

【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28年8月12日 (2016.8.12)

【公表番号】特表2015-522556(P2015-522556A)

【公表日】平成27年8月6日 (2015.8.6)

【年通号数】公開・登録公報2015-050

【出願番号】特願2015-515410(P2015-515410)

【国際特許分類】

C 0 7 D 498/04 (2006.01)

C 0 7 D 519/00 (2006.01)

C 0 7 D 513/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4245 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

A 6 1 K 31/428 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/433 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 498/04 1 0 3

C 0 7 D 498/04 C S P

C 0 7 D 519/00 3 0 1

C 0 7 D 513/04 3 2 5

A 6 1 K 31/4245

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/437

A 6 1 K 31/428

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/433

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 43/00 1 2 1

【手続補正書】

【提出日】平成28年6月24日 (2016.6.24)

【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】

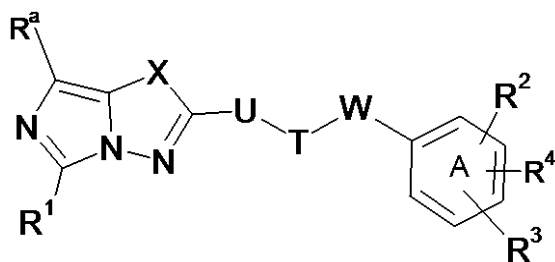
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の化合物、若しくは薬学的に許容されるその誘導体、溶媒和物、互変異性体、

塩、水和物又は立体異性体（すべての割合のその混合物であってもよい）。

【化 1】



(I)

（式中、

X は、O 又は S を表し、

U は、

( i ) C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、ハロゲン、CN から独立に選択される 1 又は 2 個の基によって置換されていてよいフェニル環

( i i ) C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルコキシ、C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキル、ハロゲン、CN から独立に選択される 1 又は 2 個の基によって置換されていてよい、1 個の窒素原子を含み、N、O 又は S から独立に選択される 2 個までの追加のヘテロ原子を含んでもよい 5 又は 6 員不飽和又は芳香族複素環系、

( i i i ) 1 個の単結合

から選択され、

T は、- NR<sup>5</sup> -、- NR<sup>5</sup>CO -、- CONR<sup>5</sup>、- NR<sup>5</sup> - CO - NR<sup>5</sup>、- CO - を表し

W は、

( i ) 1 ~ 2 個の H 原子が、フェニル環、ハロゲン、CN、CF<sub>3</sub> によって置換されていてよい直鎖又は分枝 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキレン、

( i i ) 1 個の CH<sub>2</sub> 基が、3 ~ 7 員飽和炭素環によって置換されている直鎖又は分枝 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキレン、

( i i i ) 1 個の CH<sub>2</sub> 基が、

- フェニル環 A と縮合していてもよいフェニル環、

- 1 若しくは 2 個の窒素原子を含有する 5 若しくは 6 員飽和複素環系、又は

- 飽和 6 員炭素環と縮合していてもよく、若しくはフェニル環 A と縮合していてもよい、N、O 及び S から独立に選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を含有する 5 員芳香族複素環系

によって置換されており、

- T に結合していない別の CH<sub>2</sub> 基が、- O - 又は NR<sup>5</sup> によって置換されていてよい直鎖又は分枝 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキレン、

( i v ) 1 個の単結合、

から選択され、

R<sup>5</sup> は、H 又は直鎖若しくは分枝 C<sub>1</sub> - C<sub>6</sub> - アルキルであり、

R<sup>1</sup> は、1 ~ 6 個の炭素原子を有する直鎖又は分枝アルキルを表し、

R<sup>a</sup> は、H、CN、ハロゲン、1 ~ 3 個の H 原子がハロゲンで置換されていてよい 1 ~ 6 個の炭素原子を有する直鎖又は分枝アルキル、1 ~ 3 個の H 原子がハロゲンで置換されていてよい 1 ~ 6 個の炭素原子を有する直鎖又は分枝アルコキシを表し、

R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup> は、CN、ハロゲン、1 ~ 3 個の H 原子がハロゲンで置換されていてよい 1 ~ 6 個の炭素原子を有する直鎖又は分枝アルキル、1 ~ 3 個の H 原子がハロゲンで置換されていてよい 1 ~ 6 個の炭素原子を有する直鎖又は分枝アルコキシから互いに独立に選択される )

