

【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25年5月23日(2013.5.23)

【公表番号】特表2012-523419(P2012-523419A)

【公表日】平成24年10月4日(2012.10.4)

【年通号数】公開・登録公報2012-040

【出願番号】特願2012-504795(P2012-504795)

【国際特許分類】

C 07 D 471/04	(2006.01)
A 61 K 31/4709	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
C 07 D 498/04	(2006.01)
A 61 K 31/517	(2006.01)
A 61 K 31/444	(2006.01)
A 61 K 31/506	(2006.01)
A 61 K 45/00	(2006.01)
A 61 P 31/12	(2006.01)
A 61 K 38/21	(2006.01)
A 61 K 9/20	(2006.01)
A 61 K 9/48	(2006.01)

【F I】

C 07 D 471/04	1 2 1
C 07 D 471/04	C S P
A 61 K 31/4709	
A 61 P 43/00	1 2 3
C 07 D 498/04	1 1 6
A 61 K 31/517	
A 61 K 31/444	
A 61 K 31/506	
A 61 K 45/00	
A 61 P 31/12	
A 61 K 37/66	G
A 61 K 9/20	
A 61 K 9/48	
A 61 P 43/00	1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成25年4月5日(2013.4.5)

【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

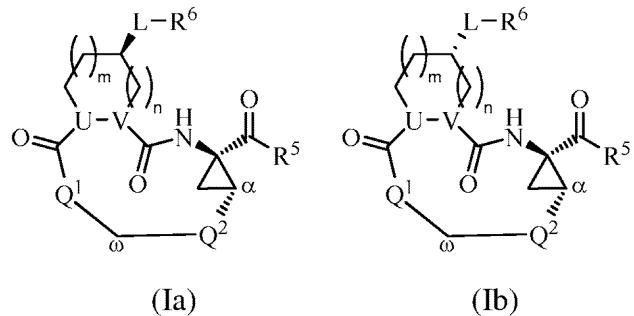
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Ia又はIbの化合物、又はそれらの単一の鏡像異性体、ラセミ混合物、ジアステレオマーの混合物、若しくは同位体変種；又は、それらの医薬として許容し得る塩、溶媒和物、若しくはプロドラッグ：

【化 1】



(式中：

R^5 は、 $-OH$ 、 $-NR^8R^9$ 、 $-NHS(O)_2R^8$ 、 $-NHS(O)_2NR^8R^9$ 、 $-NHC(O)R^8$ 、 $-NHC(O)NR^8R^9$ 、 $-C(O)R^8$ 、 又は $-C(O)NR^8R^9$ であり； ここで

各R⁸は独立して、水素、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₇シクロアルキル、C₆₋₁₄アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、C₁₋₆アルキル-C₃₋₇シクロアルキレン、-CH₂NR^{8a}R^{8b}、-CH(R^{8c})NR^{8a}R^{8b}、-CHR^{8c}CHR^{8d}NR^{8a}R^{8b}、又は-CH₂CR^{8c}R^{8d}NR^{8a}R^{8b}であり、ここで：

R^{8a} 、 R^{8c} 、及び R^{8d} の各々は独立して、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-7} シクロアルキル、 C_{6-14} アリール、 C_{7-15} アラルキル、ヘテロアリール、又はヘテロシクリルであり；かつ

各R^{8b}は独立して、水素、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₇シクロアルキル、C₆₋₁₄アリール、C₇₋₁₅アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、-C(O)R¹¹、-C(O)OR¹¹、-C(O)NR¹¹R¹²、-C(=NR¹³)NR¹¹R¹²、-S(O)R¹¹、-S(O)₂R¹¹、-S(O)NR¹¹R¹²、又は-S(O)₂NR¹¹R¹²であり、ここでR¹¹、R¹²、及びR¹³の各々は独立して、水素、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₇シクロアルキル、C₆₋₁₄アリール、C₇₋₁₅アラルキル、ヘテロアリール、若しくはヘテロシクリルであるか；又は、R¹¹とR¹²は、それらが結合したN原子と一緒にヘテロシクリルを形成するか；又は

R^aとR^bは、それらが結合したN原子と一緒に、ヘテロシクリルを形成しがつ

各R⁹は独立して、水素、C₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₇シクロアルキル、C₆₋₁₄アリール、C₇₋₁₅アラルキル、ヘテロアリール、若しくはヘテロシクリルであるか；又は

