

【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31年2月14日(2019.2.14)

【公表番号】特表2018-502083(P2018-502083A)

【公表日】平成30年1月25日(2018.1.25)

【年通号数】公開・登録公報2018-003

【出願番号】特願2017-533635(P2017-533635)

【国際特許分類】

C 0 7 D	207/333	(2006.01)
A 6 1 K	31/40	(2006.01)
C 0 7 D	207/34	(2006.01)
A 6 1 P	43/00	(2006.01)
A 6 1 P	29/00	(2006.01)
A 6 1 P	13/12	(2006.01)
A 6 1 P	27/02	(2006.01)
A 6 1 P	1/16	(2006.01)
A 6 1 P	1/04	(2006.01)
A 6 1 P	11/08	(2006.01)
A 6 1 P	19/02	(2006.01)
A 6 1 P	9/00	(2006.01)
A 6 1 P	17/00	(2006.01)
A 6 1 P	21/00	(2006.01)
A 6 1 P	11/02	(2006.01)
A 6 1 P	37/00	(2006.01)
A 6 1 P	15/02	(2006.01)
A 6 1 P	13/10	(2006.01)
A 6 1 P	19/10	(2006.01)
A 6 1 P	17/04	(2006.01)
A 6 1 P	37/06	(2006.01)
A 6 1 P	17/02	(2006.01)
A 6 1 P	21/04	(2006.01)
A 6 1 P	11/00	(2006.01)
A 6 1 P	7/06	(2006.01)
A 6 1 P	11/06	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	7/04	(2006.01)
A 6 1 P	17/06	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	5/14	(2006.01)
A 6 1 P	15/08	(2006.01)
A 6 1 P	19/08	(2006.01)
A 6 1 P	1/02	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/14	(2006.01)
A 6 1 P	9/10	(2006.01)
A 6 1 P	3/06	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/02	(2006.01)

## 【 F I 】

C 0 7 D	207/333	C S P
A 6 1 K	31/40	
C 0 7 D	207/34	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	11/08	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	11/02	
A 6 1 P	37/00	
A 6 1 P	15/02	
A 6 1 P	13/10	
A 6 1 P	19/10	
A 6 1 P	17/04	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	21/04	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	7/06	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	7/04	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	5/14	
A 6 1 P	15/08	
A 6 1 P	19/08	
A 6 1 P	1/02	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/14	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	3/06	
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 P	35/02	

## 【 手続補正書 】

【 提出日 】 平成30年12月27日 (2018.12.27)

## 【 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

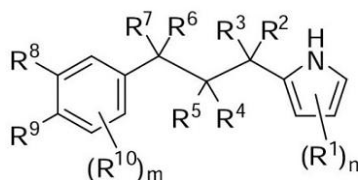
【補正の内容】

【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、または溶媒和物であって、

【化 1】



式 (I)

式中、

$R^1$  はそれぞれ独立して、H、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  フルオロアルキル、 $C_1 - C_6$  ジュウテロアルキル、 $C_3 - C_6$  シクロアルキル、 $C_1 - C_6$  ヒドロキシアルキル、または  $C_1 - C_6$  ヘテロアルキルであり、

$R^2$  は  $C_1 - C_6$  アルコキシまたはヒドロキシであり、

$R^3$  は  $C_1 - C_6$  アルコキシまたはヒドロキシであり、あるいは、 $R^2$  と  $R^3$  は、それらが結合する炭素原子と一体となって、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=NR^{13})-$ 、 $-C(=N-OR^{13})-$ 、または 2 つの O 原子を含有する複素環を形成し、

$R^{13}$  は H または  $C_1 - C_6$  アルキルであり、

$R^4$  は、H、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  フルオロアルキル、または  $C_1 - C_6$  ジュウテロアルキルであり、