【請求項 2】

U が、単結合又は以下の基の一つから選択される、請求項 1 に記載の式 (I) の化合物

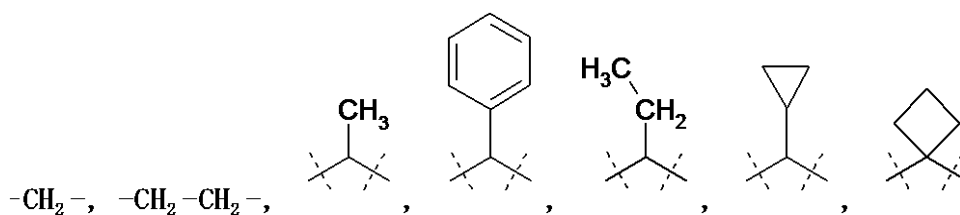
。

【表 1】


【請求項 3】

W が、

【化 2】



若しくは

【表 2】


から選択され、又は基 W - A が、

【表 3】

--	--	--

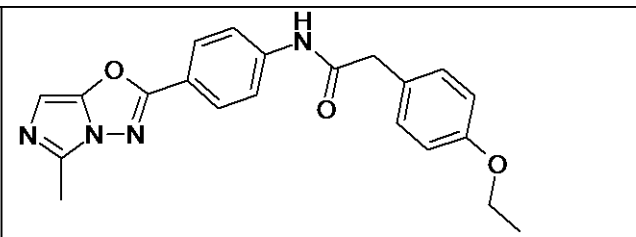
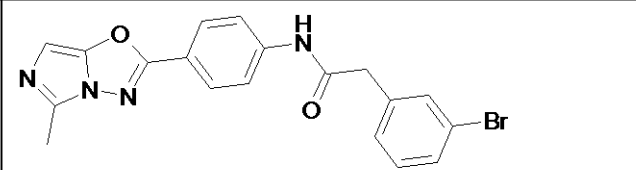
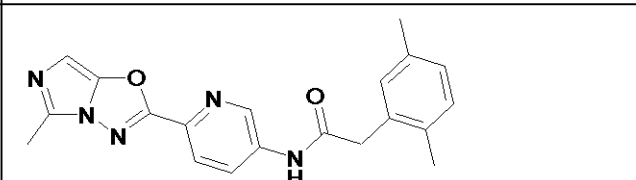
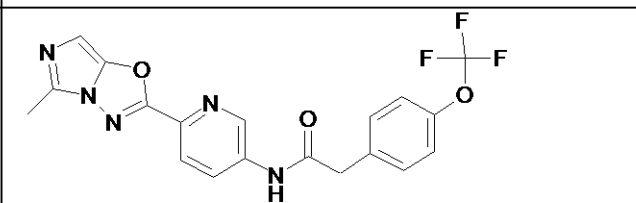
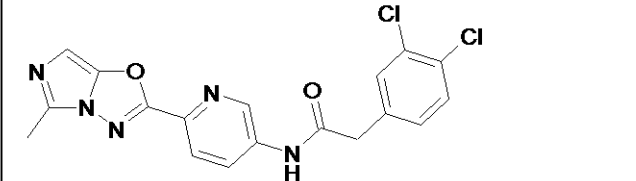
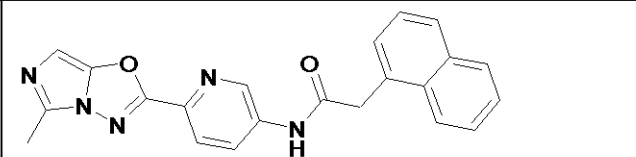
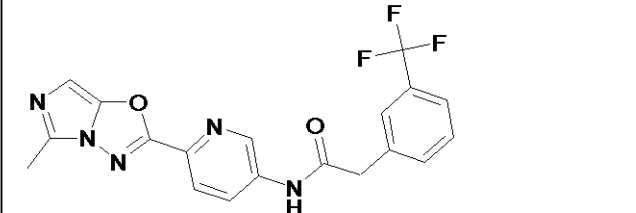
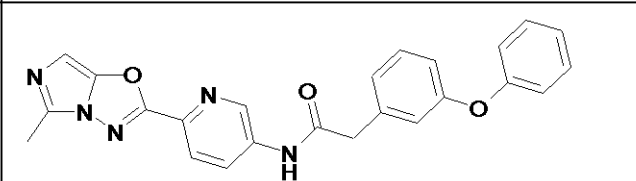
を表す、請求項 1 又は 2 のいずれか 1 項に記載の式 ( I ) の化合物。

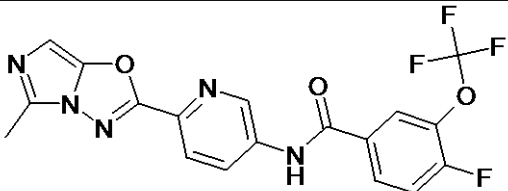
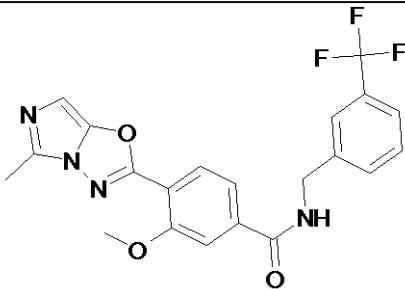
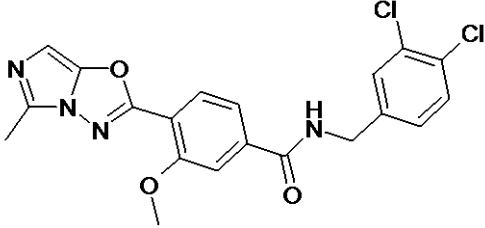
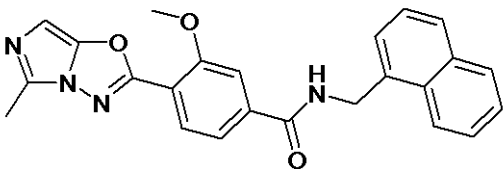
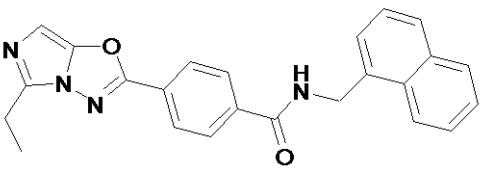
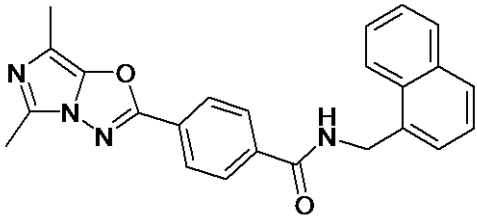
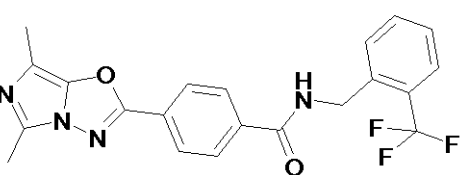
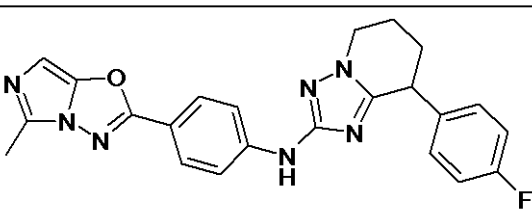
【請求項 4】

