

【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】令和 2 年 1 月 30 日 (2020.1.30)

【公表番号】特表 2019-500374 (P2019-500374A)

【公表日】平成 31 年 1 月 10 日 (2019.1.10)

【年通号数】公開・登録公報 2019-001

【出願番号】特願 2018-533649 (P2018-533649)

【国際特許分類】

C 07 J 1/00 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 15/00 (2006.01)

A 61 P 13/08 (2006.01)

A 61 P 11/00 (2006.01)

A 61 K 31/569 (2006.01)

A 61 K 31/58 (2006.01)

A 61 P 5/00 (2006.01)

A 61 K 45/00 (2006.01)

C 07 J 43/00 (2006.01)

C 07 J 17/00 (2006.01)

【F I】

C 07 J 1/00

A 61 P 43/00 1 2 1

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 35/00

A 61 P 15/00

A 61 P 13/08

A 61 P 11/00

A 61 K 31/569

A 61 K 31/58

A 61 P 5/00

A 61 K 45/00

C 07 J 43/00 C S P

C 07 J 17/00

【手続補正書】

【提出日】令和 1 年 12 月 14 日 (2019.12.14)

【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

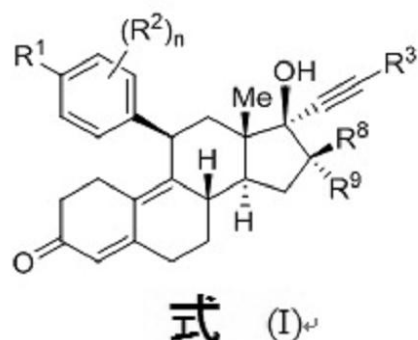
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の構造を有する化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、またはプロドラッグであって、

【化 1】



式中、

R^1 は $-NR^4R^5$ 、随意に置換されたアルキル NR^4R^5 、ハロ、 $-OR^6$ 、 $-OH$ 、随意に置換されたアルキル、ハロアルキル、随意に置換されたカルボシクリル、随意に置換されたカルボシクリルアルキル、随意に置換されたヘテロアルキル、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シクリルアルキル、随意に置換されたヒドロキシアルキル、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、 $-C(O)OR^6$ 、 $-C(O)NR^4R^5$ 、 $-OC(O)OR^6$ 、 $-OC(O)NR^4R^5$ 、 $-S(O)_2NR^4R^5$ 、 $-S(O)_2R^7$ 、 $-S(O)R^7$ 、 $-SR^7$ 、 $-NR^4S(O)_2NR^4R^5$ 、 $-P(O)(OR^6)_2$ 、 $-P(O)(R^6)_2$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、あるいは $-NO_2$ であり、

R^2 はそれぞれ独立して、 $-NR^4R^5$ 、随意に置換されたアルキル NR^4R^5 、ハロ、 $-OR^6$ 、 $-OH$ 、随意に置換されたアルキル、ハロアルキル、随意に置換されたカルボシクリル、随意に置換されたカルボシクリルアルキル、随意に置換されたヘテロアルキル、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シクリルアルキル、随意に置換されたヒドロキシアルキル、 $-C(O)R^6$ 、 $-C(O)OR^6$ 、 $-C(O)NR^4R^5$ 、 $-OC(O)OR^6$ 、 $-OC(O)NR^4R^5$ 、 $-S(O)_2NR^4R^5$ 、 $-S(O)_2R^7$ 、 $-S(O)R^7$ 、 $-SR^7$ 、 $-NR^4S(O)_2NR^4R^5$ 、 $-CN$ 、 $-CO_2H$ 、あるいは $-NO_2$ であり、

R^3 は C_{2-6} アルキル、 C_{1-6} フルオロアルキル、カルボシクリル、あるいはヘテロシクリルアルキルであり、

R^4 と R^5 はそれぞれ独立して、 $-H$ 、随意に置換されたアルキル、ハロアルキル、随意に置換されたカルボシクリル、随意に置換されたアリール、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、 $-S(O)_2R^7$ 、 $-C(O)N(R^{10})_2$ 、 $-C(O)R^6$ 、あるいは $-C(O)OR^6$ であり、あるいは、同じ N 原子に結合する R^4 と R^5 は、それらが結合している N 原子と一体になって、置換または非置換の複素環を形成し、

