

【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29年10月26日(2017.10.26)

【公表番号】特表2016-530210(P2016-530210A)

【公表日】平成28年9月29日(2016.9.29)

【年通号数】公開・登録公報2016-057

【出願番号】特願2016-515449(P2016-515449)

【国際特許分類】

C 0 7 D 231/56 (2006.01)
C 0 7 D 401/06 (2006.01)
C 0 7 D 403/06 (2006.01)
C 0 7 D 471/04 (2006.01)
C 0 7 D 495/04 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 35/02 (2006.01)
A 6 1 P 17/04 (2006.01)
A 6 1 P 29/00 (2006.01)
A 6 1 P 11/00 (2006.01)
A 6 1 P 37/02 (2006.01)
A 6 1 P 3/04 (2006.01)
A 6 1 P 27/06 (2006.01)
A 6 1 P 27/02 (2006.01)
A 6 1 P 25/04 (2006.01)
A 6 1 P 1/16 (2006.01)
A 6 1 P 13/12 (2006.01)
A 6 1 P 17/00 (2006.01)
A 6 1 P 9/10 (2006.01)
A 6 1 P 9/12 (2006.01)
A 6 1 P 19/02 (2006.01)
A 6 1 P 3/10 (2006.01)
A 6 1 P 9/00 (2006.01)
A 6 1 P 17/06 (2006.01)
A 6 1 P 31/04 (2006.01)
A 6 1 P 11/06 (2006.01)
A 6 1 P 21/00 (2006.01)
A 6 1 P 37/08 (2006.01)
A 6 1 P 11/02 (2006.01)
A 6 1 P 15/02 (2006.01)
A 6 1 P 13/10 (2006.01)
A 6 1 P 5/14 (2006.01)
A 6 1 P 7/06 (2006.01)
A 6 1 P 25/00 (2006.01)
A 6 1 P 17/02 (2006.01)
A 6 1 P 33/14 (2006.01)
A 6 1 P 31/12 (2006.01)
A 6 1 K 31/416 (2006.01)
A 6 1 K 31/4439 (2006.01)
A 6 1 K 31/437 (2006.01)
A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 31/4155 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D	231/56	C S P A
C 0 7 D	401/06	
C 0 7 D	403/06	
C 0 7 D	471/04	1 0 4 Z
C 0 7 D	495/04	1 0 3
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	35/02	
A 6 1 P	17/04	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	37/02	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	27/06	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	25/04	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	9/12	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	31/04	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	37/08	
A 6 1 P	11/02	
A 6 1 P	15/02	
A 6 1 P	13/10	
A 6 1 P	5/14	
A 6 1 P	7/06	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	17/02	
A 6 1 P	33/14	
A 6 1 P	31/12	
A 6 1 K	31/416	
A 6 1 K	31/4439	
A 6 1 K	31/437	
A 6 1 K	31/444	
A 6 1 K	31/4155	

【 手続補正書 】

【 提出日 】平成29年9月14日(2017.9.14)

【 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

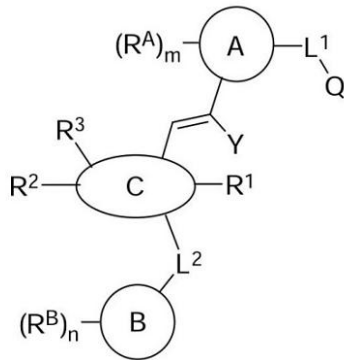
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

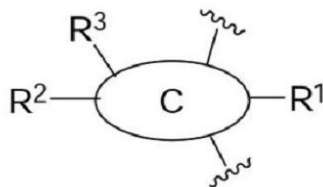
式 (I) の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩または溶媒和物であって、
【化 1】



式 (I)

