

【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23年10月27日(2011.10.27)

【公表番号】特表2010-540569(P2010-540569A)

【公表日】平成22年12月24日(2010.12.24)

【年通号数】公開・登録公報2010-051

【出願番号】特願2010-527296(P2010-527296)

【国際特許分類】

C 0 7 C 217/22 (2006.01)
 A 6 1 P 29/00 (2006.01)
 A 6 1 P 37/06 (2006.01)
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)
 A 6 1 P 3/10 (2006.01)
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)
 C 0 7 D 295/08 (2006.01)
 A 6 1 K 31/5375 (2006.01)
 A 6 1 K 31/13 (2006.01)
 C 0 7 D 213/30 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4422 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4453 (2006.01)
 C 0 7 D 211/38 (2006.01)
 A 6 1 K 31/445 (2006.01)
 C 0 7 D 207/10 (2006.01)
 A 6 1 K 31/40 (2006.01)
 C 0 7 D 211/46 (2006.01)
 C 0 7 D 211/44 (2006.01)
 C 0 7 D 241/18 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4965 (2006.01)
 C 0 7 D 249/04 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4196 (2006.01)
 C 0 7 D 205/04 (2006.01)
 A 6 1 K 31/397 (2006.01)
 A 6 1 K 31/54 (2006.01)
 C 0 7 D 205/06 (2006.01)
 C 0 7 D 233/60 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4164 (2006.01)
 C 0 7 D 265/30 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 217/22 C S P
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 43/00 1 1 1
 C 0 7 D 295/08 Z
 A 6 1 K 31/5375
 A 6 1 K 31/13
 C 0 7 D 213/30
 A 6 1 K 31/4422

A 6 1 K 31/4453
 C 0 7 D 211/38
 A 6 1 K 31/445
 C 0 7 D 207/10
 A 6 1 K 31/40
 C 0 7 D 211/46
 C 0 7 D 211/44
 C 0 7 D 241/18
 A 6 1 K 31/4965
 C 0 7 D 249/04 5 0 3
 A 6 1 K 31/4196
 C 0 7 D 205/04
 A 6 1 K 31/397
 A 6 1 K 31/54
 C 0 7 D 205/06
 C 0 7 D 233/60
 A 6 1 K 31/4164
 C 0 7 D 265/30

【手続補正書】

【提出日】平成23年9月9日(2011.9.9)

【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

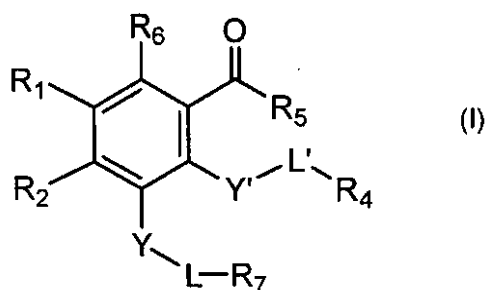
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物またはその塩：

【化1】



式中、

R_1 および R_2 は、水素、シアノ、ハロ、ニトロ、随意に置換された低級アルキル、随意に置換されたアリール、 $-OR$ 、 $-C(O)R$ 、 $-C(O)OR$ 、 $-OC(O)R$ (R は、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換された $C_3 - 7$ シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、および随意に置換されたアリールから選択される)、 $-C(O)NR'R''$ 、 $-NR'C(O)R''$ および $-NR'R''$ (R' および R'' は、水素または低級アルキルから独立して選択される) から独立して選択され、ならびに

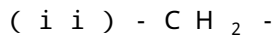
R_1 および R_2 の少なくとも一方は、水素以外であり；

R_6 は、シアノ、ハロ、ニトロ、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたヘテ

ロアリアル、随意に置換された C_{3-7} シクロアルキル、随意に置換された C_{4-7} シクロアルケニル、 $-OR$ 、 $-SR$ 、 $-C(O)R$ 、 $-C(O)OR$ 、 $-OC(O)R$ (R は、水素、随意に置換された低級アルキル、低級アルケニル、低級アルキニル、随意に置換された C_{3-7} シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリアル、および随意に置換されたアリアルから選択される)、 $-C(O)NR'R'$ 、 $-NR'C(O)R''$ および $-NR'R''$ (R' および R'' は、水素または低級アルキルから独立して選択される) から選択され;

L は、随意に置換された C_{2-6} アルキレン、随意に置換された C_{2-6} アルケニレン、または随意に置換された C_{2-6} アルキニレンから選択される原子数 2 - 6 の長さの二価リンカー基であり;

L' は、(i) 随意に置換された C_{2-6} アルキレン、随意に置換された C_{2-6} アルケニレン、もしくは随意に置換された C_{2-6} アルキニレンから選択される原子数 2 - 6 の長さの二価リンカー基; または