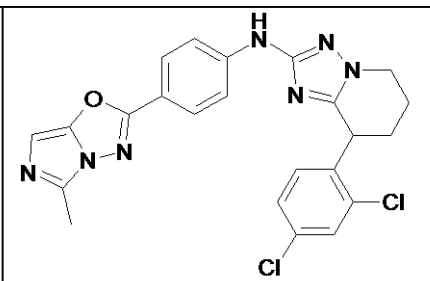
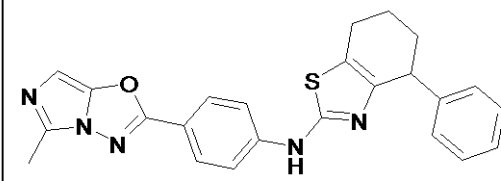
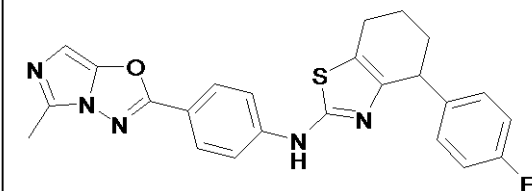
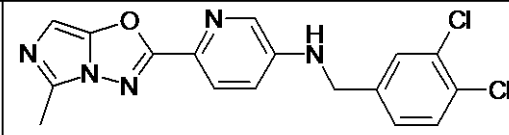
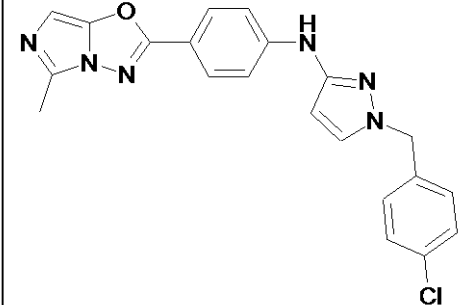
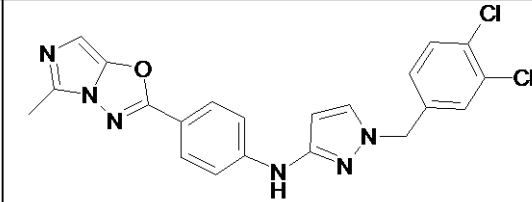
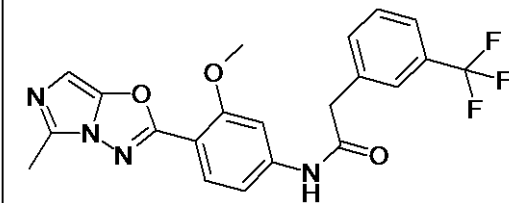
化合物が、以下の群から選択される、請求項 1 から 3 のいずれか 1 項に記載の式 ( I ) の化合物。

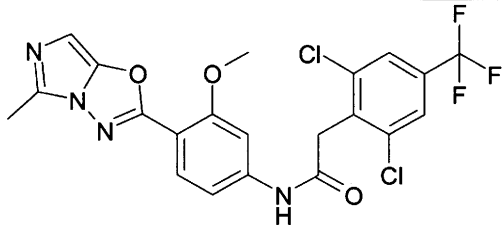
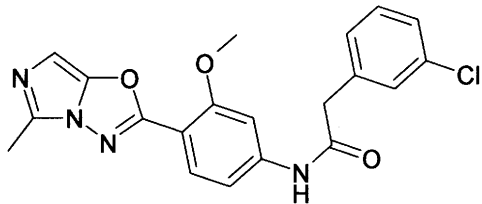
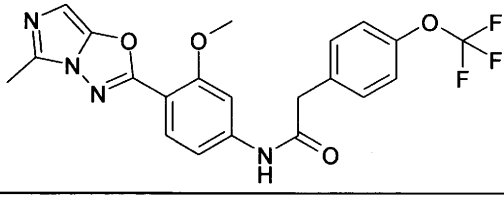
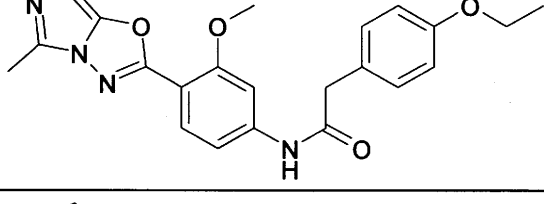
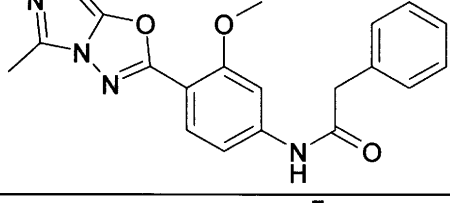
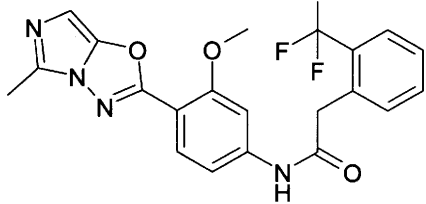
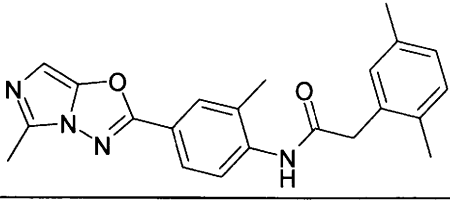
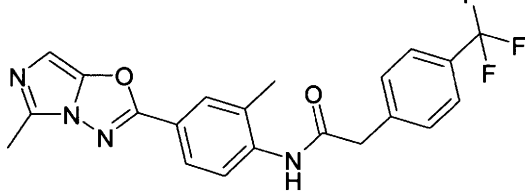
【表 4】

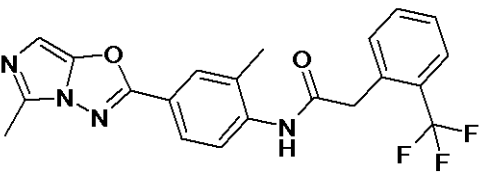
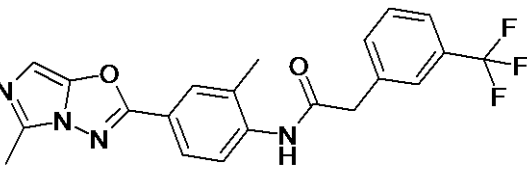
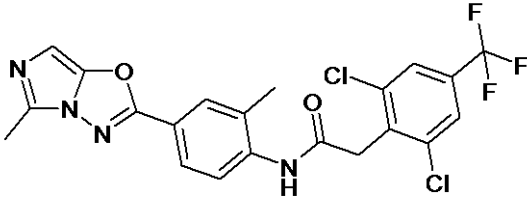
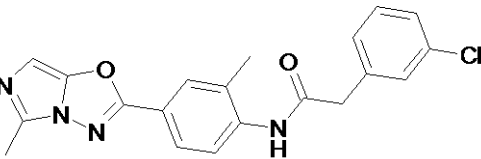
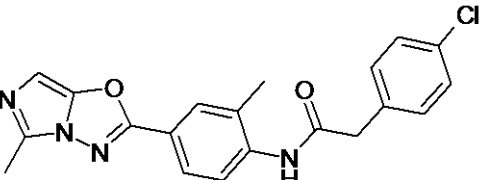
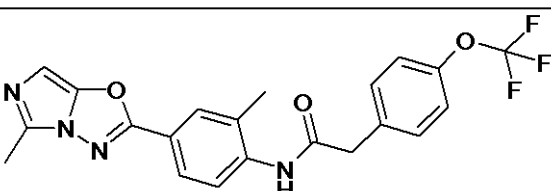
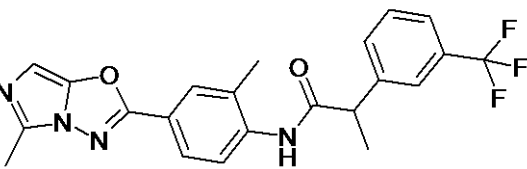
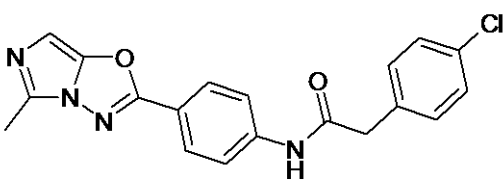
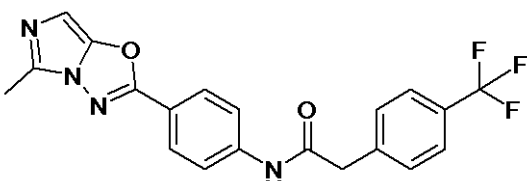
Ex.No	構造
1	
2	
3	
4	
5	
6	
7	