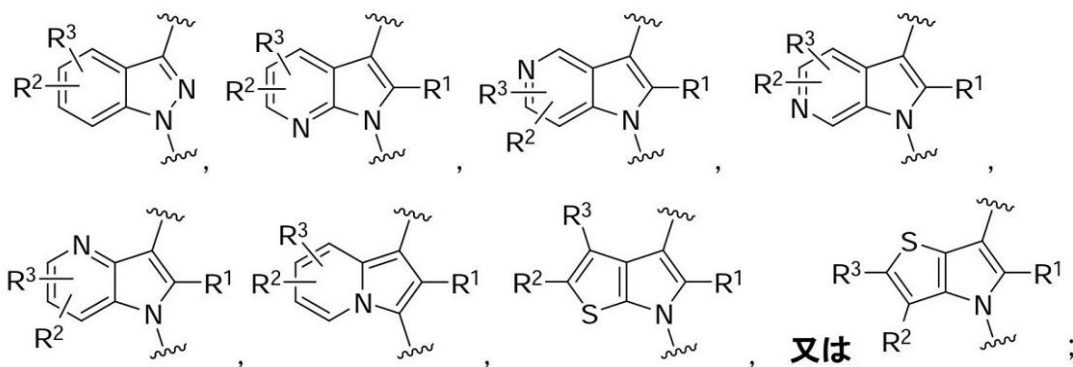
式中、

【化 2】



は、

【化 3】



であり、

R¹ は、H、D、ハロゲン、-CN、-C(=O)H、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄フルオロアルキル、C₃-C₆シクロアルキル、またはC₁-C₄重水素化アルキルであり、

R² は、H、ハロゲン、-CN、-OH、NO₂、NH₂、N(R¹⁰)₂、-OC(=O)N(R¹⁰)₂、-C(=O)N(R¹⁰)₂、-NHC(=O)R⁹、-NHC(=O)OR⁹、置換または非置換のC₁-C₄アルキル、C₁-C₄フルオロアルキル、C₁-C₄重水素化アルキル、置換または非置換のC₁-C₄アルコキシ、C₁-C₄フルオロアルコキシ、-S-C₁-C₄アルキル、-S(=O)-C₁-C₄アルキル、-S(=O)₂-C₁-C₄アルキル、C₁-C₄ヒドロキシアルキル、置換または非置

換のフェニル、あるいは置換または非置換の単環式のヘテロアリールであり、

R^3 は H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-OH$ 、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ フルオロアルキル、 $C_1 - C_4$ 重水素化アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、 $C_1 - C_4$ フルオロアルコキシ、 $-S - C_1 - C_4$ アルキル、 $-S(=O) - C_1 - C_4$ アルキル、 $-S(=O)_2 - C_1 - C_4$ アルキル、または $C_1 - C_4$ ヒドロキシアルキルであり、

環 A は、単環式のアリール、二環式のアリール、単環式のヘテロアリール、または二環式のヘテロアリールであり、

R^A はそれぞれ、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OH$ 、 $-OR^9$ 、 $-SR^9$ 、 $-S(=O)R^9$ 、 $-S(=O)_2R^9$ 、 $-S(=O)_2N(R^{10})_2$ 、 $-NR^{10}S(=O)_2R^9$ 、 $-C(=O)R^9$ 、 $-OC(=O)R^9$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-OCO_2R^9$ 、 $-N(R^{10})_2$ 、 $-C(=O)N(R^{10})_2$ 、 $-OC(=O)N(R^{10})_2$ 、 $-NHC(=O)R^9$ 、 $-NHC(=O)OR^9$ 、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ フルオロアルキル、 $C_1 - C_6$ 重水素化アルキル、 $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、置換または非置換の $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、置換または非置換の $C_2 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキル、置換または非置換のフェニル、および置換または非置換の単環式のヘテロアリールから成る群から独立して選択され、

m は 0、1、または 2 であり、

L^1 は存在しないか、 $C_1 - C_6$ アルキレン、 $C_1 - C_6$ フルオロアルキレン、 $C_3 - C_6$ シクロアルキレン、 $(C_1 - C_6 \text{ アルキレン})_{\underline{p}} - C_3 - C_6$ シクロアルキレン - $(C_1 - C_6 \text{ アルキレン})_{\underline{q}}$ 、または $-(C_1 - C_6 \text{ アルキレン})_{\underline{p}} - X - (C_1 - C_6 \text{ アルキレン})_{\underline{q}}$ であり、

