

【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4月17日 (2014.4.17)

【公表番号】特表2013-521312(P2013-521312A)

【公表日】平成25年6月10日 (2013.6.10)

【年通号数】公開・登録公報2013-029

【出願番号】特願2012-556283(P2012-556283)

【国際特許分類】

C 0 7 D 207/333 (2006.01)

C 0 7 D 249/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/4196 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 417/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/427 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

C 0 7 D 403/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

C 0 7 D 417/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/433 (2006.01)

C 0 7 D 233/64 (2006.01)

A 6 1 K 31/4164 (2006.01)

C 0 7 D 207/337 (2006.01)

A 6 1 K 31/40 (2006.01)

C 0 7 D 231/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/415 (2006.01)

C 0 7 D 257/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/41 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

C 0 7 D 409/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 207/333 C S P

C 0 7 D 249/08 5 3 5

A 6 1 K 31/4196

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 403/12

C 0 7 D 401/04

A 6 1 K 31/4439

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 417/04

A 6 1 K 31/427
 C 0 7 D 401/12
 A 6 1 K 31/444
 C 0 7 D 403/06
 A 6 1 K 31/506
 C 0 7 D 417/12
 A 6 1 K 31/433
 C 0 7 D 233/64 1 0 1
 A 6 1 K 31/4164
 C 0 7 D 207/337
 A 6 1 K 31/40
 C 0 7 D 231/12 D
 A 6 1 K 31/415
 C 0 7 D 257/04 E
 A 6 1 K 31/41
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 P 31/12
 C 0 7 D 409/04

【手続補正書】

【提出日】平成26年2月28日(2014.2.28)

【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

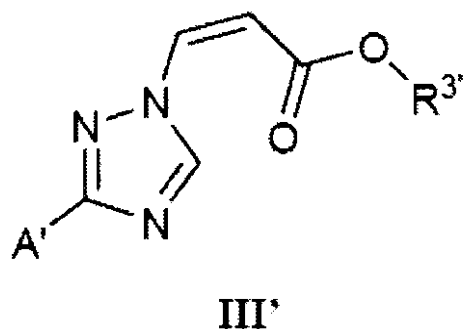
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 III' :

【化1】



(式中：

A' が、1つ以上の R^{1'} で置換されたフェニルであり；

各 R^{1'} が、独立して、ハロゲン、-NO₂、-CN、-OR^a、-SR^a、-N(R

^a) ₂、- N₃、または - L¹ - R からなる群より選択され；

各 R^a が、独立して、- H、- R または - C(O)R であり；

L¹ が、共有結合または任意に置換された二価の C₁ - ₆ 炭化水素鎖であり、ここで、L¹ の 1 つ以上のメチレン単位が、任意にかつ独立して、- Cy -、- O -、- S -、- N(R^a) -、- C(O) -、- C(S) -、- C(O)N(R^a) -、- N(R^a)C(O)N(R^a) -、- N(R^a)C(O) -、- N(R^a)C(O)O -、- OC(O)N(R^a) -、- S(O) -、- S(O)₂ -、- S(O)₂N(R^a) -、- N(R^a)S(O)₂ -、- OC(O) - または - C(O)O - で置換され；

- Cy - が、3 ~ 7 員の飽和または部分的に不飽和のシクロアルキレン環、窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 7 員の飽和または部分的に不飽和のヘテロシクロアルキレン環、フェニレン、窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 6 員の単環式ヘテロアリーレン、8 ~ 10 員の二環式アリーレン、あるいは窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 8 ~ 10 員の二環式ヘテロアリーレンから選択される、任意に置換された二価の環であり；

各 R が、独立して、任意に置換される C₁ - ₈ アルキル；C₂ - ₈ アルケニル；C₂ - ₈ アルキニル；ハロアルキル；フェニル；3 ~ 7 員の飽和もしくは部分的に不飽和のシクロアルキル環；8 ~ 10 員の二環式の飽和の、部分的に不飽和のもしくはアリールの炭素環；窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 7 員の飽和もしくは部分的に不飽和のヘテロシクロアルキル環；窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 6 員の単環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 8 ~ 10 員の二環式ヘテロアリール環であり；あるいは：

同じ窒素上の 2 つの R が、それらの間にある原子と一緒にあって、窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 7 員の複素環を形成し、

R³ が、- L¹ - R であり、この式において、L¹ が - CH₂ - であり、R が、窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 6 員の単環式複素環である）

の化合物またはその薬学的に許容できる塩。

【請求項 2】

R³ が、- L¹ - R であり、この式において、L¹ が - CH₂ - であり、R が、1 ~ 3 個の窒素を有する 6 員の単環式複素環である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

Chemical structures 1-5 are shown below:

1: Clc1ccc(cc1)-c2nc3c(ncn3C=C/C(=O)OCC4C=CC=CC=C4O2)c5ccccc5

2: Clc1ccc(cc1)-c2nc3c(ncn3C=C/C(=O)OCC4C=CC=CC=C4O2)c5ccccc5

3: Clc1ccc(cc1)-c2nc3c(ncn3C=C/C(=O)OCC4C=CC=CC=C4O2)c5ccccc5

4: Clc1ccc(cc1)-c2nc3c(ncn3C=C/C(=O)OCC4C=CC=CC=C4O2)c5ccccc5

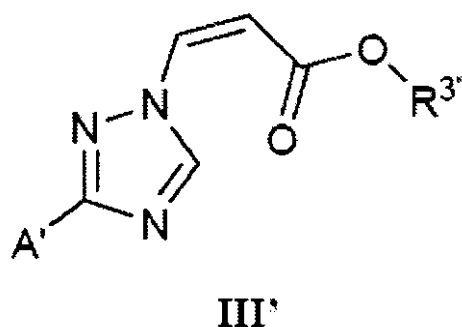
5: Clc1ccc(cc1)-c2nc3c(ncn3C=C/C(=O)OCC4C=CC=CC=C4O2)c5ccccc5

および

【請求項 4】

式 I I I ' :

