

【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7月6日 (2017.7.6)

【公表番号】特表2016-523908(P2016-523908A)

【公表日】平成28年8月12日 (2016.8.12)

【年通号数】公開・登録公報2016-048

【出願番号】特願2016-523870(P2016-523870)

【国際特許分類】

C 0 7 D 403/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

C 0 7 D 513/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 403/10 C S P

A 6 1 K 31/517

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 29/00

C 0 7 D 513/04 3 5 1

A 6 1 K 31/519

C 0 7 D 471/04 1 1 7 Z

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成29年5月17日 (2017.5.17)

【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

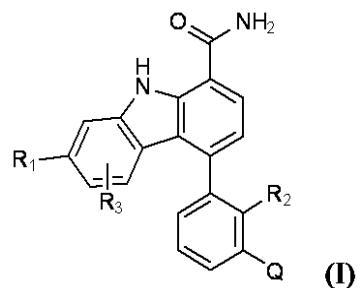
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

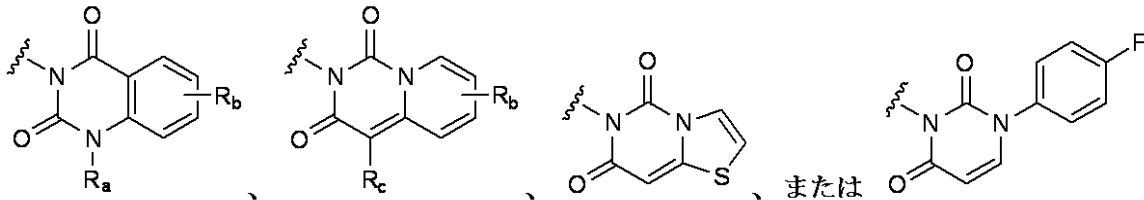
式 (I) :

【化 1】



[式中、Q は、

【化 2】



であり；

R_1 は、 $-\text{C}(\text{CH}_3)_2\text{OH}$ 、 $-\text{NHC}(=\text{O})\text{C}(\text{CH}_3)_3$ 、 $-\text{N}(\text{CH}_3)_2$ または $-\text{CH}_2\text{R}_d$ であり；

R_2 は、 Cl または $-\text{CH}_3$ であり；

R_3 は、 H 、 F または $-\text{CH}_3$ であり；

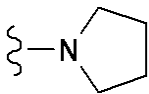
R_a は、 H または $-\text{CH}_3$ であり；

R_b は、 H 、 F 、 Cl または $-\text{OCH}_3$ であり；

R_c は、 H または F であり；および

R_d は、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OCH}_3$ 、 $-\text{NHC}(=\text{O})\text{CH}_3$ または

【化 3】



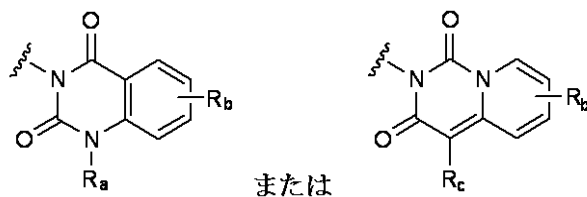
である]

の化合物またはその塩。

【請求項 2】

Q が、

【化 4】



または

である、請求項 1 記載の化合物またはその塩。

【請求項 3】

R_a が $-\text{CH}_3$ であり；

R_b が F 、 Cl または $-\text{OCH}_3$ であり；および

R_c が F である、

請求項 1 ~ 2 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

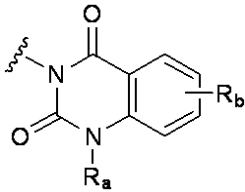
【請求項 4】

R_2 が $-\text{CH}_3$ である、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 5】