であり;

Y は、単結合、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NR'''-$ 、 $-C(O)NR'''-$ 、または $-NR'''C(O)-$ (R''' は、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換された C_{3-7} シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリアル、および随意に置換されたアリアルから選択される) から選択され;

Y' は、単結合、 $-O-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-S-$ 、 $-NR'''-$ 、 $-C(O)NR'''-$ 、または $-NR'''C(O)-$ (R''' は、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換された C_{3-7} シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリアル、および随意に置換されたアリアルから選択される) から選択され;

R_5 は、随意に置換されたアルキル、 $-OR$ 、 $-C(O)R$ 、 $-C(O)OR$ 、 SR 、(R は、随意に置換された C_{2-7} アルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換された C_{3-7} シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、および随意に置換されたアリアルから選択され)、 $-C(O)NR'R'$ 、 $-NR'C(O)R''$ および $-NR'R''$ (R' および R'' は、水素または低級アルキルから独立して選択される) から選択され;

R_4 は、置換アリアル、置換アリアルオキシ、随意に置換されたヘテロアリアル、随意に置換されたヘテロアリアルオキシ、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロシクリルオキシまたは $-NR''''R''''$ (R'''' は、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換された C_{3-7} シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリアル、および随意に置換されたアリアルから選択され、ならびに R'''' は、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換された C_{3-7} シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリアル、および随意に置換されたアリアルから選択される) から選択され; ならびに

R_7 は、随意に置換されたアリアル、随意に置換されたアリアルオキシ、随意に置換されたヘテロアリアル、随意に置換されたヘテロアリアルオキシ、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロシクリルオキシまたは $-NHR''''$ (R'''' は、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換された C_{3-7} シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリアル、および随意に置換されたアリアルから選択される) から選択される。

【請求項 2】

R_1 および R_2 が、シアノ、ハロ、ニトロ、随意に置換された低級アルキル、随意に置

換されたアリアル、-OR、-C(O)R、-C(O)OR、-OC(O)R (Rは、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたC₃-₇シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリアル、および随意に置換されたアリアルから選択される)、-C(O)NR'R''、-NR'C(O)R''および-NR'R'' (R'およびR''は、水素または低級アルキルから独立して選択される)から独立して選択される、請求項1に記載の化合物またはその塩。

【請求項3】

R₁およびR₂が、水素、シアノ、ハロ、随意に置換された低級アルキル、-O-随意に置換された低級アルキル、-C(O)-随意に置換された低級アルキル、および-C(O)NR'R'' (R'およびR''は、水素または低級アルキルから独立して選択される)から独立して選択される、請求項1に記載の化合物またはその塩。

【請求項4】

R₆が、シアノ、ハロ、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたヘテロアリアル、随意に置換されたC₃-₇シクロアルキル、-O-随意に置換された低級アルキル、-O-随意に置換されたC₃-₇シクロアルキル、または-O-随意に置換されたヘテロアリアルから選択される、請求項1から3のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項5】

R₆が、ハロ、随意に置換されたアルキル、または-O-随意に置換された低級アルキルから選択される、請求項4に記載の化合物またはその塩。

【請求項6】

Lは、C₂-₆アルキレン、C₂-₆アルケニレン、またはC₂-₆アルキニレンから選択され、これらのそれぞれが低級アルキル基により随意に置換されていてもよい、原子数2-6の長さの二価リンカー基である、請求項1から5のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項7】

L'が、C₁-₆アルキレン、C₂-₆アルケニレン、またはC₂-₆アルキニレンから選択される原子数1-6の長さの二価リンカー基である、請求項1から6のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項8】

R₇が、随意に置換されたアリアル、随意に置換されたアリアルオキシ、随意に置換されたヘテロアリアル、随意に置換されたヘテロアリアルオキシ、随意に置換されたヘテロシクリル、または随意に置換されたヘテロシクリルオキシから選択される、請求項1から7のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項9】

R₇が、随意に置換されたアリアルである、請求項8に記載の化合物またはその塩。

【請求項10】

Y'が、Oである、請求項1から9のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

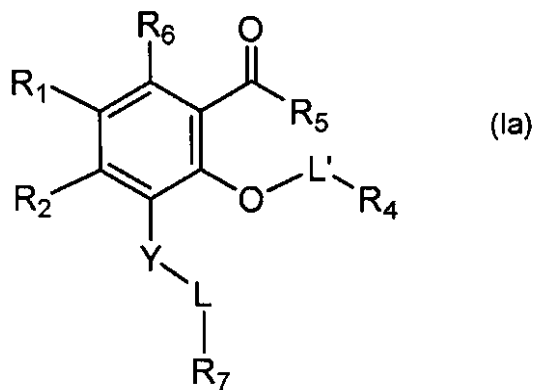
【請求項11】

Y'が、Oであり、およびYが、単結合またはOである、請求項1から10のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項12】

