

【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7月18日 (2013.7.18)

【公表番号】特表2012-528839(P2012-528839A)

【公表日】平成24年11月15日 (2012.11.15)

【年通号数】公開・登録公報2012-048

【出願番号】特願2012-513673(P2012-513673)

【国際特許分類】

C 0 7 D 217/24 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/06 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/4178 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/4725 (2006.01)

A 6 1 K 31/472 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 217/24

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 9/06

C 0 7 D 403/12 C S P

A 6 1 K 31/4178

C 0 7 D 401/12

A 6 1 K 31/4725

A 6 1 K 31/472

A 6 1 K 31/4439

【手続補正書】

【提出日】平成25年5月31日 (2013.5.31)

【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

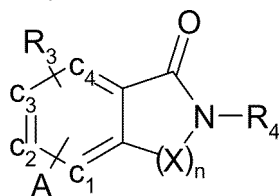
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) の化合物もしくはその塩またはこれらの製薬上許容されうる誘導体：

【化 1】

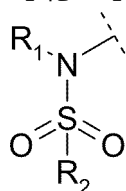


(I)

式中、

A は、一般式 (I I) で表される化学部分を表し；

【化 2】



(II)

式中、

X は、 CH_2 、 $\text{C}(=\text{O})$ 、 $\text{CH}(\text{R}_5)$ 、 $\text{C}(\text{R}_5)(\text{R}_6)$ または $\text{C}(\text{R}_5)(\text{R}_6)\text{CH}_2$ からなる群より選択され、

R_1 は、置換されていてもよいアリールアルキル、および置換されていてもよいヘテロアリールアルキルからなる群より選択され、

R_2 は、置換されていてもよいアリールもしくは置換されていてもよいヘテロアリールまたは NR_7R_8 からなる群から選択され、

R_3 は、水素、ハロゲン、ヒドロキシル、アルコキシ、アリールオキシ、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいアミノ、置換されていてもよいアミノスルホニルまたはニトリルからなる群から選択され、

R_4 は、水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいヘテロシクロアルキル、置換されていてもよいアシル、置換されていてもよいスルホニル、置換されていてもよいスルファモイル、置換されていてもよいアリール、置換されていてもよいアリールアルキル、および置換されていてもよいヘテロアリールからなる群から選択され、

R_5 および R_6 は、それぞれ置換されていてもよいアルキルであり、

R_7 および R_8 は、同一であるかまたは異なり、それぞれ水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいアリールアルキル、置換されていてもよいアリール、または置換されていてもよいヘテロアリールを表し、

n は、1 または 2 である。

【請求項 2】

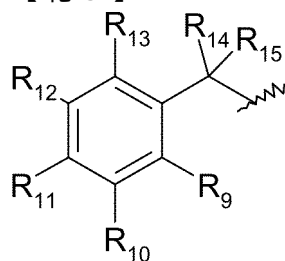
化学部分 A が、式 (I) の化合物の C_1 、 C_2 または C_3 に化学結合を介して結合し、X は CH_2 、 $\text{C}(=\text{O})$ または $\text{CR}_2\text{R}_3\text{CH}_2$ であり、

n は 1 または 2 である、請求項 1 に記載の化合物 もしくはその塩またはこれらの製薬上許容されうる誘導体。

【請求項 3】

R_1 が、式 (I I I) を含む、請求項 2 に記載の化合物 もしくはその塩またはこれらの製薬上許容されうる誘導体：

【化 3】



(III)

式中、

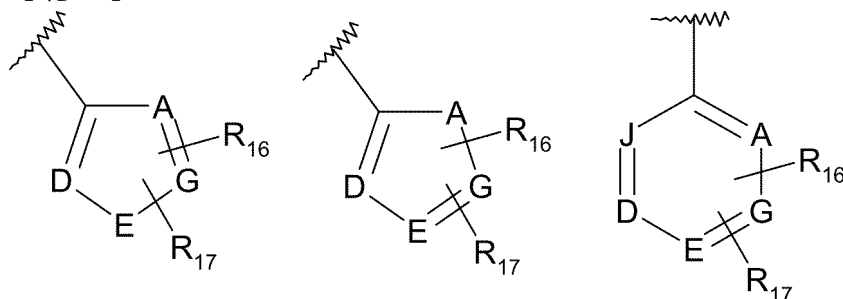
R_9 、 R_{10} 、 R_{11} 、 R_{12} および R_{13} は、同一であるかまたは異なり、それぞれ水素、ハロゲン、ヒドロキシル、置換されていてもよいアミノ、置換されていてもよいアシル、ニトリル、置換されていてもよい C_{1-3} アルキル、または置換されていてもよいアルコキシを表し、

