

【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11月16日(2017.11.16)

【公表番号】特表2016-518430(P2016-518430A)

【公表日】平成28年6月23日(2016.6.23)

【年通号数】公開・登録公報2016-038

【出願番号】特願2016-513359(P2016-513359)

【国際特許分類】

C 07 D 401/12 (2006.01)
A 61 P 43/00 (2006.01)
A 61 P 29/00 (2006.01)
C 07 D 209/52 (2006.01)
A 61 K 31/403 (2006.01)
C 07 D 405/12 (2006.01)
A 61 K 31/4184 (2006.01)
A 61 K 31/4439 (2006.01)
C 07 D 471/04 (2006.01)
A 61 K 31/437 (2006.01)
A 61 K 31/4709 (2006.01)
A 61 K 31/4725 (2006.01)
C 07 D 417/12 (2006.01)
A 61 K 31/427 (2006.01)
C 07 D 403/12 (2006.01)
A 61 K 31/497 (2006.01)
C 07 D 487/04 (2006.01)
A 61 K 31/5025 (2006.01)
A 61 K 31/416 (2006.01)
C 07 D 413/12 (2006.01)
A 61 K 31/422 (2006.01)
A 61 K 31/501 (2006.01)
A 61 K 31/4155 (2006.01)
A 61 K 31/423 (2006.01)
A 61 K 31/506 (2006.01)
A 61 K 31/519 (2006.01)
A 61 K 31/502 (2006.01)
A 61 K 31/4375 (2006.01)
C 07 D 513/04 (2006.01)
A 61 K 31/429 (2006.01)
A 61 K 31/517 (2006.01)
C 07 D 405/14 (2006.01)

【F I】

C 07 D 401/12
A 61 P 43/00 1 1 1
A 61 P 29/00
C 07 D 209/52 C S P
A 61 K 31/403
C 07 D 405/12
A 61 K 31/4184
A 61 K 31/4439

C 0 7 D	471/04	1 0 8 A
A 6 1 K	31/437	
A 6 1 K	31/4709	
A 6 1 K	31/4725	
C 0 7 D	417/12	
A 6 1 K	31/427	
C 0 7 D	403/12	
C 0 7 D	471/04	1 0 8 X
C 0 7 D	471/04	1 0 6 C
C 0 7 D	471/04	1 0 6 Z
A 6 1 K	31/497	
C 0 7 D	487/04	1 4 4
A 6 1 K	31/5025	
A 6 1 K	31/416	
C 0 7 D	413/12	
A 6 1 K	31/422	
A 6 1 K	31/501	
A 6 1 K	31/4155	
A 6 1 K	31/423	
A 6 1 K	31/506	
A 6 1 K	31/519	
A 6 1 K	31/502	
C 0 7 D	471/04	1 1 3
A 6 1 K	31/4375	
C 0 7 D	513/04	3 3 1
A 6 1 K	31/429	
C 0 7 D	471/04	1 0 4 A
A 6 1 K	31/517	
C 0 7 D	405/14	
C 0 7 D	471/04	1 0 1
C 0 7 D	471/04	1 0 6 A

【手続補正書】

【提出日】平成29年10月5日(2017.10.5)

【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

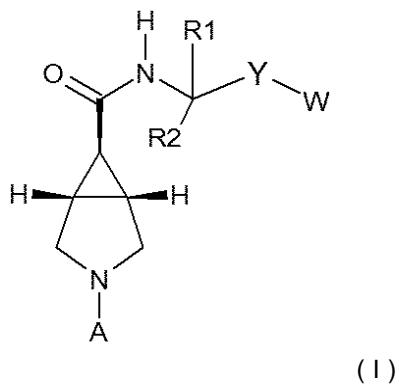
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記式(1)

【化1】



(式中、

Aは、H及びC₁₋₆-アルキルから成る群より選択され；

R¹及びR²は、H、C₁₋₆-アルキル及びC₃₋₆-シクロアルキルから成る群より独立に選択され、R¹又はR²の少なくとも一方はC₁₋₆-アルキル又はC₃₋₆-シクロアルキルであり、

前記C₁₋₆-アルキル又はC₃₋₆-シクロアルキルは任意にハロゲン又はMeO-で置換されていてもよく、或いは

R¹とR²が一緒に、N、O及びSから成る群より独立に選択される0~2個のヘテロ原子を組み入れた、任意にハロゲンで置換されていてもよい2~5員アルキレン架橋を形成しており；Wは、単環式又は二環式アリール、単環式又は二環式ヘテロアリール、単環式又は二環式ヘテロシクリル及び単環式又は二環式シクロアルキルから成る群より選択され、

これらの各環系は、任意に1つ以上のR³で置換されていてもよく、かつ

前記ヘテロアリールは、4個までのヘテロ原子及び1又は2個の5又は6員環を含み；

R³は、C₁₋₆-アルキル、C₃₋₈-シクロアルキル、C₁₋₆-アルキル-O-、ベンジル、ハロゲン、HO-、NC-、単環式又は二環式ヘテロアリール、及びN、O又はS(O)_rから成る群より選択される1個のヘテロ原子を含有する5又は6員単環式ヘテロシクリル（前記ヘテロアリールは、4個までのヘテロ原子及び1又は2個の5又は6員環を含み、rは0、1又は2である）から成る群より独立に選択され、

前記C₁₋₆-アルキル、C₃₋₈-シクロアルキル、C₁₋₆-アルキル-O-、ベンジル、ヘテロアリール及びヘテロシクリルは、任意にハロゲン、HO-、アセチル、C₁₋₆-アルキル-O-、オキソ、R⁴-S(O)₂-で置換されていてもよく、R⁴はアリール、C₃₋₆-シクロアルキル及び/又はC₁₋₆-アルキルであり；

Yは、結合、-CH₂-、-CH₂CH₂-、及び-CH₂O-から成る群より選択される)

の化合物、

又は前記化合物のいずれかの塩。

【請求項2】

AがHである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

Wが、単環式又は二環式アリール、単環式又は二環式ヘテロアリール及び単環式又は二環式ヘテロシクリルから成る群より選択され、

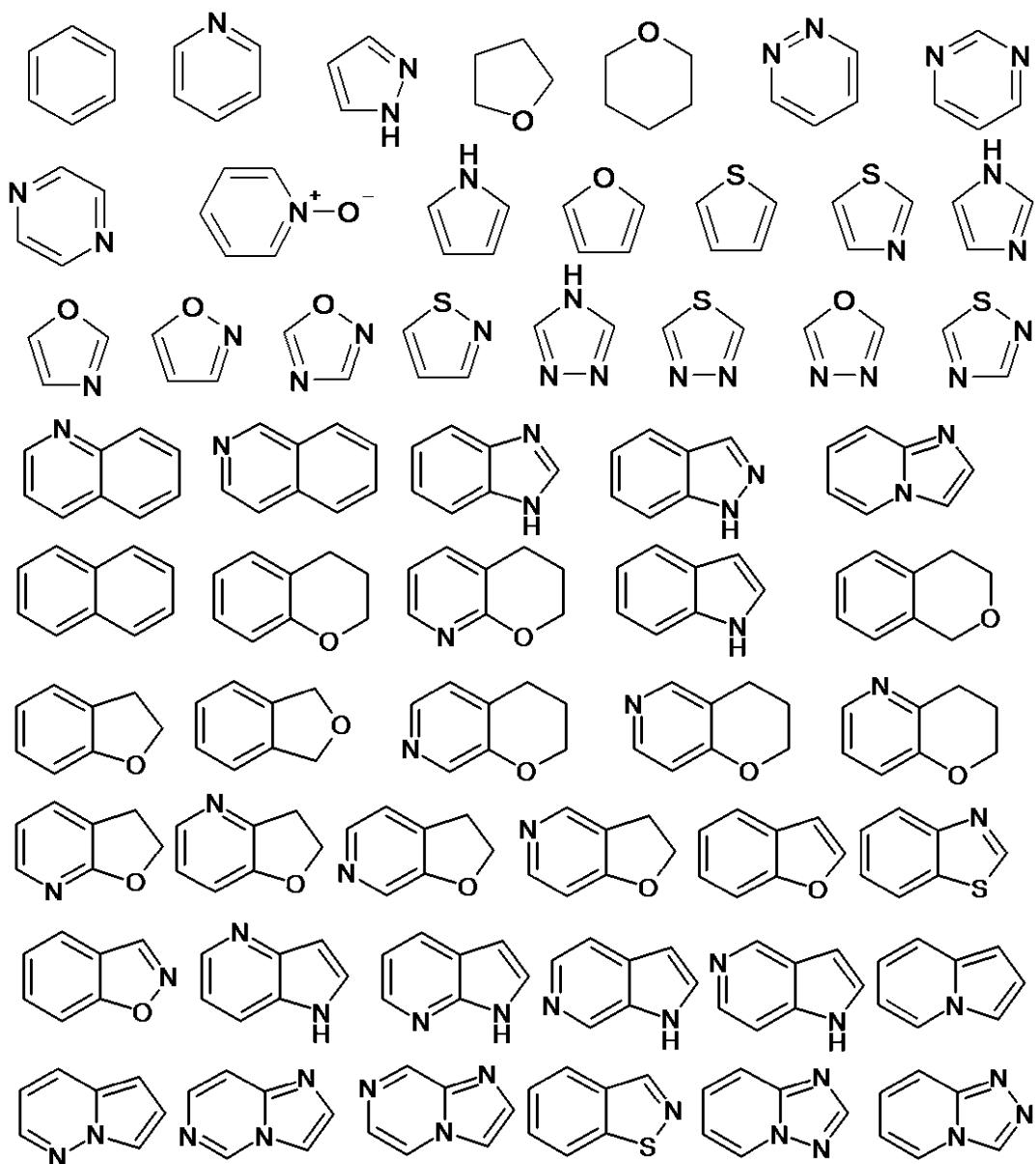
これらの各環系は、任意に1つ以上のR³で置換されていてもよく、かつ前記ヘテロアリールは、4個までのヘテロ原子及び1又は2個の5又は6員環を含む、

