

【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2月16日(2017.2.16)

【公表番号】特表2017-501193(P2017-501193A)

【公表日】平成29年1月12日(2017.1.12)

【年通号数】公開・登録公報2017-002

【出願番号】特願2016-543726(P2016-543726)

【国際特許分類】

C 07 D 403/06 (2006.01)

A 61 K 31/4178 (2006.01)

C 07 D 401/14 (2006.01)

A 61 K 31/4439 (2006.01)

C 07 D 417/06 (2006.01)

A 61 K 31/433 (2006.01)

A 61 K 31/4192 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 403/06 C S P

A 61 K 31/4178

C 07 D 401/14

A 61 K 31/4439

C 07 D 417/06

A 61 K 31/433

A 61 K 31/4192

A 61 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成28年12月27日(2016.12.27)

【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

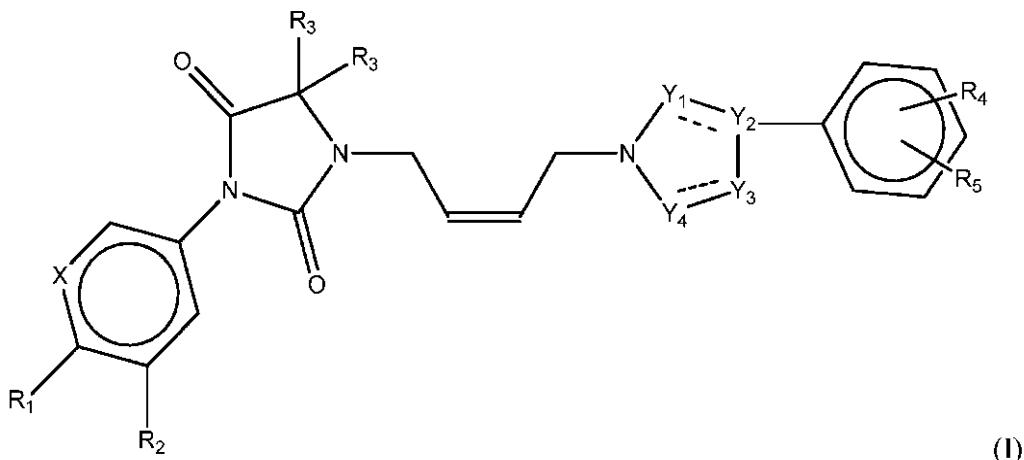
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(I)の化合物又はそれらの製薬上許容できる塩。

【化 1】



(ここで、

R^1 は $-CN$ 、 $-SO_2(C_1 - C_6)$ アルキル又は $-SO_2(C_1 - C_6)$ シクロアルキルであり；

R^2 は $-CF_3$ 又はハロゲン原子であり；

R^3 は ($C_1 - C_6$) アルキルであり、又は 2 個の R^3 が一緒になって ($C_3 - C_6$) シクロアルキルを形成し；

XはCH又はNであり；

Y¹は炭素原子、スルホニル又はカルボニル基であり、この炭素原子は隨意に1個以上の(C₁-C₆)アルキル基で置換されていてもよく：

Y²は炭素原子又は窒素原子であり、この炭素は随意に-OH基で置換されていてもよ

Y³は炭素原子又は窒素原子であり、この炭素原子及び窒素原子は隨意に1個以上の(C₁-C₆)アルキル基で置換されていてもよく：

γ^4 は炭素原子、窒素原子又はカルボニル基であり、この炭素原子及び窒素原子は隨意に1個以上の($C_1 - C_6$)アルキル基で置換されていてもよく：

R⁴ は H、アルキル、ハロゲン、-C≡N 又は -SO₂(C₁-C₆)アルキル基であり、

R^5 は H、-C₁F₃、(C₁-C₆)アルキル基又はハロゲン原子であり：

【化 2】

はそれぞれ独立して単結合又は二重結合である。)

【請求項2】

R^1 が $-SO_2(C_1-C_6)$ アルキル基である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項3】

R¹が - CN 基である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項4】

R²が-C₆F₅である、請求項1～3のいずれかに記載の化合物。

【請求項 5】

X が C₆H₅ である、請求項 1～4 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 6】

R^3 が $(C_1 - C_6)$ アルキル基であり、好ましくは R^3 がメチル基である、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 7】