$R^5$  は、H、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  フルオロアルキル、または  $C_1 - C_6$  ジュウテロアルキルであり、あるいは、 $R^4$  と  $R^5$  は、それらが結合する炭素原子と一体となって、置換または非置換の  $C_3 - C_6$  シクロアルキル環、あるいは  $-O-$ 、 $-NR^{12}-$  および、 $-S-$  から選択された 1 つまたは 2 つのヘテロ原子を含む置換または非置換の  $C_3 - C_6$  複素環を形成し、

$R^6$  は、H、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  フルオロアルキル、または  $C_1 - C_6$  ジュウテロアルキルであり、

$R^7$  は、H、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  フルオロアルキル、または  $C_1 - C_6$  ジュウテロアルキルであり、あるいは、 $R^6$  と  $R^7$  は、それらが結合する炭素原子と一体となって、置換または非置換の  $C_3 - C_6$  シクロアルキル環、あるいは  $-O-$ 、 $-NR^{12}-$  および、 $-S-$  から選択された 1 つまたは 2 つのヘテロ原子を含む置換または非置換の  $C_3 - C_6$  複素環を形成し、

$R^8$  は、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  フルオロアルキル、 $C_1 - C_6$  ジュウテロアルキル、 $C_1 - C_6$  シクロアルキル、 $C_1 - C_6$  ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_6$  ヘテロアルキル、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OH$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-SR^{11}$ 、 $-S(=O)R^{11}$ 、 $-S(=O)_2R^{11}$ 、 $-S(=O)_2N(R^{12})_2$ 、 $-NR^{12}S(=O)_2R^{11}$ 、 $-C(=O)R^{11}$ 、 $-OC(=O)R^{11}$ 、 $-CO_2R^{12}$ 、 $-OCO_2R^{11}$ 、 $-N(R^{12})_2$ 、 $-C(=O)N(R^{12})_2$ 、 $-OC(=O)N(R^{12})_2$ 、 $-NHC(=O)R^{11}$ 、または  $-NHC(=O)OR^{11}$  であり、

$R^9$  は、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  フルオロアルキル、 $C_1 - C_6$  ジュウテロアルキル、 $C_1 - C_6$  シクロアルキル、 $C_1 - C_6$  ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_6$  ヘテロアルキル、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OH$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-SR^{11}$ 、 $-S(=O)R^{11}$ 、 $-S(=O)_2R^{11}$ 、 $-S(=O)_2N(R^{12})_2$ 、 $-NR^{12}S(=O)_2R^{11}$ 、 $-C(=O)R^{11}$ 、 $-OC(=O)R^{11}$ 、 $-CO_2R^{12}$ 、 $-OCO_2$

$R^{11}$ 、 $-N(R^{12})_2$ 、 $-C(=O)N(R^{12})_2$ 、 $-OC(=O)N(R^{12})_2$ 、 $-NHC(=O)R^{11}$ 、または  $-NHC(=O)OR^{11}$  であり、あるいは、

$R^{10}$  はそれぞれ独立して、H、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  フルオロアルキル、 $C_1 - C_6$  ジュウテロアルキル、 $C_1 - C_6$  シクロアルキル、 $C_1 - C_6$  ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_6$  ヘテロアルキル、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OH$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-SR^{11}$ 、 $-S(=O)R^{11}$ 、 $-S(=O)_2R^{11}$ 、 $-S(=O)_2N(R^{12})_2$ 、 $-NR^{12}S(=O)_2R^{11}$ 、 $-C(=O)R^{11}$ 、 $-OC(=O)R^{11}$ 、 $-CO_2R^{12}$ 、 $-OCO_2R^{11}$ 、 $-N(R^{12})_2$ 、 $-C(=O)N(R^{12})_2$ 、 $-OC(=O)N(R^{12})_2$ 、 $-NHC(=O)R^{11}$ 、または  $-NHC(=O)OR^{11}$  であり、

$R^{11}$  はそれぞれ独立して、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  フルオロアルキル、 $C_1 - C_6$  ジュウテロアルキル、または  $C_3 - C_6$  シクロアルキルであり、