R^6 はそれぞれ独立して、随意に置換されたアルキル、ハロアルキル、随意に置換されたカルボシクリル、随意に置換されたアリール、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アリールであり、

R^7 は随意に置換されたアルキル、ハロアルキル、随意に置換されたカルボシクリル、随意に置換されたヘテロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、あるいは随意に置換されたヘテロアリールであり、

R^8 と R^9 は H であり、

R^{10} はそれぞれ独立して、 H 、随意に置換されたアルキル、ハロアルキル、随意に置換されたカルボシクリル、随意に置換されたヘテロアルキル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラルキル、随意に置換されたヘテロシクリル、あるいは随意に置換されたヘテロアリールであり、および、

n は 0、1、2、3、または 4 であり、

ここで、 R^1 が $-NMe_2$ であり、 n が 0 である場合、 R^3 は i -プロピルではなく、

R^1 が N 結合イミダゾリルであり、 n が 0 である場合、 R^3 は $-CF_3$ ではない、化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、またはプロドラッグ。

【請求項 2】

R^1 は、 $-NR^4R^5$ 、ハロ、 $-OR^6$ 、随意に置換されたアルキル、フルオロアルキル、随意に置換されたカルボシクリル、随意に置換されたヘテロシクリル、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、 $-C(O)NR^4R^5$ 、 $-S(O)_2NR^4R^5$ 、 $-S(O)_2R^7$ 、 $-NR^4S(O)_2NR^4R^5$ 、 $-P(O)(R^6)_2$ 、 $-P(O)(OR^6)_2$ 、あるいは $-CN$ である、請求項 1 に記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、またはプロドラッグ。

【請求項 3】

R^1 は、 $-NR^4R^5$ 、ハロ、 $-OR^6$ 、 $-S(O)_2NR^4R^5$ 、あるいは $-P(O)(OR^6)_2$ である、請求項 1 または 2 に記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、またはプロドラッグ。

【請求項 4】

R^1 はアルキル、フルオロアルキル、カルボシクリル、あるいはヘテロシクリルである、請求項 1 または 2 に記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、またはプロドラッグ。

【請求項 5】

R^1 はピリミジニル、ピリジニル、ピラジニル、トリアジニル、あるいはチアゾリルである、請求項 1 に記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、またはプロドラッグ。

【請求項 6】

R^2 はそれぞれ独立して、 $-NR^4R^5$ 、ハロ、アルキル、カルボシクリル、アルコキシ、あるいは $-CN$ である、請求項 1 - 5 のいずれか 1 つに記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、またはプロドラッグ。

【請求項 7】

R^4 と R^5 はそれぞれ独立して、 $-H$ 、アルキル、あるいは $-S(O)_2R^7$ である、請求項 1 - 6 のいずれか 1 つに記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、またはプロドラッグ。

【請求項 8】

同じ N 原子に結合した R^4 と R^5 は、それらが結合している N 原子と一体となって、 $-O-$ 、 $-NH-$ 、 $-NR^6-$ 、 $-S-$ 、および $-S(O)_2-$ からなる群から選択された 0 - 3 のヘテロ原子をさらに含有する置換または非置換の 4 -、5 -、あるいは 6 - 員環複素環を形成し、および、

R^6 はアルキルである、請求項 1 - 6 のいずれか 1 つに記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、またはプロドラッグ。

【請求項 9】

R^6 はアルキル、カルボシクリル、あるいはフルオロアルキルである、請求項 1 - 7 のいずれか 1 つに記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、またはプロドラッグ。

【請求項 10】

R^7 はアルキル、カルボシクリル、随意に置換されたアリール、随意に置換されたアラキル、あるいは随意に置換されたヘテロシクリルである、請求項 1 - 9 のいずれか 1 つに記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、またはプロドラッグ。