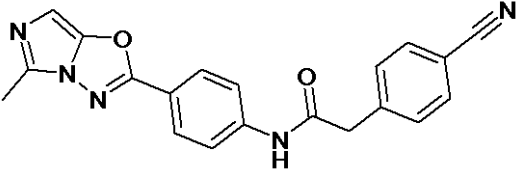
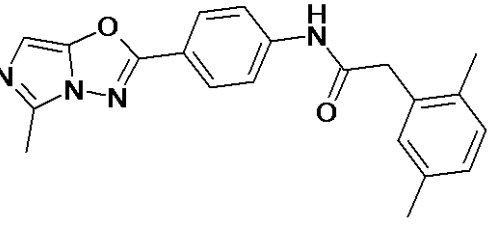
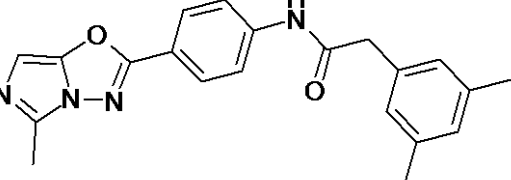
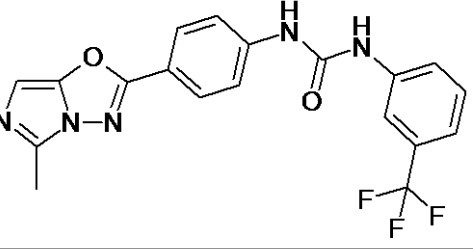
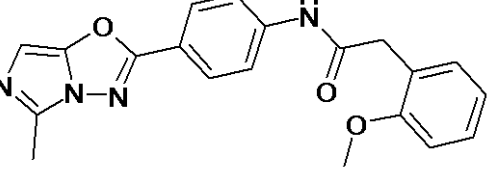
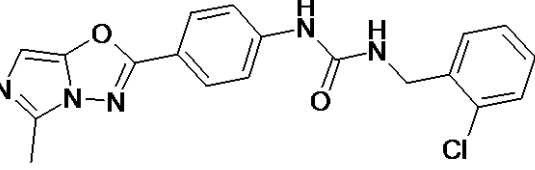
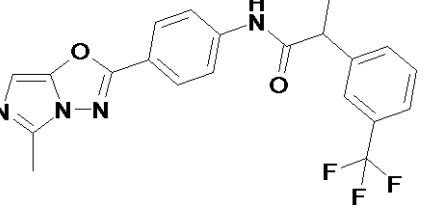
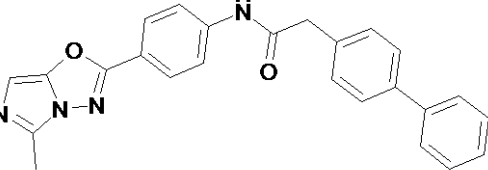
8	 <chem>CCOC1=CC=C(C=C1)CC(=O)Nc2ccc(cc2)c3nc4c(n3)nn(C)c4</chem>
9	 <chem>BrC1=CC=C(C=C1)CC(=O)Nc2ccc(cc2)c3nc4c(n3)nn(C)c4</chem>
10	 <chem>CC1=CC(=C(C=C1)C)CC(=O)Nc2ccc(nc2)c3nc4c(n3)nn(C)c4</chem>
11	 <chem>COc1ccc(cc1)C(=O)Nc2ccc(nc2)c3nc4c(n3)nn(C)c4C(F)(F)F</chem>
12	 <chem>ClC1=CC(=C(C=C1)C)C(Cl)=CC(=O)Nc2ccc(nc2)c3nc4c(n3)nn(C)c4</chem>
13	 <chem>c1ccc2ccccc2c1CC(=O)Nc3ccc(nc3)c4nc5c(n4)nn(C)c5</chem>
14	 <chem>Cc1ccc(cc1)C(=O)Nc2ccc(nc2)c3nc4c(n3)nn(C)c4C(F)(F)F</chem>
15	 <chem>c1ccc(cc1)Oc2ccc(cc2)CC(=O)Nc3ccc(nc3)c4nc5c(n4)nn(C)c5</chem>