式(Ia)の化合物またはその塩：

【化 2】



式中、

R_1 および R_2 は、水素、シアノ、ハロ、ニトロ、随意に置換された低級アルキル、随意に置換されたアリール、 $-OR$ 、 $-C(O)R$ 、 $-C(O)OR$ 、 $-OC(O)R$ (R は、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換された $C_3 - 7$ シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、および随意に置換されたアリールから選択される)、 $-C(O)NR'R''$ 、 $-NR'C(O)R''$ および $-NR'R''$ (R' および R'' は、水素または低級アルキルから独立して選択される) から独立して選択され、ならびに

R_1 および R_2 の少なくとも一方は、水素以外であり；

R_6 は、シアノ、ハロ、ニトロ、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換された $C_3 - 7$ シクロアルキル、随意に置換された $C_4 - 7$ シクロアルケニル、 $-OR$ 、 $-SR$ 、 $-C(O)R$ 、 $-C(O)OR$ 、 $-OC(O)R$ (R は、水素、低級アルキル、低級アルケニル、低級アルキニル、随意に置換された $C_3 - 7$ シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、および随意に置換されたアリールから選択される)、 $-C(O)NR'R''$ 、 $-NR'C(O)R''$ および $-NR'R''$ (この場合、 R' および R'' は、水素または低級アルキルから独立して選択される) から選択され；

L は、随意に置換された $C_2 - 6$ アルキレン、随意に置換された $C_2 - 6$ アルケニレン、または随意に置換された $C_2 - 6$ アルキニレンから選択される原子数 2 - 6 の長さの二価リンカー基であり；

L' は、 $C_1 - 6$ アルキレン、 $C_2 - 6$ アルケニレン、または $C_2 - 6$ アルキニレンから選択される原子数 1 - 6 の長さの二価リンカー基であり；

Y は、単結合、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NR'''$ 、 $-C(O)NR'''$ 、または $-NR'''C(O)-$ (R''' は、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換された $C_3 - 7$ シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、および随意に置換されたアリールから選択される) から選択され；

R_5 は、随意に置換されたアルキル、 $-OR$ 、 $-C(O)R$ 、 $-C(O)OR$ 、 SR 、(R は、随意に置換された $C_2 - 7$ アルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換された $C_3 - 7$ シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、および随意に置換されたアリールから選択され)、 $-C(O)NR'R''$ 、 $-NR'C(O)R''$ および $-NR'R''$ (この場合、 R' および R'' は、水素または低級アルキルから独立して選択される) から選択され；

R_4 は、置換アリール、置換アリールオキシ、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換されたヘテロアリールオキシ、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロシクリルオキシまたは $-NR''''R''''$ (R'''' は、水素、随意に置換されたアル

キル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換された C_{3-7} シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、および随意に置換されたアリールから選択され、ならびに R'''' は、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換された C_{3-7} シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、および随意に置換されたアリールから選択される) から選択され; ならびに

R_7 は、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアリーロキシ、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換されたヘテロアリーロキシ、随意に置換されたヘテロシクリルまたは随意に置換されたヘテロシクリロキシから選択される。

【請求項 13】

R_1 および R_2 が、シアノ、ハロ、ニトロ、随意に置換された低級アルキル、随意に置換されたアリール、 $-OR$ 、 $-C(O)R$ 、 $-C(O)OR$ 、 $-OC(O)R$ (R は、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換された C_{3-7} シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、および随意に置換されたアリールから選択される)、 $-C(O)NR'R''$ 、 $-NR'C(O)R''$ および $-NR'R''$ (R' および R'' は、水素または低級アルキルから独立して選択される) から独立して選択される、請求項 12 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 14】

R_1 および R_2 が、水素、シアノ、ハロ、随意に置換された低級アルキル、 $-O$ - 随意に置換された低級アルキル、 $-C(O)$ - 随意に置換された低級アルキル、および $-C(O)NR'R''$ (R' および R'' は、水素または低級アルキルから独立して選択される) から独立して選択される、請求項 12 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 15】

R_1 および R_2 が、シアノ、ハロ、随意に置換された低級アルキル、 $-OH$ 、 $-O$ - 随意に置換された低級アルキル、 $-C(O)$ - 随意に置換された低級アルキル、および $-C(O)NR'R''$ (R' および R'' は、水素または低級アルキルから独立して選択される) から独立して選択される、請求項 12 から 14 のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 16】

