

【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30年2月15日 (2018.2.15)

【公表番号】特表2017-503808(P2017-503808A)

【公表日】平成29年2月2日 (2017.2.2)

【年通号数】公開・登録公報2017-005

【出願番号】特願2016-545888(P2016-545888)

【国際特許分類】

C 0 7 D 279/02 (2006.01)

C 0 7 D 417/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/541 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 21/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 279/02

C 0 7 D 417/10 C S P

A 6 1 K 31/541

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 17/02

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 21/02

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【誤訳訂正書】

【提出日】平成30年1月4日 (2018.1.4)

【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

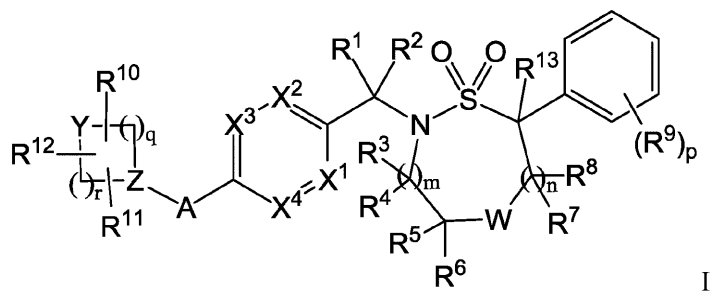
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

【化 1】



[式中、

m は、0 又は 1 であり；

n は、0 又は 1 であり；

p は、0 ～ 3 であり；

q は、0、1 又は 2 であり；

r は、1 ～ 3 であり；

A は：

結合；

- (C R_j R_k)_t - ；
- C (O) - (C R_j R_k)_t - ；
- (C R_j R_k)_t - C (O) - ；
- N R^a - (C R_j R_k)_t - ；
- (C R_j R_k)_t - N R^a - ；
- C (O) N R^a - (C R_j R_k)_t - ；
- (C R_j R_k)_t - N R^a C (O) - ；
- O - (C R_j R_k)_t - ；
- (C R_j R_k)_t - O - ；
- S - (C R_j R_k)_t - ；
- (C R_j R_k)_t - S - ；
- S O₂ - (C R_j R_k)_t - ；
- (C R_j R_k)_t - S O₂ - であり；又は

t は、0 ～ 4 であり；

W は：

- C R^b R^c - ；
- O - ；
- S - ；
- S O₂ - ；又は
- N R^d - であり；

X¹、X²、X³ 及び X⁴ の 1 つは N であり、そして、他のものは C R^e であるか；又は X¹、X²、X³ 及び X⁴ の 2 つは N であり、そして、他のものは C R^e であるか；

；

又は X¹、X²、X³ 及び X⁴ の 3 つは N であり、そして、他のものは C R^e であるか；

；

又は X¹、X²、X³ 及び X⁴ の各々は、C R^e であり；

Y は：

- O - ；
- S - ；
- S O₂ - ；
- C R^f R^g - ；又は

- NR^h - であり；

Z は： CR^m であり；

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 及び R^8 は、各々独立して；

水素；又は C_{1-6} アルキル（非置換であっても又はハロで 1 回以上置換されていてよい）であるか；

又は R^3 及び R^4 は、これらが連結している原子と一緒にあって、エチレン基を形成してもよく；

又は R^3 及び R^4 は、これらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環（場合により - O -、- NR^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i で 1 回以上置換されていてよい）を形成してもよく；

又は R^5 及び R^6 は、これらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環（場合により - O -、- NR^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i で 1 回以上置換されていてよい）を形成してもよく；

又は R^7 及び R^8 は、これらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環（場合により - O -、- NR^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i で 1 回以上置換されていてよい）を形成してもよく；

又は R^3 及び R^4 の 1 つは、 R^5 及び R^6 の 1 つならびにこれらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環（場合により - O -、- NR^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i で 1 回以上置換されていてよい）を形成してもよく；

又は R^5 及び R^6 の 1 つは、 R^7 及び R^8 の 1 つならびにこれらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環（場合により - O -、- NR^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i で 1 回以上置換されていてよい）を形成してもよく；

各 R^9 は、独立して；

C_{1-6} アルキル；

ハロ；

C_{1-6} アルコキシ；又は

シアノであり；

ここで、 C_{1-6} アルキル部分は、非置換であっても又はハロで 1 回以上置換されていてよく；

R^{10} は：

水素；

カルボキシ；

C_{1-6} アルキル - カルボニル；

C_{1-6} アルコキシ - カルボニル；

オキソ；

ヒドロキシ；

アミノカルボニル；

N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

N, N - ジ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

シアノ；

ヒドロキシ - C_{1-6} アルキル；

N - C_{1-6} アルコキシ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

N - ヒドロキシ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

N - C_{1-6} アルコキシ - アミノカルボニル；

ハロ；又は

C_{1-6} アルキル（非置換であっても又はハロ若しくはオキソで 1 回以上置換されていてよい）であり；

R^{11} は：

水素；

ハロ；

カルボキシ；

C_{1-6} アルキル - カルボニル；

C_{1-6} アルコキシ - カルボニル；

オキソ；

ヒドロキシ；

アミノカルボニル；

$N - C_{1-6}$ アルキル - アミノカルボニル；

N, N - ジ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

C_{1-6} アルキル - スルホニルアミノ；

C_{1-6} アルキル - スルホニルアミノ - C_{1-6} アルキル；

シアノ；

ヒドロキシ - C_{1-6} アルキル；

$N - C_{1-6}$ アルコキシ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

N - ヒドロキシ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

$N - C_{1-6}$ アルコキシ - アミノカルボニル；又は

C_{1-6} アルキル（非置換であっても又はハロ若しくはオキソで 1 回以上置換されていてよい）であるか；

又は R^{10} 及び R^{11} は、これらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環（場合により - O -、- NR^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i で 1 回以上置換されていてよい）を形成してもよく；

又は R^{10} 及び R^{11} は、これらが連結している原子と一緒にあって、二重結合を形成してもよく；

R^{12} は：

水素；

ハロ；

カルボキシ；

C_{1-6} アルキル - カルボニル；

C_{1-6} アルコキシ - カルボニル；

オキソ；

ヒドロキシ；

アミノカルボニル；

$N - C_{1-6}$ アルキル - アミノカルボニル；

N, N - ジ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

シアノ；

ヒドロキシ - C_{1-6} アルキル；

$N - C_{1-6}$ アルコキシ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

N - ヒドロキシ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

$N - C_{1-6}$ アルコキシ - アミノカルボニル；又は

C_{1-6} アルキル（非置換であっても又はハロ若しくはオキソで 1 回以上置換されていてよい）であり；

R^{13} は：

水素；又は

C_{1-6} アルキル（非置換であっても又はハロで 1 回以上置換されていてよい）であり；

R^a 、 R^b 、 R^c 及び R^d は、各々独立して：

水素；又は

C_{1-6} アルキル（非置換であっても又はハロで 1 回以上置換されていてよい）であるか；

又は R^b 及び R^c は、これらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環（場合により - O -、- N R^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i で 1 回以上置換されていてよい）を形成してもよく；

又は R^b 及び R^c の 1 つは、 R^7 及び R^8 の 1 つならびにこれらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環（場合により - O -、- N R^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i で 1 回以上置換されていてよい）を形成してもよく；

又は R^b 及び R^c の 1 つは、 R^5 及び R^6 の 1 つならびにこれらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環（場合により - O -、- N R^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i で 1 回以上置換されていてよい）を形成してもよく；