Q が、

【化 5】



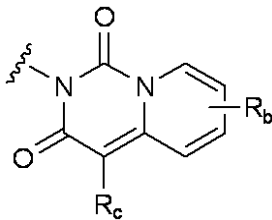
であり；および

R_1 が $C(CH_3)_2OH$ である、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

【請求項 6】

Q が、

【化 6】



であり；

R_2 が $-CH_3$ であり；および

R_3 が H である、請求項 1 ~ 4 のいずれかに記載の化合物またはその塩。

【請求項 7】

4 - (3 - (8 - フルオロ - 2, 4 - ジオキソ - 1, 2 - ジヒドロキナゾリン - 3 (4 H) - イル) - 2 - メチルフェニル) - 7 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボキサミド (1 および 2) ; 4 - (3 - (S) - (8 - フルオロ - 1 - メチル - 2, 4 - ジオキソ - 1, 2 - ジヒドロキナゾリン - 3 (4 H) - イル) - 2 - メチルフェニル) - 7 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボキサミド (3) ; 4 - (3 - (S) - (8 - フルオロ - 1 - メチル(d_3) - 2, 4 - ジオキソ - 1, 2 - ジヒドロキナゾリン - 3 (4 H) - イル) - 2 - メチルフェニル) - 7 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボキサミド (4) ; 4 - (2 - クロロ - 3 - (8 - フルオロ - 1 - メチル - 2, 4 - ジオキソ - 1, 2 - ジヒドロキナゾリン - 3 (4 H) - イル)フェニル) - 7 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボキサミド (5) ; 4 - (2 - クロロ - 3 - (1 - メチル - 2, 4 - ジオキソ - 1, 2 - ジヒドロキナゾリン - 3 (4 H) - イル)フェニル) - 7 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボキサミド (6) ; 7 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 4 - (3 - (8 - メトキシ - 1 - メチル - 2, 4 - ジオキソ - 1, 2 - ジヒドロキナゾリン - 3 (4 H) - イル) - 2 - メチルフェニル) - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボキサミド (7) ; 4 - (3 - (6 - フルオロ - 1 - メチル - 2, 4 - ジオキソ - 1, 2 - ジヒドロキナゾリン - 3 (4 H) - イル) - 2 - メチルフェニル) - 7 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボキサミド (8) ; 4 - (3 - (3 - (4 - フルオロフェニル) - 2, 6 - ジオキソ - 2, 3 - ジヒドロピリミジン - 1 (6 H) - イル) - 2 - メチルフェニル) - 7 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボキサミド (9) ; 7 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 4 - (3 - (7 - メトキシ - 1, 3 - ジオキソ - 1 H - ピリド [1, 2 - c] ピリミジン - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチルフェニル) - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボキサミド (10) ; 7 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 4 - (3 - (6 - メトキシ - 1, 3 - ジオキソ - 1 H - ピリド [1, 2 - c] ピリミジン - 2 (3 H) - イル) - 2 - メチルフェニル) - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボキサミド (11) ; 7 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 4 - (3 - (5 - メトキシ - 1, 3 - ジオキソ - 1 H - ピリド [1, 2 - c] ピリミジン - 2 (3 H

