

【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 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 498/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 K 38/21 (2006.01)

A 6 1 K 9/20 (2006.01)

A 6 1 K 9/48 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/04 1 2 1

C 0 7 D 471/04 C S P

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 P 43/00 1 2 3

C 0 7 D 498/04 1 1 6

A 6 1 K 31/517

A 6 1 K 31/444

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 31/12

A 6 1 K 37/66 G

A 6 1 K 9/20

A 6 1 K 9/48

A 6 1 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

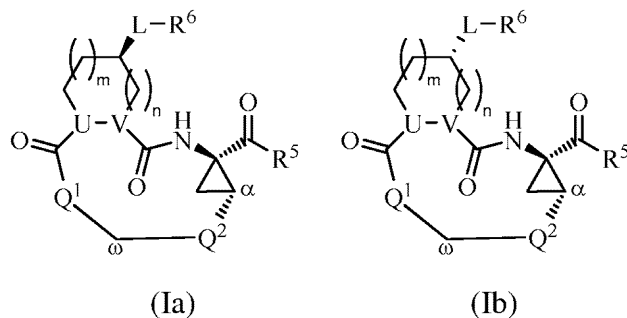
【補正の内容】

【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、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{R}^8$ 、 $-\text{NHS}(\text{O})_2\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{R}^8$ 、 $-\text{NHC}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^8$ 、又は $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$ であり；ここで

各 $R^8$ は独立して、水素、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニル、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニル、 $\text{C}_{3-7}$ シクロアルキル、 $\text{C}_{6-14}$ アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル- $\text{C}_{3-7}$ シクロアルキレン、 $-\text{CH}_2\text{NR}^{8a}\text{R}^{8b}$ 、 $-\text{CH}(\text{R}^{8c})\text{NR}^{8a}\text{R}^{8b}$ 、 $-\text{CHR}^{8c}\text{CHR}^{8d}\text{NR}^{8a}\text{R}^{8b}$ 、又は $-\text{CH}_2\text{CR}^{8c}\text{R}^{8d}\text{NR}^{8a}\text{R}^{8b}$ であり、ここで：

$R^{8a}$ 、 $R^{8c}$ 、及び $R^{8d}$ の各々は独立して、水素、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニル、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニル、 $\text{C}_{3-7}$ シクロアルキル、 $\text{C}_{6-14}$ アリール、 $\text{C}_{7-15}$ 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、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニル、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニル、 $\text{C}_{3-7}$ シクロアルキル、 $\text{C}_{6-14}$ アリール、 $\text{C}_{7-15}$ アラルキル、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^{11}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{OR}^{11}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^{13})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{R}^{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{R}^{11}$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ 、又は $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{11}\text{R}^{12}$ であり、ここで $\text{R}^{11}$ 、 $\text{R}^{12}$ 、及び $\text{R}^{13}$ の各々は独立して、水素、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニル、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニル、 $\text{C}_{3-7}$ シクロアルキル、 $\text{C}_{6-14}$ アリール、 $\text{C}_{7-15}$ 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、 $\text{R}^{11}$ と $\text{R}^{12}$ 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

$\text{R}^{8a}$ と $\text{R}^{8b}$ 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；かつ

各 $\text{R}^9$ は独立して、水素、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニル、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニル、 $\text{C}_{3-7}$ シクロアルキル、 $\text{C}_{6-14}$ アリール、 $\text{C}_{7-15}$ 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

$\text{R}^8$ と $\text{R}^9$ 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；

$\text{R}^6$ 及び $\text{L}$ は、(i)又は(ii)であり：

(i) $\text{R}^6$ は、水素、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニル、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニル、 $\text{C}_{3-7}$ シクロアルキル、 $\text{C}_{6-14}$ 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

$\text{L}$ は、結合、 $\text{C}_{1-6}$ アルキレン、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニレン、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニレン、 $\text{C}_{3-7}$ シクロアルキレン、 $-\text{X}-$ 、若しくは $-(\text{CR}^{6a}\text{R}^{6b})_p\text{X}-$ であり；ここで、 $p$ は、1、2、若しくは3の整数であり； $\text{R}^{6a}$ 及び $\text{R}^{6b}$ 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、 $\text{X}$ は、 $-\text{C}(\text{O})-$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{O}-$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}^{14}-$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^{14})\text{NR}^{15}-$ 、 $-\text{O}-$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{O}-$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{NR}^{14}-$ 、 $-\text{OC}(=\text{NR}^{14})\text{NR}^{15}-$ 、 $-\text{OP}(\text{O})(\text{OR}^{14})-$ 、 $-\text{NR}^{14}-$ 、 $-\text{NR}^{14}\text{C}(\text{O})\text{NR}^{15}-$ 、 $-\text{NR}^{14}\text{C}(=\text{NR}^{15})\text{NR}^{16}-$ 、 $-\text{NR}^{14}\text{S}(\text{O})\text{NR}^{15}-$ 、 $-\text{NR}^{14}\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{15}-$ 、 $-\text{S}-$ 、 $-\text{S}(\text{O})-$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2-$ 、 $-\text{S}(\text{O})\text{NR}^{14}-$ 、 $-\text{S}(\text{O})_2\text{NR}^{14}-$ 、若しくは $-\text{P}(\text{O})(\text{OR}^{14})-$ であり、ここで $\text{R}^{14}$ 、 $\text{R}^{15}$ 、及び $\text{R}^{16}$ の各々は独立して、水素、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニル、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニル、 $\text{C}_{3-7}$ シクロアルキル、 $\text{C}_{6-14}$ アリール、 $\text{C}_{7-15}$ 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)- $\text{L}-\text{R}^6$ は、 $-\text{O}-\text{N}=\text{CR}^{6c}\text{R}^{6d}$ であり、ここで、 $\text{R}^{6c}$ 及び $\text{R}^{6d}$ の各々は独立して、水素、 $\text{C}_{1-6}$ アルキル、 $\text{C}_{2-6}$ アルケニル、 $\text{C}_{2-6}$ アルキニル、 $\text{C}_{3-7}$ シクロアルキル、 $\text{C}_{6-14}$ アリール、 $\text{C}_{7-15}$ 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、 $\text{R}^{6c}$ と $\text{R}^{6d}$ は、それらが結合したC原子と一緒に、 $\text{C}_{3-15}$ シクロアルキリデン、 $\text{C}_{6-14}$ 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；

$\text{Q}^1$ 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) $-C(O)R^a$ 、 $-C(O)OR^a$ 、 $-C(O)NR^bR^c$ 、 $-C(NR^a)NR^bR^c$ 、 $-OR^a$ 、 $-OC(O)R^a$ 、 $-OC(O)OR^a$ 、 $-OC(O)NR^bR^c$ 、 $-OC(=NR^a)NR^bR^c$ 、 $-OS(O)R^a$ 、 $-OS(O)_2R^a$ 、 $-OS(O)NR^bR^c$ 、 $-OS(O)_2NR^bR^c$ 、 $-NR^bR^c$ 、 $-NR^aC(O)R^d$ 、 $-NR^aC(O)OR^d$ 、 $-NR^aC(O)NR^bR^c$ 、 $-NR^aC(=NR^d)NR^bR^c$ 、 $-NR^aS(O)R^d$ 、 $-NR^aS(O)_2R^d$ 、 $-NR^aS(O)NR^bR^c$ 、 $-NR^aS(O)_2NR^bR^c$ 、 $-SR^a$ 、 $-S(O)R^a$ 、 $-S(O)_2R^a$ 、 $-S(O)NR^bR^c$ 、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。)