R_6 が、シアノ、ハロ、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換された C_{3-7} シクロアルキル、 $-O$ - 随意に置換された低級アルキル、 $-O$ - 随意に置換された C_{3-7} シクロアルキル、または $-O$ - 随意に置換されたヘテロアリールから選択される、請求項 12 から 15 のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 17】

R_6 が、ハロ、随意に置換されたアルキル、または $-O$ - 随意に置換された低級アルキルから選択される、請求項 16 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 18】

L は、 C_{2-6} アルキレン、 C_{2-6} アルケニレン、または C_{2-6} アルキニレンから選択され、これらのそれぞれが、低級アルキル基により随意に置換されていてもよい、原子数 2 - 6 の長さの二価リンカー基である、請求項 12 から 17 のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 19】

L' が、 C_{1-6} アルキレン、 C_{2-6} アルケニレン、または C_{2-6} アルキニレンから選択される原子数 1 - 6 の長さの二価リンカー基である、請求項 12 から 18 のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 20】

R_7 が、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアリーロキシ、随意に置換さ

れたヘテロアリール、随意に置換されたヘテロアリールオキシ、随意に置換されたヘテロシクリル、または随意に置換されたヘテロシクリルオキシから選択される、請求項 1 2 から 1 9 のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 2 1】

R_7 が、随意に置換されたアリールである、請求項 2 0 に記載の化合物またはその塩。

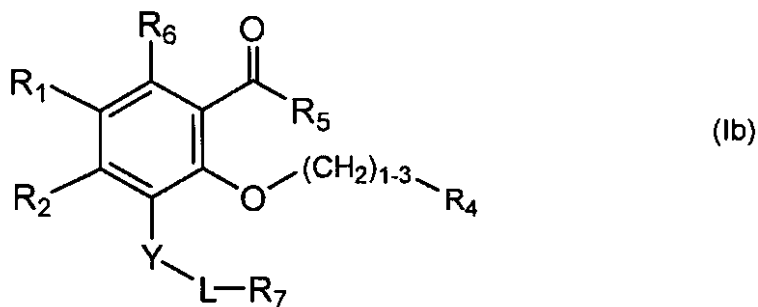
【請求項 2 2】

Y が、単結合または O である、請求項 1 2 から 2 1 のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 2 3】

式 (I b) の化合物またはその塩：

【化 3】



式中、

R_1 および R_2 は、水素、シアノ、ハロ、ニトロ、随意に置換された低級アルキル、随意に置換されたアリール、 $-OR$ 、 $-C(O)R$ 、 $-C(O)OR$ 、 $-OC(O)R$ (この場合、 R は、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換された $C_3 - 7$ シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、および随意に置換されたアリールから選択される)、 $-C(O)NR'R''$ 、 $-NR'C(O)R''$ および $-NR'R''$ (この場合、 R' および R'' は、水素または低級アルキルから独立して選択される) から独立して選択され、ならびに

R_1 および R_2 の少なくとも一方は、水素以外であり；

R_6 は、シアノ、ハロ、ニトロ、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換された $C_3 - 7$ シクロアルキル、随意に置換された $C_4 - 7$ シクロアルケニル、 $-OR$ 、 $-SR$ 、 $-C(O)R$ 、 $-C(O)OR$ 、 $-OC(O)R$ (この場合、 R は、水素、低級アルキル、低級アルケニル、低級アルキニル、随意に置換された $C_3 - 7$ シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、および随意に置換されたアリールから選択される)、 $-C(O)NR'R''$ 、 $-NR'C(O)R''$ および $-NR'R''$ (この場合、 R' および R'' は、水素または低級アルキルから独立して選択される) から選択され；

L は、随意に置換された $C_2 - 6$ アルキレン、随意に置換された $C_2 - 6$ アルケニレン、または随意に置換された $C_2 - 6$ アルキニレンから選択される原子数 2 - 6 の長さの二価リンカー基であり；

Y は、単結合、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NR'''-$ 、 $-C(O)NR'''-$ 、または $-NR'''C(O)-$ (この場合、 R''' は、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換された $C_3 - 7$ シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、および随意に置換されたアリールから選択される) から選択され；

R_5 は、随意に置換されたアルキル、 $-OR$ 、 $-C(O)R$ 、 $-C(O)OR$ 、 SR 、(この場合、 R は、随意に置換された $C_2 - 7$ アルキル、随意に置換されたアルケニル、

随意に置換されたアルキニル、随意に置換された $C_3 - 7$ シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、および随意に置換されたアリールから選択され)、 $-C(O)NR'R''$ 、 $-NR'C(O)R''$ および $-NR'R''$ (この場合、 R' および R'' は、水素または低級アルキルから独立して選択される)から選択され;