$R^{12}$  はそれぞれ独立して、H、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  フルオロアルキル、 $C_1 - C_6$  ジュウテロアルキル、または  $C_3 - C_6$  シクロアルキルであり、

$n$  は 0、1、2、または 3 であり、および、

$m$  は 0、1、2、または 3 である、化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物。

#### 【請求項 2】

$R^1$  はそれぞれ独立して、H、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  フルオロアルキル、 $C_3 - C_6$  シクロアルキルであり、

$R^2$  と  $R^3$  は、それらが結合する炭素原子と一体となって、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=NR^{13})-$ 、 $-C(=N-OR^{13})-$ 、または 2 つの O 原子を含有する複素環を形成し、

$R^{13}$  は H または  $C_1 - C_6$  アルキルであり、

$R^4$  は、H、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  フルオロアルキル、または  $C_1 - C_6$  ジュウテロアルキルであり、

$R^5$  は、H、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  フルオロアルキル、または  $C_1 - C_6$  ジュウテロアルキルであり、

$R^6$  は、H、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  フルオロアルキル、または  $C_1 - C_6$  ジュウテロアルキルであり、および、

$R^7$  は、H、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  フルオロアルキル、または  $C_1 - C_6$  ジュウテロアルキルである、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または溶媒和物。

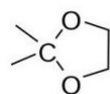
#### 【請求項 3】

$R^1$  はそれぞれ独立して、H、F、Cl、Br、または  $C_1 - C_6$  アルキルである、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または溶媒和物。

#### 【請求項 4】

$R^2$  と  $R^3$  は、それらが結合する炭素原子と一体となって、 $-C(=O)-$ 、 $-C(=NH)-$ 、 $-C(=N-OH)-$ 、または、

#### 【化 2】



を形成する、請求項 1 - 3 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または溶媒和物。

#### 【請求項 5】

$R^4$  は H または  $C_1 - C_6$  アルキルであり、

$R^5$  は H または  $C_1 - C_6$  アルキルであり、

$R^6$  は H または  $C_1 - C_6$  アルキルであり、および、

$R^7$  は H または  $C_1 - C_6$  アルキルである、請求項 1 - 4 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または溶媒和物。

【請求項 6】

$R^8$  は、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  フルオロアルキル、 $C_1 - C_6$  ジュウテロアルキル、 $C_1 - C_6$  シクロアルキル、 $C_1 - C_6$  ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_6$  ヘテロアルキル、 $-OH$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-SR^{11}$ 、 $-S(=O)R^{11}$ 、 $-S(=O)_2R^{11}$ 、 $-C(=O)R^{11}$ 、 $-CO_2R^{12}$ 、 $-N(R^{12})_2$ 、または  $-C(=O)N(R^{12})_2$  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または溶媒和物。

【請求項 7】

$R^9$  は、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_6$  ヘテロアルキル、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OH$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-SR^{11}$ 、 $-S(=O)R^{11}$ 、 $-S(=O)_2R^{11}$ 、 $-S(=O)_2N(R^{12})_2$ 、 $-NR^{12}S(=O)_2R^{11}$ 、 $-C(=O)R^{11}$ 、 $-OC(=O)R^{11}$ 、 $-CO_2R^{12}$ 、 $-OCO_2R^{11}$ 、 $-N(R^{12})_2$ 、 $-C(=O)N(R^{12})_2$ 、 $-OC(=O)N(R^{12})_2$ 、 $-NHC(=O)R^{11}$ 、または  $-NHC(=O)OR^{11}$  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または溶媒和物。