各 R^e は、独立して：

水素；

C_{1-6} アルキル；

ハロ；

C_{1-6} アルコキシ；又は

シアノであり；

ここで、 C_{1-6} アルキル部分は、非置換であっても又はハロ、ヒドロキシ若しくは C_{1-6} アルコキシで 1 回以上置換されていてよく；

R^f は：

水素；

ハロ；

C_{1-6} アルコキシ；又は

C_{1-6} アルキル（非置換であっても又はハロ、ヒドロキシ若しくは C_{1-6} アルコキシで 1 回以上置換されていてよい）であり；

R^g は：

水素；

C_{1-6} アルキル；

C_{3-6} シクロアルキル；

C_{3-6} シクロアルケニル；

C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル；

ハロ；

C_{1-6} アルキル - カルボニル；

C_{3-6} シクロアルキル - カルボニル；

C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル - カルボニル；

シアノ - C_{1-6} アルキル - カルボニル；

ヒドロキシ - C_{1-6} アルキル - カルボニル；

C_{1-6} アルコキシ - C_{1-6} アルキル - カルボニル；

カルボキシ；

N - シアノ - アミノカルボニル；

N - シアノ - N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

N - C_{1-6} アルキル - アセトイミドアミジル；

N, N' - ジ - C_{1-6} アルキル - アセトイミドアミジル；

N' - シアノ - N - C_{1-6} アルキル - アセトイミドアミジル；

N' - ヒドロキシ - アセトイミドアミジル；

$N' - C_{1-6}$ アルコキシ - アセトイミドアミジル ;
 $N' -$ ヒドロキシ - $N - C_{1-6}$ アルキル - アセトイミドアミジル ;
 $N' - C_{1-6}$ アルコキシ - $N - C_{1-6}$ アルキル - アセトイミドアミジル ;
 $2 -$ ニトロ - $1 - N - C_{1-6}$ アルキルアミノ - ビニル ; ホルミル ;
 C_{1-6} アルキル - スルホニル ;
 C_{3-6} シクロアルキル - スルホニル ;
 C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル - スルホニル ;
 C_{1-6} アルキル - スルホニル - C_{1-6} アルキル ;
 アミノカルボニル ;
 カルボニルアミノ ;
 $N -$ ヒドロキシ - アミノカルボニル ;
 $N - C_{1-6}$ アルコキシ - アミノカルボニル ;
 $N - C_{1-6}$ アルキル - アミノカルボニル ;
 アミノカルボニル - C_{1-6} アルキル ;
 $N - C_{1-6}$ アルキル - アミノカルボニル - C_{1-6} アルキル ;
 $N, N -$ ジ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル - C_{1-6} アルキル ;
 C_{1-6} アルコキシ - カルボニル ;
 $N -$ ヒドロキシ - $N - C_{1-6}$ アルキル - アミノカルボニル ;
 $N - C_{1-6}$ アルコキシ - $N - C_{1-6}$ アルキル - アミノカルボニル ;
 $N, N -$ ジ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル ;
 アミノスルホニル ;
 $N - C_{1-6}$ アルキル - アミノスルホニル ;
 $N, N -$ ジ - C_{1-6} アルキル - アミノスルホニル ;
 シアノ ;
 C_{1-6} アルコキシ ;
 C_{1-6} アルキル - スルホニルアミノ ;
 $N - C_{1-6}$ アルキル - スルホニルアミノカルボニル ;
 $N - (C_{1-6}$ アルキル - スルホニル) - $N - C_{1-6}$ アルキル - アミノカルボニル ;
 $N - (C_{1-6}$ アルキル - スルホニル) - アミノ - C_{1-6} アルキル ; アミノ ;
 $N - C_{1-6}$ アルキル - アミノ ;
 $N, N -$ ジ - C_{1-6} アルキル - アミノ ;
 ハロ - C_{1-6} アルキル ;
 フェニル ;
 ヘテロシクリル ;
 ヘテロアリール ;
 C_{1-6} アルキル - カルボニルアミノ ;
 カルボニルアミノ ; 又は
 ヒドロキシであり ;
 ここで、 C_{1-6} アルキル部分は、非置換であっても又はハロで 1 回以上置換されていてもよく ; そして
 フェニル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルケニル及び C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル部分は、非置換であっても又は R^i で 1 回以上置換されていてもよく ;
 又は R^f 及び R^g は、一緒になって、オキソを形成してもよく ;
 又は R^f 及び R^g は、これらが連結している原子と一緒に、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環 (場合により - O - 、 - NR^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i で 1 回以上置換されてよい) を形成してもよく ;
 R^h は :
 水素 ;

C_{1-6} アルキル ;
 C_{3-6} シクロアルキル ;
 C_{3-6} シクロアルケニル ;
 C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル ;
 C_{1-6} アルキル - カルボニル ;
 C_{3-6} シクロアルキル - カルボニル ;
 C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル - カルボニル ;
シアノ - C_{1-6} アルキル - カルボニル ;
ヒドロキシ - C_{1-6} アルキル - カルボニル ;
 C_{1-6} アルコキシ - C_{1-6} アルキル - カルボニル ;
N - シアノ - アミノカルボニル ;
N - シアノ - N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル ;
N - C_{1-6} アルキル - アセトイミドアミジル ;
N, N' - ジ - C_{1-6} アルキル - アセトイミドアミジル ;
N' - シアノ - N - C_{1-6} アルキル - アセトイミドアミジル ;
N' - ヒドロキシ - アセトイミドアミジル ;
N' - C_{1-6} アルコキシ - アセトイミドアミジル ;
N' - ヒドロキシ - N - C_{1-6} アルキル - アセトイミドアミジル ;
N' - C_{1-6} アルコキシ - N - C_{1-6} アルキル - アセトイミドアミジル ;
2 - ニトロ - 1 - N - C_{1-6} アルキルアミノ - ビニル ;
ホルミル ;
 C_{1-6} アルキル - スルホニル ;
 C_{3-6} シクロアルキル - スルホニル ;
 C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル - スルホニル ;
 C_{1-6} アルキル - スルホニル - C_{1-6} アルキル ;
アミノカルボニル ;
N - ヒドロキシ - アミノカルボニル ;
N - C_{1-6} アルコキシ - アミノカルボニル ;
N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル ;
N - ヒドロキシ - N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル ;
N - C_{1-6} アルコキシ - N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル ;
N, N - ジ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル ;
アミノスルホニル ;
N - C_{1-6} アルキル - アミノスルホニル ;
N, N - ジ - C_{1-6} アルキル - アミノスルホニル ;
シアノ ;
 C_{1-6} アルキル - スルホニルアミノ ;
 C_{1-6} アルキル - スルホニルアミノ - C_{1-6} アルキル ;
N - (C_{1-6} アルキル - スルホニル) アミノカルボニル ;
N - (C_{1-6} アルキル - スルホニル) - N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル ;
N - (C_{1-6} アルキル - スルホニル) - アミノ - C_{1-6} アルキル ;
アミノカルボニル - C_{1-6} アルキル ;
N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル - C_{1-6} アルキル ;
N, N - ジ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル - C_{1-6} アルキル ;
 C_{1-6} アルコキシ - カルボニル ;
フェニル ;
ヘテロシクリル ; 又は
ヘテロアリールであり ;
ここで、 C_{1-6} アルキル部分は、非置換であっても又は八口で 1 回以上置換されていてもよく ; そして

フェニル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、 $C_3 - 6$ シクロアルキル、 $C_3 - 6$ シクロアルケニル及び $C_3 - 6$ シクロアルキル - $C_1 - 6$ アルキル部分は、非置換であっても又は R^i で 1 回以上置換されていてもよく；

又は R^h ならびに R^{10} 及び R^{11} の 1 つは、これらが連結している原子と一緒にあって、4、5、6 又は 7 員の芳香族、部分飽和又は不飽和環（場合により - O - 、 - NR^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個の追加のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i - で 1 回以上置換されていてもよい）を形成してもよく；

又は R^f 及び R^g の 1 つならびに R^{10} 及び R^{11} の 1 つは、これらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の芳香族、部分飽和又は不飽和環（場合により - O - 、 - NR^a - 又は - S - から選択される追加のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i で 1 回以上置換されていてもよい）を形成してもよく；