請求項1又は2に記載の化合物。

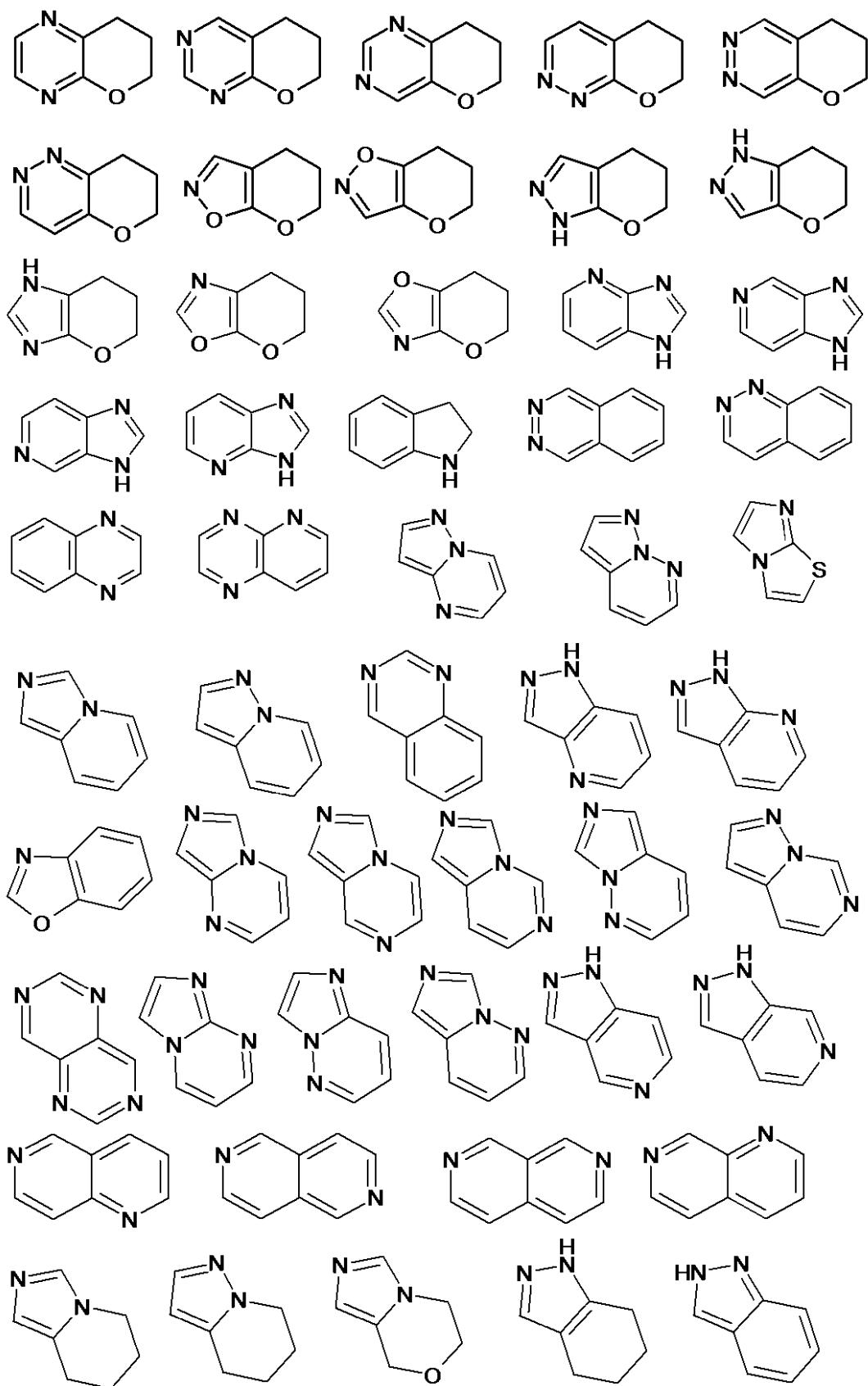
【請求項4】

Wが、下記

【化 2】



【化 3】

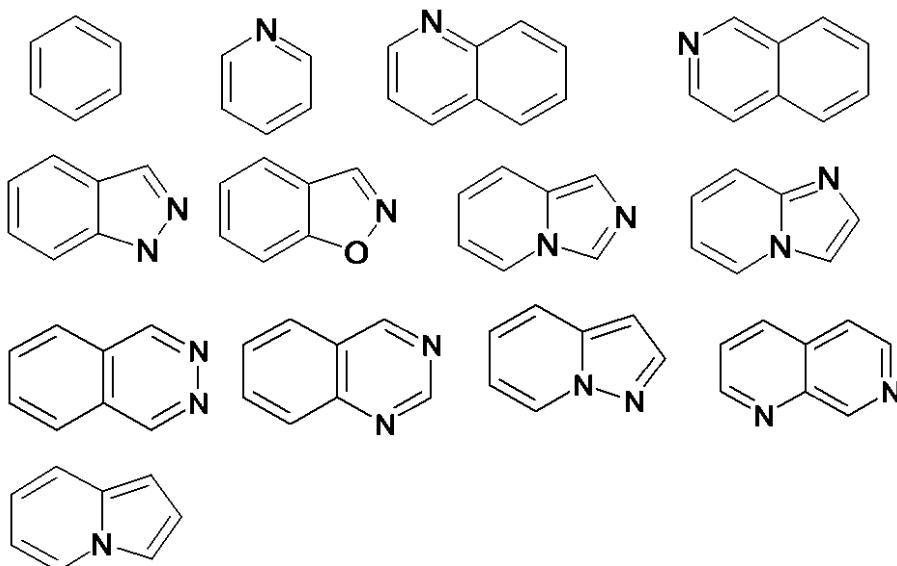


(これらの各環系は、任意に1つ以上のR³で置換されていてもよい)から成る群より選択される、請求項1又は2に記載の化合物。

【請求項5】

Wが、下記

【化4】

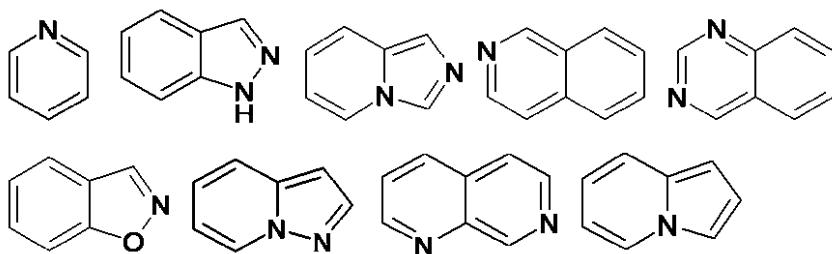


(これらの各環系は、任意に1つ以上のR³で置換されていてもよい)
から成る群より選択される、請求項1又は2に記載の化合物。

【請求項6】

Wが、下記

【化5】



(これらの各環系は、任意に1つ以上のR³で置換されていてもよい)
から成る群より選択される、請求項1又は2に記載の化合物。

【請求項7】

R³が、C_{1~3}-アルキル、C_{3~6}-シクロアルキル、C_{1~3}-アルキル-O-、ハロゲン、及びNC-から成る群より選択され、

R³がWのN原子に結合している場合、R³は、C_{1~3}-アルキル及びC_{3~6}-シクロアルキルから成る群より選択され、前記C_{1~3}-アルキル、C_{3~6}-シクロアルキル及びC_{1~3}-アルキル-O-置換基は、任意にハロゲンで置換されていてもよい、

請求項1~6のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項8】

R³が、H₃C-、F-及びF₃C-から成る群より選択され、

R³がWのN原子に結合している場合、R³はH₃C-である、

請求項1~6のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項9】

R¹及びR²が、H及び任意にハロゲンで置換されていてもよいC_{1~3}-アルキルから成る群より独立に選択され、R¹又はR²の少なくとも一方は独立に、任意にハロゲンで置換されていてもよいC_{1~3}-アルキルであり、或いはR¹とR²が一緒に、N、O又はSから成る群より独立に選択される0~2個のヘテロ原子を組み入れた、任意にハロゲンで置換されていてもよい2~5員アルキレン架橋を形成している、