R_4 は、置換アリール、置換アリールオキシ、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換されたヘテロアリールオキシ、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロシクリルオキシまたは $-NR'''R''''$ (この場合、 R''' は、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換された $C_3 - 7$ シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、および随意に置換されたアリールから選択され、ならびに R'''' は、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換された $C_3 - 7$ シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、および随意に置換されたアリールから選択される)から選択され;ならびに

R_7 は、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアリールオキシ、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換されたヘテロアリールオキシ、随意に置換されたヘテロシクリルまたは随意に置換されたヘテロシクリルオキシから選択される。

【請求項24】

R_1 および R_2 が、シアノ、ハロ、ニトロ、随意に置換された低級アルキル、随意に置換されたアリール、 $-OR$ 、 $-C(O)R$ 、 $-C(O)OR$ 、 $-OC(O)R$ (R は、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換された $C_3 - 7$ シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、および随意に置換されたアリールから選択される)、 $-C(O)NR'R''$ 、 $-NR'C(O)R''$ および $-NR'R''$ (R' および R'' は、水素または低級アルキルから独立して選択される)から独立して選択される、請求項23に記載の化合物またはその塩。

【請求項25】

R_1 および R_2 が、水素、シアノ、ハロ、随意に置換された低級アルキル、 $-O$ - 随意に置換された低級アルキル、 $-C(O)$ - 随意に置換された低級アルキル、および $-C(O)NR'R''$ (R' および R'' は、水素または低級アルキルから独立して選択される)から独立して選択される、請求項24に記載の化合物またはその塩。

【請求項26】

R_1 および R_2 が、シアノ、ハロ、随意に置換された低級アルキル、 $-O$ - 随意に置換された低級アルキル、 $-C(O)$ - 随意に置換された低級アルキル、および $-C(O)NR'R''$ (R' および R'' は、水素または低級アルキルから独立して選択される)から独立して選択される、請求項23から25のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項27】

R_6 が、シアノ、ハロ、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換された $C_3 - 7$ シクロアルキル、 $-O$ - 随意に置換された低級アルキル、 $-O$ - 随意に置換された $C_3 - 7$ シクロアルキル、または $-O$ - 随意に置換されたヘテロアリールから選択される、請求項23から26のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項28】

R_6 が、ハロ、随意に置換されたアルキル、または $-O$ - 随意に置換された低級アルキルから選択される、請求項27に記載の化合物またはその塩。

【請求項29】

L が、 $C_2 - 6$ アルキレン、 $C_2 - 6$ アルケニレン、または $C_2 - 6$ アルキニレンから選択され、これらのそれぞれが、低級アルキル基により随意に置換されていてもよい、原子数2 - 6の長さの二価リンカー基である、請求項23から28のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 30】

L'が、 C_{1-6} アルキレン、 C_{2-6} アルケニレン、または C_{2-6} アルキニレンから選択される原子数1-6の長さの二価リンカー基である、請求項23から29のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 31】

R_7 が、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアリールオキシ、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換されたヘテロアリールオキシ、随意に置換されたヘテロシクリル、または随意に置換されたヘテロシクリルオキシから選択される、請求項23から30のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 32】

R_7 が、随意に置換されたアリールである、請求項31に記載の化合物またはその塩。

【請求項 33】

Yが、単結合またはOである、請求項23から32のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 34】

R_4 が、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換されたヘテロアリールオキシ、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロシクリルオキシ、または-NHC₃₋₇シクロアルキルから選択される、請求項1から33のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 35】

R_4 が、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換されたヘテロアリールオキシ、随意に置換されたヘテロシクリル、または-NHC₃₋₇シクロアルキルから選択される、請求項34に記載の化合物またはその塩。

【請求項 36】

R_4 が、アゼチジニル、ピロリジニル、ピラゾリニル、ピラゾリジニル、イミダゾリニル、イミダゾリジニル、ピロリニル(2および3ピロリニルを含む)、ジオキサラン、フリル、チエニル、ピロリル、H-ピロリル、オキサゾリル、オキサジアゾリル、(1,2,3および1,2,4オキサジアゾリルを含む)チアゾリル、イソオキサゾリル、フラザニル、イソチアゾリル、ピラゾリル、イミダゾリル、トリアゾリル(1,2,3および1,3,4トリアゾリルを含む)、テトラゾリル、およびチアジアゾリル(1,2,3および1,3,4チアジアゾリルを含む)、ピリジル、ピリミジニル、ピリダジニル、ピラジニル、ピラニル(2Hおよび4Hピラニルを含む)、ペリジニル、モルホリニル、ピペラジニル、1,3,5-トリチアニル、チオモルホリニル、1-オキソ-チオモルホリニル、1,1-ジオキソチオモルホリニル、1,4-ジチアニル、ならびに1,4-ジオキサニルから選択され；これらのすべてが、ハロゲン、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{1-6} ハロアルキル(特に、-CF₃)、 C_{1-6} ハロアルコキシ(例えば、-OCF₃)、-OH、フェニル、ベンジル、フェノキシ、ベンジルオキシ、ベンゾイル、-NH₂、-NHC₁₋₄アルキル、-N(C₁₋₄アルキル)₂、-CN、-NO₂、メルカプト、 C_{1-6} アルキルカルボニル、 C_{1-6} アルコキシカルボニルおよびCO₂Hから選択される1つ以上の基で随意に置換されたことがある、請求項1から33のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 37】