R_{14} および R_{15} は、同一であるかまたは異なり、それぞれ水素、ヒドロキシル、および置換されていてもよい C_{1-3} アルキルを表す。

【請求項 4】

R_2 が、式 (IV)、式 (V) または式 (VI) から選択される、請求項 2 に記載の化合物もしくはその塩またはこれらの製薬上許容されうる誘導体：

【化 4】



(IV)

(V)

(VI)

式中、

A、D、E、G および J は、同一であるかまたは異なり、それぞれ C または N を表し (ただし、それぞれの場合において A、D、E、G または J の少なくとも 1 つは N である)

R_2 が式 (IV) の化合物から選択されるとき、E はさらに O または S であってもよく、

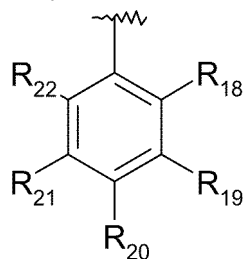
R_2 が式 (V) の化合物から選択されるとき、A はさらに O または S であってもよく、

R_{16} および R_{17} は、同一であるかまたは異なり、それぞれ水素、ハロゲン、ヒドロキシル、ニトリル、置換されていてもよいアミノ、置換されていてもよいアシル、置換されていてもよい C_{1-3} アルキル、置換されていてもよいアリールアルキル、置換されていてもよいアリールまたは置換されていてもよいヘテロアリールを表すか、あるいは、一緒になって置換されていてもよい飽和または部分飽和の 5 ~ 7 員のヘテロ環または炭素環を形成する。

【請求項 5】

R_2 が式 (VII) の化合物から選択された、請求項 2 に記載の化合物もしくはその塩またはこれらの製薬上許容されうる誘導体：

【化 5】



(VII)

式中、

R_{18} 、 R_{19} 、 R_{20} 、 R_{21} および R_{22} は、同一であるかまたは異なり、それぞれ水素、ハロゲン、ヒドロキシル、置換されていてもよいアミノ、置換されていてもよいアシル、ニトリル、置換されていてもよい C_{1-3} アルキルを表し、 R_{18} および R_{19} 、または R_{19} および R_{20} 、または R_{20} および R_{21} 、または R_{21} および R_{22} の対のいずれかが、一緒になって置換されていてもよい飽和または部分飽和の 5 ~ 7 員のヘテロ環または炭素環を形成してもよい。

【請求項 6】

R_3 は、H、F または CH_3 である、請求項 2 に記載の化合物もしくはその塩またはこれらの製薬上許容されうる誘導体。

【請求項 7】

R_4 は、水素、置換されていてもよいアルキル、置換されていてもよいシクロアルキル、置換されていてもよいヘテロシクロアルキル、置換されていてもよいアシル、置換されていてもよいアリールアルキル、および置換されていてもよいヘテロアリールからなる群から選択される、請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくはその塩またはこれらの製薬上許容されうる誘導体。

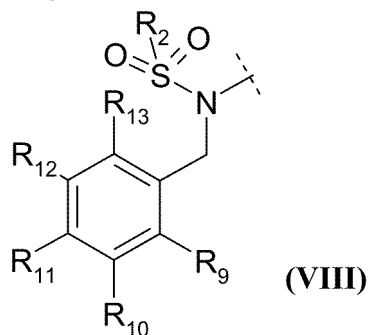
【請求項 8】

R_5 および R_6 は置換されていてもよいアルキルである、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくはその塩またはこれらの製薬上許容されうる誘導体。

【請求項 9】

A は式 (VII) の化学部分である、請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくはその塩またはこれらの製薬上許容されうる誘導体。

【化 6】



(VIII)

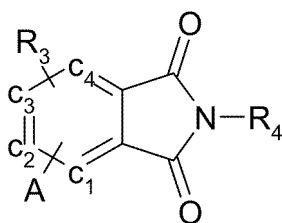
式中、

R_2 は式 (IV)、式 (V)、式 (VI) または式 (VII) の化合物から選択され、 R_9 、 R_{10} 、 R_{11} 、 R_{12} および R_{13} は上記で定義された通りである。