請求項1~8のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項 10】

R^1 と R^2 が両方とも H_3C - である、請求項1～8のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項 11】

Y が、結合、 $-CH_2CH_2-$ 及び $-CH_2O-$ から成る群より選択される、請求項1～10のいずれか1項に記載の化合物。

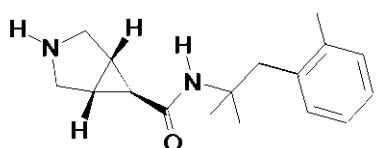
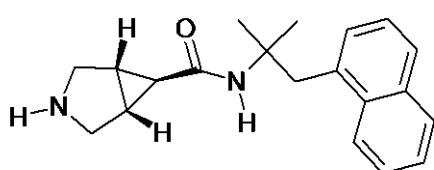
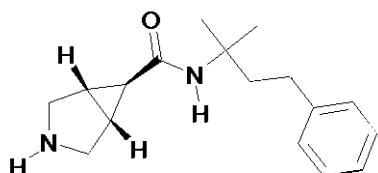
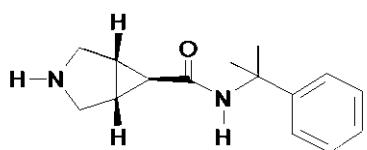
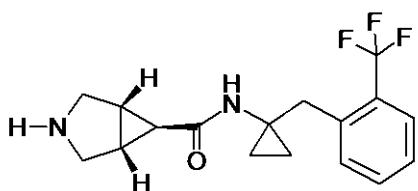
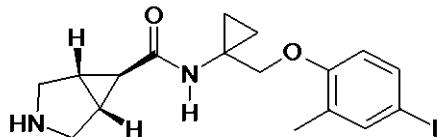
【請求項 12】

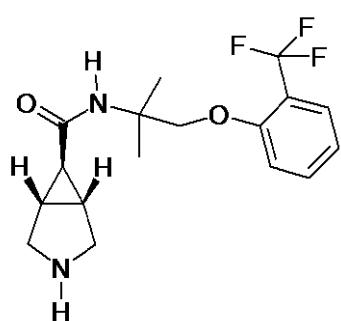
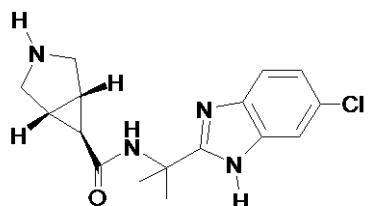
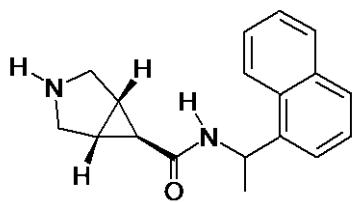
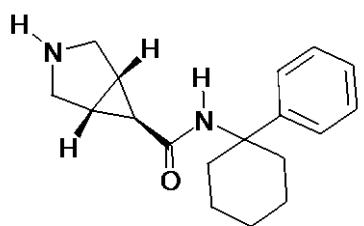
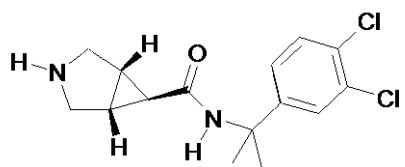
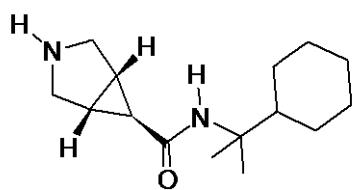
Y が、結合及び $-CH_2O-$ から成る群より選択される、請求項1～10のいずれか1項に記載の化合物。

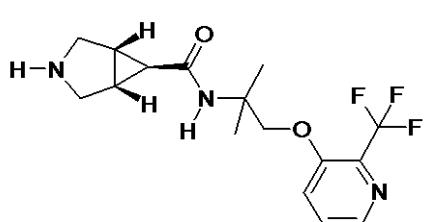
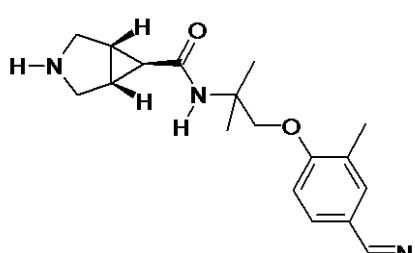
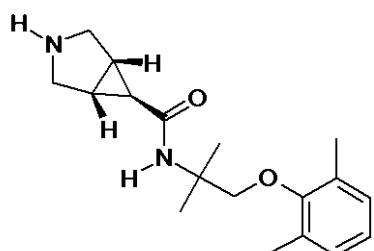
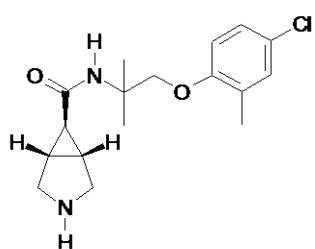
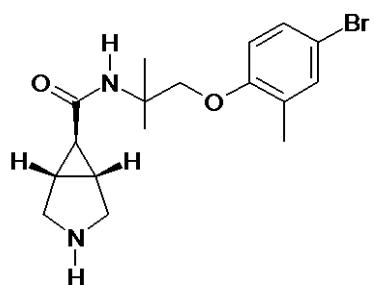
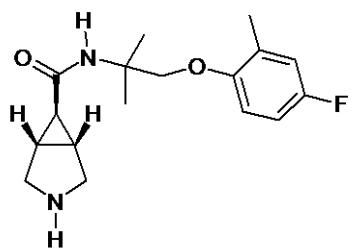
【請求項 13】

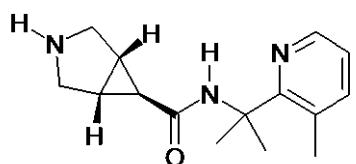
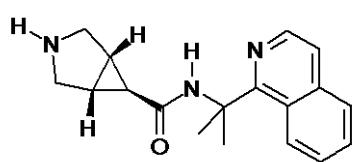
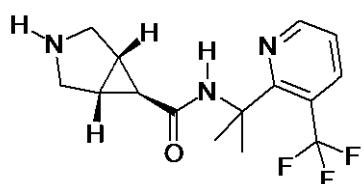
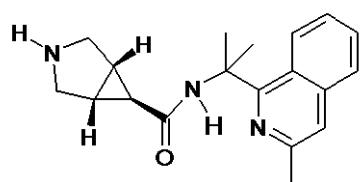
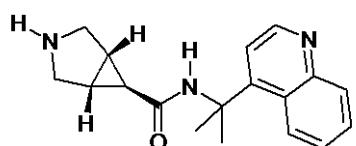
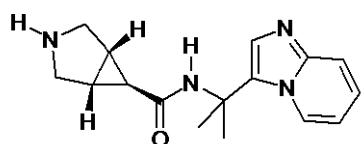
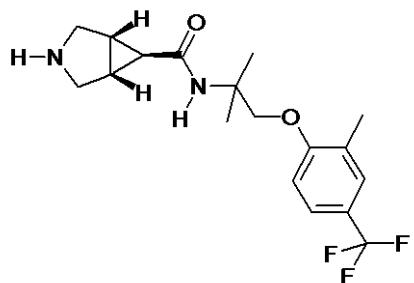
前記化合物が、下記：

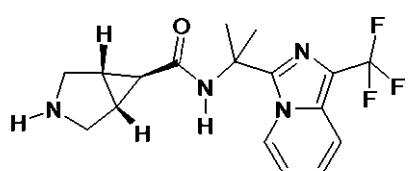
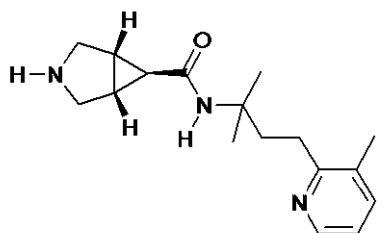
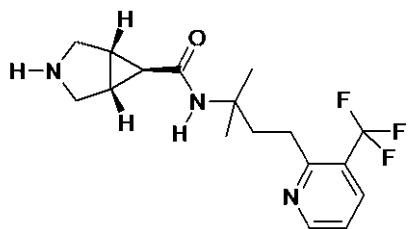
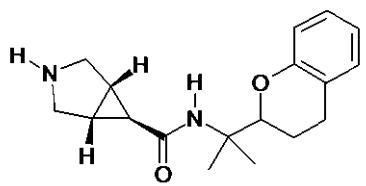
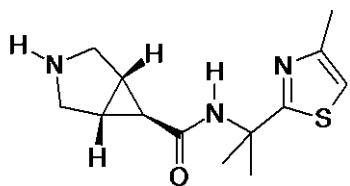
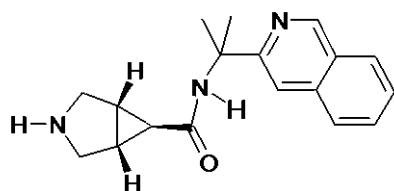
【化 6】