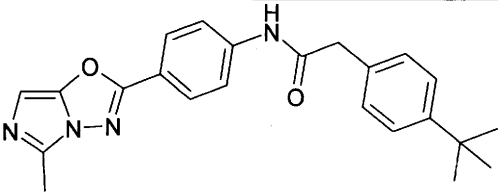
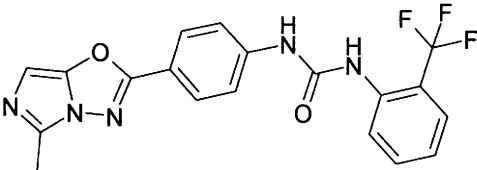
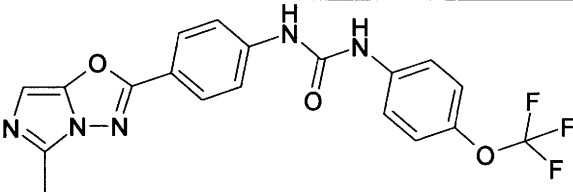
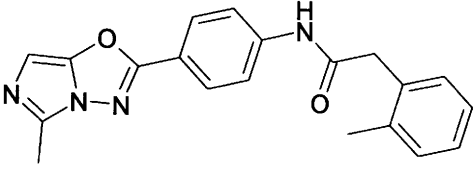
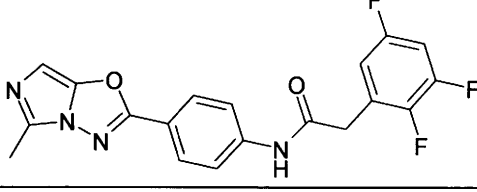
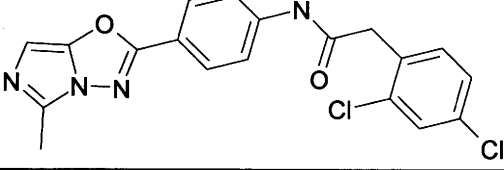
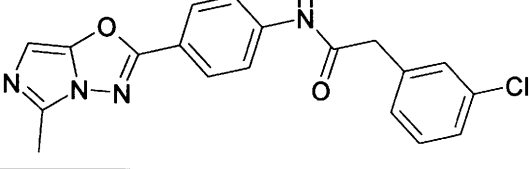
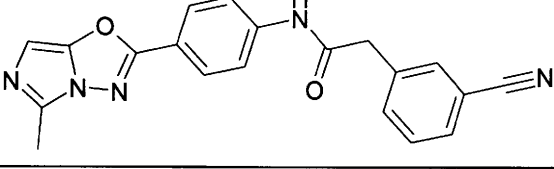
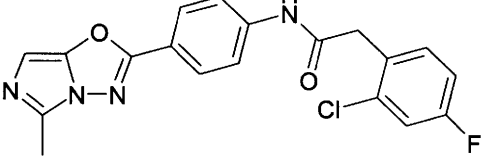
16	
18	
19	
20	
21	
22	
23	
24	

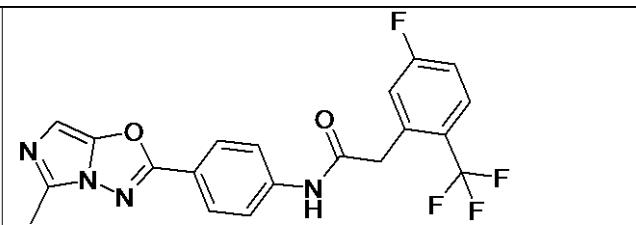
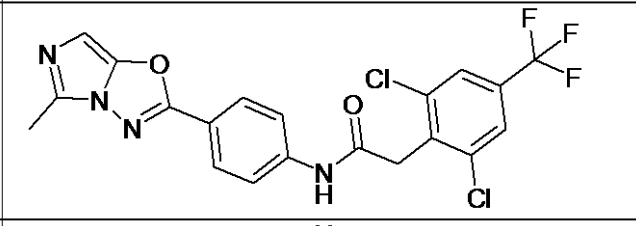
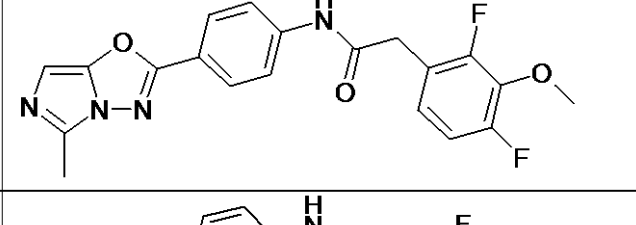
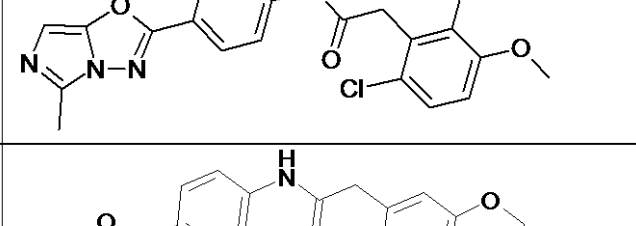
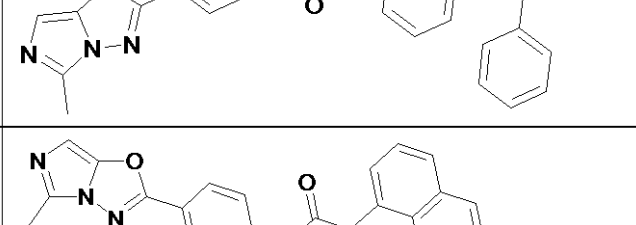
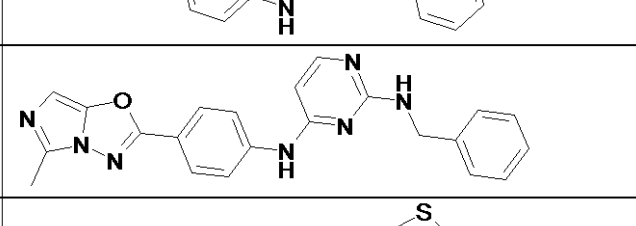
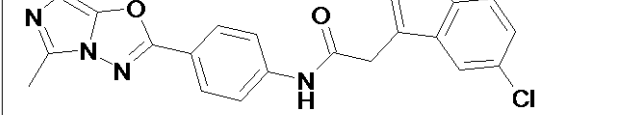