R⁴が -SO₂(C₁ - C₆)アルキル基である、請求項1～6のいずれかに記載の化合物。

【請求項 8】

R^5 が $-CF_3$ 基である、請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 9】

Y¹が炭素原子である、請求項1～8のいずれかに記載の化合物。

【請求項 10】

Y³が炭素原子である、請求項1～9のいずれかに記載の化合物。

【請求項 11】

Y²が炭素原子である、請求項1～10のいずれかに記載の化合物。

【請求項 12】

以下のものである、請求項1～11のいずれかに記載の化合物：

(Z)-4-(3-(4-(4-(4-シアノ-3-(トリフルオロメチル)フェニル)-1H-ピラゾール-1-イル)-2-ブテン-1-イル)-4,4-ジメチル-2,5-ジオキソイミダゾリジン-1-イル)-2-(トリフルオロメチル)ベンゾニトリル
 (Z)-4-(1-(4-(5,5-ジメチル-3-(4-(メチルスルホニル)フェニル)-2,4-ジオキソイミダゾリジン-1-イル)-2-ブテン-1-イル)-1H-ピラゾール-4-イル)-2-(トリフルオロメチル)ベンゾニトリル
 (Z)-5,5-ジメチル-3-(4-(メチルスルホニル)-3-(トリフルオロメチル)フェニル)-1-(4-(4-(メチルスルホニル)-3-(トリフルオロメチル)フェニル)-1H-ピラゾール-1-イル)-2-ブテン-1-イル)イミダゾリジン-2,4-ジオン
 (Z)-5-(4,4-ジメチル-3-(4-(4-(メチルスルホニル)-3-(トリフルオロメチル)フェニル)-1H-ピラゾール-1-イル)-2-ブテン-1-イル)-2,5-ジオキソイミダゾリジン-1-イル)-3-(トリフルオロメチル)ピコリノニトリル
 (Z)-4-(3-(4-(3,5-ジメチル-4-(4-(メチルスルホニル)-3-(トリフルオロメチル)フェニル)-1H-ピラゾール-1-イル)-2-ブテン-1-イル)-4,4-ジメチル-2,5-ジオキソイミダゾリジン-1-イル)-2-(トリフルオロメチル)ベンゾニトリル
 (Z)-5-(3-(4-(3-(4-(3-クロロ-4-(メチルスルホニル)フェニル)-1H-ピラゾール-1-イル)-2-ブテン-1-イル)-4,4-ジメチル-2,5-ジオキソイミダゾリジン-1-イル)-3-(トリフルオロメチル)ピコリノニトリル
 (Z)-4-(3-(4-(3,5-ジメチル-4-(4-(メチルスルホニル)-3-(トリフルオロメチル)フェニル)-1H-ピラゾール-1-イル)-2-ブテン-1-イル)-4,4-ジメチル-2,5-ジオキソイミダゾリジン-1-イル)-2-(トリフルオロメチル)ベンゾニトリル
 (Z)-4-(3-(4-(5,5-ジメチル-3-(4-(メチルスルホニル)フェニル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル)-2-ブテン-1-イル)-5,5-ジメチルイミダゾリジン-2,4-ジオン
 (Z)-4-(3-(4-(5,5-ジメチル-3-(4-(メチルスルホニル)フェニル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル)-2-ブテン-1-イル)-4,4-ジメチル-2-オキソイミダゾリジン-1-イル)-2-(トリフルオロメチル)ベンゾニトリル
 (Z)-3-(3-クロロ-4-(メチルスルホニル)フェニル)-1-(4-(5,5-ジメチル-3-(4-(メチルスルホニル)フェニル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル)-2-ブテン-1-イル)-5,5-ジメチルイミダゾリジン-2,4-ジオン
 (Z)-4-(3-(4-(5,5-ジメチル-3-(4-(メチルスルホニル)フェニル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル)-2-ブテン-1-イル)-4,4-ジメチル-2-オキソイミダゾリジン-1-イル)-2-(トリフルオロメチル)ベンゾニトリル
 (Z)-4-(4,4-ジメチル-3-(4-(3-(4-(メチルスルホニル)フェニル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル)-2-ブテン-1-イル)-2,5-ジオキソイミダゾリジン-1-イル)-2-(トリフルオロメチル)ベンゾニトリル
 (Z)-4-(3-(4-(3-(3-クロロ-4-(メチルスルホニル)フェニル)-2-オキソイミダゾリジン-1-イル)-2-ブテン-1-イル)-4,4-ジメチル-2,5-ジオキソイミダゾリジン-1-イル)-2-(トリフルオロメチル)ベンゾニトリル

(Z)-4-(1-(4-(3-(4-シアノ-3-(トリフルオロメチル)フェニル)-5,5-ジメチル-2,4-ジオキソイミダゾリジン-1-イル)-2-ブテン-1-イル)ピロリジン-3-イル)-2-(トリフルオロメチル)ベンゾニトリル

(Z)-4-(4,4-ジメチル-3-(4-(4-(メチルスルホニル)フェニル)-2-オキソピロリジン-1-イル)-2-ブテン-1-イル)-2,5-ジオキソイミダゾリジン-1-イル)-2-(トリフルオロメチル)ベンゾニトリル