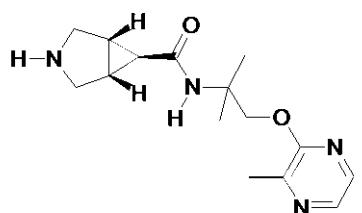
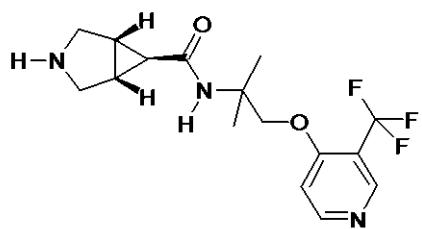
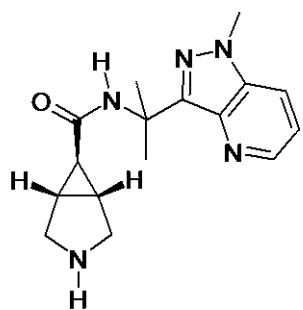
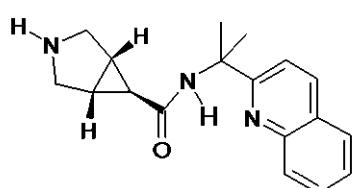
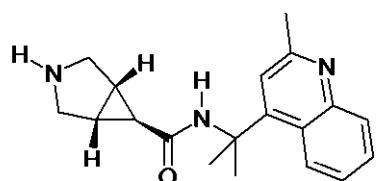
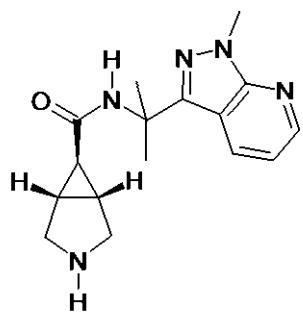


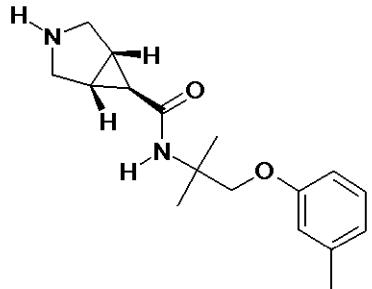
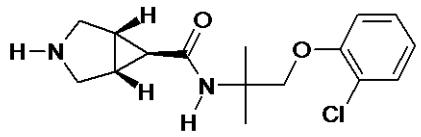
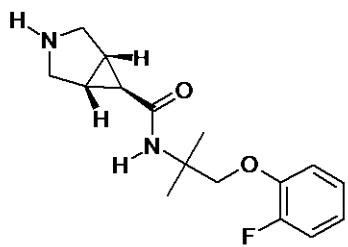
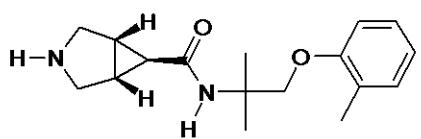
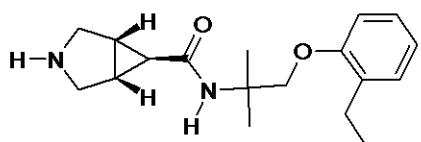
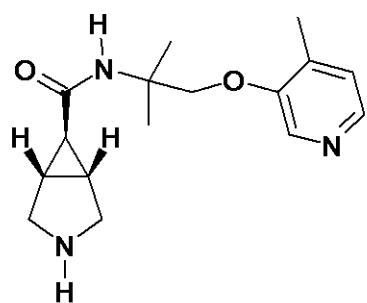


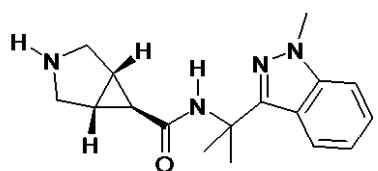
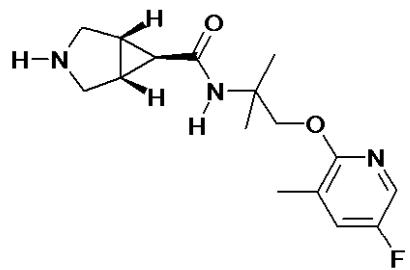
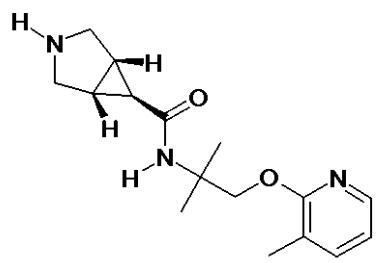
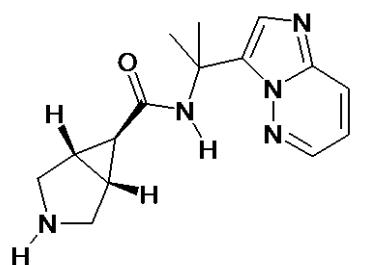
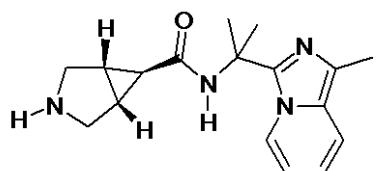
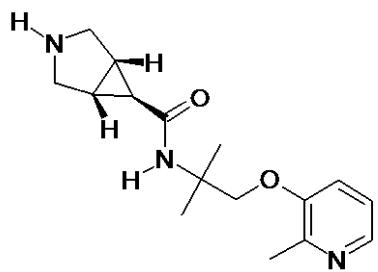


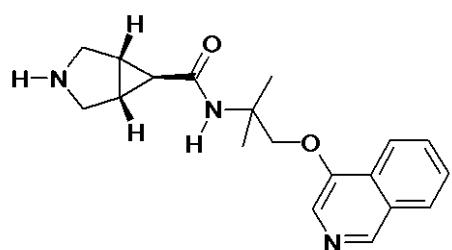
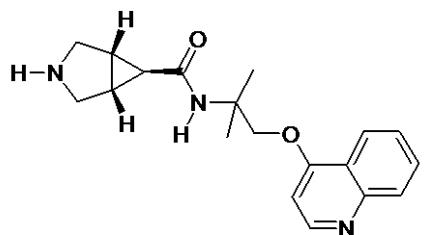
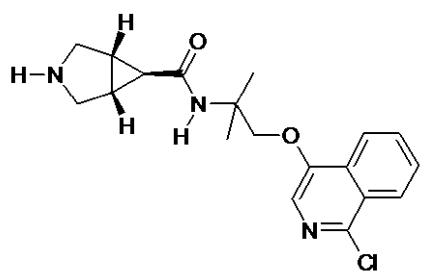
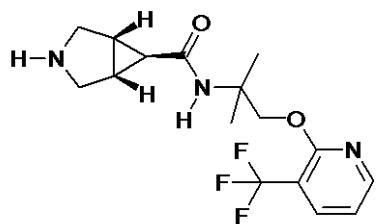
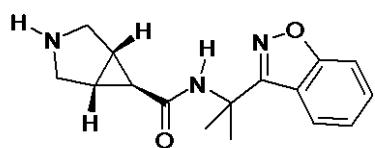
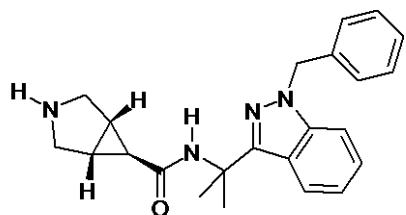


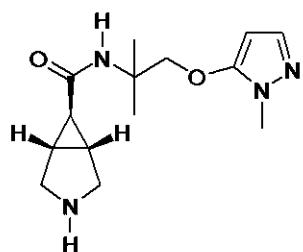
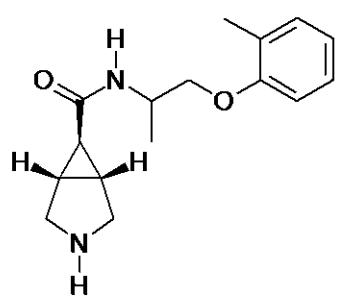
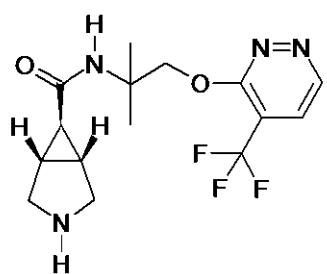
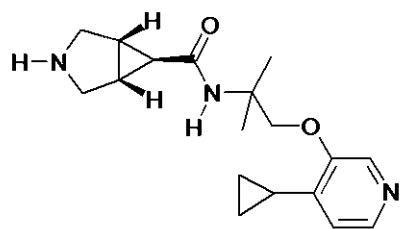
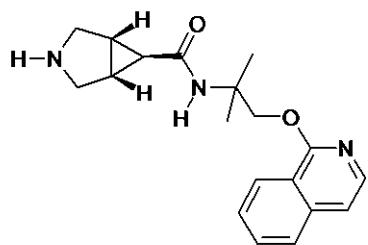


