

【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26年8月14日(2014.8.14)

【公表番号】特表2013-530239(P2013-530239A)

【公表日】平成25年7月25日(2013.7.25)

【年通号数】公開・登録公報2013-040

【出願番号】特願2013-518695(P2013-518695)

【国際特許分類】

C 07 D 417/14	(2006.01)
A 61 P 19/02	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 17/06	(2006.01)
A 61 P 37/02	(2006.01)
A 61 P 1/04	(2006.01)
A 61 P 27/02	(2006.01)
A 61 P 13/12	(2006.01)
A 61 P 17/00	(2006.01)
A 61 P 21/04	(2006.01)
A 61 P 7/06	(2006.01)
A 61 P 37/08	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)

【F I】

C 07 D 417/14	C S P
A 61 P 19/02	
A 61 P 29/00	1 0 1
A 61 P 25/00	
A 61 P 17/06	
A 61 P 29/00	
A 61 P 37/02	
A 61 P 1/04	
A 61 P 27/02	
A 61 P 13/12	
A 61 P 17/00	
A 61 P 21/04	
A 61 P 7/06	
A 61 P 37/08	
A 61 P 35/00	
A 61 K 31/5377	

【手続補正書】

【提出日】平成26年6月26日(2014.6.26)

【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

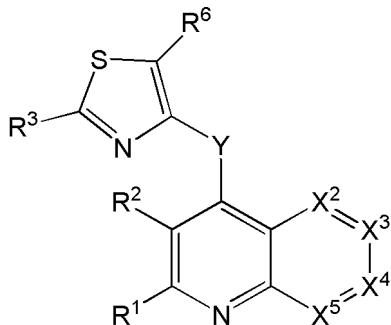
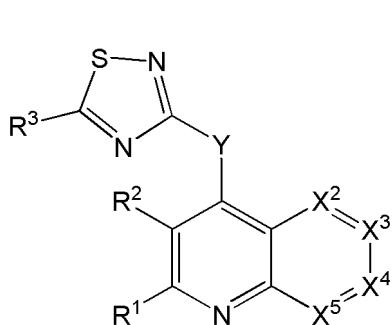
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記の構造：

〔化 1 〕



を有する化合物もしくは任意の医薬上許容可能なその塩であって、

「式中」

X^2 は $C(R^4)$ もしくは N であり；

X³ は C (R⁵) もしくは N であり ;