(Z)-4-(3-(4-(3-(クロロ-4-(メチルスルホニル)フェニル)-2-オキソピロリジン-1-イル)-2-ブテン-1-イル)-4,4-ジメチル-2,5-ジオキソイミダゾリジン-1-イル)-2-(トリフルオロメチル)ベンゾニトリル

(Z)-5,5-ジメチル-3-(4-(メチルスルホニル)-3-(トリフルオロメチル)フェニル)-1-(4-(4-(メチルスルホニル)-3-(トリフルオロメチル)フェニル)-2-オキソピロリジン-1-イル)-2-ブテン-1-イル)イミダゾリジン-2,4-ジオン

(Z)-4-(1-(4-(3-(3-(クロロ-4-(メチルスルホニル)フェニル)-2-オキソピロリジン-1-イル)-2-ブテン-1-イル)-3-ヒドロキシピロリジン-3-イル)-2-(トリフルオロメチル)ベンゾニトリル

(Z)-4-(3-(4-(5-(3-(クロロ-4-(メチルスルホニル)フェニル)-1,1-ジオキシド-1,2,5-チアジアゾリジン-2-イル)-2-ブテン-1-イル)-4,4-ジメチル-2,5-ジオキソイミダゾリジン-1-イル)-2-(トリフルオロメチル)ベンゾニトリル

(Z)-4-(3-(4-(5-(3-(クロロ-4-(メチルスルホニル)フェニル)-1,1-ジオキシド-1,2,5-チアジアゾリジン-2-イル)-2-ブテン-1-イル)-4,4-ジメチル-2,5-ジオキソイミダゾリジン-1-イル)-2-(トリフルオロメチル)ベンゾニトリル；

(Z)-4-(4,4-ジメチル-2,5-ジオキソ-3-(4-(4-フェニル-1H-1,2,3-トリアゾール-1-イル)-2-ブテン-1-イル)イミダゾリジン-1-イル)-2-(トリフルオロメチル)ベンゾニトリル；

(Z)-4-(3-(4-(4-(3,4-ジクロロフェニル)-1H-1,2,3-トリアゾール-1-イル)-2-ブテン-1-イル)-4,4-ジメチル-2,5-ジオキソイミダゾリジン-1-イル)-2-(トリフルオロメチル)ベンゾニトリル；

(Z)-4-(3-(4-(4-(フルオロ-3-メチルフェニル)-1H-1,2,3-トリアゾール-1-イル)-2-ブテン-1-イル)-4,4-ジメチル-2,5-ジオキソイミダゾリジン-1-イル)-2-(トリフルオロメチル)ベンゾニトリル；若しくは

(Z)-4-(3-(4-(4-(4-シアノ-3-(トリフルオロメチル)フェニル)-1H-1,2,3-トリアゾール-1-イル)-2-ブテン-1-イル)-4,4-ジメチル-2,5-ジオキソイミダゾリジン-1-イル)-2-(トリフルオロメチル)ベンゾニトリル；

又はこの化合物の製薬上許容できる塩。

【請求項13】

以下のものである、請求項12に記載の化合物：

(Z)-5-(3-(4-(4-(3-(クロロ-4-(メチルスルホニル)フェニル)-1H-ピラゾール-1-イル)-2-ブテン-1-イル)-4,4-ジメチル-2,5-ジオキソイミダゾリジン-1-イル)-3-(トリフルオロメチル)ピコリノニトリル；

(Z)-4-(3-(4-(3,5-ジメチル-4-(メチルスルホニル)フェニル)-1H-ピラゾール-1-イル)-2-ブテン-1-イル)-4,4-ジメチル-2,5-ジオキソイミダゾリジン-1-イル)-2-(トリフルオロメチル)ベンゾニトリル；

(Z)-5,5-ジメチル-3-(4-(メチルスルホニル)-3-(トリフルオロメチル)フェニル)-1-(4-(4-(メチルスルホニル)-3-(トリフルオロメチル)フェニル)-2-オキソピロリジン-1-イル)-2-ブテン-1-イル)イミダゾリジン-2,4-ジオン；

又はそれらの製薬上許容できる塩。

【請求項14】

活性成分としての請求項1～13のいずれかに記載の少なくとも1種の化合物を製薬上許容できる担体との組合せとして含有する製薬組成物。

【請求項15】

請求項1～13のいずれかに記載の式(I)の化合物から成る、癌を処置するための医薬。

【請求項16】

前記癌がホルモン依存性の癌である、請求項15に記載の医薬。

【請求項17】

前記癌がアンドロゲン受容体を発現する癌である、請求項15に記載の医薬。

【請求項18】

前記癌が乳癌又は前立腺癌である、請求項15～17のいずれかに記載の医薬。