R^8 と R^9 は、それらが結合したN原子と一緒に、ヘテロシクリルを形成し：

R^6 及び $|R|$ は、(i)又は(ii)であり：

(i) R^6 は、水素、 $C_{1\sim 6}$ アルキル、 $C_{2\sim 6}$ アルケニル、 $C_{2\sim 6}$ アルキニル、 $C_{3\sim 7}$ シクロアルキル、 $C_{6\sim 14}$ アリール、ヘテロアリール、若しくはヘテロシクリルであり；かつ

Lは、結合、 C_{1-6} アルキレン、 C_{2-6} アルケニレン、 C_{2-6} アルキニレン、 C_{3-7} シクロアルキレン、-X-、若しくは $-(CR^{6a}R^{6b})_pX-$ であり；ここで、pは、1、2、若しくは3の整数であり； R^{6a} 及び R^{6b} は各々独立して、水素、ハロ、シアノ、ヒドロキシル、若しくはアルコキシであり；かつ、Xは、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)O-$ 、 $-C(O)NR^{14}-$ 、 $-C(=NR^{14})NR^{15}-$ 、 $-O-$ 、 $-OC(O)O-$ 、 $-OC(O)NR^{14}-$ 、 $-OC(=NR^{14})NR^{15}-$ 、 $-OP(O)(OR^{14})-$ 、 $-NR^{14}-$ 、 $-NR^{14}C(O)NR^{15}-$ 、 $-NR^{14}C(=NR^{15})NR^{16}-$ 、 $-NR^{14}S(O)NR^{15}-$ 、 $-NR^{14}S(O)_2NR^{15}-$ 、 $-S-$ 、 $-S(O)-$ 、 $-S(O)_2-$ 、 $-S(O)NR^{14}-$ 、 $-S(O)_2NR^{14}-$ 、若しくは $-P(O)(OR^{14})-$ であり、ここで R^{14} 、 R^{15} 、及び R^{16} の各々は独立して、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-7} シクロアルキル、 C_{6-14} アリール、 C_{7-15} アラルキル、ヘテロアリール、若しくはヘテロシクリルであるか；又は

(ii) -L-R⁶ は、 -O-N=CR^{6c}R^{6d} であり、ここで、R^{6c} 及びR^{6d} の各々は独立して、水素、C₁₋₆ アルキル、C₂₋₆ アルケニル、C₂₋₆ アルキニル、C₃₋₇ シクロアルキル、C₆₋₁₄ アリール、C₇₋₁₅ アラルキル、ヘテロアリール、若しくはヘテロシクリルであるか；又は、R^{6c} とR^{6d} は、それらが結合したC原子と一緒に、C₃₋₁₅ シクロアルキリデン、C₆₋₁₄ アリリデン、ヘテロアリリデン、若しくはヘテロシクリリデンを形成し：

Q^1 は、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{N}(\text{R}^{17})-$ 、 $-\text{C}(\text{R}^{18}\text{R}^{19})-$ 、又は $-\text{CR}^{17}(\text{NR}^{18}\text{R}^{19})-$ であり、ここで

R^{17} 及び R^{18} の各々は独立して、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-7} シクロアルキル、 C_{6-14} アリール、 C_{7-15} アラルキル、ヘテロアリール、又はヘテロシクリルであり；かつ

各 R^{19} は独立して、 $-R^{20}$ 、 $-C(O)R^{20}$ 、 $-C(O)OR^{20}$ 、 $-C(O)NR^{21}R^{22}$ 、 $-C(=NR^{20})NR^{21}R^{22}$ 、 $-S(O)R^{20}$ 、若しくは $-S(O)_2R^{20}$ であり；ここで、 R^{20} 、 R^{21} 、及び R^{22} の各々は独立して、水素、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-7} シクロアルキル、 C_{6-14} アリール、 C_{7-15} アラルキル、ヘテロアリール、若しくはヘテロシクリルであるか；又は、 R^{21} と R^{22} は、それらが結合したN原子と一緒にヘテロシクリルを形成するか；又は

R^{18} と R^{19} は、それらが結合したC又はN原子と一緒に、 C_{3-7} シクロアルキル又はヘテロシクリルを形成し；

Q^2 は、各々任意に、O、N及びSから独立して選択された、1~3個のヘテロ原子を鎖内に含む、 C_{3-9} アルキレン、 C_{3-9} アルケニレン、又は C_{3-9} アルキニレンであり；