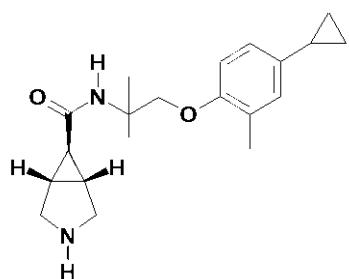
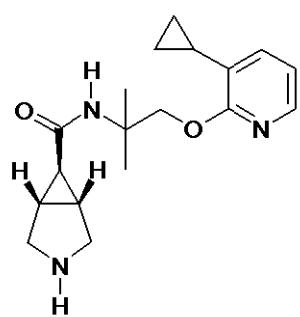
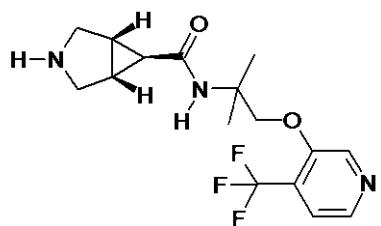
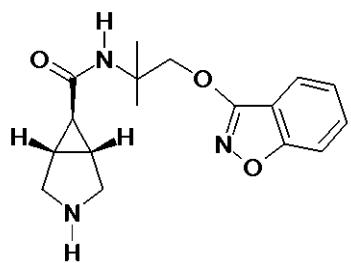
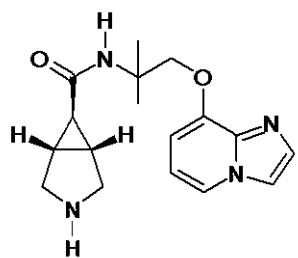


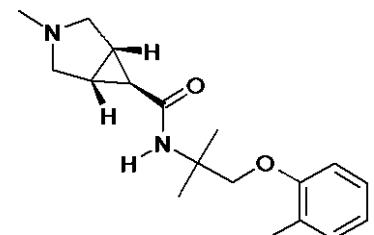
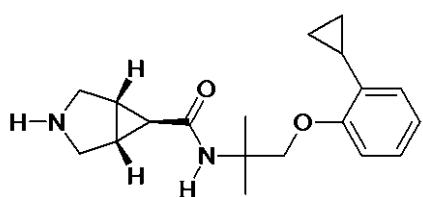
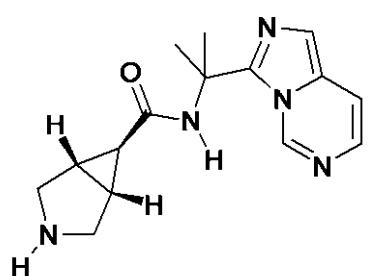
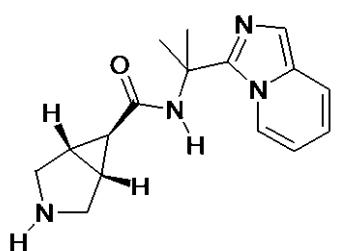
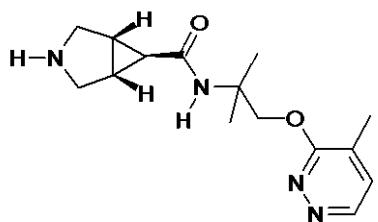
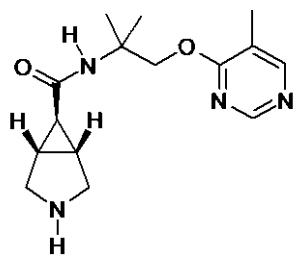


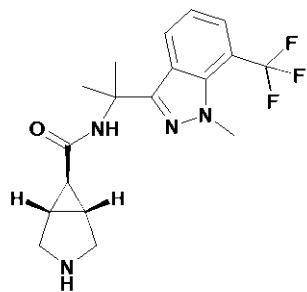
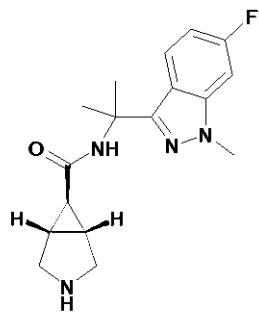
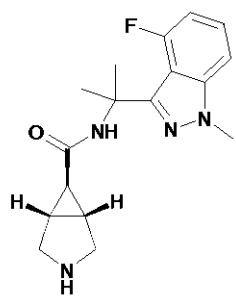
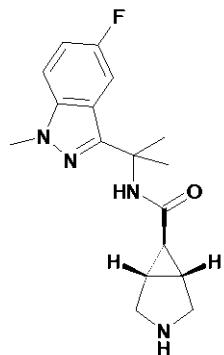
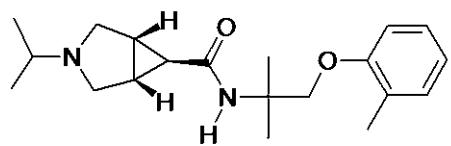


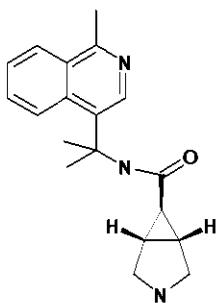
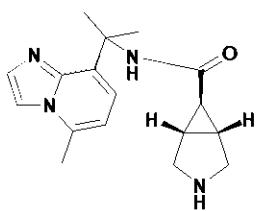
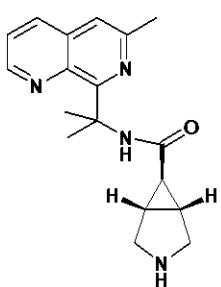
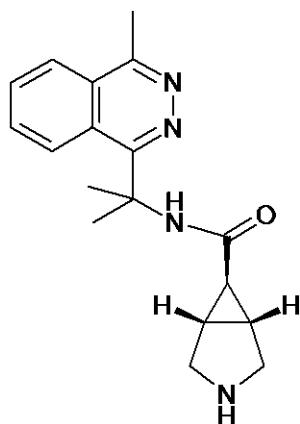


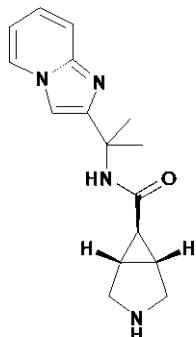
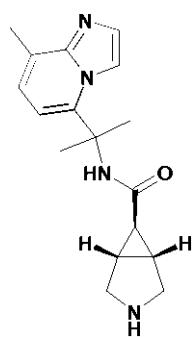
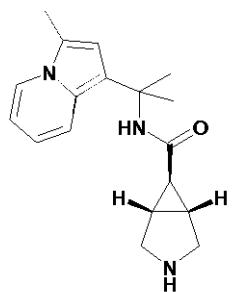
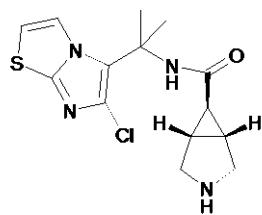


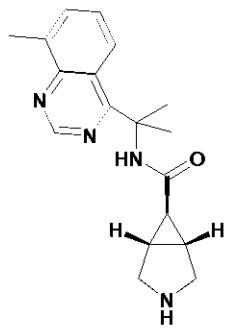
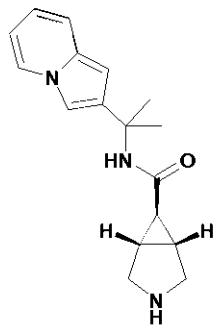
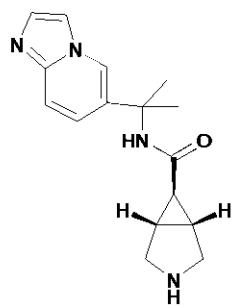
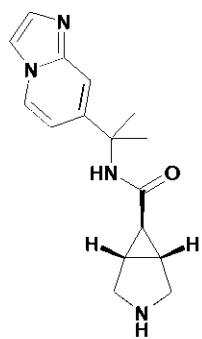


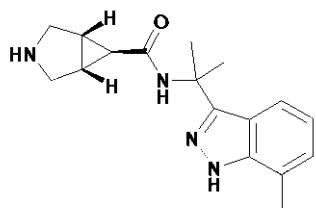
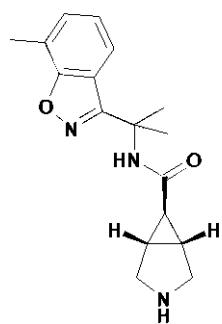
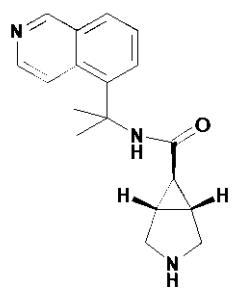
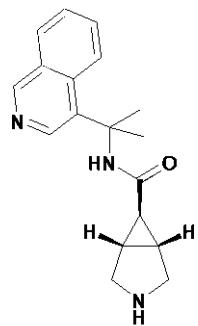
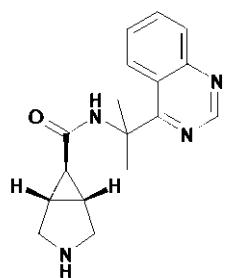