25	
26	
27	
28	
29	
30	
31	

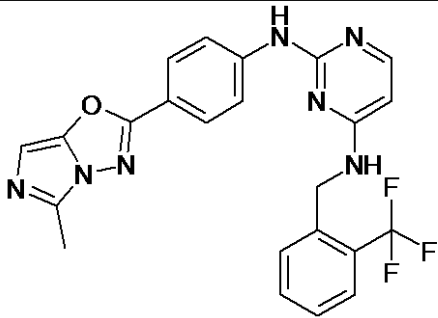
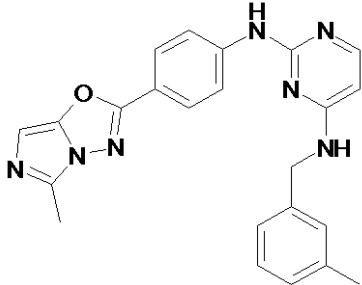
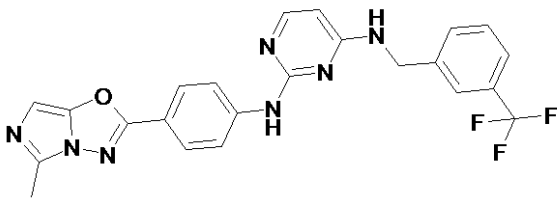
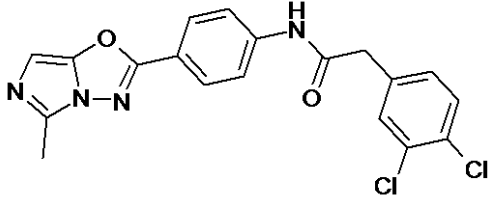
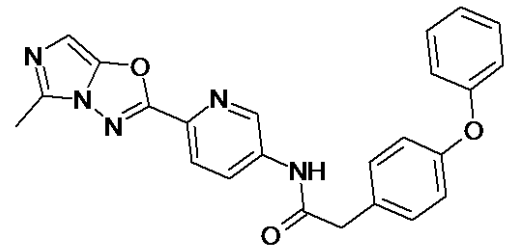
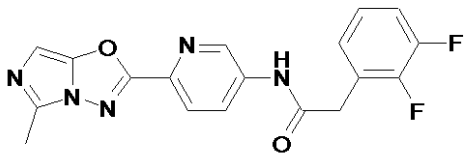
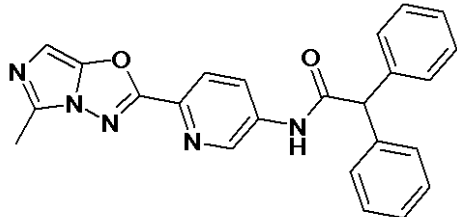
32	
33	
34	
35	
36	
37	
38	
39	

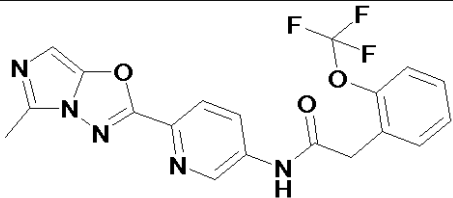
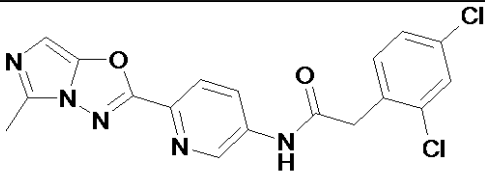
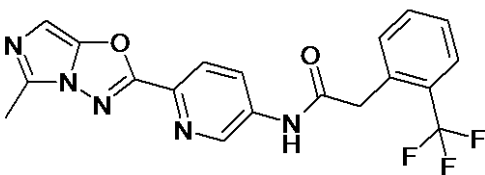
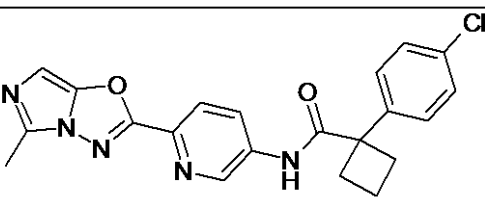
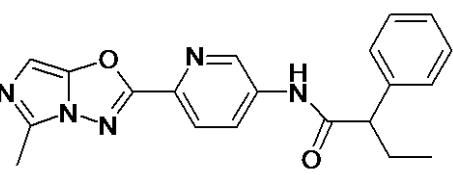
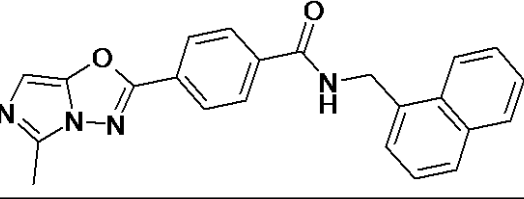
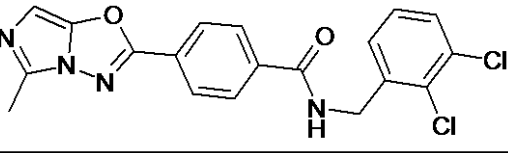
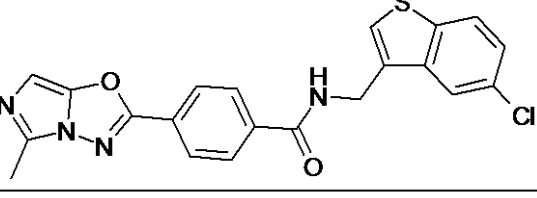
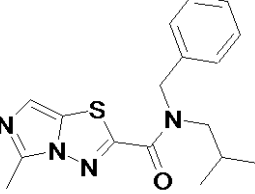
40	
41	
42	
43	
44	
45	
46	
47	
48	

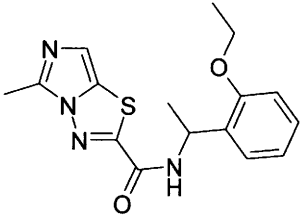
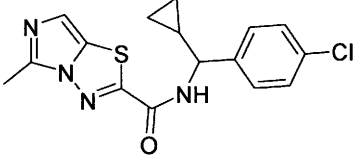
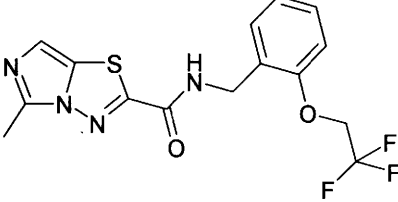
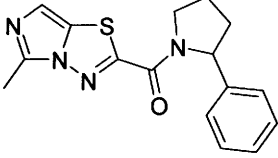
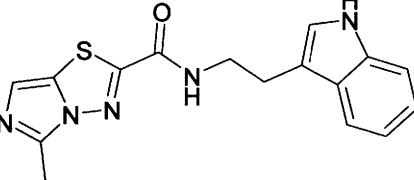
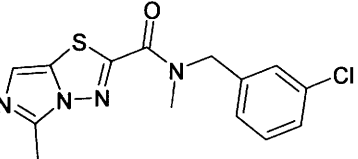
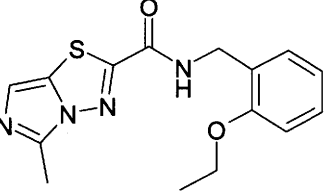
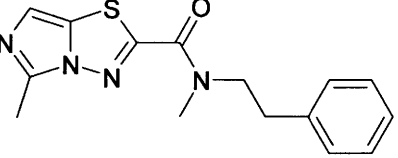
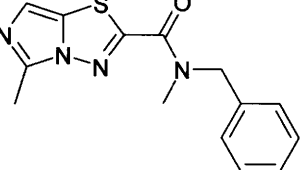
49	
50	
51	
52	
53	
54	
55	
56	