X は、 O 、 S 、 $S(=O)$ 、 $S(=O)_2$ 、 $C(=O)NH$ 、 $NHC(=O)$ 、 NH 、 $OC(=O)NH$ 、 $NHC(=O)O$ 、または $NHC(=O)O$ であり、

p は 0 または 1 であり、

q は 0 または 1 であり、

Q は、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 - C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-OH$ 、 $-CN$ 、 $-B(OH)_2$ 、 $-C(=O)NH SO_2 R^9$ 、 $-C(=O)N(R^{10})_2$ 、 $-SO_2 NHC(=O)R^9$ 、 $-CN$ 、テトラゾリル、 $-OP(=O)(OH)_2$ 、 $-P(=O)(OH)_2$ 、またはカルボン酸生物学的等価体であり、

L^2 は、 $-C_1 - C_6$ アルキレン -、 $-C_3 - C_6$ シクロアルキレン -、 $-C(=O) -$ 、 $-C(=O) - C_1 - C_6$ アルキレン -、 $-C(=O)NH -$ 、 $-C(=O)NH - C_1 - C_6$ アルキレン -、 $-C(=O)O -$ 、 $-C(=O)O - C_1 - C_6$ アルキレン -、 $-C_1 - C_6$ アルキレン - $C(=O) -$ 、 $-C_1 - C_6$ アルキレン - $C(=O)NH -$ 、 $-C_1 - C_6$ アルキレン - $NHC(=O) -$ 、 $-C_1 - C_6$ アルキレン - $C(=O)O -$ 、 $-C_1 - C_6$ アルキレン - $OC(=O) -$ 、 $-C_1 - C_6$ アルキレン - $OC(=O)NH -$ 、 $-C_1 - C_6$ アルキレン - $NHC(=O)NH -$ であるか、あるいは存在せず、

Y は、H、置換または非置換の $C_1 - C_6$ アルキル、 CF_3 、ハロゲン、あるいは CN であり、

環 B は、単環式のアリール、二環式のアリール、単環式のヘテロアリール、または二環式のヘテロアリールであり、

R^B はそれぞれ、H、ハロゲン、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、 $-OH$ 、 $-OR^9$ 、 $-SR^9$ 、 $-S(=O)R^9$ 、 $-S(=O)_2R^9$ 、 $-S(=O)_2N(R^{10})_2$ 、 $-NR^{10}S(=O)_2R^9$ 、 $-C(=O)R^9$ 、 $-OC(=O)R^9$ 、 $-CO_2R^{10}$ 、 $-OCO_2R^9$ 、 $-N(R^{10})_2$ 、 $-C(=O)N(R^{10})_2$ 、 $-OC(=O)N(R^{10})_2$ 、 $-NHC(=O)R^9$ 、 $-NHC(=O)OR^9$ 、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ フルオロアルキル、 $C_1 - C_6$ 重水素化アルキル、 $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、置換または非置換の $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、置換または非置換の $C_2 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキル、置換または非置換のフェニル、置換または非置換の単環式のヘテロアリール、および置換または非置換の二環式のヘテロアリールから成る群から独立して選択され、

n は、0、1、または 2 であり、

R^9 はそれぞれ、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ フルオロアルキル、 $C_1 - C_6$ 重水素化アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、置換または非置換のフェニル、置換または非置換の単環式のヘテロアリール、および置換または非置換の二環式のヘテロアリールからなる群から独立して選択され、

R^{10} はそれぞれ、 H 、 $C_1 - C_6$ アルキル、 $C_1 - C_6$ フルオロアルキル、 $C_1 - C_6$ 重水素化アルキル、 $C_3 - C_6$ シクロアルキル、置換または非置換のフェニル、および置換または非置換の単環式のヘテロアリールからなる群から独立して選択され、あるいは

同じ N 原子に付けられる 2 つの R^{10} 基は、それらが付いている N 原子と一緒に置換または非置換の複素環を形成する、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。