R^i は：

$C_1 - 6$ アルキル；

ハロ - $C_1 - 6$ アルキル；

$C_3 - 6$ シクロアルキル；

ハロ；

オキソ；

ヒドロキシ；

アセチル；

$C_1 - 6$ アルキル - カルボニル；

アミノ - カルボニル；

ヒドロキシ - $C_1 - 6$ アルキル；

シアノ；

シアノ - $C_1 - 6$ アルキル；

$C_1 - 6$ アルコキシ - $C_1 - 6$ アルキル；

カルボキシ；又は

$C_1 - 6$ アルコキシであり；

R^j 及び R^k は、各々独立して：

水素；又は

$C_1 - 6$ アルキル（非置換であっても又はハロで 1 回以上置換されていてもよい）であり；そして

R^m は： $C_1 - 6$ アルキル；

ヒドロキシ；

ハロ；

ヒドロキシ - $C_1 - 6$ アルキル；

$C_1 - 6$ アルキルスルホニル - $C_1 - 6$ アルキル；

シアノ；

$C_1 - 6$ アルキルスルホニル - アミノ -

$C_1 - 6$ アルキルスルフィニル - アミノ -

シアノ - $C_1 - 6$ アルキル；

シアノ - $C_2 - 6$ アルケニル；

アミノ - $C_1 - 6$ アルキル；

$C_1 - 6$ アルコキシ - $C_1 - 6$ アルキル；

$C_1 - 6$ アルコキシ - $C_1 - 6$ アルコキシ - $C_1 - 6$ アルキル；

ヒドロキシ - $C_1 - 6$ アルコキシ；

ヒドロキシ - $C_1 - 6$ アルコキシ - $C_1 - 6$ アルキル；

ヒドロキシ - $C_1 - 6$ アルキル - アミノ；

$C_1 - 6$ アルコキシ - $C_1 - 6$ アルキル - アミノ；

N - ヒドロキシ - カルボキシアミジニル；

$C_1 - 6$ アルコキシ - カルボニル - $C_2 - 6$ アルケニル；

アミノ；

$N - C_{1-6}$ アルキルアミノ；

N, N -ジ- C_{1-6} アルキルアミノ；

- $(CHR^t)_u - C(O) - NR^p R^q$ ；

- $(CHR^s)_u - O - (CHR^s)_v - C(O) - NR^p R^q$ ；

- $(CHR^s)_u - NR^n - (CHR^s)_v - C(O) - NR^p R^q$ ；

- $(CHR^t)_u - C(O) - R^u$ ；

- $(CHR^s)_u - O - (CHR^s)_v - C(O) - R^u$ ；又は

- $(CHR^s)_u - NR^n - (CHR^s)_v - C(O) - R^u$ であり；

u は、0～2であり；

v は、0～2であり；

各 R^n は、独立して；

水素；又は

C_{1-6} アルキルであり；

R^p は；

水素；又は

C_{1-6} アルキルであり；

R^q は；

水素；

C_{1-6} アルキル；

ヒドロキシ- C_{1-6} アルキル；

$N - (C_{1-6}$ アルキルカルボニル) - アミノ - C_{1-6} アルキル；

C_{1-6} アルキルスルホニル - C_{1-6} アルキル；

アミノ - C_{1-6} アルキル；

$N - C_{1-6}$ アルキルアミノ - C_{1-6} アルキル；

N, N -ジ- C_{1-6} アルキルアミノ - C_{1-6} アルキル；

N, N -ジ- C_{1-6} アルキルアミノカルボニル - C_{1-6} アルキル；

シアノ - C_{1-6} アルキル；

カルボキシ - C_{1-6} アルキル；

アミノカルボニル - C_{1-6} アルキル；

$N - C_{1-6}$ アルキルアミノカルボニル - C_{1-6} アルキル；

N, N -ジ- C_{1-6} アルキルアミノカルボニル - C_{1-6} アルキル；

C_{1-6} アルキルスルホニル - C_{1-6} アルキル；又は

C_{1-6} アルコキシ - C_{1-6} アルキルであり；

各 R^s は、独立して；

水素；又は

C_{1-6} アルキルであり；

各 R^t は、独立して；

水素；

C_{1-6} アルキル；

ハロ；又は

ヒドロキシであり；そして

R^u は： C_{1-6} アルキル；

C_{1-6} アルコキシ；

ヒドロキシ；

ヒドロキシ - C_{1-6} アルキルである]

で表される化合物又はその薬学的に許容し得る塩。

【請求項2】

R^1 、 R^2 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 、 R^8 、 R^{13} 、 R^a 、 R^b 及び R^c が水素である、請求項1に記載の化合物。

【請求項 3】

X^1 、 X^2 、 X^3 及び X^4 が CR^e である、請求項 1 又は 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

p が 0 である、請求項 1 ~ 3 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 5】

m が 1 である、請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 6】

n が 0 である、請求項 1 ~ 5 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 7】

A が：結合；又は $-(CR_j R_k)_t-O-$ である、請求項 1 ~ 6 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 8】

W が、 $-CR^b R^c-$ である、請求項 1 ~ 7 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 9】

Y が、 $-O-$ 、 $-CR^f R^g-$ 又は $-NR^h-$ である、請求項 1 ~ 8 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 10】

R^9 がハロである、請求項 1 ~ 9 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 11】

R^{10} が：水素；ハロ；又は C_{1-6} アルキル（非置換であっても又はハロ若しくはオキソで 1 回以上置換されていてもよい）である、請求項 1 ~ 10 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 12】

R^{11} が：水素；ハロ；又は C_{1-6} アルキルである、請求項 1 ~ 11 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 13】

R^{12} が：水素；又は C_{1-6} アルキルである、請求項 1 ~ 12 のいずれかに記載の化合物。

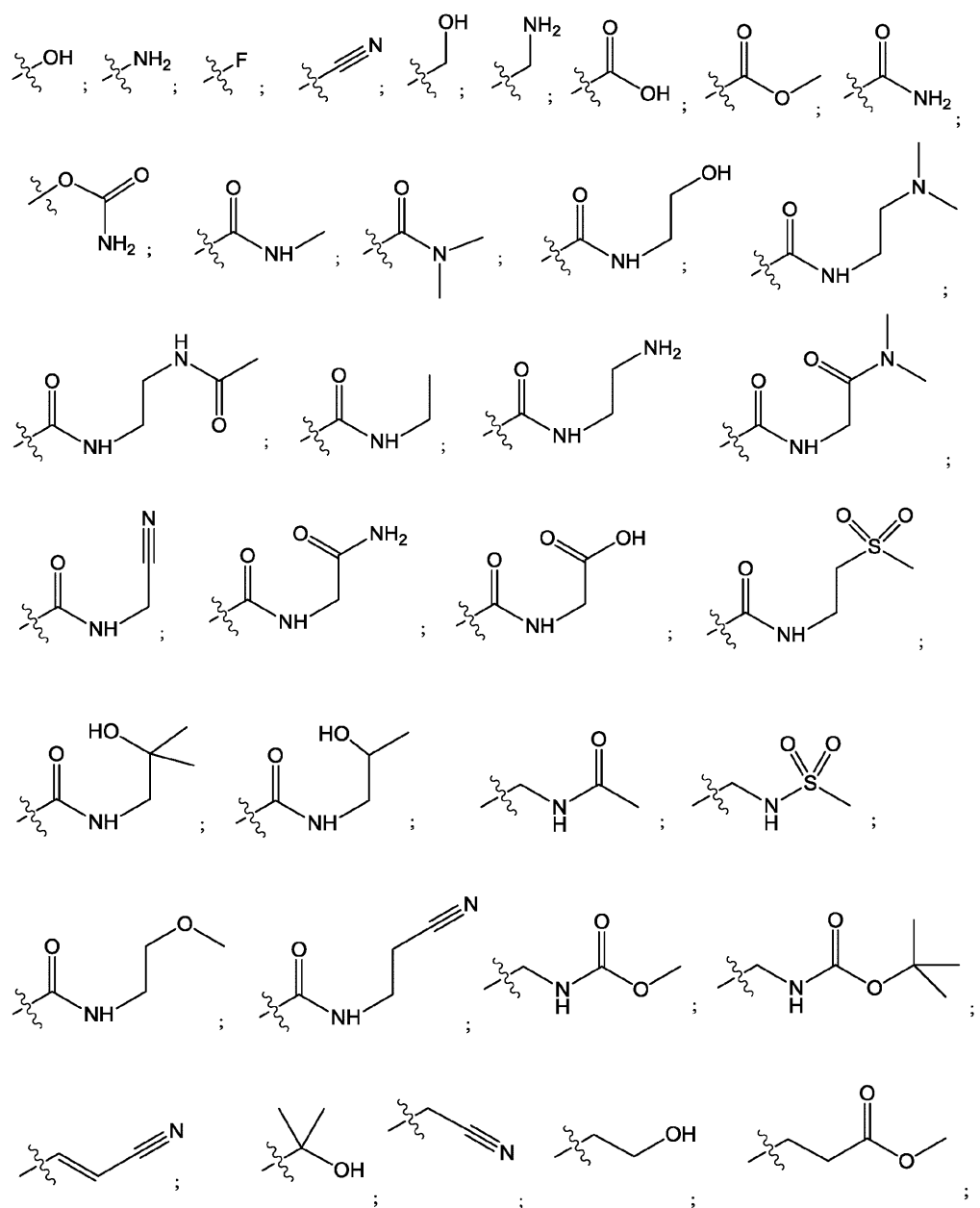
【請求項 14】

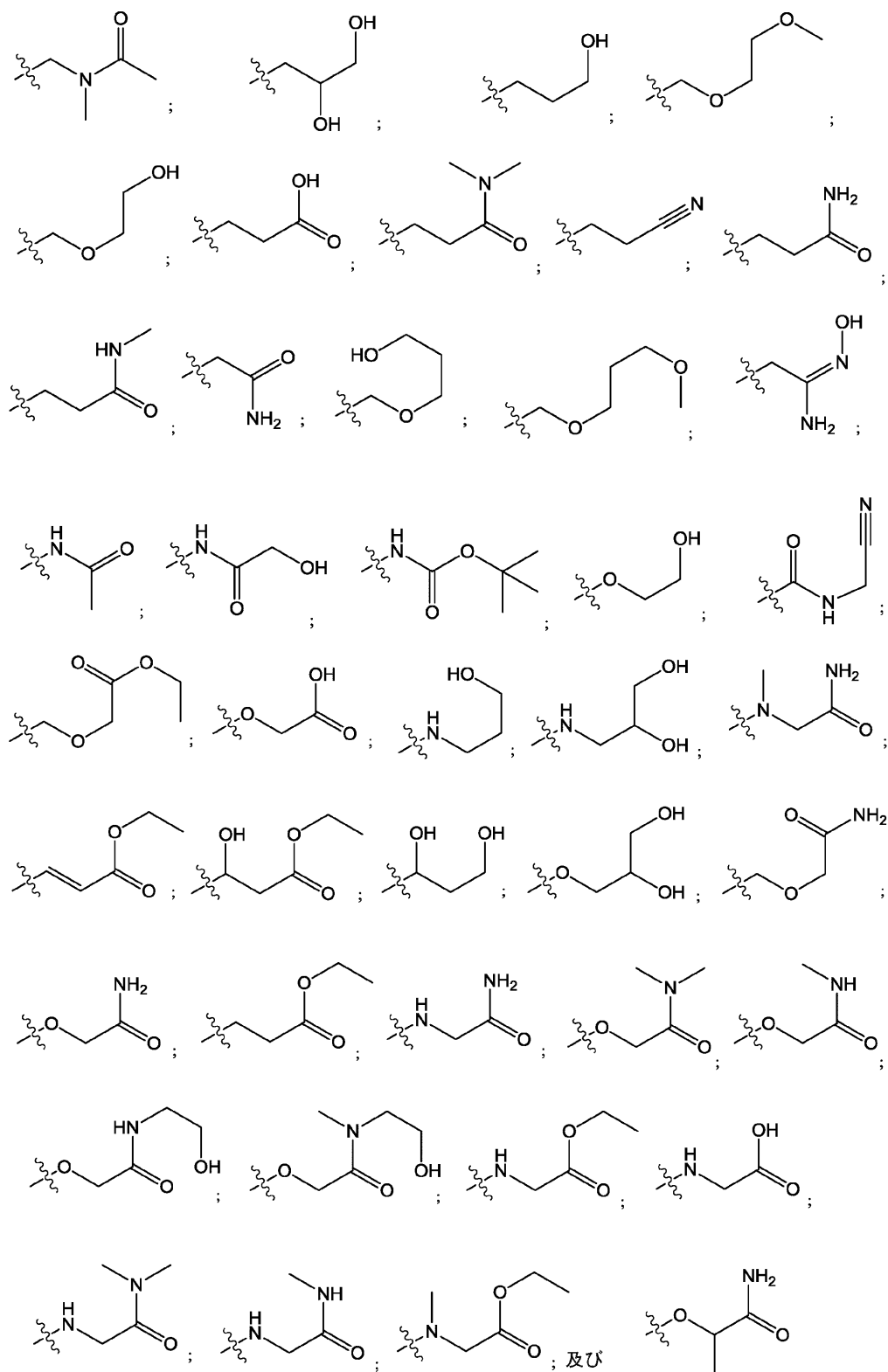
各 R^e が、独立して：水素；又はハロである、請求項 1 ~ 13 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 15】