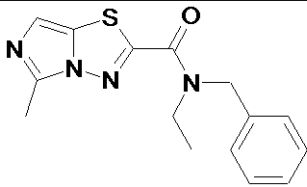
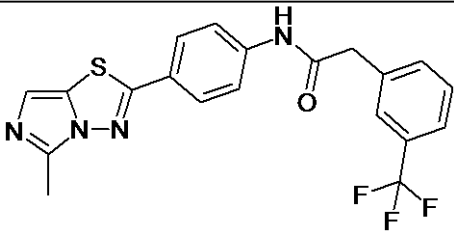
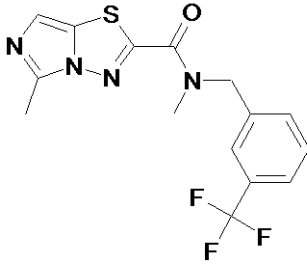
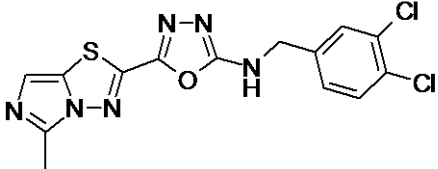
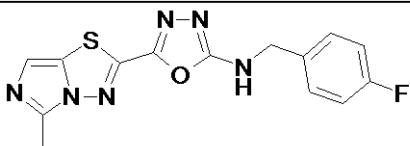
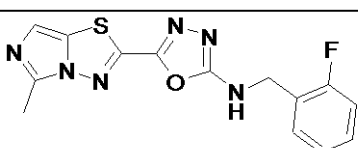
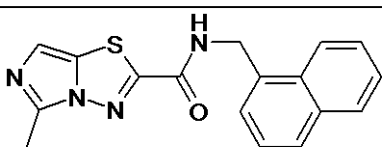
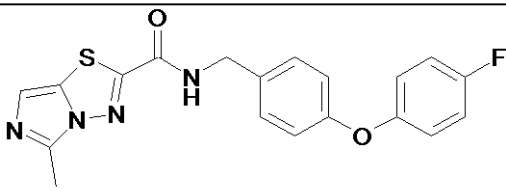
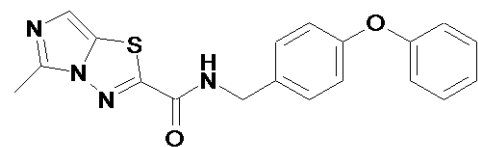
57	
58	
59	
60	
61	
62	
63	
64	
65	

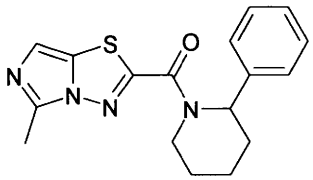
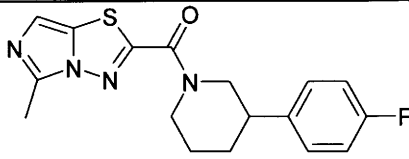
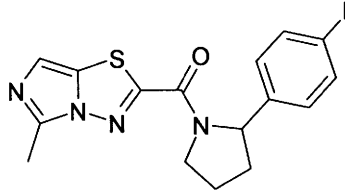
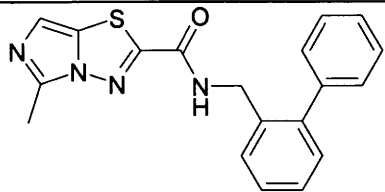
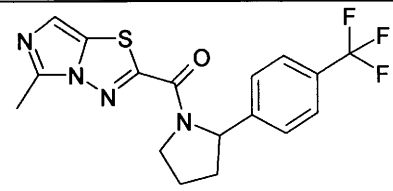
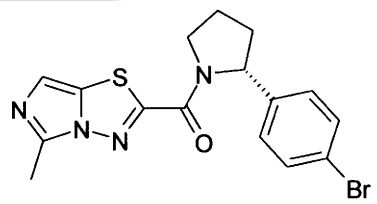
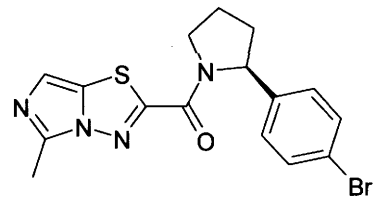
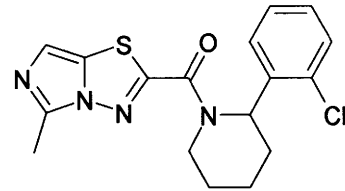
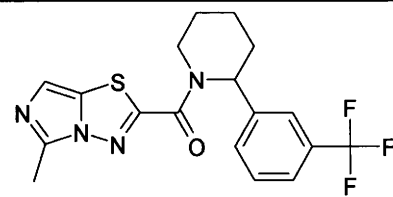
66	
67	
68	
69	
70	
71	
72	
73	