U及びVは、各々独立して、N又はCHであり；但し、U及びVの少なくとも1つはNであることを条件とし；かつ

m は、0又は1の整数であり；かつ、 n は、1又は2の整数であり；但し、 m と n の合計は、2又は3であることを条件とし；

ここでアルキル、アルキレン、アルケニル、アルケニレン、アルキニル、アルキニレン、シクロアルキル、シクロアルキレン、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、及びヘテロアリールの各々は、(a)シアノ、ハロ、及びニトロ；(b)1個以上の、一実施態様においては1、2、3若しくは4個の置換基Qにより各々任意に置換された、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-7} シクロアルキル、 C_{6-14} アリール、 C_{7-15} アラルキル、ヘテロアリール、及びヘテロシクリル；並びに、(c) $-C(O)R^a$ 、 $-C(O)OR^a$ 、 $-C(O)NR^bR^c$ 、 $-C(NR^a)NR^bR^c$ 、 $-OR^a$ 、 $-OC(O)R^a$ 、 $-OC(O)OR^a$ 、 $-OC(O)NR^bR^c$ 、 $-OC(=NR^a)NR^bR^c$ 、 $-OS(O)R^a$ 、 $-O(S(O)_2R^a$ 、 $-OS(O)NR^bR^c$ 、 $-OS(O)_2NR^bR^c$ 、 $-NR^bR^c$ 、 $-NR^aC(O)R^d$ 、 $-NR^aC(O)OR^d$ 、 $-NR^aC(O)NR^b$ 、 $-NR^aC(=NR^d)NR^bR^c$ 、 $-NR^aS(O)R^d$ 、 $-NR^aS(O)_2R^d$ 、 $-NR^aS(O)NR^bR^c$ 、 $-NR^aS(O)_2NR^bR^c$ 、 $-S(R^a)$ 、 $-S(O)R^a$ 、 $-S(O)_2R^a$ 、 $-S(O)NR^bR^c$ 、及び $-S(O)_2NR^bR^c$ であり、ここで R^a 、 R^b 、 R^c 、及び R^d の各々が独立して、(i)水素であるか；(ii)1個以上の、一実施態様においては1、2、3若しくは4個の置換基Qにより各々任意に置換された、 C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-7} シクロアルキル、 C_{6-14} アリール、 C_{7-15} アラルキル、ヘテロアリール、若しくはヘテロシクリルであるか；又は、(iii) R^b と R^c は、それらが結合したN原子と一緒に、1個以上の、一実施態様においては1、2、3若しくは4個の置換基Qにより任意に置換された、ヘテロシクリルを形成するもの：から各々独立して選択された、1個以上の基により任意に置換され；

ここで各Qは、(a)シアノ、ハロ、及びニトロ；(b) C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-7} シクロアルキル、 C_{6-14} アリール、 C_{7-15} アラルキル、ヘテロアリール、及びヘテロシクリル；並びに、(c) $-C(O)R^e$ 、 $-C(O)OR^e$ 、 $-C(O)NR^fR^g$ 、 $-C(NR^e)NR^fR^g$ 、 $-OR^e$ 、 $-OC(O)R^e$ 、 $-OC(O)OR^e$ 、 $-OC(O)NR^fR^g$ 、 $-OC(=NR^e)NR^fR^g$ 、 $-OS(O)R^e$ 、 $-OS(O)_2R^e$ 、 $-OS(O)NR^fR^g$ 、 $-OS(O)_2NR^fR^g$ 、 $-NR^fR^g$ 、 $-NR^eC(O)R^h$ 、 $-NR^eC(O)OR^f$ 、 $-NR^eC(O)NR^fR^g$ 、 $-NR^eC(=NR^h)NR^fR^g$ 、 $-NR^eS(O)R^h$ 、 $-NR^eS(O)_2R^h$ 、 $-NR^eS(O)NR^fR^g$ 、 $-NR^eS(O)_2NR^fR^g$ 、 $-SR^e$ 、 $-S(O)R^e$ 、 $-S(O)_2R^e$ 、 $-S(O)NR^fR^g$ 、及び $-S(O)_2NR^fR^g$ ：からなる群から独立して選択され；ここで、 R^e 、 R^f 、 R^g 、及び R^h の各々は独立して、(i)水素；(ii) C_{1-6} アルキル、 C_{2-6} アルケニル、 C_{2-6} アルキニル、 C_{3-7} シクロアルキル、 C_{6-14} アリール、 C_{7-15} アラルキル、ヘテロアリール、若しくはヘテロシクリルであるか；又は、(iii) R^f と R^g は、それらが結合したN原子と一緒に、ヘテロシクリルを形成する。)。