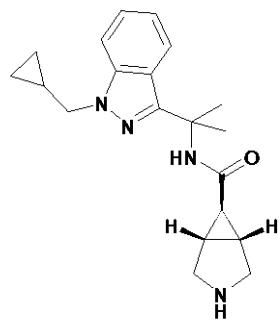
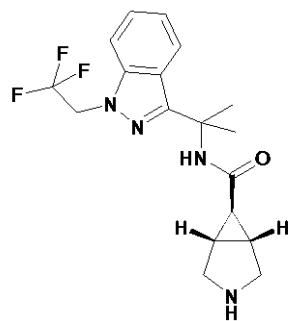
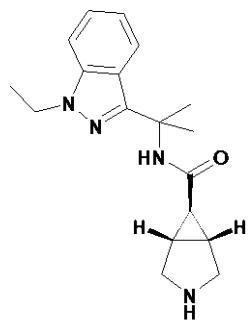
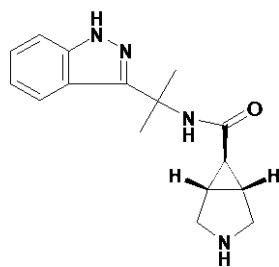


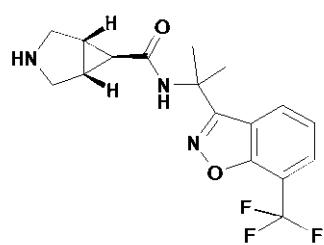
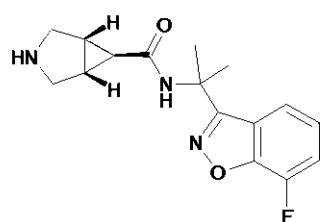
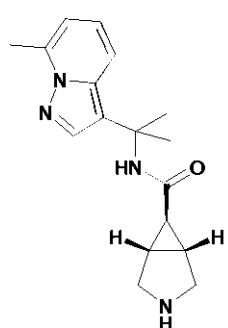
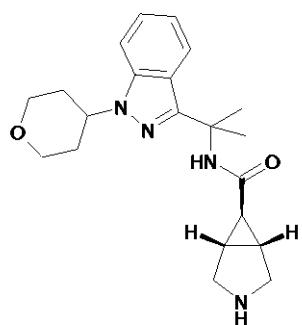
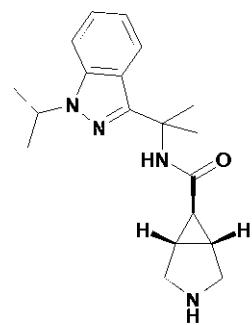


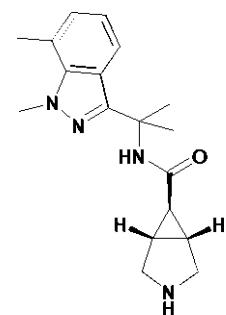
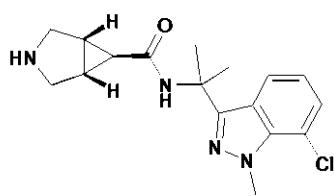
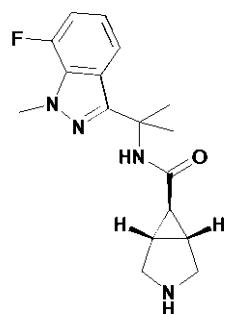
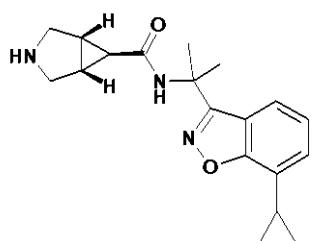
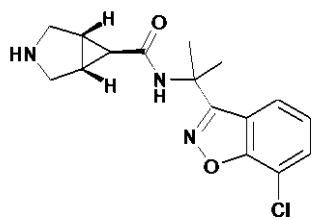


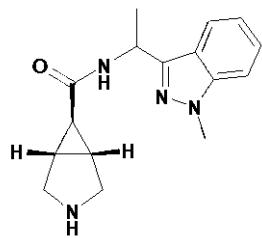
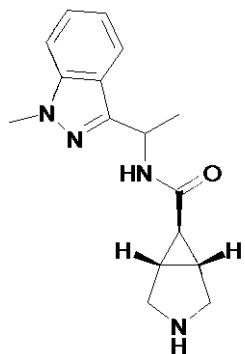
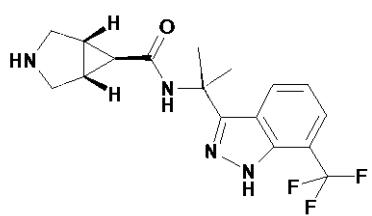
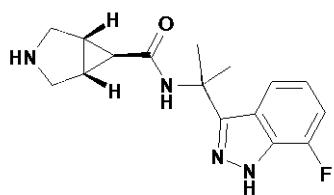
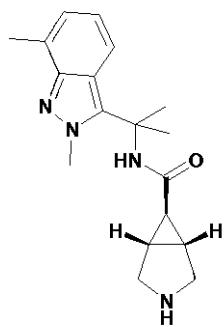


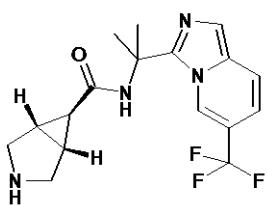
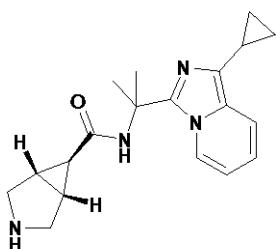
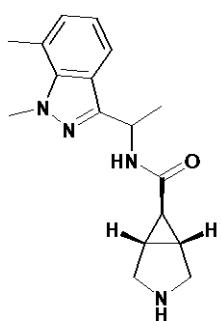
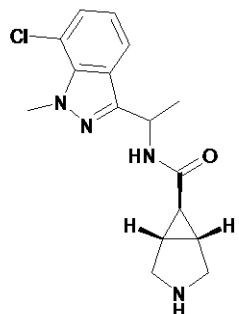
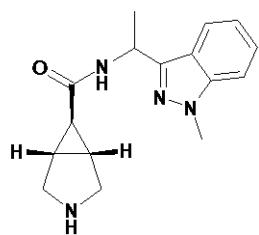


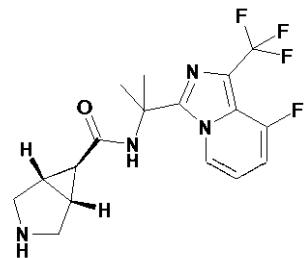
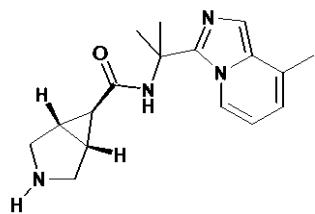
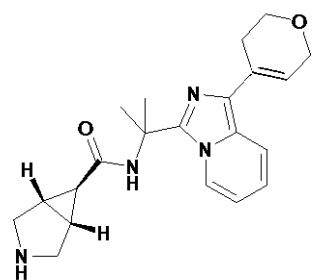
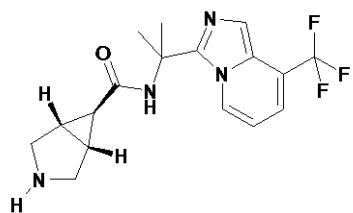
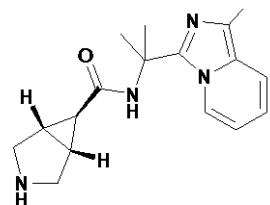
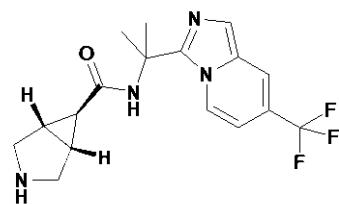


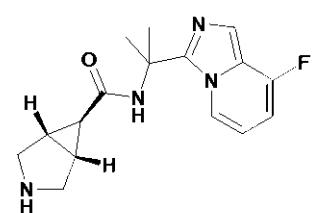
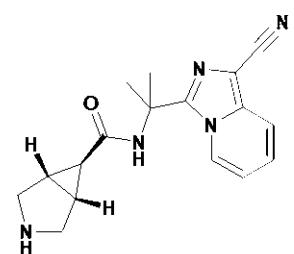
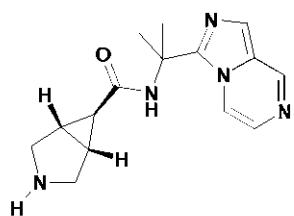
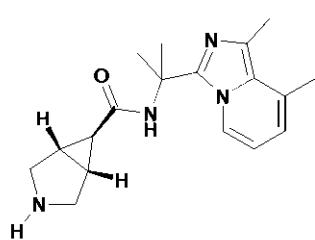
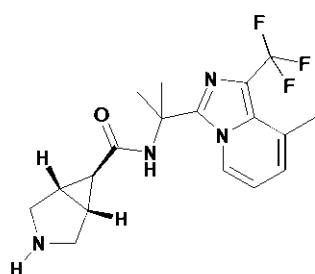
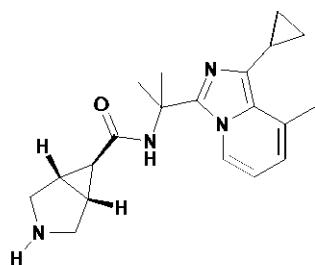