) - イル) - 2 - メチルフェニル) - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボキサミド(12); 4
 - (3 - (5 - クロロ - 1, 3 - ジオキソ - 1 H - ピリド[1, 2 - c]ピリミジン - 2(3
 H) - イル) - 2 - メチルフェニル) - 7 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 9 H -
 カルバゾール - 1 - カルボキサミド(13); 4 - (3 - (R) - (5 - クロロ - 1, 3 - ジオ
 キソ - 1 H - ピリド[1, 2 - c]ピリミジン - 2(3 H) - イル) - 2 - メチルフェニル)
 - 7 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボキサミド
 (14); 4 - (3 - (S) - (5 - クロロ - 1, 3 - ジオキソ - 1 H - ピリド[1, 2 - c]ピ
 リミジン - 2(3 H) - イル) - 2 - メチルフェニル) - 7 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2
 - イル) - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボキサミド(15); 4 - (3 - (5 - クロロ - 1,
 3 - ジオキソ - 1 H - ピリド[1, 2 - c]ピリミジン - 2(3 H) - イル) - 2 - メチルフ
 ェニル) - 7 - ピバルアミド - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボキサミド(16); 4 - (3
 - (5 - クロロ - 1, 3 - ジオキソ - 1 H - ピリド[1, 2 - c]ピリミジン - 2(3 H) -
 イル) - 2 - メチルフェニル) - 7 - (メトキシメチル) - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボ
 キサミド(17); 4 - (3 - (5 - フルオロ - 1, 3 - ジオキソ - 1 H - ピリド[1, 2 - c
]ピリミジン - 2(3 H) - イル) - 2 - メチルフェニル) - 7 - (メトキシメチル) - 9 H -
 カルバゾール - 1 - カルボキサミド(18); 4 - (3 - (4 - フルオロ - 1, 3 - ジオキソ
 - 1 H - ピリド[1, 2 - c]ピリミジン - 2(3 H) - イル) - 2 - メチルフェニル) - 7
 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボキサミド(1
 9); 4 - (3 - (5, 7 - ジオキソ - 5 H - チアゾール[3, 2 - c]ピリミジン - 6(7 H
) - イル) - 2 - メチルフェニル) - 7 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 9 H - カ
 ルバゾール - 1 - カルボキサミド(20); 4 - (3 - (5 - フルオロ - 1, 3 - ジオキソ -
 1 H - ピリド[1, 2 - c]ピリミジン - 2(3 H) - イル) - 2 - メチルフェニル) - 7 - (
 2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボキサミド(21)
 ; 4 - (3 - (5 - フルオロ - 1, 3 - ジオキソ - 1 H - ピリド[1, 2 - c]ピリミジン -
 2(3 H) - イル) - 2 - メチルフェニル) - 7 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 9
 H - カルバゾール - 1 - カルボキサミド(22および23); 4 - (3 - (S) - (8 - フルオ
 ロ - 1 - メチル - 2, 4 - ジオキソ - 1, 2 - ジヒドロキナゾリン - 3(4 H) - イル) - 2
 - メチルフェニル) - 7 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 5 - メチル - 9 H - カ
 ルバゾール - 1 - カルボキサミド(24); 4 - (3 - (8 - フルオロ - 1 - メチル - 2, 4
 - ジオキソ - 1, 2 - ジヒドロキナゾリン - 3(4 H) - イル) - 2 - メチルフェニル) - 7
 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 5 - メチル - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボ
 キサミド(25); 4 - (3 - (S) - (8 - フルオロ - 1 - メチル - 2, 4 - ジオキソ - 1, 2
 - ジヒドロキナゾリン - 3(4 H) - イル) - 2 - メチルフェニル) - 7 - (2 - ヒドロキシ
 プロパン - 2 - イル) - 8 - メチル - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボキサミド(26);
 4 - (3 - (S) - (8 - フルオロ - 1 - メチル(d₃) - 2, 4 - ジオキソ - 1, 2 - ジヒドロ
 キナゾリン - 3(4 H) - イル) - 2 - メチルフェニル) - 7 - (2 - ヒドロキシプロパン -
 2 - イル) - 5 - メチル - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボキサミド(27); 4 - (3 - (
 5 - フルオロ - 1, 3 - ジオキソ - 1 H - ピリド[1, 2 - c]ピリミジン - 2(3 H) - イ
 ル) - 2 - メチルフェニル) - 7 - (ヒドロキシメチル) - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボ
 キサミド(28); 7 - (ジメチルアミノ) - 4 - (3 - (5 - フルオロ - 1, 3 - ジオキソ -
 1 H - ピリド[1, 2 - c]ピリミジン - 2(3 H) - イル) - 2 - メチルフェニル) - 9 H
 - カルバゾール - 1 - カルボキサミド(29); 7 - (アセトアミドメチル) - 4 - (3 - (5
 - フルオロ - 1, 3 - ジオキソ - 1 H - ピリド[1, 2 - c]ピリミジン - 2(3 H) - イル)
) - 2 - メチルフェニル) - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボキサミド(30); 4 - (3 - (
 5 - クロロ - 1, 3 - ジオキソ - 1 H - ピリド[1, 2 - c]ピリミジン - 2(3 H) - イル)
) - 2 - メチルフェニル) - 7 - (ピロリジン - 1 - イルメチル) - 9 H - カルバゾール - 1
 - カルボキサミド(31); 4 - (3 - (5 - フルオロ - 1, 3 - ジオキソ - 1 H - ピリド[
 1, 2 - c]ピリミジン - 2(3 H) - イル) - 2 - メチルフェニル) - 7 - (メトキシメチル)
) - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボキサミド(32); 8 - フルオロ - 4 - (3 - (8 - フ
 ルオロ - 1 - メチル - 2, 4 - ジオキソ - 1, 2 - ジヒドロキナゾリン - 3(4 H) - イル)

- 2 - メチルフェニル) - 7 - (2 - ヒドロキシプロパン - 2 - イル) - 9 H - カルバゾール - 1 - カルボキサミド (3 3) ; およびその塩、から選択される、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 8】

請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容され得る塩、および医薬的に許容され得る担体を含む、医薬組成物。

【請求項 9】

自己免疫疾患または慢性の炎症性疾患を治療するための、請求項 8 記載の医薬組成物。

【請求項 10】

自己免疫疾患または慢性の炎症性疾患の治療のための医薬の製造における、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬的に許容され得る塩の使用。