Lが、随意に置換されたプロピレンまたはブチレンである、請求項1から36のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 38】

Lが、-CH₂-CH₂-CH(CH₃)-、-CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-、または-CH₂-CH₂-CH₂-である、請求項37に記載の化合物またはその塩。

【請求項 39】

R_5 が、メチルである、請求項1から38のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 40】

R₆ が、C₁₋₃ アルキルである、請求項 1 から 39 のいずれか一項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 41】

R₆ が、メチルである、請求項 40 に記載の化合物またはその塩。

【請求項 42】

1 - (3 - クロロ - 5 - (3 - (4 - フルオロフェニル) プロポキシ) - 4 - メトキシ - 2 - メチル - 6 - (2 - モルホリノエトキシ) フェニル) エタノン;

1 - (3 - クロロ - 6 - (シクロペンチルアミノ) エトキシ) - 5 - (3 - (4 - フルオロフェニル) プロポキシ - 4 - メトキシ - 2 - メチルフェニル) エタノン;

1 - [3 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - プロポキシ] - 4 - メトキシ - 5, 6 - ジメチル - 2 - (2 - モルホリン - 4 - イル - エトキシ) - フェニル] - エタノン;

1 - [3 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - ブトキシ] - 4 - メトキシ - 5, 6 - ジメチル - 2 - (2 - ピリジン - 2 - イル - エトキシ) - フェニル] - エタノン;

1 - [3 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - ブトキシ] - 4 - メトキシ - 5, 6 - ジメチル - 2 - (2 - モルホリン - 4 - イル - エトキシ) - フェニル] - エタノン;

1 - {2 - (2 - シクロペンチルアミノ - エトキシ) - 3 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - ブトキシ] - 4 - メトキシ - 5, 6 - ジメチル - フェニル} - エタノン;

1 - [3 - クロロ - 5 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - ブトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - メチル - 6 - (2 - ピリジン - 2 - イル - エトキシ) - フェニル] - エタノン;

1 - [3 - クロロ - 5 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - ブトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - メチル - 6 - (2 - モルホリン - 4 - イル - エトキシ) - フェニル] - エタノン;

1 - [3 - クロロ - 6 - (2 - シクロペンチルアミノ - エトキシ) - 5 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - ブトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - メチル - フェニル] - エタノン;

1 - [3 - クロロ - 5 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - ブトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - メチル - 6 - (2 - ピペリジン - 1 - イル - エトキシ) - フェニル] - エタノン;

1 - {3 - クロロ - 5 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - ブトキシ] - 6 - [2 - (4 - フルオロ - ピペリジン - 1 - イル) - エトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - メチル - フェニル} - エタノン;

1 - {3 - クロロ - 5 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - ブトキシ] - 6 - [2 - (R - 3 - フルオロ - ピロリジン - 1 - イル) - エトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - メチル - フェニル} - エタノン;

1 - [3 - クロロ - 5 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - ブトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - メチル - 6 - (ピリジン - 2 - イルメトキシ) - フェニル] - エタノン;

1 - {3 - クロロ - 5 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - ブトキシ] - 6 - [2 - (4 - ヒドロキシ - ピペリジン - 1 - イル) - エトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - メチル - フェニル} - エタノン;

1 - {3 - クロロ - 5 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - ブトキシ] - 6 - [2 - (4 - オキソ - ピペリジン - 1 - イル) - エトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - メチル - フェニル} - エタノン;

1 - {3 - クロロ - 6 - [2 - (4, 4 - ジフルオロ - ピペリジン - 1 - イル) - エトキシ] - 5 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - ブトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - メチル - フェニル} - エタノン;

1 - {3 - クロロ - 6 - [2 - (3, 3 - ジフルオロ - ピペリジン - 1 - イル) - エトキシ] - 5 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - ブトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - メチル - フェニル} - エタノン;

1 - {3 - クロロ - 5 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - ブトキシ] - 4 - メトキシ