R^m が、以下から選択される、請求項 1 ~ 14 のいずれかに記載の化合物：

【化 2】

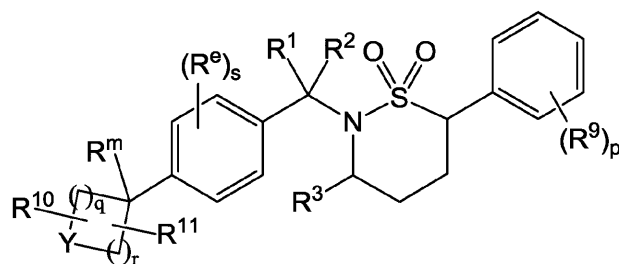




【請求項 16】

式 II :

【化 3】



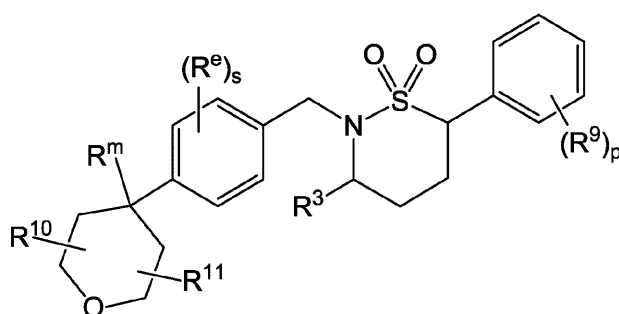
III.

で表される、請求項 1 ~ 15 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 17】

式 V I I :

【化 4】



VII

で表される、請求項 1 ~ 16 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 18】

以下を含む組成物：

- (a) 薬学的に許容し得る担体；及び
- (b) 請求項 1 ~ 17 のいずれかに記載の化合物。

【請求項 19】

関節炎、喘息、COPD、乾癬、ループス（紅斑性狼瘡）、シェーグレン症候群、過敏性腸疾患、特発性肺線維症又は筋硬化症の処置のための、請求項 1 ~ 18 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 20】

関節炎、喘息、COPD、乾癬、ループス（紅斑性狼瘡）、シェーグレン症候群、過敏性腸疾患、特発性肺線維症又は筋硬化症を処置するための、請求項 1 ~ 18 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項 21】

関節炎、喘息、COPD、乾癬、ループス（紅斑性狼瘡）、シェーグレン症候群、過敏性腸疾患、特発性肺線維症又は筋硬化症を処置するための医薬の調製のための、請求項 1 ~ 18 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0004

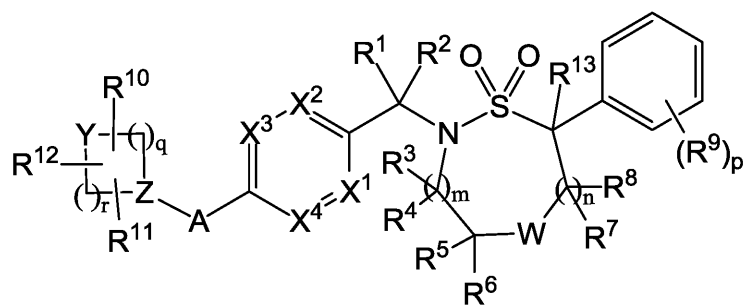
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0004】

発明の概要

【化 1】



I

m は、 0 又は 1 であり ;
n は、 0 又は 1 であり ;
p は、 0 ~ 3 であり ;
q は、 0、 1 又は 2 であり ;
r は、 1 ~ 3 であり ;
A は ;

$$\begin{aligned}
& - (C R_j R_k)_t - ; \\
& - C(O) - (C R_j R_k)_t - ; \\
& - (C R_j R_k)_t - C(O) - ; \\
& - N R^a - (C R_j R_k)_t - ; \\
& - (C R_j R_k)_t - N R^a - ; \\
& - C(O) N R^a - (C R_j R_k)_t - ; \\
& - (C R_j R_k)_t - N R^a C(O) - ; \\
& - O - (C R_j R_k)_t - ; \\
& - (C R_j R_k)_t - O - ; \\
& - S - (C R_j R_k)_t - ; \\
& - (C R_j R_k)_t - S - ; \\
& - S O_2 - (C R_j R_k)_t - ; \\
& - (C R_j R_k)_t - S O_2 - \text{であり；又は} \\
& t \text{は、} 0 \sim 4 \text{であり；}
\end{aligned}$$

- C R^b R^c - ;
- O - ;
- S - ;
- S O₂ - ; 又は
- N R^d - であり ;

X^1 、 X^2 、 X^3 及び X^4 の 1 つは N であり、そして、他のものは CR^e であるか；
又は X^1 、 X^2 、 X^3 及び X^4 の 2 つは N であり、そして、他のものは CR^e であるか

又は X^1 、 X^2 、 X^3 及び X^4 の 3 つは N であり、そして、他のものは CR^e であるか

又は X^1 、 X^2 、 X^3 及び X^4 の各々は、 CR^e であり；

- O - ;
- S - ;
- S O₂ - ;

- C R^f R^g - ; 又は

- N R^h - であり ;

Z は : C R^m であり ;

R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷ 及び R⁸ は、各々独立して ;

水素 ; 又は C₁₋₆ アルキル (非置換であっても又はハロで 1 回以上置換されていてよい) であるか ;

又は R³ 及び R⁴ は、これらが連結している原子と一緒にあって、エチレン基を形成してもよく ;

又は R³ 及び R⁴ は、これらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環 (場合により - O - 、 - N R^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により Rⁱ で 1 回以上置換されていてよい) を形成してもよく ;

又は R⁵ 及び R⁶ は、これらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環 (場合により - O - 、 - N R^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により Rⁱ で 1 回以上置換されていてよい) を形成してもよく ;

又は R⁷ 及び R⁸ は、これらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環 (場合により - O - 、 - N R^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により Rⁱ で 1 回以上置換されていてよい) を形成してもよく ;

又は R³ 及び R⁴ の 1 つは、R⁵ 及び R⁶ の 1 つならびにこれらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環 (場合により - O - 、 - N R^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により Rⁱ で 1 回以上置換されていてよい) を形成してもよく ;

又は R⁵ 及び R⁶ の 1 つは、R⁷ 及び R⁸ の 1 つならびにこれらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環 (場合により - O - 、 - N R^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により Rⁱ で 1 回以上置換されていてよい) を形成してもよく ;

各 R⁹ は、独立して :

C₁₋₆ アルキル ;

ハロ ;

C₁₋₆ アルコキシ ; 又は

シアノであり ;

ここで、C₁₋₆ アルキル部分は、非置換であっても又はハロで 1 回以上置換されていてよく ;

R¹⁰ は :

水素 ;

カルボキシ ;

C₁₋₆ アルキル - カルボニル ;

C₁₋₆ アルコキシ - カルボニル ;

オキソ ;

ヒドロキシ ;

アミノカルボニル ;

N - C₁₋₆ アルキル - アミノカルボニル ;

N, N - ジ - C₁₋₆ アルキル - アミノカルボニル ;

シアノ ;

ヒドロキシ - C₁₋₆ アルキル ;

N - C₁₋₆ アルコキシ - C₁₋₆ アルキル - アミノカルボニル ;

N - ヒドロキシ - C₁₋₆ アルキル - アミノカルボニル ;

N - C₁₋₆ アルコキシ - アミノカルボニル ;