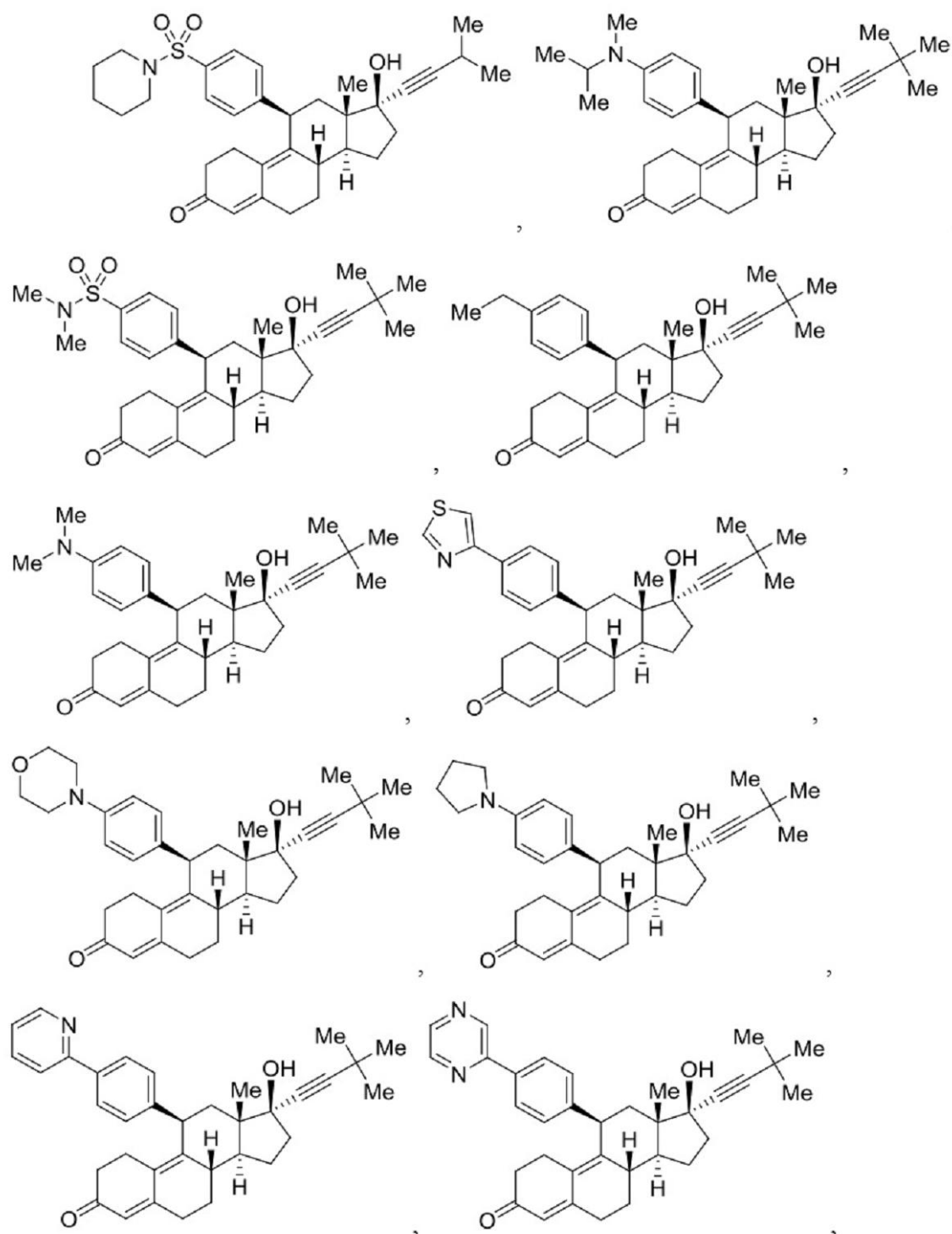
【請求項 11】

n は 0 または 1 である、請求項 1 - 10 のいずれか 1 つに記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、またはプロドラッグ。