【請求項 2】

R^1 は、 H 、 F 、 Cl 、 $-CN$ 、 $-C(=O)H$ 、 $-CH_3$ 、 $-CF_3$ 、または $-CD_3$ であり、

L^2 は $-C_1 - C_6$ アルキレン -、または $C_3 - C_6$ シクロアルキレンであり、及び Y は、 H 、 $-CH_3$ 、 CF_3 、 F 、 Cl 、 Br 、または 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または溶媒和物。

【請求項 3】

L^1 は存在しないか、 $-CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-CH(CH_3)-$ 、 $-CH(CH_2CH_3)-$ 、 $-C(CH_3)_2-$ 、 $-C(CH_2CH_3)_2-$ 、シクロプロピル - 1, 1 - ジイル、シクロブチル - 1, 1 - ジイル、シクロペンチル - 1, 1 - ジイル、またはシクロヘキシル - 1, 1 - ジイルであり、

Q は、 $-CO_2H$ 、 $-CO_2(C_1 - C_6 \text{ アルキル})$ 、 $-C(=O)NH SO_2 R^9$ 、またはテトラゾリルであり、及び

L^2 は、 $-CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2-$ 、 $-CH_2CH_2CH_2-$ 、 $-C(CH_3)_2-$ 、 $-CH(CH_3)-$ 、またはシクロプロピル - 1, 1 - ジイルである、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】

環 A は、フェニル、ナフチル、1 - 4 の N 原子と 0 または 1 つの O または S 原子とを含む単環式のヘテロアリール、0 - 4 の N 原子と 1 つの O または S 原子とを含む単環式のヘテロアリール、1 - 4 の N 原子と 0 または 1 つの O または S 原子とを含む二環式のヘテロアリール、あるいは 0 - 4 の N 原子と 1 つの O または S 原子とを含む二環式のヘテロアリールであり、

環 B は、フェニル、ナフチル、1 - 4 の N 原子と 0 または 1 つの O または S 原子とを含む単環式のヘテロアリール、0 - 4 の N 原子と 1 つの O または S 原子とを含む単環式のヘテロアリール、1 - 4 の N 原子と 0 または 1 つの O または S 原子とを含む二環式のヘテロアリール、あるいは 0 - 4 の N 原子と 1 つの O または S 原子とを含む二環式のヘテロアリールである、請求項 1 乃至 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】

環 A は、フェニル、ナフチル、インダニル、フラニル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、イソキサゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、トリアジニル、キノリニル、イソキノリニル、キナゾリニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、インドリル、インダゾリル、ベンゾキサゾリル、ベンズイソキサゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、ベンゾチアゾリル、ベンズイミダゾリル、プリニル、シンノリニル、フタラジニル、プテリジニル、ピリドピリミジニル、ピラゾロピリミジニル、またはアザインドリルであり、及び

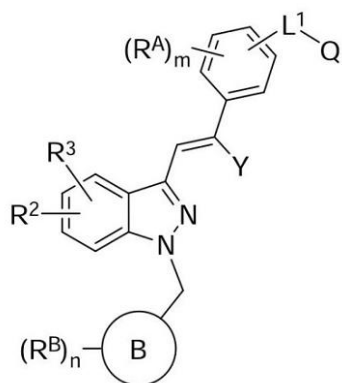
環 B は、フェニル、ナフチル、フラニル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、イソキサゾリル、イソチアゾリル

、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、トリアジニル、キノリニル、イソキノリニル、キナゾリニル、キノキサリニル、ナフチリジニル、インドリル、インダゾリル、ベンゾキサゾリル、ベンズイソオキサゾリル、ベンゾフラニル、ベンゾチエニル、ベンゾチアジアゾリル、ベンズイミダゾリル、プリニル、シンノリニル、フタラジニル、プテリジニル、ピリドピリミジニル、ピラゾロピリミジニル、またはアザインドリルである、請求項 1 乃至 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。