ハロ；又は

C_{1-6} アルキル（非置換であっても又はハロ若しくはオキソで1回以上置換されていてよい）であり；

R^{11} は：

水素；

ハロ；

カルボキシ；

C_{1-6} アルキル - カルボニル；

C_{1-6} アルコキシ - カルボニル；

オキソ；

ヒドロキシ；

アミノカルボニル；

$N-C_{1-6}$ アルキル - アミノカルボニル；

N,N -ジ- C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

C_{1-6} アルキル - スルホニルアミノ；

C_{1-6} アルキル - スルホニルアミノ - C_{1-6} アルキル；

シアノ；

ヒドロキシ - C_{1-6} アルキル；

$N-C_{1-6}$ アルコキシ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

N -ヒドロキシ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

$N-C_{1-6}$ アルコキシ - アミノカルボニル；又は

C_{1-6} アルキル（非置換であっても又はハロ若しくはオキソで1回以上置換されていてよい）であるか；

又は R^{10} 及び R^{11} は、これらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6又は7員の飽和又は部分飽和環（場合により - O -、- NR^a - 又は - S - から選択される1又は2個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i で1回以上置換されていてよい）を形成してもよく；

又は R^{10} 及び R^{11} は、これらが連結している原子と一緒にあって、二重結合を形成してもよく；

R^{12} は：

水素；

ハロ；

カルボキシ；

C_{1-6} アルキル - カルボニル；

C_{1-6} アルコキシ - カルボニル；

オキソ；

ヒドロキシ；

アミノカルボニル；

$N-C_{1-6}$ アルキル - アミノカルボニル；

N,N -ジ- C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

シアノ；

ヒドロキシ - C_{1-6} アルキル；

$N-C_{1-6}$ アルコキシ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

N -ヒドロキシ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

$N-C_{1-6}$ アルコキシ - アミノカルボニル；又は

C_{1-6} アルキル（非置換であっても又はハロ若しくはオキソで1回以上置換されていてよい）であり；

R^{13} は：

水素；又は

C_{1-6} アルキル（非置換であっても又はハロで1回以上置換されていてよい）であり

;

R^a 、 R^b 、 R^c 及び R^d は、各々独立して：

水素；又は

C_{1-6} アルキル（非置換であっても又はハロで 1 回以上置換されていてよい）であるか；

又は R^b 及び R^c は、これらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環（場合により - O -、- N R^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i で 1 回以上置換されていてよい）を形成してもよく；

又は R^b 及び R^c の 1 つは、 R^7 及び R^8 の 1 つならびにこれらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環（場合により - O -、- N R^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i で 1 回以上置換されていてよい）を形成してもよく；

又は R^b 及び R^c の 1 つは、 R^5 及び R^6 の 1 つならびにこれらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環（場合により - O -、- N R^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i で 1 回以上置換されていてよい）を形成してもよく；

各 R^e は、独立して：

水素；

C_{1-6} アルキル；

ハロ；

C_{1-6} アルコキシ；又は

シアノであり；

ここで、 C_{1-6} アルキル部分は、非置換であっても又はハロ、ヒドロキシ若しくは C_{1-6} アルコキシで 1 回以上置換されていてよい；

R^f は：

水素；

ハロ；

C_{1-6} アルコキシ；又は

C_{1-6} アルキル（非置換であっても又はハロ、ヒドロキシ若しくは C_{1-6} アルコキシで 1 回以上置換されていてよい）であり；

R^g は：

水素；

C_{1-6} アルキル；

C_{3-6} シクロアルキル；

C_{3-6} シクロアルケニル；

C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル；

ハロ；

C_{1-6} アルキル - カルボニル；

C_{3-6} シクロアルキル - カルボニル；

C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル - カルボニル；

シアノ - C_{1-6} アルキル - カルボニル；

ヒドロキシ - C_{1-6} アルキル - カルボニル；

C_{1-6} アルコキシ - C_{1-6} アルキル - カルボニル；

カルボキシ；

N - シアノ - アミノカルボニル；

N - シアノ - N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

N - C_{1-6} アルキル - アセトイミドアミジル；

N, N' - ジ - C_{1-6} アルキル - アセトイミドアミジル；

N' - シアノ - N - C_{1-6} アルキル - アセトイミドアミジル；

N' - ヒドロキシ - アセトイミドアミジル ;
 N' - C_{1-6} アルコキシ - アセトイミドアミジル ;
 N' - ヒドロキシ - N - C_{1-6} アルキル - アセトイミドアミジル ;
 N' - C_{1-6} アルコキシ - N - C_{1-6} アルキル - アセトイミドアミジル ;
2 - ニトロ - 1 - N - C_{1-6} アルキルアミノ - ビニル ; ホルミル ;
 C_{1-6} アルキル - スルホニル ;
 C_{3-6} シクロアルキル - スルホニル ;
 C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル - スルホニル ;
 C_{1-6} アルキル - スルホニル - C_{1-6} アルキル ;
アミノカルボニル ;
カルボニルアミノ ;
 N - ヒドロキシ - アミノカルボニル ;
 N - C_{1-6} アルコキシ - アミノカルボニル ;
 N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル ;
アミノカルボニル - C_{1-6} アルキル ;
 N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル - C_{1-6} アルキル ;
 N, N - ジ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル - C_{1-6} アルキル ;
 C_{1-6} アルコキシ - カルボニル ;
 N - ヒドロキシ - N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル ;
 N - C_{1-6} アルコキシ - N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル ;
 N, N - ジ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル ;
アミノスルホニル ;
 N - C_{1-6} アルキル - アミノスルホニル ;
 N, N - ジ - C_{1-6} アルキル - アミノスルホニル ;
シアノ ;
 C_{1-6} アルコキシ ;
 C_{1-6} アルキル - スルホニルアミノ ;
 N - C_{1-6} アルキル - スルホニルアミノカルボニル ;
 N - (C_{1-6} アルキル - スルホニル) - N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル ;
 N - (C_{1-6} アルキル - スルホニル) - アミノ - C_{1-6} アルキル ; アミノ ;
 N - C_{1-6} アルキル - アミノ ;
 N, N - ジ - C_{1-6} アルキル - アミノ ;
ハロ - C_{1-6} アルキル ;
フェニル ;
ヘテロシクリル ;
ヘテロアリール ;
 C_{1-6} アルキル - カルボニルアミノ ;
カルボニルアミノ ; 又は
ヒドロキシであり ;
ここで、 C_{1-6} アルキル部分は、非置換であっても又はハロで 1 回以上置換されていてもよく ; そして
フェニル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルケニル及び C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル部分は、非置換であっても又は R^i で 1 回以上置換されていてもよく ;
又は R^f 及び R^g は、一緒になって、オキソを形成してもよく ;
又は R^f 及び R^g は、これらが連結している原子と一緒に、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環 (場合により - O - 、 - NR^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i で 1 回以上置換されてよい) を形成してもよく ;
 R^h は :

水素；

C_{1-6} アルキル；
 C_{3-6} シクロアルキル；
 C_{3-6} シクロアルケニル；
 C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル；
 C_{1-6} アルキル - カルボニル；
 C_{3-6} シクロアルキル - カルボニル；
 C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル - カルボニル；
 シアノ - C_{1-6} アルキル - カルボニル；
 ヒドロキシ - C_{1-6} アルキル - カルボニル；
 C_{1-6} アルコキシ - C_{1-6} アルキル - カルボニル；
 N - シアノ - アミノカルボニル；
 N - シアノ - N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；
 N - C_{1-6} アルキル - アセトイミドアミジル；
 N, N' - ジ - C_{1-6} アルキル - アセトイミドアミジル；
 N' - シアノ - N - C_{1-6} アルキル - アセトイミドアミジル；
 N' - ヒドロキシ - アセトイミドアミジル；
 N' - C_{1-6} アルコキシ - アセトイミドアミジル；
 N' - ヒドロキシ - N - C_{1-6} アルキル - アセトイミドアミジル；
 N' - C_{1-6} アルコキシ - N - C_{1-6} アルキル - アセトイミドアミジル；
 2 - ニトロ - 1 - N - C_{1-6} アルキルアミノ - ビニル；

ホルミル；

C_{1-6} アルキル - スルホニル；
 C_{3-6} シクロアルキル - スルホニル；
 C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル - スルホニル；
 C_{1-6} アルキル - スルホニル - C_{1-6} アルキル；
 アミノカルボニル；
 N - ヒドロキシ - アミノカルボニル；
 N - C_{1-6} アルコキシ - アミノカルボニル；
 N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；
 N - ヒドロキシ - N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；
 N - C_{1-6} アルコキシ - N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；
 N, N - ジ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；
 アミノスルホニル；
 N - C_{1-6} アルキル - アミノスルホニル；
 N, N - ジ - C_{1-6} アルキル - アミノスルホニル；

シアノ；

C_{1-6} アルキル - スルホニルアミノ；
 C_{1-6} アルキル - スルホニルアミノ - C_{1-6} アルキル；
 N - (C_{1-6} アルキル - スルホニル) アミノカルボニル；
 N - (C_{1-6} アルキル - スルホニル) - N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；
 N - (C_{1-6} アルキル - スルホニル) - アミノ - C_{1-6} アルキル；
 アミノカルボニル - C_{1-6} アルキル；
 N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル - C_{1-6} アルキル；
 N, N - ジ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル - C_{1-6} アルキル；
 C_{1-6} アルコキシ - カルボニル；