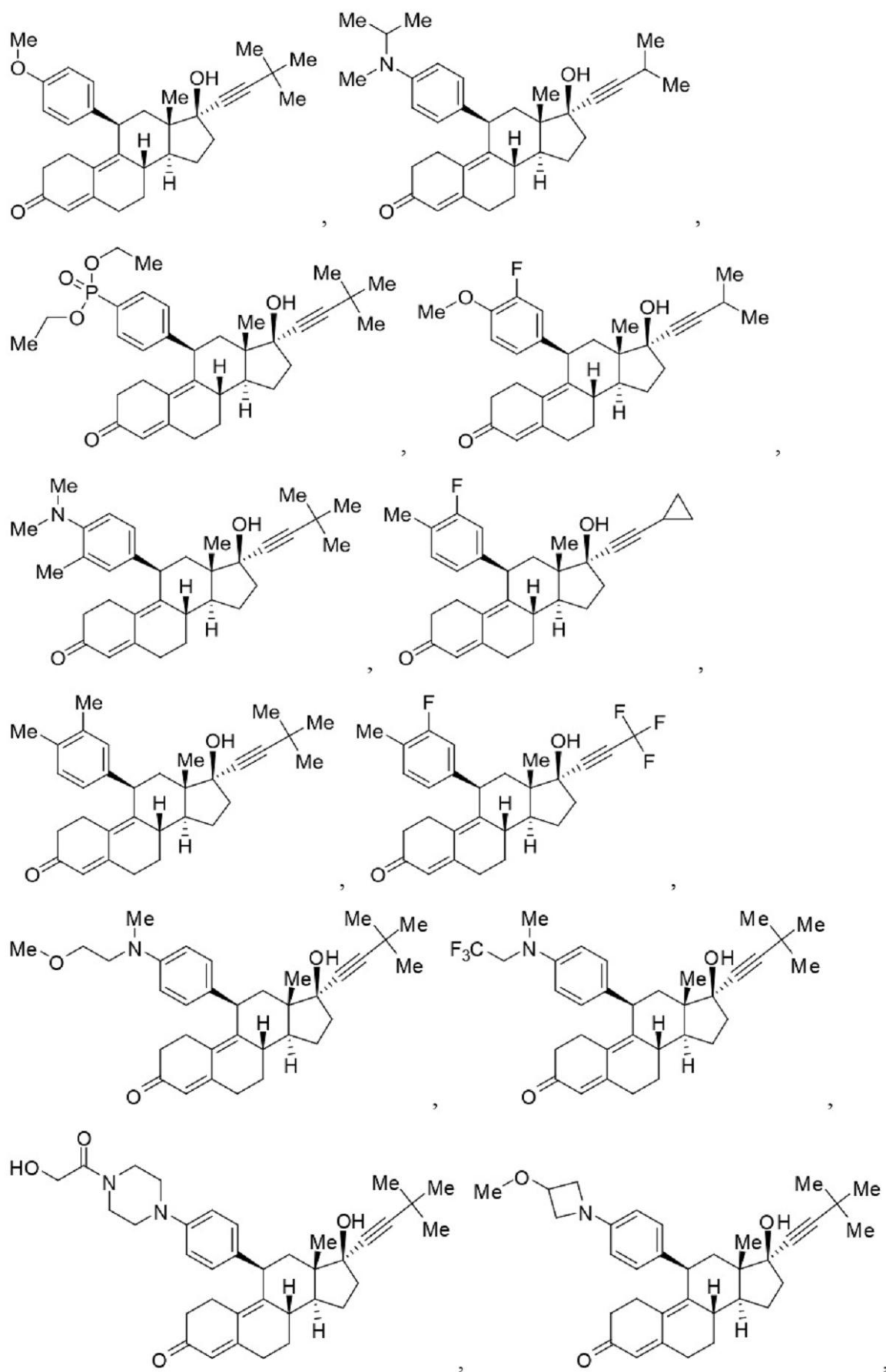
【請求項 12】

化合物は以下の構造を有する、請求項 1 に記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、またはプロドラッグ。