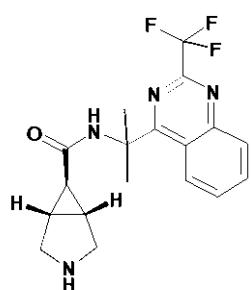
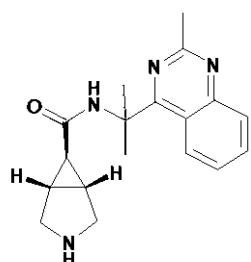
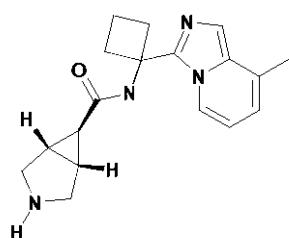
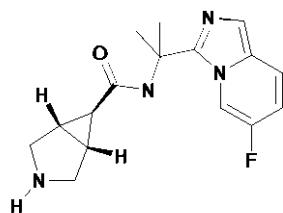
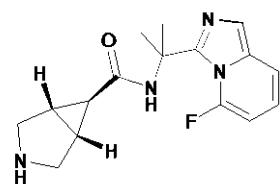
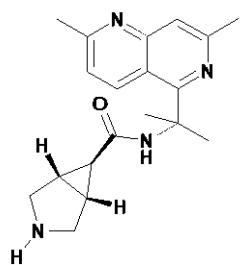


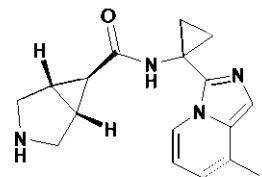
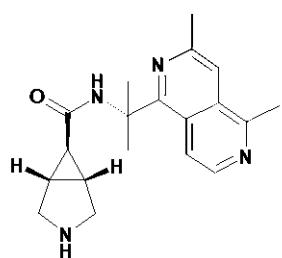
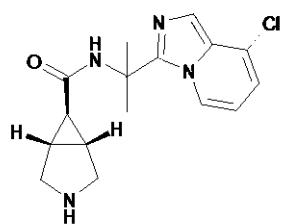
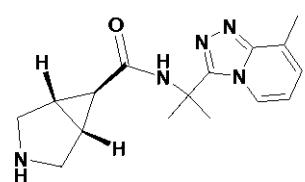
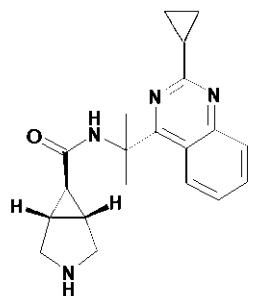
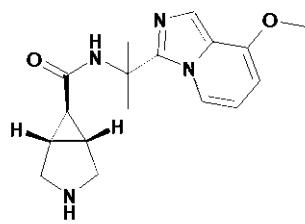


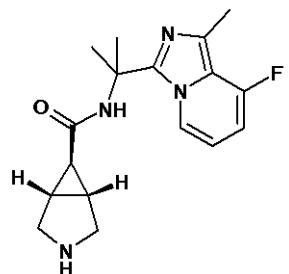
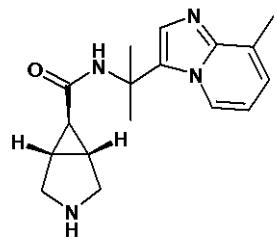
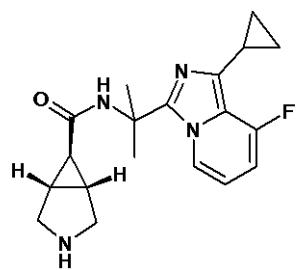
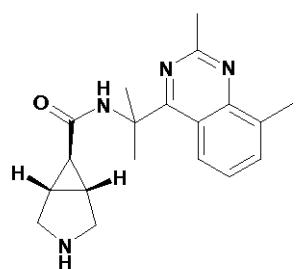
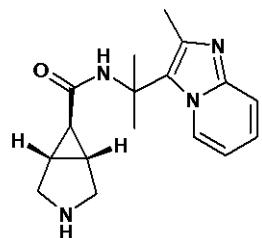
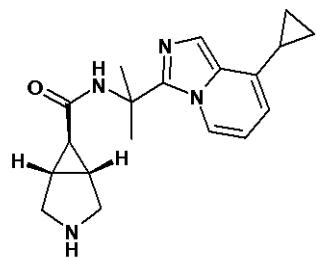


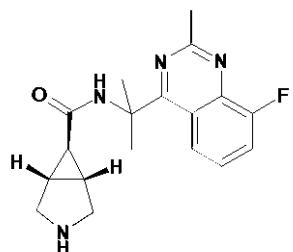
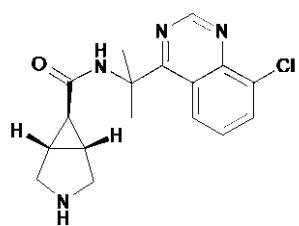
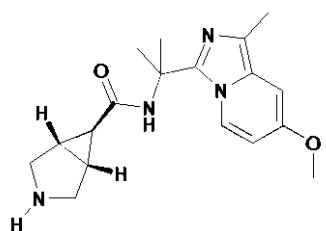
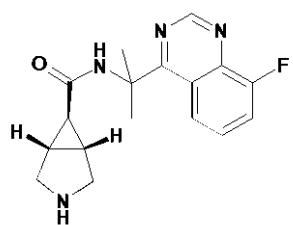
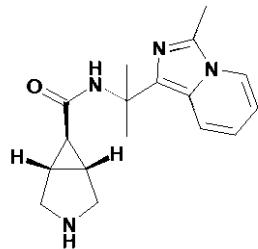
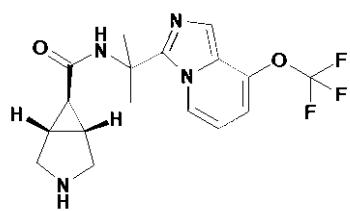


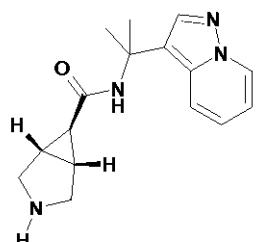
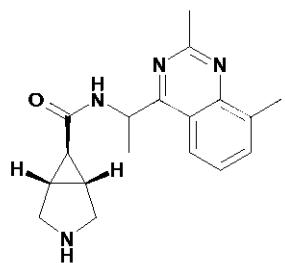
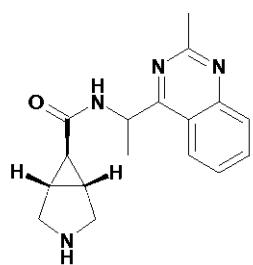
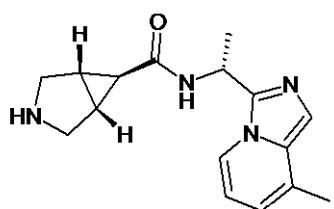
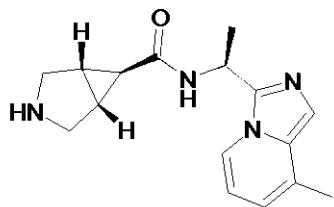
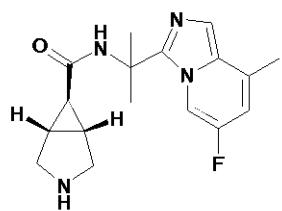


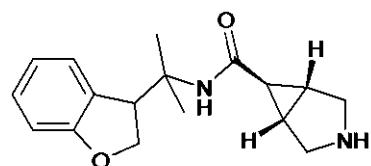
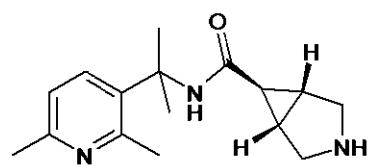
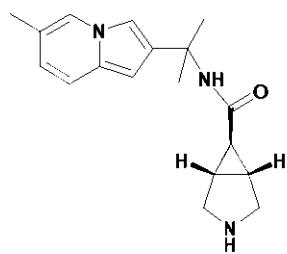
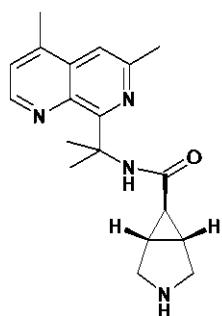
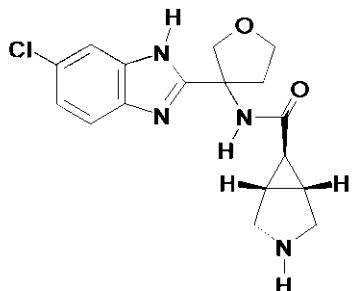
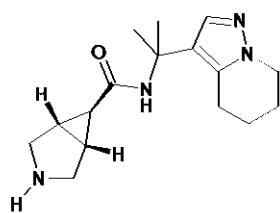