フェニル；

ヘテロシクリル；又は

ヘテロアリールであり；

ここで、 C_{1-6} アルキル部分は、非置換であっても又はハロで 1 回以上置換されていて

もよく；そして

フェニル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、 C_{3-6} シクロアルキル、 C_{3-6} シクロアルケニル及び C_{3-6} シクロアルキル- C_{1-6} アルキル部分は、非置換であっても又は R^i で1回以上置換されていてもよく；

又は R^h ならびに R^{10} 及び R^{11} の1つは、これらが連結している原子と一緒にあって、4、5、6又は7員の芳香族、部分飽和又は不飽和環（場合により-O-、-NR^a-又は-S-から選択される1又は2個の追加のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i -で1回以上置換されていてもよい）を形成してもよく；

又は R^f 及び R^g の1つならびに R^{10} 及び R^{11} の1つは、これらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6又は7員の芳香族、部分飽和又は不飽和環（場合により-O-、-NR^a-又は-S-から選択される追加のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i で1回以上置換されていてもよい）を形成してもよく；

R^i は：

C_{1-6} アルキル；

ハロ- C_{1-6} アルキル；

C_{3-6} シクロアルキル；

ハロ；

オキソ；

ヒドロキシ；

アセチル；

C_{1-6} アルキル-カルボニル；

アミノ-カルボニル；

ヒドロキシ- C_{1-6} アルキル；

シアノ；

シアノ- C_{1-6} アルキル；

C_{1-6} アルコキシ- C_{1-6} アルキル；

カルボキシ；又は

C_{1-6} アルコキシであり；

R^j 及び R^k は、各々独立して：

水素；又は

C_{1-6} アルキル（非置換であっても又はハロで1回以上置換されていてもよい）であり；そして

R^m は： C_{1-6} アルキル；

ヒドロキシ；

ハロ；

ヒドロキシ- C_{1-6} アルキル；

C_{1-6} アルキルスルホニル- C_{1-6} アルキル；

シアノ；

C_{1-6} アルキルスルホニル-アミノ-

C_{1-6} アルキルスルフィニル-アミノ-

シアノ- C_{1-6} アルキル；

シアノ- C_{2-6} アルケニル；

アミノ- C_{1-6} アルキル；

C_{1-6} アルコキシ- C_{1-6} アルキル；

C_{1-6} アルコキシ- C_{1-6} アルコキシ- C_{1-6} アルキル；

ヒドロキシ- C_{1-6} アルコキシ；

ヒドロキシ- C_{1-6} アルコキシ- C_{1-6} アルキル；

ヒドロキシ- C_{1-6} アルキル-アミノ；

C_{1-6} アルコキシ- C_{1-6} アルキル-アミノ；

N-ヒドロキシ-カルボキシアミジニル；

C_{1-6} アルコキシ - カルボニル - C_{2-6} アルケニル ;
 アミノ ;
 $N - C_{1-6}$ アルキルアミノ ;
 N, N - ジ - C_{1-6} アルキルアミノ ;
 $-(CHR^t)_u - C(O) - NR^p R^q$;
 $-(CHR^s)_u - O - (CHR^s)_v - C(O) - NR^p R^q$;
 $-(CHR^s)_u - NR^n - (CHR^s)_v - C(O) - NR^p R^q$;
 $-(CHR^t)_u - C(O) - R^u$;
 $-(CHR^s)_u - O - (CHR^s)_v - C(O) - R^u$; 又は
 $-(CHR^s)_u - NR^n - (CHR^s)_v - C(O) - R^u$ であり ;
 u は、0 ~ 2 であり ;
 v は、0 ~ 2 であり ;
 各 R^n は、独立して :

水素 ; 又は

C_{1-6} アルキルであり ;
 R^p は :

水素 ; 又は

C_{1-6} アルキルであり ;
 R^q は :

水素 ;

C_{1-6} アルキル ;
 ヒドロキシ - C_{1-6} アルキル ;
 $N - (C_{1-6}$ アルキルカルボニル) - アミノ - C_{1-6} アルキル ;
 C_{1-6} アルキルスルホニル - C_{1-6} アルキル ;
 アミノ - C_{1-6} アルキル ;
 $N - C_{1-6}$ アルキルアミノ - C_{1-6} アルキル ;
 N, N - ジ - C_{1-6} アルキルアミノ - C_{1-6} アルキル ;
 N, N - ジ - C_{1-6} アルキルアミノカルボニル - C_{1-6} アルキル ;
 シアノ - C_{1-6} アルキル ;
 カルボキシ - C_{1-6} アルキル ;
 アミノカルボニル - C_{1-6} アルキル ;
 $N - C_{1-6}$ アルキルアミノカルボニル - C_{1-6} アルキル ;
 N, N - ジ - C_{1-6} アルキルアミノカルボニル - C_{1-6} アルキル ;
 C_{1-6} アルキルスルホニル - C_{1-6} アルキル ; 又は
 C_{1-6} アルコキシ - C_{1-6} アルキルであり ;
 各 R^s は、独立して :

水素 ; 又は

C_{1-6} アルキルであり ;
 各 R^t は、独立して :

水素 ;

C_{1-6} アルキル ;

ハロ ; 又は

ヒドロキシであり ; そして

R^u は : C_{1-6} アルキル ;

C_{1-6} アルコキシ ;

ヒドロキシ ; 又は

ヒドロキシ - C_{1-6} アルキルである]

で表される化合物又はその薬学的に許容し得る塩を提供する。

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】 0 1 2 1

【訂正方法】 変更

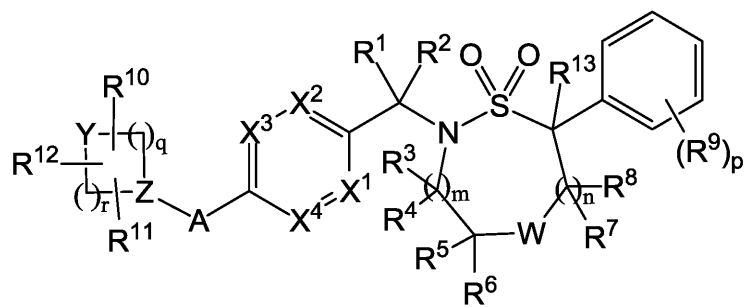
【訂正の内容】

【 0 1 2 1 】

本発明の化合物

本発明は、式 I :

【化 2】



I

[式中 :

m は、 0 又は 1 であり ;

n は、 0 又は 1 であり ;

p は、 0 ~ 3 であり ;

q は、 0、 1 又は 2 であり ;

r は、 1 ~ 3 であり ;

A は :

結合 ;

- (C R_j R_k)_t - ;
- C (O) - (C R_j R_k)_t - ;
- (C R_j R_k)_t - C (O) - ;
- N R^a - (C R_j R_k)_t - ;
- (C R_j R_k)_t - N R^a - ;
- C (O) N R^a - (C R_j R_k)_t - ;
- (C R_j R_k)_t - N R^a C (O) - ;
- O - (C R_j R_k)_t - ;
- (C R_j R_k)_t - O - ;
- S - (C R_j R_k)_t - ;
- (C R_j R_k)_t - S - ;
- S O₂ - (C R_j R_k)_t - ;
- (C R_j R_k)_t - S O₂ - であり ; 又は

t は、 0 ~ 4 であり ;

W は :

- C R^b R^c - ;
- O - ;
- S - ;
- S O₂ - ; 又は
- N R^d - であり ;

X¹、X²、X³ 及び X⁴ の 1 つは N であり、そして、他のものは C R^e であるか ;

又は X¹、X²、X³ 及び X⁴ の 2 つは N であり、そして、他のものは C R^e であるか ;

;

又は X¹、X²、X³ 及び X⁴ の 3 つは N であり、そして、他のものは C R^e であるか ;

;

又は X^1 、 X^2 、 X^3 及び X^4 の各々は、 CR^e であり；

Y は：

- O - ；
- S - ；
- SO_2 - ；
- CR^fR^g - ；又は
- NR^h - であり；

Z は： CR^m であり；

R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^6 、 R^7 及び R^8 は、各々独立して；

水素；又は C_{1-6} アルキル（非置換であっても又はハロで 1 回以上置換されていてよい）であるか；

又は R^3 及び R^4 は、これらが連結している原子と一緒にあって、エチレン基を形成してもよく；

又は R^3 及び R^4 は、これらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環（場合により - O -、- NR^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i で 1 回以上置換されていてよい）を形成してもよく；

又は R^5 及び R^6 は、これらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環（場合により - O -、- NR^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i で 1 回以上置換されていてよい）を形成してもよく；

又は R^7 及び R^8 は、これらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環（場合により - O -、- NR^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i で 1 回以上置換されていてよい）を形成してもよく；

又は R^3 及び R^4 の 1 つは、 R^5 及び R^6 の 1 つならびにこれらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環（場合により - O -、- NR^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i で 1 回以上置換されていてよい）を形成してもよく；

又は R^5 及び R^6 の 1 つは、 R^7 及び R^8 の 1 つならびにこれらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環（場合により - O -、- NR^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i で 1 回以上置換されていてよい）を形成してもよく；