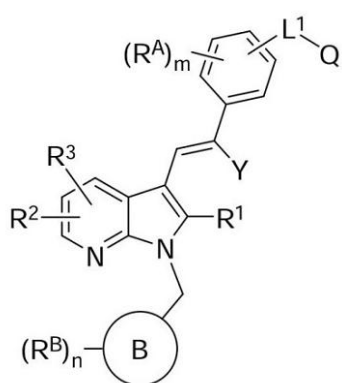
【請求項 6】

式 (I) の化合物は、式 (II)、式 (III)、式 (IV)、式 (V)、または式 (VI) の以下の構造を有するか、

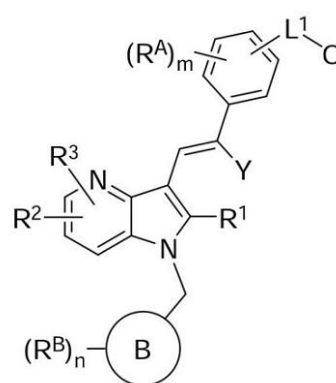
【化 4】



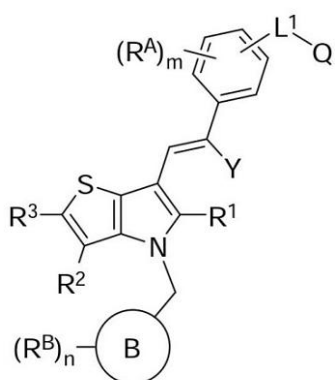
式 (II)



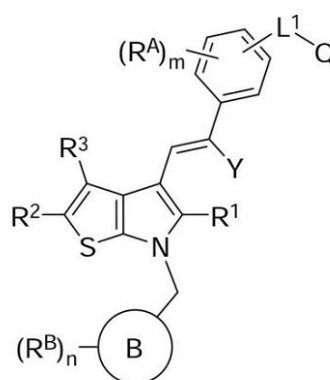
式 (III)



式 (IV)



式 (V)



式 (VI)

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る、請求項 1 乃至 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】

環 A はピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、またはトリアジニルである、請求項 1 乃至 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 8】

R^A はそれぞれ、H、ハロゲン、-CN、-OH、-OR⁹、C₁-C₆アルキル、および C₁-C₆フルオロアルキルからなる群から独立して選択される、請求項 1 乃至 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】

環 B はフェニルまたはナフチルである、請求項 1 乃至 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】

環Bは、フラニル、ピロリル、オキサゾリル、チアゾリル、イミダゾリル、ピラゾリル、トリアゾリル、テトラゾリル、イソキサゾリル、イソチアゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリジニル、ピリミジニル、ピラジニル、ピリダジニル、またはトリアジニルである、請求項1乃至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11】

R²は、H、ハロゲン、-CN、-OH、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄フルオロアルキル、C₁-C₄重水素化アルキル、C₁-C₄アルコキシ、C₁-C₄フルオロアルコキシ、またはC₁-C₄ヒドロキシアルキルであり、及び

R³は、H、ハロゲン、-CN、-OH、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄フルオロアルキル、C₁-C₄重水素化アルキル、C₁-C₄アルコキシ、C₁-C₄フルオロアルコキシ、またはC₁-C₄ヒドロキシアルキルである、請求項1乃至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または溶媒和物。

【請求項12】

R²は、H、F、Cl、Br、I、-CN、-OH、-CH₃、-CF₃、-CD₃、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-OCF₃、-OCH₂CF₃、または-CH₂OHであり、及び

R³は、H、F、Cl、Br、I、-CN、-OH、-CH₃、-CF₃、-CD₃、-OCH₃、-OCH₂CH₃、-OCF₃、-OCH₂CF₃、または-CH₂OHである、請求項1乃至11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13】

L¹は存在しないか、-CH₂-、-CH₂CH₂-、または-CH₂CH₂CH₂-であり、

Qは-CO₂H、または-CO₂(C₁-C₆アルキル)である、請求項1乃至12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14】

請求項1乃至13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、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15】

哺乳動物の癌、繊維症、そう痒症、炎症性疾患または疾病、気道疾患または疾病、自己免疫性疾患または疾病、肥満、眼内圧、神経障害性疼痛、あるいはこれらの組み合わせの処置または予防における、請求項1乃至13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の使用。