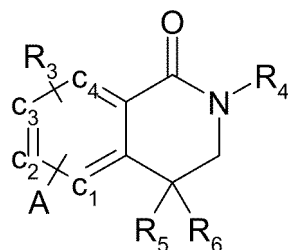
【請求項 10】

式 (I) は、式 (IX)、式 (X) または式 (XI) によって表される、請求項 1 ~ 9 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくはその塩またはこれらの製薬上許容されうる誘導体。

(IX)



(X)



(XI)

Aは式(VII I)の化学部分であり、R₃およびR₄は請求項6および請求項7でそれぞれ定義された通りである。

1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - スルホン酸 (4 - クロロ - ベンジル) - (2 - エチル - 1 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - イソキノリン - 7 - イル) - アミド
 ピリジン - 3 - スルホン酸 (4 - クロロ - ベンジル) - (2 - エチル - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 5 - イル) - アミド

N - (4 - クロロ - ベンジル) - 3 - シアノ - N - (1 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - イソキノリン - 7 - イル) - ベンゼンスルホンアミド

1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - スルホン酸 (4 - クロロ - ベンジル) - (2 - エチル - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 5 - イル) - アミド

ピリジン - 3 - スルホン酸 (4 - クロロ - ベンジル) - [2 - (2 - ヒドロキシ - エチル) - 1 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - イソキノリン - 7 - イル] - アミド

1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - スルホン酸 (4 - クロロ - ベンジル) - (2 - エチル - 4 , 4 - ジメチル 1 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - イソキノリン - 7 - イル) - アミド

1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - スルホン酸 (4 - クロロ - ベンジル) - (1 - オキ
ソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - イソキノリン - 7 - イル) - アミド

N - (4 - クロロ - ベンジル) - 3 - シアノ - N - (1 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - イソキノリン - 7 - イル) - ベンゼンスルホンアミド

1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - スルホン酸 (4 - クロロ - ベンジル) - (2 - メチル - 1 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - イソキノリン - 7 - イル) - アミド

1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - スルホン酸 (4 - クロロ - ベンジル) - [2 - (2 - ヒドロキシ - エチル) - 1 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - イソキノリン - 7 - イル] - アミド

N - (4 - クロロ - ベンジル) - 3 - シアノ - n - (2 - エチル - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 5 - イル) - ベンゼンスルホンアミド

N - (4 - クロロ - ベンジル) - 3 - シアノ - N - (2 - エチル - 1 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 5 - イル) ベンゼンスルホンアミド

ピリジン - 3 - スルホン酸 (4 - クロロ - ベンジル) - (1 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - イソキノリン - 7 - イル) - アミド

1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - スルホン酸 (4 - クロロ - ベンジル) - (2 - エチル - 3 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 5 - イル) - アミド

ピリジン - 3 - スルホン酸 (4 - クロロ - ベンジル) - (4 , 4 - ジメチル 1 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - イソキノリン - 7 - イル) - アミド

1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - スルホン酸 (4 - クロロ - ベンジル) - (4 , 4 - ジメチル 1 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - イソキノリン - 7 - イル) - アミド

1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - スルホン酸 (4 - クロロ - ベンジル) - (2 - イソプロピル - 1 , 3 - ジオキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 - H - イソインドール - 5 - イル

) - アミド

1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - スルホン酸 (4 - クロロ - ベンジル) - (2 - エチル - 1 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 5 - イル) - アミド

1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 3 - スルホン酸ベンジル (2 - エチル - 1 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - イソキノリン - 6 - イル) - アミド

1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - スルホン酸 (4 - クロロ - ベンジル) - (4 , 4 - ジメチル 1 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - イソキノリン - 7 - イル) - アミド

1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - スルホン酸 (4 - クロロ - ベンジル) - (2 - エチル - 1 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 4 - イル) - アミド

1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - スルホン酸 (4 - クロロ - ベンジル) - (2 - エチル - 1 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - 1 H - イソインドール - 5 - イル) - アミド

1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - スルホン酸ベンジル - (2 - エチル - 1 - オキソ - 1 , 2 , 3 , 4 - テトラヒドロ - イソキノリン - 6 - イル) - アミド

から選択される、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくはその塩またはこれらの製薬上許容されうる誘導体。

【請求項 12】

請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくはその塩またはこれらの製薬上許容されうる誘導体の少なくとも 1 つを含む、医薬組成物。

【請求項 13】

カリウムチャネルの障害を必要とする障害の予防または治療に用いるための、請求項 12 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

前記障害が、乾癬、関節リウマチ、多発性硬化症若しくは他の免疫学的障害、または不整脈である、請求項 13 に記載の医薬組成物。