【請求項 8】

$R^{10}$  はそれぞれ独立して、H、ハロゲン、 $C_1 - C_6$  アルキル、 $C_1 - C_6$  フルオロアルキル、 $C_1 - C_6$  ジュウテロアルキル、 $C_1 - C_6$  シクロアルキル、 $C_1 - C_6$  ヒドロキシアルキル、 $C_1 - C_6$  ヘテロアルキル、 $-OH$ 、 $-OR^{11}$ 、 $-SR^{11}$ 、 $-S(=O)R^{11}$ 、 $-S(=O)_2R^{11}$ 、 $-C(=O)R^{11}$ 、 $-CO_2R^{12}$ 、 $-N(R^{12})_2$ 、または  $-C(=O)N(R^{12})_2$  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または溶媒和物。

【請求項 9】

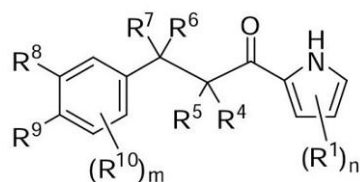
$n$  は 2 または 3 であり；及び

$m$  は 1 である、請求項 1 - 8 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または溶媒和物。

【請求項 10】

化合物が以下の式 (II) の構造を有する、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または溶媒和物。

【化 3】

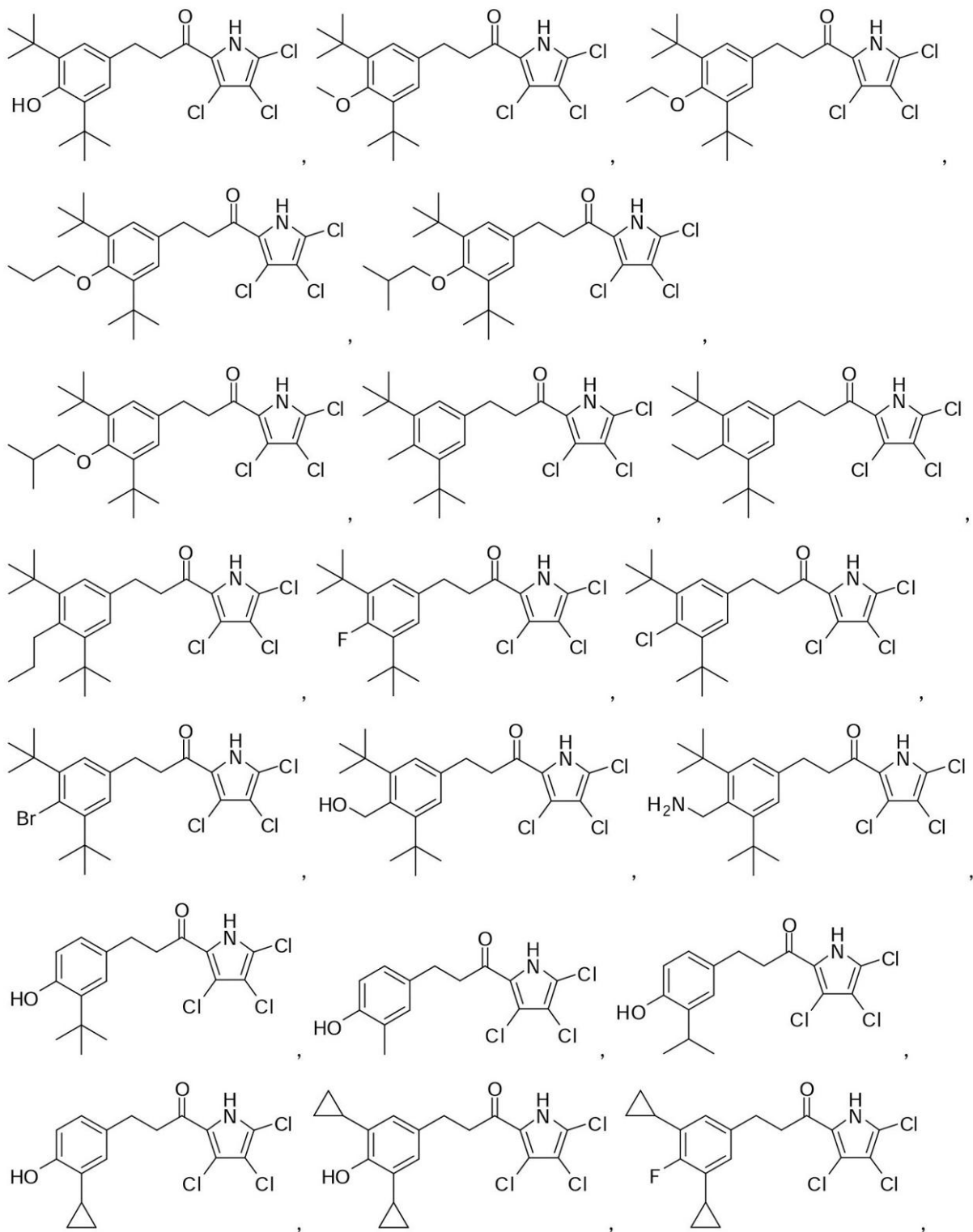


式 (II)