×⁴ は C (B⁵) もしくは N であり：

X^5 は $C(R^4)$ もしくは N であり；前記 X^2 、 X^3 、 X^4 および X^5 のうち 2 つより多くが N であることはなく；

YはNR⁷、CR^aR^a、SもしくはOであり：

これは0、1、2もしくは3であり：

R¹ は、H、ハロ、C_{1～6}アルキル、C_{1～4}ハロアルキル、シアノ、ニトロ、-C(=O)R^a、-C(=O)OR^a、-C(=O)NR^aR^a、-C(=NR^a)NR^aR^a、-OR^a、-OC(=O)R^a、-OC(=O)NR^aR^a、-OC(=O)NR^aR^a、-OC(=O)NR^aR^a、-SR^a、-S(=O)R^a、-S(=O)₂R^a、-S(=O)₂NR^aR^a、-S(=O)₂N(R^a)C(=O)R^a、-S(=O)₂N(R^a)C(=O)OR^a、-S(=O)₂N(R^a)C(=O)NR^aR^a、-NR^aR^a、-N(R^a)C(=O)NR^aR^a、-N(R^a)C(=O)OR^a、-N(R^a)C(=O)NR^aR^a、-N(R^a)S(=O)₂R^a、-N(R^a)S(=O)₂NR^aR^a、-NR^aC_{2～6}アルキルNR^aR^a、-NR^aC_{2～6}アルキルOR^a、-NR^aC_{2～6}アルキルCO₂R^a、-NR^aC_{2～6}アルキルSO₂R^b、-CH₂C(=O)R^a、-CH₂C(=O)OR^a、-CH₂C(=O)NR^aR^a、-CH₂C(=NR^a)NR^aR^a、-CH₂OR^a、-CH₂OC(=O)R^a、-CH₂OC(=O)NR^aR^a、-CH₂OC(=O)N(R^a)S(=O)₂R^a、-CH₂OC_{2～6}アルキルNR^aR^a、-CH₂OC_{2～6}アルキルOR^a、-CH₂SR^a、-CH₂S(=O)R^a、-CH₂S(=O)₂R^b、-CH₂S(=O)₂NR^aR^a、-CH₂S(=O)₂N(R^a)C(=O)R^a、-CH₂S(=O)₂N(R^a)C(=O)OR^a、-CH₂S(=O)₂N(R^a)C(=O)NR^aR^a、-CH₂NR^aR^a、-CH₂N(R^a)C(=O)R^a、-CH₂N(R^a)C(=O)OR^a、-CH₂N(R^a)C(=O)NR^aR^a、-CH₂N(R^a)S(=O)₂R^a、-CH₂N(R^a)S(=O)₂NR^aR^a、-CH₂NR^aC_{2～6}アルキルNR^aR^a、-CH₂NR^aC_{2～6}アルキルOR^a、-CH₂NR^aC_{2～6}アルキルCO₂R^aおよび-CH₂NR^aC_{2～6}アルキルSO₂R^bから選択されるか；またはR¹は、N、OおよびSから選択される0、1、2、3もしくは4個の原子を含むが、OもしくはS原子は1個より多く含むことはない、直接結合、C_{1～4}アルキル結合、OC_{1～2}アルキル結合、C_{1～2}アルキルO結合、N(R^a)結合もしくはO結合した飽和、部分飽和もしくは不飽和3、4、5、6もしくは7員单環または8、9、10もしくは11員二環であり、ハロ、C_{1～6}アルキル、C_{1～4}ハロアルキル、シアノ、ニトロ、-C(=O)R^a、-C(=O)OR^a、-C(=O)

NR^aR^a 、 $-\text{C}(=\text{NR}^a)\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{OR}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^a)\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}_{2\sim 6}\text{アルキルNR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}_{2\sim 6}\text{アルキルOR}^a$ 、 $-\text{SR}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(=\text{NR}^a)\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{N}(\text{R}^a)\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a$ 、 $-\text{N}(\text{R}^a)\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{C}_{2\sim 6}\text{アルキルNR}^a\text{R}^a$ および $-\text{NR}^a\text{C}_{2\sim 6}\text{アルキルOR}^a$ から独立して選択される0、1、2もしくは3個の置換基により置換され、前記環の利用可能な炭素原子は、追加的に0、1もしくは2個のオキソもしくはチオキソ基により置換され、前記環は、追加的にフェニル、ピリジル、ピリミジル、モルホリノ、ピペラジニル、ピペラジニル、ピロリジニル、シクロペンチル、シクロヘキシルから選択される0もしくは1個の直接結合、 SO_2 結合、 $\text{C}(=\text{O})$ 結合または CH_2 結合基により置換され、これらは全て、さらにハロ、 $\text{C}_{1\sim 6}$ アルキル、 $\text{C}_{1\sim 4}$ ハロアルキル、シアノ、ニトロ、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^a)\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{OR}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{SR}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{R}^a$ 、および $-\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ から選択される0、1、2もしくは3基により置換され；

R^2 は、ハロ、 $\text{C}_{1\sim 6}$ アルキル、 $\text{C}_{1\sim 4}$ ハロアルキル、シアノ、ニトロ、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^a)\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{OR}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^a)\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}_{2\sim 6}\text{アルキルNR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}_{2\sim 6}\text{アルキルOR}^a$ 、 $-\text{SR}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(=\text{NR}^a)\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{N}(\text{R}^a)\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a$ 、 $-\text{N}(\text{R}^a)\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{C}_{2\sim 6}\text{アルキルNR}^a\text{R}^a$ および $-\text{NR}^a\text{C}_{2\sim 6}\text{アルキルOR}^a$ から選択され；