シ - 2 - メチル - 6 - [2 - (ピラジン - 2 - イルオキシ) - エトキシ] - フェニル } - エタノン ;

1 - [3 - クロロ - 5 - [3 - (4 - フルオロフェニル) - ブトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - メチル - 6 - (2 - [1 , 2 , 4] トリアゾール - 1 - イル - エトキシ) - フェニル] - エタノン ;

1 - { 3 - クロロ - 6 - [2 - (3 , 3 - ジフルオロ - アゼチジン - 1 - イル) - エトキシ] - 5 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - ブトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - メチル - フェニル } - エタノン ;

1 - [3 - クロロ - 5 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - ブトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - メチル - 6 - (3 - モルホリン - 4 - イル - プロポキシ) - フェニル] - エタノン ;

1 - { 3 - クロロ - 6 - [3 - (1 , 1 - ジオキソ - チオモルホリン - 4 - イル) - プロポキシ] - 5 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - ブトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - メチル - フェニル } - エタノン ;

1 - { 3 - クロロ - 5 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - ブトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - メチル - 6 - [3 - (1 - オキソ - チオモルホリン - 4 - イル) - プロポキシ] - フェニル } - エタノン ;

1 - (3 - クロロ - 4 - メトキシ - 2 - メチル - 6 - (2 - モルホリノエトキシ) - 5 - 5 (4 - フェニルブチル) フェニル) エタノン ;

1 - (3 - クロロ - 4 - メトキシ - 2 - メチル - 5 - (4 - フェニルブチル) - 6 - (2 - (ピリジン - 2 - イル) エトキシ) フェニル) エタノン ;

1 - (3 - クロロ - 5 - (4 - (4 - フルオロフェニル) ペンチル) - 4 - メトキシ - 2 - メチル - 6 - (2 - モルホリノエトキシ) フェニル) エタノン ;

1 - [3 - クロロ - 5 - [4 - (4 - フルオロ - フェニル) - ペンチル] - 4 - メトキシ - 2 - メチル - 6 - (2 - ピリジン - 2 - イル - エトキシ) - フェニル] - エタノン ;

1 - [4 - メトキシ - 6 - メチル - 2 - (2 - モルホリン - 4 - イル - エトキシ) - 3 - (3 - フェニル - プロポキシ) - フェニル] - エタノン ;

1 - [3 - クロロ - 6 - (2 - シクロペンチルアミノ - エトキシ) - 4 - メトキシ - 2 - メチル - 5 - (3 - フェニル - プロポキシ) - フェニル] - エタノン ;

1 - [3 - クロロ - 6 - [2 - (3 , 3 - ジフルオロ - アゼチジン - 1 - イル) - エトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - メチル - 5 - (3 - フェニル - プロポキシ) - フェニル] - エタノン ;

1 - [3 - クロロ - 4 - メトキシ - 2 - メチル - 5 - (3 - フェニル - プロポキシ) - 6 - (2 - チオモルホリン - 4 - イル - エトキシ) - フェニル] - エタノン ;

1 - [3 - クロロ - 6 - [2 - (3 , 3 - ジフルオロ - ピロリジン - 1 - イル) - エトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - メチル - 5 - (3 - フェニル - プロポキシ) - フェニル] - エタノン ;

1 - [3 - クロロ - 6 - [2 - (3 - ヒドロキシ - アゼチジン - 1 - イル) - エトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - メチル - 5 - (3 - フェニル - プロポキシ) - フェニル] - エタノン ;

1 - [3 - クロロ - 6 - [2 - (3 - オキソ - アゼチジン - 1 - イル) - エトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - メチル - 5 - (3 - フェニル - プロポキシ) - フェニル] - エタノン ;

1 - { 3 - クロロ - 6 - (2 - ジメチルアミノ - エトキシ) - 5 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - ブトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - メチル - フェニル } - エタノン ;

1 - [3 - クロロ - 5 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - ブトキシ] - 6 - (2 - イミダゾール - 1 - イル - エトキシ) - 4 - メトキシ - 2 - メチル - フェニル] - エタノン ; および

1 - { 3 - クロロ - 5 - [3 - (4 - フルオロ - フェニル) - ブトキシ] - 4 - メトキシ - 2 - メチル - 6 - [2 - ((S) - 3 - メチル - モルホリン - 4 - yl) - エトキシ

] - フェニル } - エタノン

から選択される化合物、またはその塩。

【請求項 4 3】

請求項 1 から 4 2 のいずれか一項に記載の 1 つ以上の化合物またはその塩と、場合によっては、医薬的に許容される担体または希釈剤とを含む、医薬組成物。

【請求項 4 4】

追加の免疫抑制化合物または他の多発性硬化症治療薬をさらに含む、請求項 4 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 5】