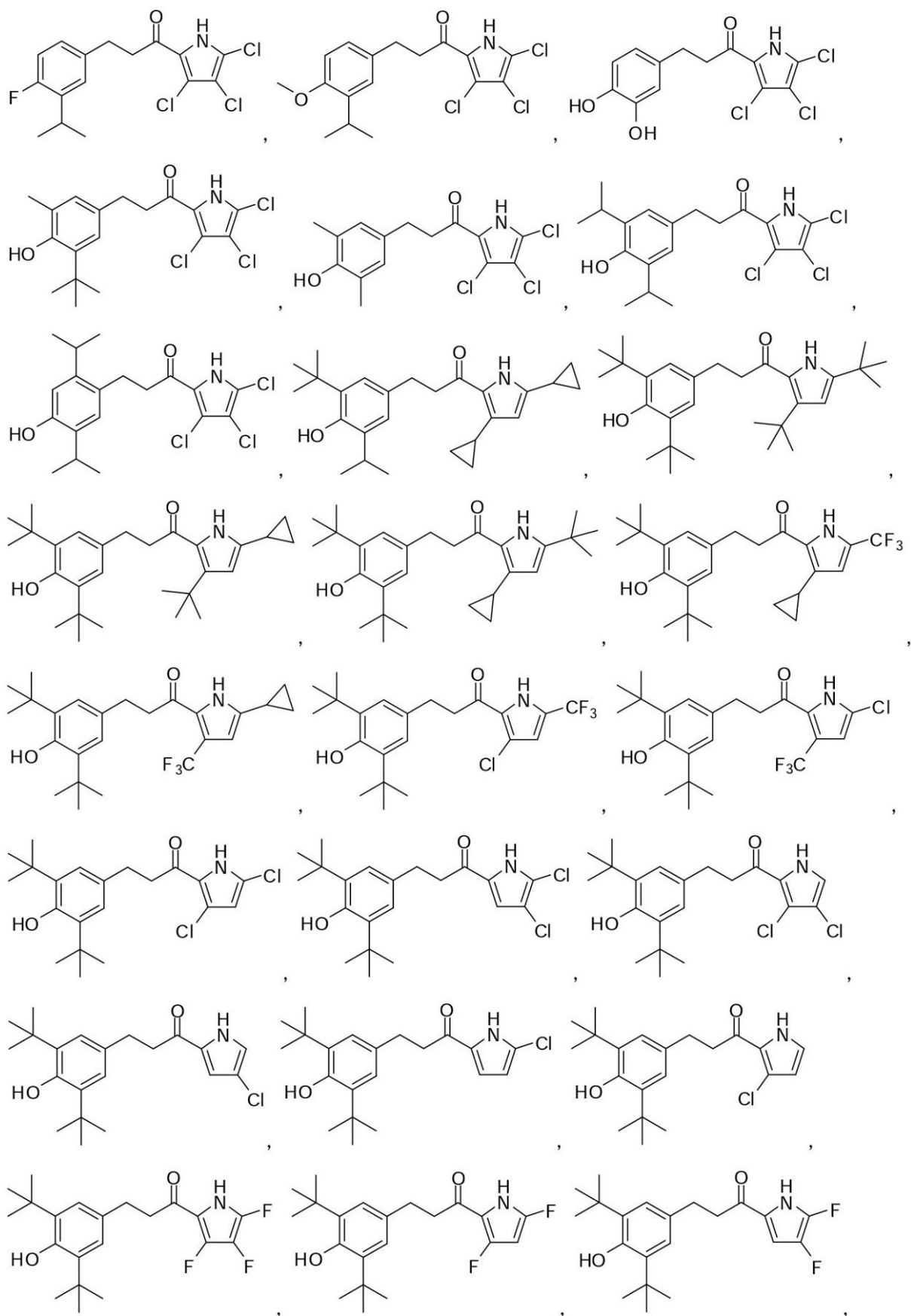
【請求項 11】

化合物は以下である、請求項 1 に記載の化合物。

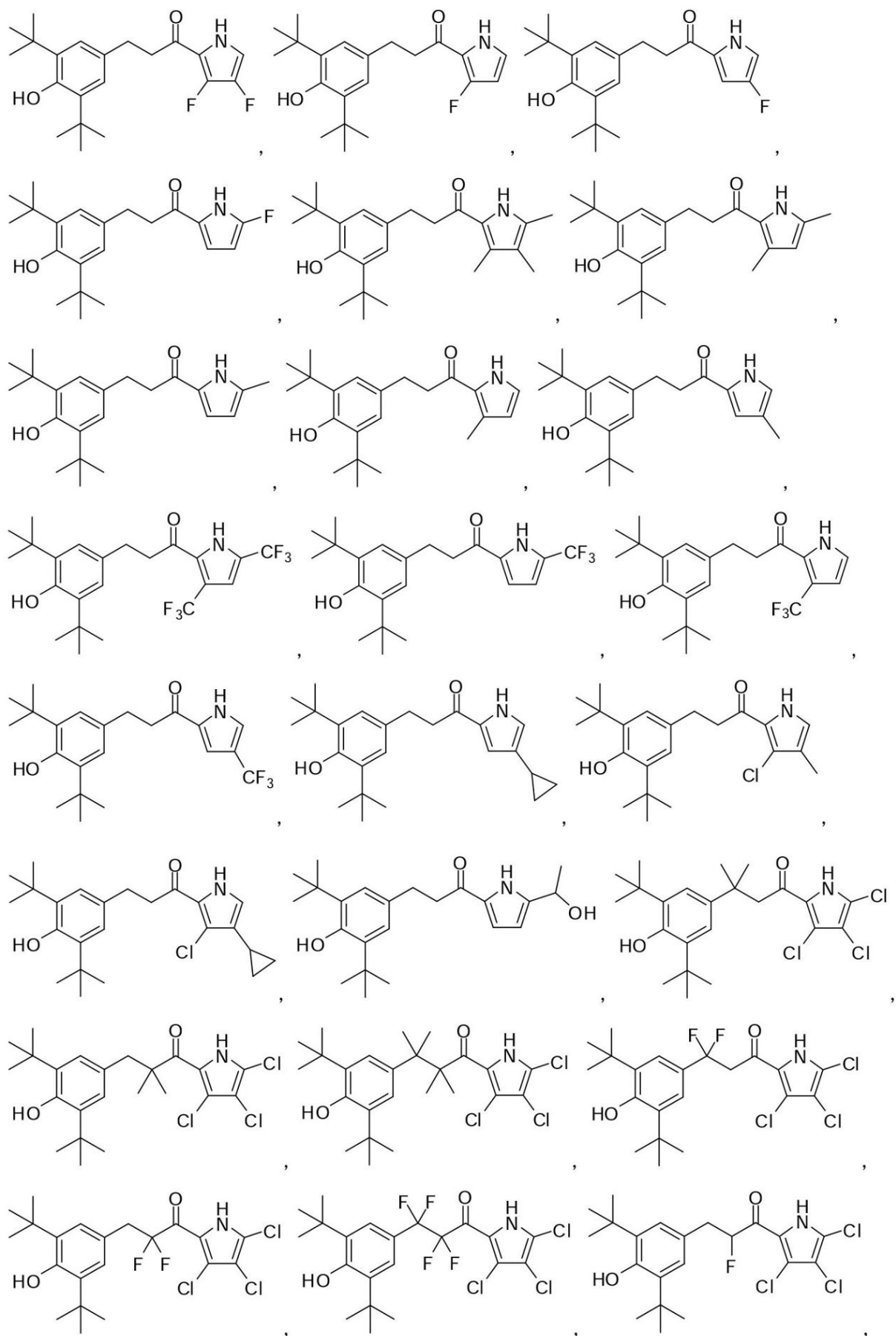