各 R^9 は、独立して；

C_{1-6} アルキル；

ハロ；

C_{1-6} アルコキシ；又は

シアノであり；

ここで、 C_{1-6} アルキル部分は、非置換であっても又はハロで 1 回以上置換されていてよく；

R^{10} は：

水素；

カルボキシ；

C_{1-6} アルキル - カルボニル；

C_{1-6} アルコキシ - カルボニル；

オキソ；

ヒドロキシ；

アミノカルボニル；

N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

N, N - ジ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

シアノ；
 ヒドロキシ - C₁ - 6 アルキル；
 N - C₁ - 6 アルコキシ - C₁ - 6 アルキル - アミノカルボニル；
 N - ヒドロキシ - C₁ - 6 アルキル - アミノカルボニル；
 N - C₁ - 6 アルコキシ - アミノカルボニル；
 ハロ；又は
 C₁ - 6 アルキル（非置換であっても又はハロ若しくはオキソで1回以上置換されていてよい）であり；
 R^{1 1} は：
 水素；
 ハロ；
 カルボキシ；
 C₁ - 6 アルキル - カルボニル；
 C₁ - 6 アルコキシ - カルボニル；
 オキソ；
 ヒドロキシ；
 アミノカルボニル；
 N - C₁ - 6 アルキル - アミノカルボニル；
 N, N - ジ - C₁ - 6 アルキル - アミノカルボニル；
 C₁ - 6 アルキル - スルホニルアミノ；
 C₁ - 6 アルキル - スルホニルアミノ - C₁ - 6 アルキル；
 シアノ；
 ヒドロキシ - C₁ - 6 アルキル；
 N - C₁ - 6 アルコキシ - C₁ - 6 アルキル - アミノカルボニル；
 N - ヒドロキシ - C₁ - 6 アルキル - アミノカルボニル；
 N - C₁ - 6 アルコキシ - アミノカルボニル；又は
 C₁ - 6 アルキル（非置換であっても又はハロ若しくはオキソで1回以上置換されていてよい）であるか；
 又は R^{1 0} 及び R^{1 1} は、これらが連結している原子と一緒に、3、4、5、6 又は7員の飽和又は部分飽和環（場合により - O - 、 - NR^a - 又は - S - から選択される1又は2個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により Rⁱ で1回以上置換されていてよい）を形成してもよく；
 又は R^{1 0} 及び R^{1 1} は、これらが連結している原子と一緒に、二重結合を形成してもよく；
 R^{1 2} は：
 水素；
 ハロ；
 カルボキシ；
 C₁ - 6 アルキル - カルボニル；
 C₁ - 6 アルコキシ - カルボニル；
 オキソ；
 ヒドロキシ；
 アミノカルボニル；
 N - C₁ - 6 アルキル - アミノカルボニル；
 N, N - ジ - C₁ - 6 アルキル - アミノカルボニル；
 シアノ；
 ヒドロキシ - C₁ - 6 アルキル；
 N - C₁ - 6 アルコキシ - C₁ - 6 アルキル - アミノカルボニル；
 N - ヒドロキシ - C₁ - 6 アルキル - アミノカルボニル；
 N - C₁ - 6 アルコキシ - アミノカルボニル；又は

C₁ - 6 アルキル（非置換であっても又はハロ若しくはオキソで 1 回以上置換されていてよい）であり；

R¹³ は：

水素；又は

C₁ - 6 アルキル（非置換であっても又はハロで 1 回以上置換されていてよい）であり；

R^a、R^b、R^c 及び R^d は、各々独立して：

水素；又は

C₁ - 6 アルキル（非置換であっても又はハロで 1 回以上置換されていてよい）であるか；

又は R^b 及び R^c は、これらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環（場合により - O -、- N R^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により Rⁱ で 1 回以上置換されていてよい）を形成してもよく；

又は R^b 及び R^c の 1 つは、R⁷ 及び R⁸ の 1 つならびにこれらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環（場合により - O -、- N R^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により Rⁱ で 1 回以上置換されていてよい）を形成してもよく；

又は R^b 及び R^c の 1 つは、R⁵ 及び R⁶ の 1 つならびにこれらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の飽和又は部分飽和環（場合により - O -、- N R^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により Rⁱ で 1 回以上置換されていてよい）を形成してもよく；

各 R^e は、独立して：

水素；

C₁ - 6 アルキル；

ハロ；

C₁ - 6 アルコキシ；又は

シアノであり；

ここで、C₁ - 6 アルキル部分は、非置換であっても又はハロ、ヒドロキシ若しくは C₁ - 6 アルコキシで 1 回以上置換されていてよく；

R^f は：

水素；

ハロ；

C₁ - 6 アルコキシ；又は

C₁ - 6 アルキル（非置換であっても又はハロ、ヒドロキシ若しくは C₁ - 6 アルコキシで 1 回以上置換されていてよい）であり；

R^g は：

水素；

C₁ - 6 アルキル；

C₃ - 6 シクロアルキル；

C₃ - 6 シクロアルケニル；

C₃ - 6 シクロアルキル - C₁ - 6 アルキル；

ハロ；

C₁ - 6 アルキル - カルボニル；

C₃ - 6 シクロアルキル - カルボニル；

C₃ - 6 シクロアルキル - C₁ - 6 アルキル - カルボニル；

シアノ - C₁ - 6 アルキル - カルボニル；

ヒドロキシ - C₁ - 6 アルキル - カルボニル；

C₁ - 6 アルコキシ - C₁ - 6 アルキル - カルボニル；

カルボキシ；

N - シアノ - アミノカルボニル ;
 N - シアノ - N - C₁₋₆ アルキル - アミノカルボニル ;
 N - C₁₋₆ アルキル - アセトイミドアミジル ;
 N, N' - ジ - C₁₋₆ アルキル - アセトイミドアミジル ;
 N' - シアノ - N - C₁₋₆ アルキル - アセトイミドアミジル ;
 N' - ヒドロキシ - アセトイミドアミジル ;
 N' - C₁₋₆ アルコキシ - アセトイミドアミジル ;
 N' - ヒドロキシ - N - C₁₋₆ アルキル - アセトイミドアミジル ;
 N' - C₁₋₆ アルコキシ - N - C₁₋₆ アルキル - アセトイミドアミジル ;
 2 - ニトロ - 1 - N - C₁₋₆ アルキルアミノ - ビニル ; ホルミル ;
 C₁₋₆ アルキル - スルホニル ;
 C₃₋₆ シクロアルキル - スルホニル ;
 C₃₋₆ シクロアルキル - C₁₋₆ アルキル - スルホニル ;
 C₁₋₆ アルキル - スルホニル - C₁₋₆ アルキル ;
 アミノカルボニル ;
 カルボニルアミノ ;
 N - ヒドロキシ - アミノカルボニル ;
 N - C₁₋₆ アルコキシ - アミノカルボニル ;
 N - C₁₋₆ アルキル - アミノカルボニル ;
 アミノカルボニル - C₁₋₆ アルキル ;
 N - C₁₋₆ アルキル - アミノカルボニル - C₁₋₆ アルキル ;
 N, N - ジ - C₁₋₆ アルキル - アミノカルボニル - C₁₋₆ アルキル ;
 C₁₋₆ アルコキシ - カルボニル ;
 N - ヒドロキシ - N - C₁₋₆ アルキル - アミノカルボニル ;
 N - C₁₋₆ アルコキシ - N - C₁₋₆ アルキル - アミノカルボニル ;
 N, N - ジ - C₁₋₆ アルキル - アミノカルボニル ;
 アミノスルホニル ;
 N - C₁₋₆ アルキル - アミノスルホニル ;
 N, N - ジ - C₁₋₆ アルキル - アミノスルホニル ;
 シアノ ;
 C₁₋₆ アルコキシ ;
 C₁₋₆ アルキル - スルホニルアミノ ;
 N - C₁₋₆ アルキル - スルホニルアミノカルボニル ;
 N - (C₁₋₆ アルキル - スルホニル) - N - C₁₋₆ アルキル - アミノカルボニル ;
 N - (C₁₋₆ アルキル - スルホニル) - アミノ - C₁₋₆ アルキル ; アミノ ;
 N - C₁₋₆ アルキル - アミノ ;
 N, N - ジ - C₁₋₆ アルキル - アミノ ;
 ハロ - C₁₋₆ アルキル ;
 フェニル ;
 ヘテロシクリル ;
 ヘテロアリール ;
 C₁₋₆ アルキル - カルボニルアミノ ;
 カルボニルアミノ ; 又は
 ヒドロキシであり ;
 ここで、C₁₋₆ アルキル部分は、非置換であっても又はハロで 1 回以上置換されていてもよく ; そして
 フェニル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、C₃₋₆ シクロアルキル、C₃₋₆ シクロアルケニル及び C₃₋₆ シクロアルキル - C₁₋₆ アルキル部分は、非置換であっても又は Rⁱ で 1 回以上置換されていてもよく ;
 又は R^f 及び R^g は、一緒になって、オキソを形成してもよく ;

又は R^f 及び R^g は、これらが連結している原子と一緒にあって、4、5、6又は7員の飽和又は部分飽和環（場合により - O - 、 - NR^a - 又は - S - から選択される1又は2個のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により R^i で1回以上置換されていてよい）を形成してもよく；

