

【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12月18日(2014.12.18)

【公表番号】特表2014-503527(P2014-503527A)

【公表日】平成26年2月13日(2014.2.13)

【年通号数】公開・登録公報2014-008

【出願番号】特願2013-543879(P2013-543879)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/4192 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 31/53 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 K 31/428 (2006.01)

A 6 1 K 31/404 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

A 6 1 K 31/5025 (2006.01)

A 6 1 K 31/423 (2006.01)

A 6 1 K 31/416 (2006.01)

A 6 1 K 31/4184 (2006.01)

A 6 1 K 31/4725 (2006.01)

A 6 1 K 31/4245 (2006.01)

A 6 1 K 31/36 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

A 6 1 K 31/497 (2006.01)

A 6 1 K 31/502 (2006.01)

A 6 1 K 31/343 (2006.01)

A 6 1 K 31/433 (2006.01)

A 6 1 K 31/4436 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/427 (2006.01)

A 6 1 K 31/4196 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/4985 (2006.01)

A 6 1 K 31/4178 (2006.01)

A 6 1 K 31/381 (2006.01)

A 6 1 K 31/4188 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 31/549 (2006.01)

A 6 1 K 31/422 (2006.01)

A 6 1 K 31/397 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

【 F I 】

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/4192

A 6 1 K 31/519  
A 6 1 K 31/53  
A 6 1 K 31/437  
A 6 1 K 31/55  
A 6 1 K 31/428  
A 6 1 K 31/404  
A 6 1 K 31/517  
A 6 1 K 31/5025  
A 6 1 K 31/423  
A 6 1 K 31/416  
A 6 1 K 31/4184  
A 6 1 K 31/4725  
A 6 1 K 31/4245  
A 6 1 K 31/36  
A 6 1 K 31/4709  
A 6 1 K 31/497  
A 6 1 K 31/502  
A 6 1 K 31/343  
A 6 1 K 31/433  
A 6 1 K 31/4436  
A 6 1 K 31/5377  
A 6 1 K 31/427  
A 6 1 K 31/4196  
A 6 1 K 31/506  
A 6 1 K 31/4985  
A 6 1 K 31/4178  
A 6 1 K 31/381  
A 6 1 K 31/4188  
A 6 1 K 31/444  
A 6 1 K 31/549  
A 6 1 K 31/422  
A 6 1 K 31/397  
A 6 1 P 43/00 1 1 1  
A 6 1 P 25/28  
A 6 1 P 25/16  
A 6 1 P 25/00

【手続補正書】

【提出日】平成26年10月24日(2014.10.24)

【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】

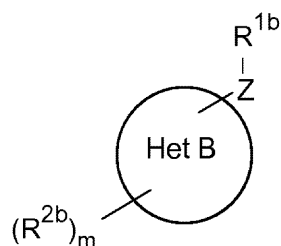
【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(1B)の化合物又はその医薬として許容し得る塩若しくは溶媒和物を含む、医薬組成物

:

## 【化 1】



(IB)

(式中、

「Het B」は、インドリル、又はインドリジニルを表し；

$R^{1b}$ は、アリール、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、単環式若しくは二環式ヘテロシクリル、又は単環式若しくは二環式ヘテロアリール環系を表し、式中、 $R^{1b}$ は、1個以上の(例えば、1、2、又は3個の) $R^{4b}$ 基により置換されていてよく；

$R^{4b}$ は、ハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルケニル、 $C_{1-6}$ アルキニル、 $C_{3-8}$ シクロアルキル、ハロ $C_{1-6}$ アルキル、ヒドロキシル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $-O-C_{1-6}$ アルケニル、ハロ $C_{1-6}$ アルコキシ、 $-COOH$ 、 $-CO-C_{1-6}$ アルキル、 $-COO-C_{1-6}$ アルキル、 $-CONH_2$ 、 $-CH_2-CONH_2$ 、 $-NH-C_{1-6}$ アルキル、 $-NH-C_{2-6}$ アルケニル、 $-NH-CO-C_{1-6}$ アルキル、 $-CO-NH-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-CH_2-CO-NH-C_{1-6}$ アルキル、 $-CH_2-CH_2-CO-NH-C_{1-6}$ アルキル、 $-S-C_{1-6}$ アルキル、 $-SO-C_{1-6}$ アルキル、 $-SO_2-C_{1-6}$ アルキル、 $-SO_2-NH_2-$ 、 $-SO_2-NH-C_{1-6}$ アルキル、 $-S-CH_2-CO-C_{2-6}$ アルケニル、 $-SO_2-OH$ 、アミノ、シアノ、 $NO_2$ 、 $=O$ 、 $-CO-NH-(CH_2)_2-OMe$ 、 $-NH-C_{3-8}$ シクロアルキル、 $-CH_2-CO-NH-C_{3-8}$ シクロアルキル、 $-CO-$ ヘテロシクリル、 $-CO-$ ヘテロアリール、 $-COO-(CH_2)_2-$ ヘテロシクリル、 $-CH_2-$ アリール、 $-OCH_2-$ アリール、 $-OCH_2-$ ヘテロアリール、 $-CH_2-O-CO-$ アリール、 $-O-$ アリール、 $-NH-CO-$ アリール、 $-NH-CO-$ ヘテロアリール、 $-NH-CO-CH_2-$ アリール、 $-NH-$ アリール、アリール、又はヘテロアリール基を表し、式中、 $R^{4b}$ の前記アリール、ヘテロシクリル、又はヘテロアリール基は、1個以上のハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $=S$ 、又はヒドロキシル基により任意に置換されていてよく、式中、 $R^{4b}$ の前記 $C_{1-6}$ アルキル又は $C_{2-6}$ アルケニル基は、1個以上のヒドロキシル、アミノ、シアノ、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $CONH_2$ 、又は $-COO-C_{1-6}$ アルキル基により任意に置換されていてよく；