【化 4】



## 【化 5】

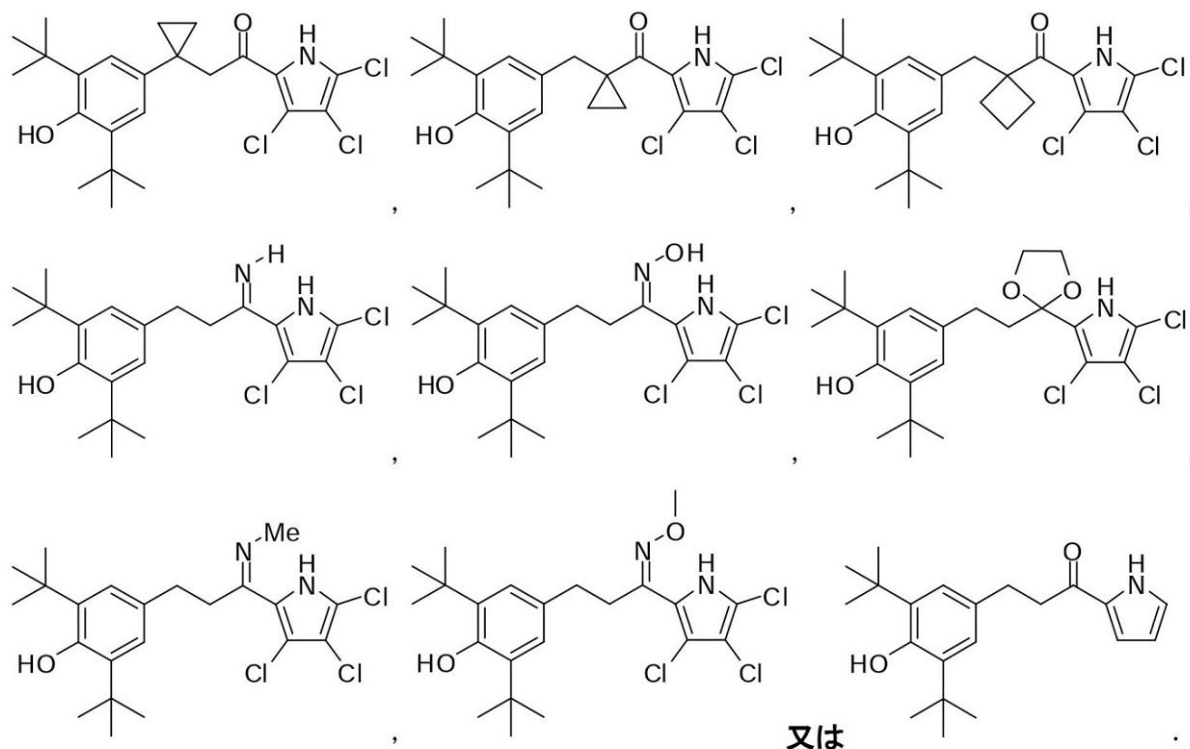


【化 6】





## 【化 7】



## 【請求項 1 2】

請求項 1 - 1 1 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または溶媒和物、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 3】