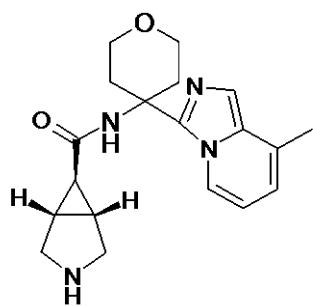
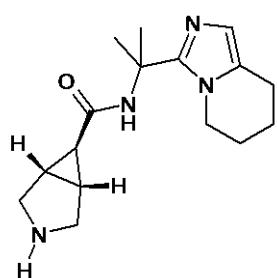
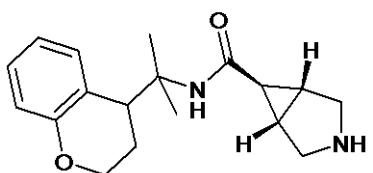
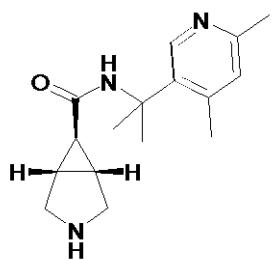
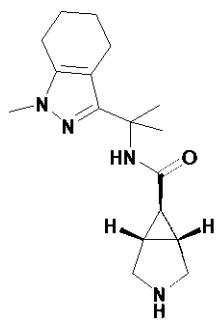


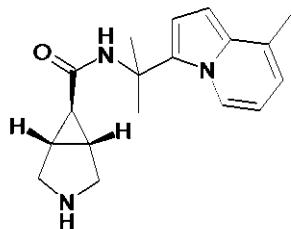
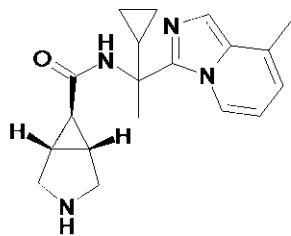












から成る群より選択される、請求項1に記載の化合物、又は前記化合物のいずれかの塩。

【請求項14】

R¹及びR²が、C₁₋₆-アルキルであり、Wが、任意に1つ以上のR³で置換されていてもよい单環式又は二環式ヘテロアリールであり、前記ヘテロアリールは、4個までのヘテロ原子及び1又は2個の5又は6員環を含み、R³は、C₁₋₃-アルキル、C₃₋₆-シクロアルキル、C₁₋₃-アルキル-O-、ハロゲン、又はNC-であり、R³がWのN原子に結合している場合、R³は、C₁₋₃-アルキル及びC₃₋₆-シクロアルキルから成る群より選択される、請求項1に記載の化合物。

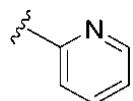
【請求項15】

AがHである、請求項14に記載の化合物。

【請求項16】

Wが、任意に1つ以上のR³で置換されていてもよい下記基：

【化7】

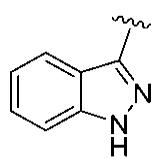


である、請求項14又は15に記載の化合物。

【請求項17】

Wが、任意に1つ以上のR³で置換されていてもよい下記基：

【化8】



である、請求項14又は15に記載の化合物。

【請求項18】

Yが、-CH₂O-である、請求項14～17のいずれか1項に記載の化合物。

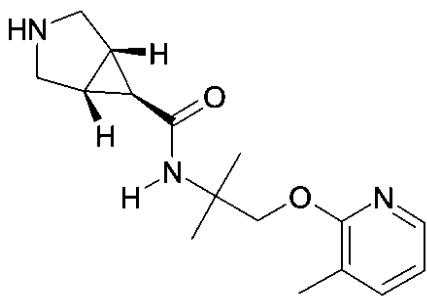
【請求項19】

Yが、結合である、請求項14～17のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項20】

前記化合物が下記化合物：

【化9】

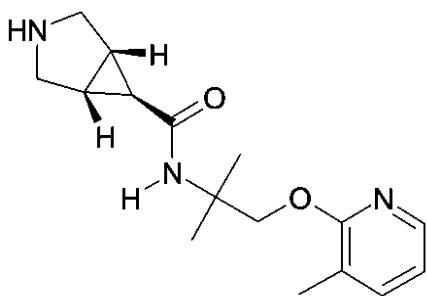


又は医薬的に許容できるその塩である、
請求項1に記載の化合物。

【請求項21】

前記化合物が下記化合物：

【化10】

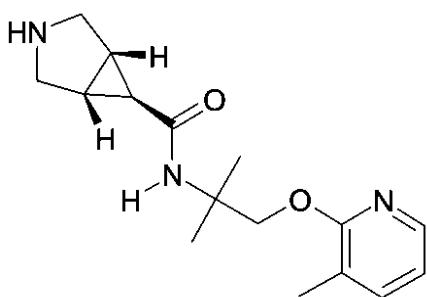


である、請求項1に記載の化合物。

【請求項22】

前記化合物が下記化合物：

【化11】

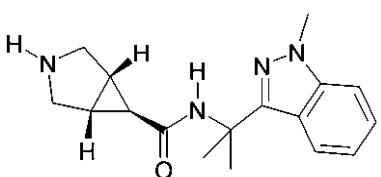


の医薬的に許容できる塩である、請求項1に記載の化合物。

【請求項23】

前記化合物が下記化合物：

【化12】



又は医薬的に許容できるその塩である、
請求項1に記載の化合物。

【請求項 24】

請求項1～23のいずれか1項に記載の少なくとも1種の化合物又はその医薬的に許容できる塩を含み、さらに任意に少なくとも1種の医薬的に許容できる担体を共に含有していよい、医薬組成物。

【請求項 25】

請求項1～23のいずれか1項に記載の化合物、又はその医薬的に許容できる塩を含む、SS TR4の活性化によって影響され得る疾患又は状態を治療又は予防するための医薬組成物。

【請求項 26】

請求項1～23のいずれか1項に記載の化合物、又はその医薬的に許容できる塩を含む、疼痛を治療するための医薬組成物。

【請求項 27】

請求項1～23のいずれか1項に記載の化合物、又はその医薬的に許容できる塩を含む、疼痛の予防に使用するための医薬組成物。

【請求項 28】

疼痛が、神経障害性疼痛又は炎症性疼痛である、請求項26又は27に記載の医薬組成物。

【請求項 29】

疼痛が、慢性疼痛である、請求項26又は27に記載の医薬組成物。

【請求項 30】

疼痛が、脳卒中後疼痛、中枢神経系損傷による疼痛、多発性硬化症による疼痛、複合性局所疼痛症候群I型、複合性局所疼痛症候群II型、腫瘍疼痛、又は変形性関節症に起因する疼痛である、請求項26又は27に記載の医薬組成物。

【請求項 31】

疼痛が、線維筋痛、三叉神経痛、又は過敏性腸に起因する疼痛である、請求項26又は27に記載の医薬組成物。

【請求項 32】

疼痛が、腰痛又は慢性腰背部痛である、請求項26又は27に記載の医薬組成物。

【請求項 33】

疼痛が、糖尿病性神経障害に起因する疼痛である、請求項26又は27に記載の医薬組成物。

【請求項 34】

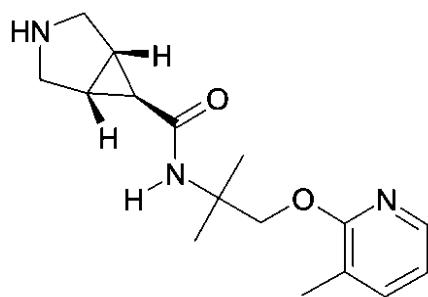
請求項1～23のいずれか1項に記載の化合物、又はその医薬的に許容できる塩を含む、過敏性腸症候群、糖尿病性神経障害、及び変形性関節症から選択される疾患又は症状を治療するための医薬組成物。

【請求項 35】

疾患又は症状が過敏性腸症候群である、請求項34に記載の医薬組成物。

【請求項 36】

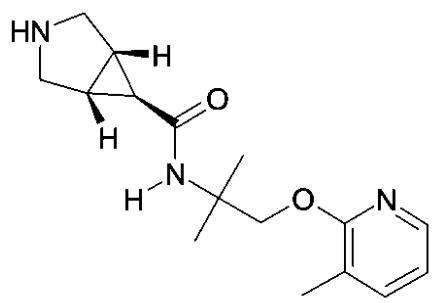
前記化合物が下記化合物：

【化13】

又は医薬的に許容されるその塩である、請求項24～35のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項 37】

前記化合物が下記化合物：
【化14】

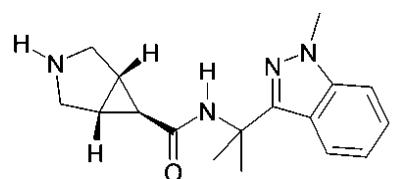


である、請求項24～35のいずれか1項に記載の医薬組成物。

【請求項38】

前記化合物が下記化合物：

【化15】



又は医薬的に許容されるその塩である、請求項24～35のいずれか1項に記載の医薬組成物
。