R^3 は、N、OおよびSから選択される0、1、2、3もしくは4個の原子を含むが、OもしくはSは1個より多く含むことはない、飽和、部分飽和もしくは不飽和5、6もしくは7員单環または8、9、10もしくは11員二環から選択され、前記環の利用可能な炭素原子は、0、1もしくは2個のオキソもしくはチオキソ基により置換され、前記環は、0もしくは1個の R^2 置換基により置換され、環は、ハロ、 $\text{C}_{1\sim 6}$ アルキル、 $\text{C}_{1\sim 4}$ ハロアルキル、シアノ、ニトロ、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^a)\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{OR}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^a)\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}_{2\sim 6}\text{アルキルNR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}_{2\sim 6}\text{アルキルOR}^a$ 、 $-\text{SR}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{N}(\text{R}^a)\text{C}(=\text{NR}^a)\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{N}(\text{R}^a)\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a$ 、 $-\text{N}(\text{R}^a)\text{S}(=\text{O})_2\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{NR}^a\text{C}_{2\sim 6}\text{アルキルNR}^a\text{R}^a$ および $-\text{NR}^a\text{C}_{2\sim 6}\text{アルキルOR}^a$ から独立して選択される0、1、2もしくは3個の置換基によりさらに置換されるか；または R^3 は、ハロ、 $\text{C}_{1\sim 6}$ アルキル、 $\text{C}_{1\sim 4}$ ハロアルキル、シアノ、ニトロ、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{C}(=\text{NR}^a)\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{OR}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{NR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}(=\text{O})\text{N}(\text{R}^a)\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}_{2\sim 6}\text{アルキルNR}^a\text{R}^a$ 、 $-\text{OC}_{2\sim 6}\text{アルキルOR}^a$ 、 $-\text{SR}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})\text{R}^a$ 、 $-\text{S}(=\text{O})_2\text{R}^a$

O)₂ R^a 、- $S(=O)$ ₂ NR^aR^a 、- $S(=O)$ ₂ $N(R^a)C(=O)R^a$ 、- $S(=O)$ ₂ $N(R^a)C(=O)OR^a$ 、- $S(=O)$ ₂ $N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、- NR^aR^a 、- $N(R^a)C(=O)R^a$ 、- $N(R^a)C(=O)OR^a$ 、- $N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、- $N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、- $N(R^a)S(=O)R^a$ 、- $N(R^a)S(=O)NR^aR^a$ 、- $NR^aC_{2~6}$ アルキル NR^aR^a および- $NR^aC_{2~6}$ アルキル OR^a から選択され；

R^4 は、各場合において、独立して、 H 、ハロ、ニトロ、シアノ、 $C_{1~4}$ アルキル、 $OC_{1~4}$ アルキル、 $OC_{1~4}$ ハロアルキル、 $NHC_{1~4}$ アルキル、 $N(C_{1~4})$ アルキル、 $C(=O)N(C_{1~4})$ アルキル、 $C(=O)NH_2$ 、 $C(=O)NHC_{1~4}$ アルキル、 $C(=O)N(C_{1~4})$ アルキル、 $N(H)C(=O)C_{1~4}$ アルキル、 $N(C_{1~4})$ アルキル、 $N(C_{1~4})C(=O)C_{1~4}$ アルキル、 $C_{1~4}$ ハロアルキルであり、または N 、 O および S から選択される 0 、 1 、 2 、 3 もしくは 4 個の原子を含むが、 O もしくは S は 1 個より多く含むことはない、不飽和 5 、 6 もしくは 7 員単環であり、ハロ、 $C_{1~4}$ アルキル、 $C_{1~3}$ ハロアルキル、- $OC_{1~4}$ アルキル、- NH_2 、- $NHC_{1~4}$ アルキル、- $N(C_{1~4})$ アルキルから選択される 0 、 1 、 2 もしくは 3 個の置換基により置換され；

R^5 は、各場合において、独立して、 H 、ハロ、ニトロ、シアノ、 $C_{1~4}$ アルキル、 $OC_{1~4}$ アルキル、 $OC_{1~4}$ ハロアルキル、 $NHC_{1~4}$ アルキル、 $N(C_{1~4})$ アルキル、 $C_{1~4}$ アルキルもしくは $C_{1~4}$ ハロアルキルであり；