治療による処置方法における使用のための；あるいは、 $\text{Ca}^{2+}$  放出活性化  $\text{Ca}^{2+}$  (CRAC) チャネル関連疾患または障害を処置する方法における使用のための、請求項 1 - 1 1 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、または溶媒和物。

## 【請求項 1 4】

$\text{Ca}^{2+}$  放出活性化  $\text{Ca}^{2+}$  (CRAC) チャネル関連疾患または障害は、炎症、癌または他の増殖性疾患、肝臓の疾患または障害、腎臓の疾患または障害、あるいは炎症性の肺障害に關与する免疫系関連の疾患または障害である、請求項 1 3 に記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩、または溶媒和物。

## 【請求項 1 5】

$\text{Ca}^{2+}$  放出活性化  $\text{Ca}^{2+}$  (CRAC) チャネル関連疾患または障害は、炎症、糸球体腎炎、ブドウ膜炎、肝臓の疾患または障害、腎臓の疾患または障害、炎症性の肺障害、慢性閉塞性肺疾患、関節リウマチ、炎症性腸疾患、血管炎、皮膚炎、変形性関節症、炎症性の筋肉疾患、アレルギー性鼻炎、膣炎、間質性膀胱炎、強皮症、骨粗鬆症、湿疹、同種移植または異種移植、移植片拒絶反応、移植片対宿主病、紅斑性狼瘡、肺線維症、皮膚筋炎、甲状腺炎、重症筋無力症、自己免疫性溶血性貧血、囊胞性線維症、慢性の再発性肝炎、原発性胆汁性肝硬変、アレルギー性結膜炎、肝炎、アトピー性皮膚炎、喘息、シェーグレン症候群、移植臓器拒絶、多発性硬化症、ギラン・バレー症候群、自己免疫性ブドウ膜

炎、自己免疫性溶血性貧血、悪性貧血、自己免疫性血小板減少、側頭動脈炎、抗リン脂質抗体症候群、ヴェーゲナー肉芽腫症、ベーチェット病のような血管炎、乾癬、疱疹状皮膚炎、尋常性天疱瘡、白斑、クローン病、大腸炎、潰瘍性大腸炎、原発性胆汁性肝硬変、自己免疫性肝炎、1型または免疫媒介性の真性糖尿病、グレース病、橋本甲状腺炎、自己免疫性卵巣炎と精巣炎、副腎の自己免疫障害、全身性エリテマトーデス、多発性筋炎、皮膚筋炎、強直性脊椎炎、移植拒絶反応、皮膚移植片拒絶反応、関節炎、骨吸収の増加に関連する骨疾患、回腸炎、バレット症候群、成人呼吸窮迫症候群、慢性閉塞性気道疾患；角膜変性、トラコーマ、オンコセルカ症、交感性眼炎、眼内炎；歯肉炎、歯周炎；結核；ハンセン病；尿毒症の合併症、ネフローゼ；硬化性皮膚炎、乾癬、神経系の慢性脱髄症、エイズ関連の神経変性、アルツハイマー病、感染性髄膜炎、脳脊髄炎、パーキンソン病、ハンチントン病、筋萎縮性側索硬化症、ウイルスまたは自己免疫性の脳炎；自己免疫障害、免疫複合体血管炎、全身性紅斑性およびエリテマトーデス；全身性エリテマトーデス（SLE）；心筋症、虚血性心疾患高コレステロール血症、アテローム性動脈硬化症、子癇前症；慢性肝不全、脳と脊髄の損傷、あるいは癌である、請求項13に記載の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩、または溶媒和物。