R^h は：

水素；

C_{1-6} アルキル；

C_{3-6} シクロアルキル；

C_{3-6} シクロアルケニル；

C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル；

C_{1-6} アルキル - カルボニル；

C_{3-6} シクロアルキル - カルボニル；

C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル - カルボニル；

シアノ - C_{1-6} アルキル - カルボニル；

ヒドロキシ - C_{1-6} アルキル - カルボニル；

C_{1-6} アルコキシ - C_{1-6} アルキル - カルボニル；

N - シアノ - アミノカルボニル；

N - シアノ - N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

N - C_{1-6} アルキル - アセトイミドアミジル；

N, N' - ジ - C_{1-6} アルキル - アセトイミドアミジル；

N' - シアノ - N - C_{1-6} アルキル - アセトイミドアミジル；

N' - ヒドロキシ - アセトイミドアミジル；

N' - C_{1-6} アルコキシ - アセトイミドアミジル；

N' - ヒドロキシ - N - C_{1-6} アルキル - アセトイミドアミジル；

N' - C_{1-6} アルコキシ - N - C_{1-6} アルキル - アセトイミドアミジル；

2 - ニトロ - 1 - N - C_{1-6} アルキルアミノ - ビニル；

ホルミル；

C_{1-6} アルキル - スルホニル；

C_{3-6} シクロアルキル - スルホニル；

C_{3-6} シクロアルキル - C_{1-6} アルキル - スルホニル；

C_{1-6} アルキル - スルホニル - C_{1-6} アルキル；

アミノカルボニル；

N - ヒドロキシ - アミノカルボニル；

N - C_{1-6} アルコキシ - アミノカルボニル；

N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

N - ヒドロキシ - N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

N - C_{1-6} アルコキシ - N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

N, N - ジ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

アミノスルホニル；

N - C_{1-6} アルキル - アミノスルホニル；

N, N - ジ - C_{1-6} アルキル - アミノスルホニル；

シアノ；

C_{1-6} アルキル - スルホニルアミノ；

C_{1-6} アルキル - スルホニルアミノ - C_{1-6} アルキル；

N - (C_{1-6} アルキル - スルホニル) アミノカルボニル；

N - (C_{1-6} アルキル - スルホニル) - N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル；

N - (C_{1-6} アルキル - スルホニル) - アミノ - C_{1-6} アルキル；

アミノカルボニル - C_{1-6} アルキル；

N - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル - C_{1-6} アルキル；

N, N - ジ - C_{1-6} アルキル - アミノカルボニル - C_{1-6} アルキル；

C₁ - 6 アルコキシ - カルボニル ;

フェニル ;

ヘテロシクリル ; 又は

ヘテロアリールであり ;

ここで、C₁ - 6 アルキル部分は、非置換であっても又はハロで 1 回以上置換されていてもよく ; そして

フェニル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、C₃ - 6 シクロアルキル、C₃ - 6 シクロアルケニル及び C₃ - 6 シクロアルキル - C₁ - 6 アルキル部分は、非置換であっても又は Rⁱ で 1 回以上置換されていてもよく ;

又は R^h ならびに R¹⁰ 及び R¹¹ の 1 つは、これらが連結している原子と一緒にあって、4、5、6 又は 7 員の芳香族、部分飽和又は不飽和環 (場合により - O - 、 - NR^a - 又は - S - から選択される 1 又は 2 個の追加のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により Rⁱ - で 1 回以上置換されていてもよい) を形成してもよく ;

又は R^f 及び R^g の 1 つならびに R¹⁰ 及び R¹¹ の 1 つは、これらが連結している原子と一緒にあって、3、4、5、6 又は 7 員の芳香族、部分飽和又は不飽和環 (場合により - O - 、 - NR^a - 又は - S - から選択される追加のヘテロ原子を含んでよく、かつ場合により Rⁱ で 1 回以上置換されていてもよい) を形成してもよく ;

Rⁱ は :

C₁ - 6 アルキル ;

ハロ - C₁ - 6 アルキル ;

C₃ - 6 シクロアルキル ;

ハロ ;

オキソ ;

ヒドロキシ ;

アセチル ;

C₁ - 6 アルキル - カルボニル ;

アミノ - カルボニル ;

ヒドロキシ - C₁ - 6 アルキル ;

シアノ ;

シアノ - C₁ - 6 アルキル ;

C₁ - 6 アルコキシ - C₁ - 6 アルキル ;

カルボキシ ; 又は

C₁ - 6 アルコキシであり ;

R^j 及び R^k は、各々独立して :

水素 ; 又は

C₁ - 6 アルキル (非置換であっても又はハロで 1 回以上置換されていてもよい) であり ; そして

R^m は : C₁ - 6 アルキル ;

ヒドロキシ ;

ハロ ;

ヒドロキシ - C₁ - 6 アルキル ;

C₁ - 6 アルキルスルホニル - C₁ - 6 アルキル ;

シアノ ;

C₁ - 6 アルキルスルホニル - アミノ -

C₁ - 6 アルキルスルフィニル - アミノ -

シアノ - C₁ - 6 アルキル ;

シアノ - C₂ - 6 アルケニル ;

アミノ - C₁ - 6 アルキル ;

C₁ - 6 アルコキシ - C₁ - 6 アルキル ;

C₁ - 6 アルコキシ - C₁ - 6 アルコキシ - C₁ - 6 アルキル ;

ヒドロキシ - C_{1 - 6} アルコキシ ;
 ヒドロキシ - C_{1 - 6} アルコキシ - C_{1 - 6} アルキル ;
 ヒドロキシ - C_{1 - 6} アルキル - アミノ ;
 C_{1 - 6} アルコキシ - C_{1 - 6} アルキル - アミノ ;
 N - ヒドロキシ - カルボキシアミジニル ;
 C_{1 - 6} アルコキシ - カルボニル - C_{2 - 6} アルケニル ;
 アミノ ;
 N - C_{1 - 6} アルキルアミノ ;
 N, N - ジ - C_{1 - 6} アルキルアミノ ;
 - (CHR^t)_u - C(O) - NR^pR^q ;
 - (CHR^s)_u - O - (CHR^s)_v - C(O) - NR^pR^q ;
 - (CHR^s)_u - NRⁿ - (CHR^s)_v - C(O) - NR^pR^q ;
 - (CHR^t)_u - C(O) - R^u ;
 - (CHR^s)_u - O - (CHR^s)_v - C(O) - R^u ; 又は
 - (CHR^s)_u - NRⁿ - (CHR^s)_v - C(O) - R^u であり ;
 u は、0 ~ 2 であり ;
 v は、0 ~ 2 であり ;
 各 Rⁿ は、独立して :
 水素 ; 又は
 C_{1 - 6} アルキル であり ;
 R^p は :
 水素 ; 又は
 C_{1 - 6} アルキル であり ;
 R^q は :
 水素 ;
 C_{1 - 6} アルキル ;
 ヒドロキシ - C_{1 - 6} アルキル ;
 N - (C_{1 - 6} アルキルカルボニル) - アミノ - C_{1 - 6} アルキル ;
 C_{1 - 6} アルキルスルホニル - C_{1 - 6} アルキル ;
 アミノ - C_{1 - 6} アルキル ;
 N - C_{1 - 6} アルキルアミノ - C_{1 - 6} アルキル ;
 N, N - ジ - C_{1 - 6} アルキルアミノ - C_{1 - 6} アルキル ;
 N, N - ジ - C_{1 - 6} アルキルアミノカルボニル - C_{1 - 6} アルキル ;
 シアノ - C_{1 - 6} アルキル ;
 カルボキシ - C_{1 - 6} アルキル ;
 アミノカルボニル - C_{1 - 6} アルキル ;
 N - C_{1 - 6} アルキルアミノカルボニル - C_{1 - 6} アルキル ;
 N, N - ジ - C_{1 - 6} アルキルアミノカルボニル - C_{1 - 6} アルキル ;
 C_{1 - 6} アルキルスルホニル - C_{1 - 6} アルキル ; 又は
 C_{1 - 6} アルコキシ - C_{1 - 6} アルキル であり ;
 各 R^s は、独立して :
 水素 ; 又は
 C_{1 - 6} アルキル であり ;
 各 R^t は、独立して :
 水素 ;
 C_{1 - 6} アルキル ;
 ハロ ; 又は
 ヒドロキシ であり ; そして
 R^u は : C_{1 - 6} アルキル ;
 C_{1 - 6} アルコキシ ;

ヒドロキシ；又は

ヒドロキシ - C₁ - 6 アルキルである]

で表される化合物又はその薬学的に許容し得る塩を提供する。

【誤訳訂正4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0486

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0486】

式Iの特定の実施態様において、R^hならびにR^{1 0}及びR^{1 1}の1つは、これらが連結している原子と一緒にあって、4、5、6又は7員の芳香族、部分飽和又は不飽和環を形成する。

【誤訳訂正5】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0491

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0491】

式Iの特定の実施態様において、R^f及びR^gの1つならびにR^{1 0}及びR^{1 1}の1つは、これらが連結している原子と一緒にあって、4、5、6又は7員の芳香族、部分飽和又は不飽和環を形成する。