R^6 は、 N 、 O および S から選択される 0 、 1 、 2 、 3 もしくは 4 個の原子を含むが、 O もしくは S は 1 個より多く含むことはない、飽和、部分飽和もしくは不飽和 5 、 6 もしくは 7 員単環または 8 、 9 、 10 もしくは 11 員二環から選択され、前記環の利用可能な炭素原子は、 0 、 1 もしくは 2 個のオキソもしくはチオキソ基により置換され、前記環は、 0 もしくは 1 個の R^2 置換基により置換され、環は、ハロ、 $C_{1~6}$ アルキル、 $C_{1~4}$ ハロアルキル、シアノ、ニトロ、- $C(=O)R^a$ 、- $C(=O)OR^a$ 、- $C(=O)NR^aR^a$ 、- $C(=NR^a)NR^aR^a$ 、- OR^a 、- $OC(=O)R^a$ 、- $OC(=O)NR^aR^a$ 、- $OC(=O)N(R^a)S(=O)R^a$ 、- $OC_{2~6}$ アルキル NR^aR^a 、- $OC_{2~6}$ アルキル OR^a 、- SR^a 、- $S(=O)R^a$ 、- $S(=O)R^a$ 、- $S(=O)N(R^a)C(=O)OR^a$ 、- $S(=O)N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、- NR^aR^a 、- $N(R^a)C(=O)R^a$ 、- $N(R^a)C(=O)OR^a$ 、- $N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、- $N(R^a)C(=NR^a)NR^aR^a$ 、- $N(R^a)S(=O)R^a$ 、- $N(R^a)S(=O)NR^aR^a$ 、- $NR^aC_{2~6}$ アルキル NR^aR^a および- $NR^aC_{2~6}$ アルキル OR^a から独立して選択される 0 、 1 、 2 もしくは 3 個の置換基によりさらに置換されるか；または R^6 は、 H 、ハロ、 $C_{1~6}$ アルキル、 $C_{1~4}$ ハロアルキル、シアノ、ニトロ、- $C(=O)R^a$ 、- $C(=O)OR^a$ 、- $C(=O)NR^aR^a$ 、- $C(=NR^a)NR^aR^a$ 、- OR^a 、- $OC(=O)R^a$ 、- $OC(=O)NR^aR^a$ 、- $OC(=O)N(R^a)S(=O)R^a$ 、- $OC_{2~6}$ アルキル NR^aR^a 、- $OC_{2~6}$ アルキル OR^a 、- SR^a 、- $S(=O)R^a$ 、- $S(=O)R^a$ 、- $S(=O)N(R^a)C(=O)R^a$ 、- $S(=O)N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、- NR^aR^a 、- $N(R^a)C(=O)R^a$ 、- $N(R^a)C(=O)OR^a$ 、- $N(R^a)C(=O)NR^aR^a$ 、- $N(R^a)C(=NR^a)NR^aR^a$ 、- $N(R^a)S(=O)R^a$ 、- $N(R^a)S(=O)NR^aR^a$ 、- $NR^aC_{2~6}$ アルキル NR^aR^a および- $NR^aC_{2~6}$ アルキル OR^a から選択され；

R^7 は、 H 、 $C_{1~6}$ アルキル、- $C(=O)N(R^a)R^a$ 、- $C(=O)R^b$ もしくは $C_{1~4}$ ハロアルキルであり；

R^a は、各場合で、独立して、 H もしくは R^b であり；並びに

R^b は、各場合で、独立して、フェニル、ベンジルもしくは $C_{1~6}$ アルキルであり、フェニル、ベンジルおよび $C_{1~6}$ アルキルは、ハロ、 $C_{1~4}$ アルキル、 $C_{1~3}$ ハロ

アルキル、-O-C₁~₄アルキル、-NH₂、-NHC₁~₄アルキル、-N(C₁~₄アルキル)C₁~₄アルキルから選択される0、1、2もしくは3個の置換基により置換されている]

化合物もしくは任意の医薬上許容可能なその塩。

【請求項2】

請求項1に記載の化合物と、医薬上許容可能な希釈液もしくは担体と、を含む医薬組成物。

【請求項3】

関節リウマチ、強直性脊椎炎、骨関節炎、乾癬性関節炎、乾癬、炎症疾患および自己免疫疾患、炎症腸障害、炎症眼障害、炎症もしくは不安定膀胱障害、炎症成分を伴う皮膚病、慢性炎症状態、自己免疫疾患、全身性紅斑性狼瘡(SLE)、重症筋無力症、関節リウマチ、急性播種性脳脊髄炎、特発性血小板減少性紫斑病、多発性硬化症、シェーグレン症候群および自己免疫溶血性貧血、アレルギー性状態並びに過敏症を治療するための、請求項2に記載の医薬組成物。

【請求項4】

p110 活性が媒介する、p110 活性に依存するまたはp110 活性に関連する癌を治療するための、請求項2に記載の医薬組成物。