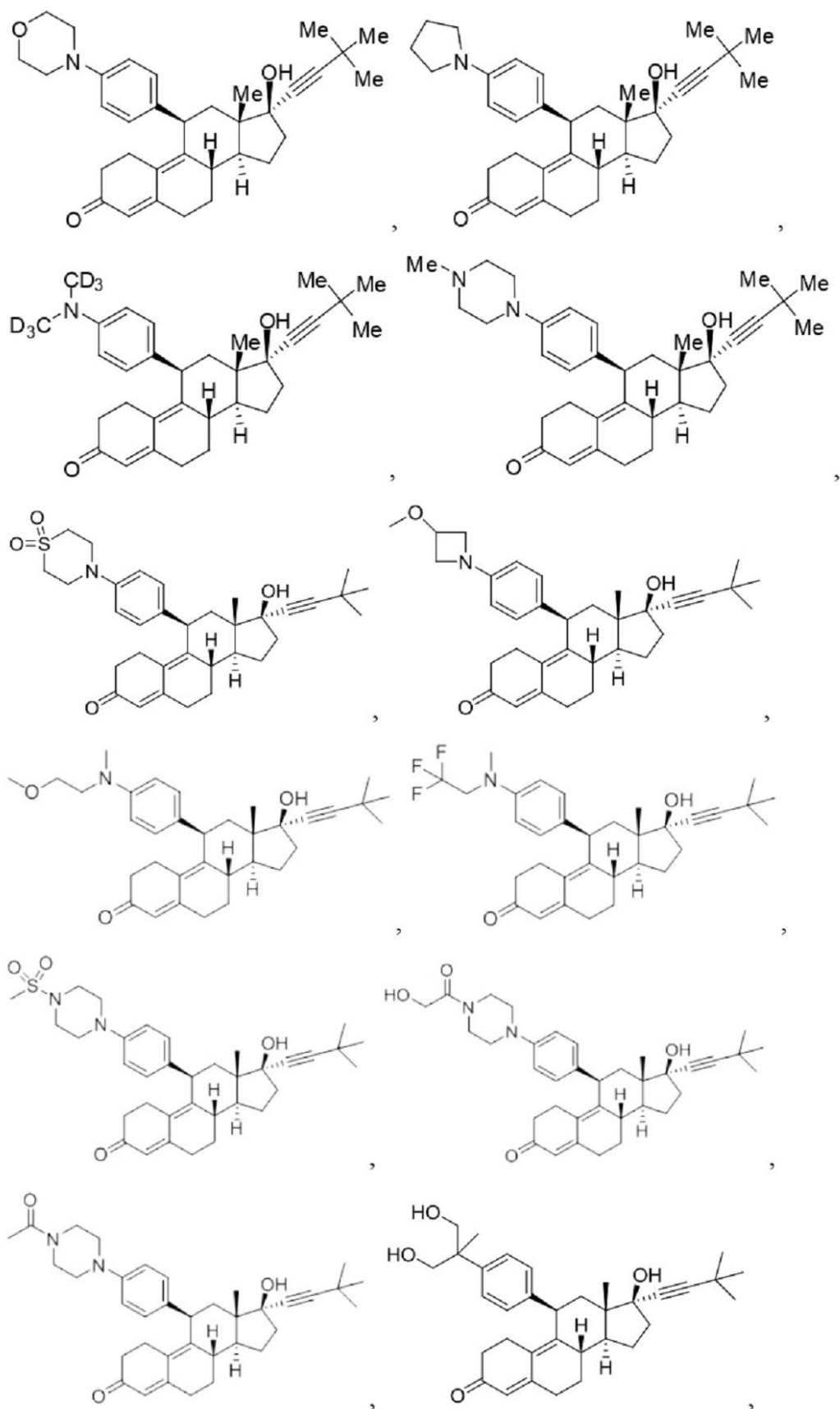
【化 2】



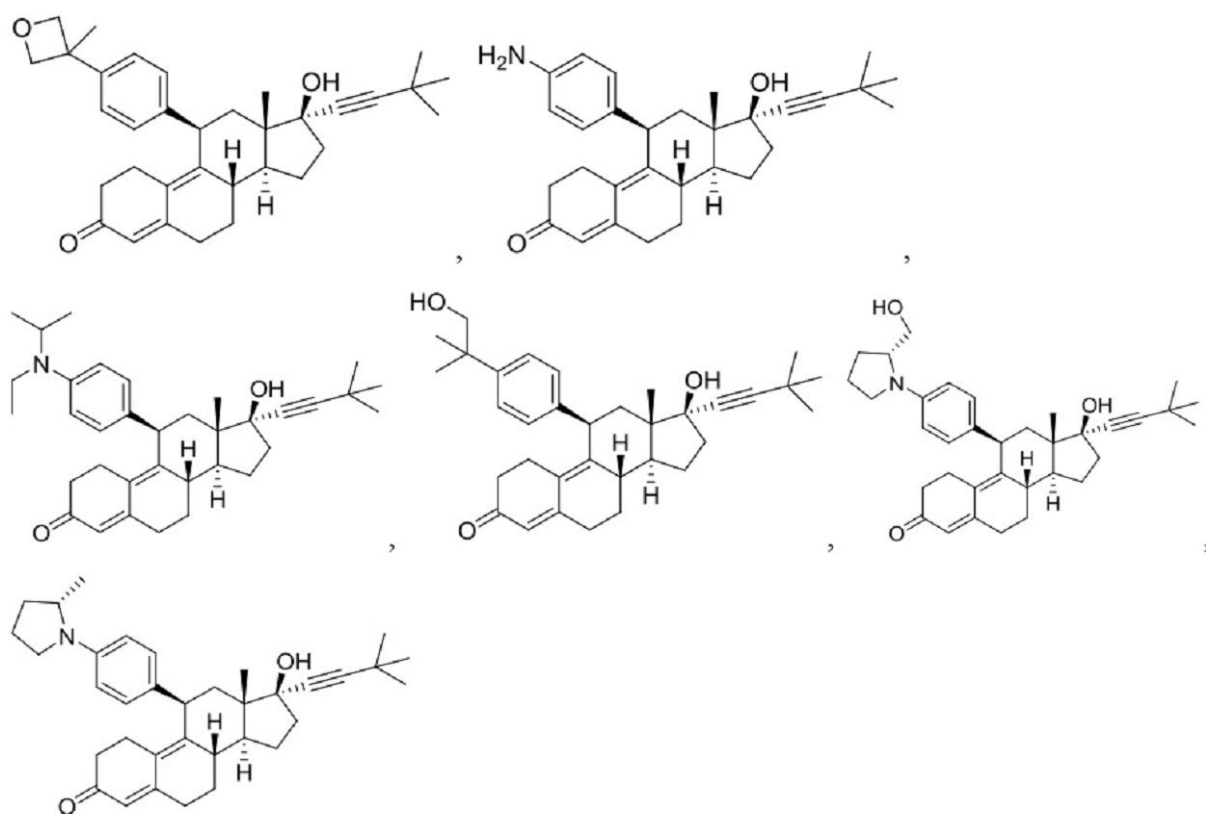
【化 3】



【化 4】



【化 5】



【請求項 1 3】

請求項 1 - 1 2 のいずれか 1 つの化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、またはプロドラッグ、および少なくとも 1 つの薬学的に許容可能な賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 1 4】

必要とする被験体の癌を処置または予防するための薬剤の製造における、請求項 1 - 1 2 のいずれか 1 つの化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、またはプロドラッグの使用。

【請求項 1 5】

必要とする被験体のコルチゾン過剰症性疾患または障害を処置するための薬剤の製造における、請求項 1 - 1 2 のいずれか 1 つの化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩、溶媒和物、またはプロドラッグの使用。