前記追加の免疫抑制化合物または他の多発性硬化症治療薬が、インターフェロンベータ - 1 b、インターフェロンベータ - 1 a、酢酸グラチラマー、ナタリズマブまたはミトキサントロンから選択される、請求項 4 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 4 6】

自己免疫もしくは慢性炎症性疾患の治療もしくは予防、または異種臓器移植片に対する拒絶反応および/もしくは関連した苦痛の予防のための薬物の製造における、請求項 1 から 4 2 のいずれか一項に記載の化合物またはその塩の使用。

【請求項 4 7】

前記自己免疫疾患が、多発性硬化症である、請求項 4 6 に記載の使用。

【請求項 4 8】

前記疾患が、糖尿病である、請求項 4 7 に記載の使用。

【請求項 4 9】

自己免疫もしくは慢性炎症性疾患の治療もしくは予防、または異種臓器移植片に対する拒絶反応および/もしくは関連した苦痛の予防のための、請求項 1 から 4 2 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項 5 0】

前記自己免疫疾患が、多発性硬化症である、請求項 4 9 に記載の使用。

【請求項 5 1】

前記疾患が、糖尿病である、請求項 5 0 に記載の使用。

【請求項 5 2】

請求項 1 から 4 2 のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩を T 細胞を適用することによって、前記 T 細胞のカリウムイオンチャンネル活性を計画的に調節する方法。

【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 3

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 2 3】

式中、

R_1 および R_2 は、水素、シアノ、ハロ、ニトロ、随意に置換された低級アルキル、随意に置換されたアリール、 $-OR$ 、 $-C(O)R$ 、 $-C(O)OR$ 、 $-OC(O)R$ (R は、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換された C_{3-7} シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、および随意に置換されたアリールから選択される)、 $-C(O)NR'R''$ 、 $-NR'C(O)R''$ および $-NR'R''$ (R' および R'' は、水素または低級アルキルから独立して選択される) から独立して選択され、ならびに

R_1 および R_2 の少なくとも一方は、水素以外であり；

R_6 は、シアノ、ハロ、ニトロ、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換された C_{3-7} シクロアルキル、随意に置換された C_{4-7} シク

ロアルケニル、-OR、-SR、-C(O)R、-C(O)OR、-OC(O)R (Rは、水素、低級アルキル、低級アルケニル、低級アルキニル、随意に置換されたC₃₋₇シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、および随意に置換されたアリールから選択される)、-C(O)NR'R''、-NR'C(O)R''および-NR'R'' (R'およびR''は、水素または低級アルキルから独立して選択される)から選択され;

Lは、随意に置換されたC₂₋₆アルキレン、随意に置換されたC₂₋₆アルケニレン、または随意に置換されたC₂₋₆アルキニレンから選択される原子数2-6の長さの二価リンカー基であり;

L'は、(i) 随意に置換されたC₂₋₆アルキレン、随意に置換されたC₂₋₆アルケニレン、もしくは随意に置換されたC₂₋₆アルキニレンから選択される原子数2-6の長さの二価リンカー基; または

(ii) -CH₂-

であり;

Yは、単結合、-O-、-S-、-NR'''-、-C(O)NR'''-、または-NR'''C(O)- (R'''は、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたC₃₋₇シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、および随意に置換されたアリールから選択される)から選択され;

Y'は、単結合、-O-、-C(O)-、-S-、-NR'''-、-C(O)NR'''-、または-NR'''C(O)- (R'''は、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたC₃₋₇シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、および随意に置換されたアリールから選択される)から選択され;

R₅は、随意に置換されたアルキル、-OR、-C(O)R、-C(O)OR、SR、(Rは、随意に置換されたC₂₋₇アルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたC₃₋₇シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、および随意に置換されたアリールから選択され)、-C(O)NR'R''、-NR'C(O)R''および-NR'R'' (R'およびR''は、水素または低級アルキルから独立して選択される)から選択され;

R₄は、置換アリール、置換アリーロキシ、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換されたヘテロアリーロキシ、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロシクリロキシまたは-NR'''R'''' (R'''は、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたC₃₋₇シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、および随意に置換されたアリールから選択され、ならびにR''''は、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたC₃₋₇シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、および随意に置換されたアリールから選択される)から選択され; ならびに

R₇は、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアリーロキシ、随意に置換されたヘテロアリール、随意に置換されたヘテロアリーロキシ、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロシクリロキシまたは-NHR'''' (R''''は、水素、随意に置換されたアルキル、随意に置換されたアルケニル、随意に置換されたアルキニル、随意に置換されたC₃₋₇シクロアルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、随意に置換されたヘテロアリール、および随意に置換されたアリールから選択される)から選択される。