C(CH_3)_3)_2$ である、本発明1082の化合物。

[本発明1084]

R_{22} が水素である、本発明1081～1083のいずれかの化合物。

[本発明1085]

R_{23} がアリール $_{(C-12)}$ である、本発明1081～1084のいずれかの化合物。

[本発明1086]

R_{23} がフェニルである、本発明1085の化合物。

[本発明1087]

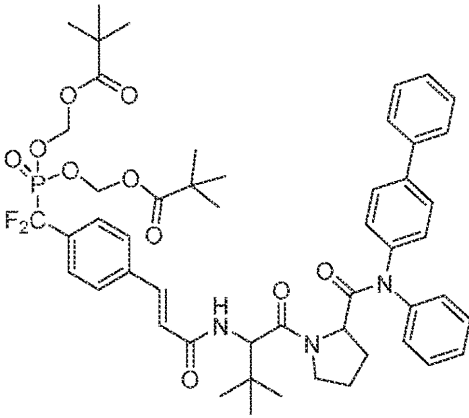
R_{24} がアリール $_{(C8-C12)}$ である、本発明1081～1086のいずれかの化合物。

[本発明1088]

R_{24} 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。

。

[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のいずれかの方法。

[本発明1104]

第二の治療薬を前記化合物に続いて投与する、本発明1100～1102のいずれかの方法。

[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。