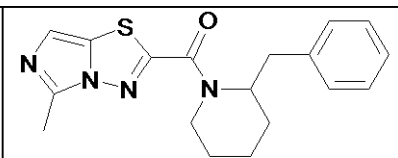
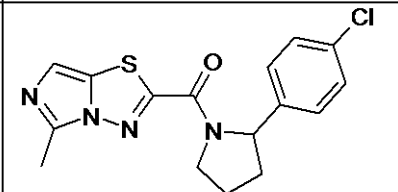
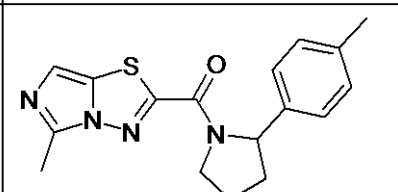
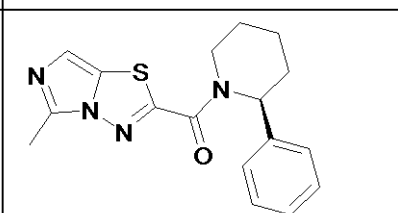
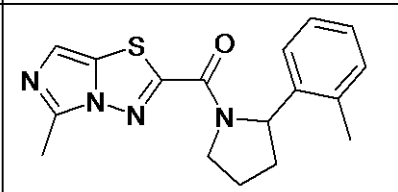
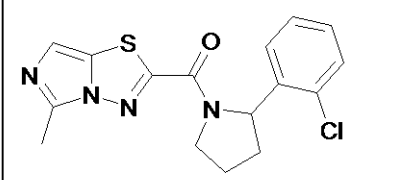
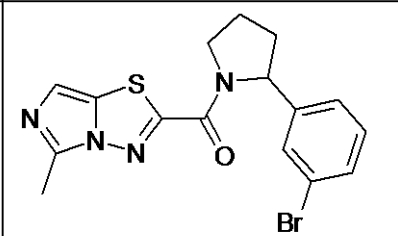
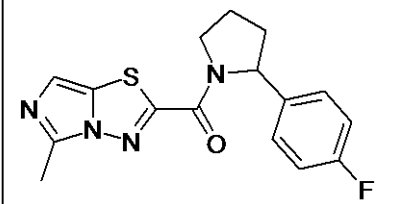
74	
75	
76	
77	
78	
79	
80	

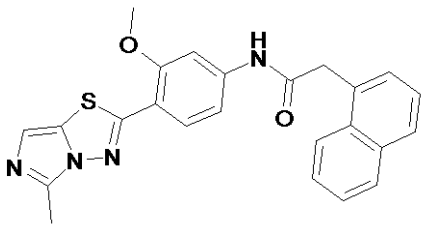
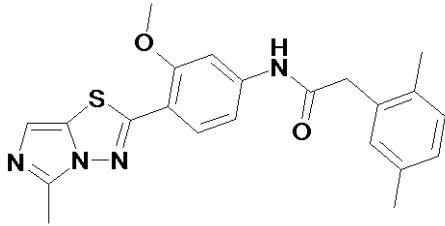
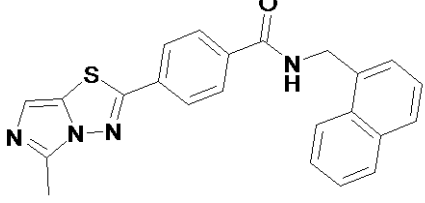
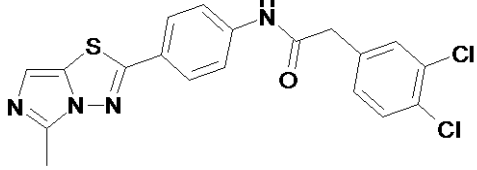
81	
82	
83	
84	
85	
86	
87	
88	
89	

90	
91	
92	
93	
94	
95	
96	
97	
98	

99	
100	
101	
102	
103	
104	
105	
106	
107	

108	
109	
110	
111	
112	
113	
114	
115	
116	

117	
118	
119	
120	
121	
122	
123	
124	

125	
126	
127	
128	

## 【請求項 5】

請求項 1 に記載の式 (I) の化合物、若しくは薬学的に許容されるその誘導体、溶媒和物、互変異性体、塩、水和物又は立体異性体（全ての割合のその混合物を含む）を含む医薬組成物。

## 【請求項 6】

神経変性疾患及び関連疾患の治療又は予防における使用のための、請求項 5 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 7】

神経変性疾患が、アルツハイマー病、軽度認知障害、脳アミロイド血管症及び／又はダウン症候群から選択される、請求項 6 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 8】

(a) 有効量の式 (I) の化合物、及び／若しくは薬学的に使用できるその誘導体、溶媒和物、塩、水和物又は立体異性体（全ての割合のその混合物を含む）、並びに

(b) 有効量のさらなる薬剤活性成分  
の別々のパックからなるキット。

## 【請求項 9】

請求項 1 から 4 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物の少なくとも一つを含有する医薬組成物。

## 【請求項 10】

炎症性疾患又は免疫障害の治療において使用される少なくとも 1 種のさらなる薬剤を追加的に含有する、請求項 10 に記載の医薬組成物。

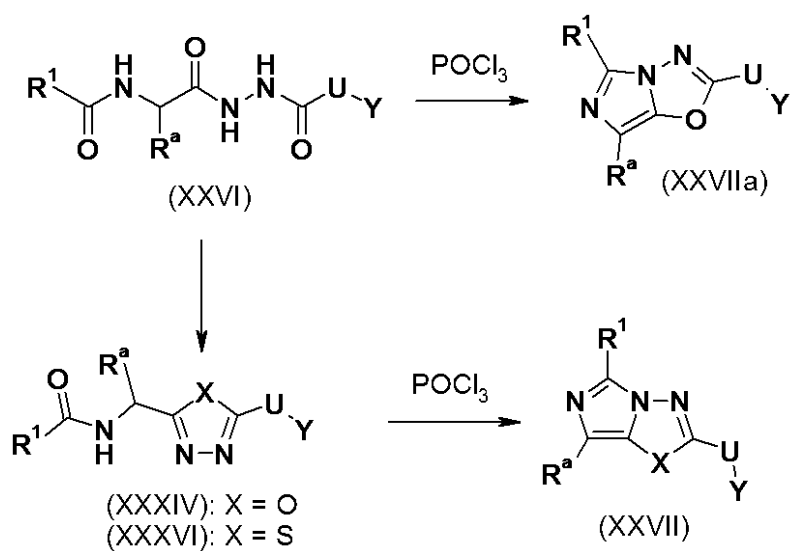
## 【請求項 11】

少なくとも 1 種のさらなる免疫調節剤を追加的に含有する、請求項 11 に記載の医薬組成物。

## 【請求項 12】

以下の縮合環系の形成を含む、請求項 1 から 4 に記載の式 ( I ) の化合物を生成するための方法。

【化 3】



(式中、Y は、ハロゲン又は保護アミノ基である)