$m$ は、2を表し；

$R^{2b}$ は、アミノ、又は $-CONH_2$ を表す。 )。

## 【請求項 2】

$R^{1b}$ が、単環式アリール又はヘテロアリール環系を表し、式中、 $R^{1b}$ が、1個以上の(例えば、1、2、又は3個の) $R^{4b}$ 基により置換されていてよい、請求項 1 記載の医薬組成物。

## 【請求項 3】

$R^{1b}$ が、1個以上の(例えば、1個の) $R^{4b}$ 基により任意に置換されているフェニルなどの単環式アリール基、又は1個以上の(例えば、1又は2個の) $R^{4b}$ 基により任意に置換されているチエニル、ピリミジニル、又はピラゾリニルなどの単環式ヘテロアリール基を表す、請求項 2 記載の医薬組成物。

## 【請求項 4】

$R^{1b}$ が、1個以上の(例えば、1個の) $R^{4b}$ 基により任意に置換されているフェニルを表す、請求項 3 記載の医薬組成物。

## 【請求項 5】

$R^{4b}$ が、ハロゲン、ヒドロキシル、 $-O-C_{1-6}$ アルケニル、 $-COO-C_{1-6}$ アルキル、 $-NH-C_{1-6}$ アルキル、 $-SO_2-NH_2$ 、アミノ、シアノ、 $=O$ 、 $-CH_2-CO-NH-C_{3-8}$ シクロアルキル、 $-CH_2-$ アリール、 $-OCH_2-$ ヘテロアリール、 $-O-$ アリール、 $-NH-CO-$ アリール、 $-NH-$ アリール、又はヘテロアリール基を表し、式中、 $R^{4b}$ の前記アリール、ヘテロシクリル、又はヘテロアリール基が、1個以上のハロゲン、 $C_{1-6}$ アルキル、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $=S$ 、又はヒドロキシル基に

より任意に置換されていてよく、式中、 $R^{4b}$ の前記 $C_{1-6}$ アルキル又は $C_{2-6}$ アルケニル基が、1個以上のヒドロキシル、アミノ、シアノ、 $C_{1-6}$ アルコキシ、 $CONH_2$ 、又は $-COO-C_{1-6}$ アルキル基により任意に置換されていてよい、請求項1～4のいずれか一項記載の医薬組成物。

【請求項6】

$R^{4b}$ が、ハロゲン(例えば、フッ素)、アミノ、又はヘテロアリール(例えば、ピリジル)を表す、請求項5記載の医薬組成物。

【請求項7】

$R^{4b}$ が、ハロゲン(例えば、フッ素)を表す、請求項6記載の医薬組成物。

【請求項8】

式(1B)の化合物が、本明細書に記載される化合物：847、987、990若しくは999のいずれか又はその医薬として許容し得る塩若しくは溶媒和物から選択される、請求項1記載の医薬組成物。

【請求項9】

式(1B)の化合物が、2-アミノ-3-[(4-フルオロフェニル)カルボニル]インドリジン-1-カルボキサミド(化合物987);及び、2-アミノ-1-[(4-フルオロフェニル)カルボニル]-1H-インドール-3-カルボキサミド(化合物999);のいずれか又はその医薬として許容し得る塩若しくは溶媒和物から選択される、請求項8記載の医薬組成物。

【請求項10】

式(1B)の化合物が、2-アミノ-3-[(4-フルオロフェニル)カルボニル]インドリジン-1-カルボキサミド(化合物987)又はその医薬として許容し得る塩若しくは溶媒和物から選択される、請求項8又は9記載の医薬組成物。

【請求項11】

療法に使用するための、請求項1～10のいずれか一項記載の式(1B)の化合物。

【請求項12】

タウオパチーなどの神経変性疾患の治療におけるカゼインキナーゼDELTA(CK1)阻害剤として使用するための、請求項1～10のいずれか一項記載の式(1B)の化合物。

【請求項13】

前記タウオパチーが、アルツハイマー病、第17番染色体に連鎖しパーキンソニズムを伴う前頭側頭型認知症(FTDP-17)、進行性核上性麻痺(PSP)、ピック病、大脳皮質基底核変性症、多系統萎縮症(MSA)、鉄蓄積を伴う神経基底変性、1型(ハレルフォルデン・スパッツ)、嗜銀顆粒性認知症、ダウン症候群、石灰化を伴うびまん性神経原線維変化病、ボクサー認知症、ゲルストマン・シュトロイスラー・シャインカー病、筋強直性ジストロフィー、ニーマンピック病C型、進行性皮質下グリオーシス、プリオンタンパク質脳アミロイドアンギオパチー、神経原線維変化型認知症、脳炎後パーキンソニズム、亜急性硬化性全脳炎、クロイツフェルト・ヤコブ病、筋萎縮性側索硬化症/パーキンソン認知症複合、神経原線維変化/認知症を伴う非グアム型運動ニューロン疾患、及びパーキンソン病から選択される、請求項12記載の化合物。

【請求項14】

前記タウオパチーがアルツハイマー病を含む、請求項12又は13記載の化合物。