【化 3】

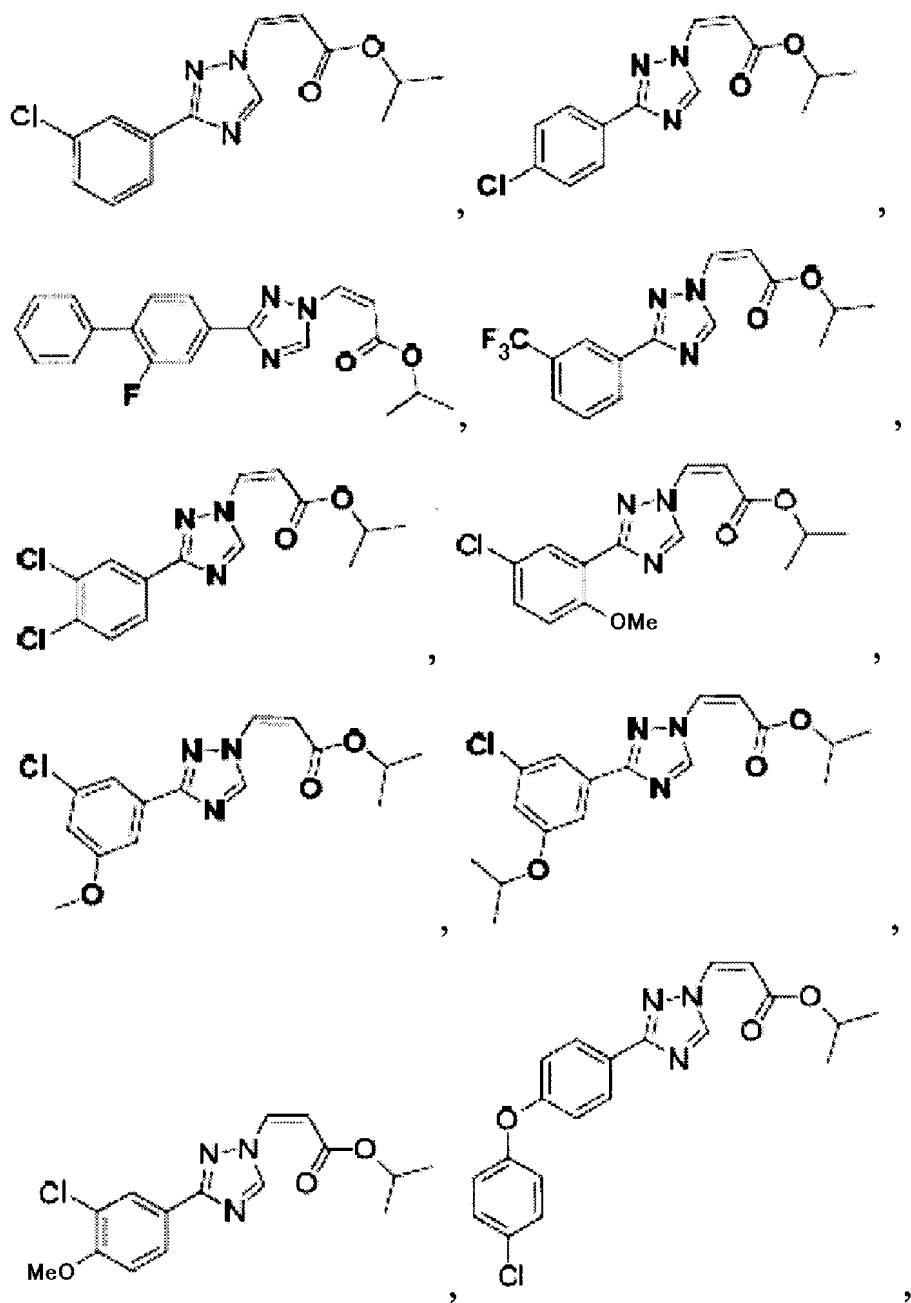


(式中：

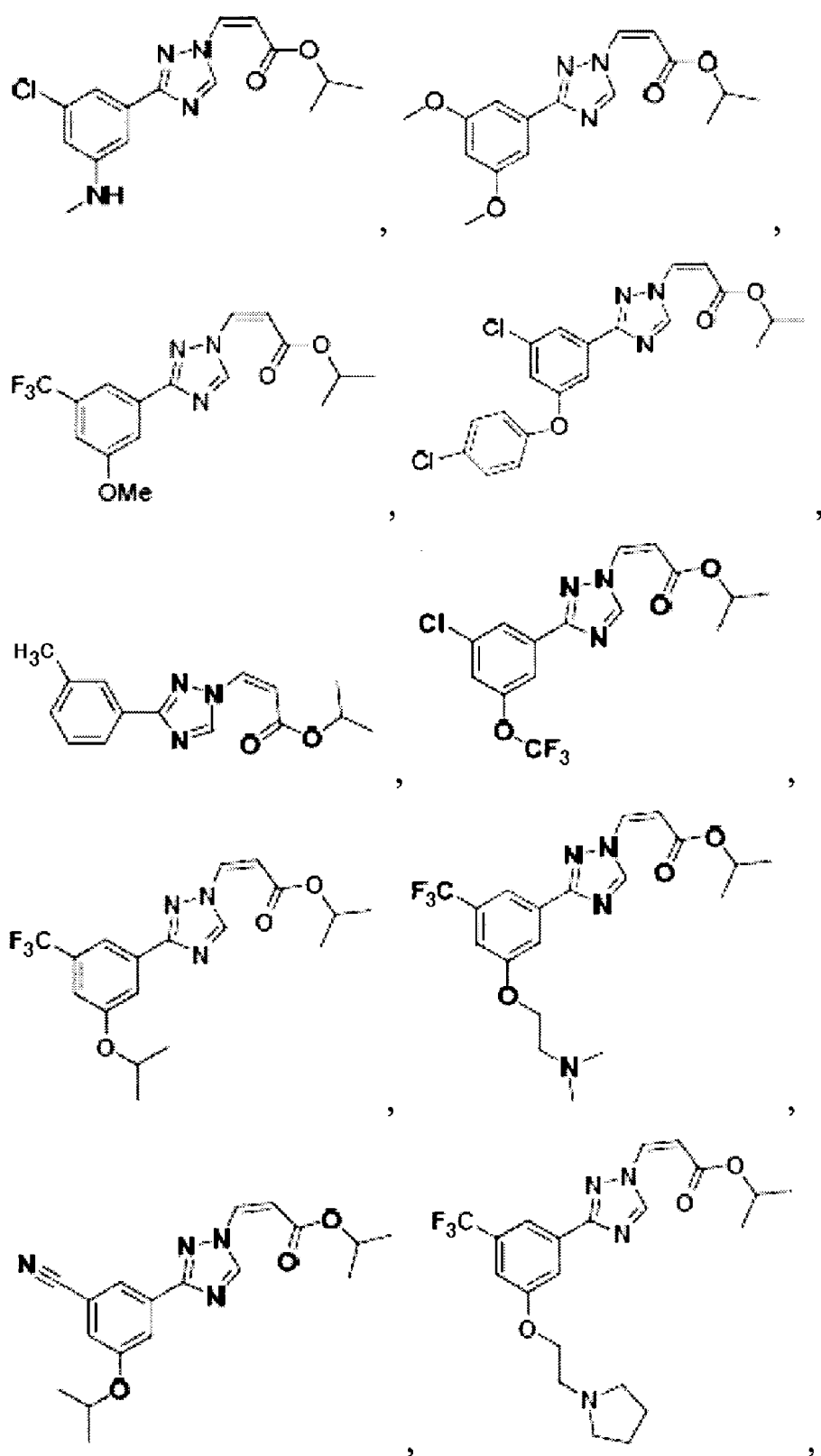
A' が、1つ以上の R^{1'} で置換されたフェニルであり；各 R^{1'} が、独立して、ハロゲン、-NO₂、-CN、-OR^a、-SR^a、-N(R^a)₂、-N₃、または -L¹-R からなる群より選択され；各 R^a が、独立して、-H、-R または -C(O)R であり；L¹ が、共有結合または任意に置換された二価の C₁ ~ 6 炭化水素鎖であり、ここで、L¹ の1つ以上のメチレン単位が、任意にかつ独立して、-Cy-、-O-、-S-、-N(R^a)-、-C(O)-、-C(S)-、-C(O)N(R^a)-、-N(R^a)C(O)N(R^a)-、-N(R^a)C(O)-、-N(R^a)C(O)O-、-OC(O)N(R^a)-、-S(O)-、-S(O)₂-、-S(O)₂N(R^a)-、-N(R^a)S(O)₂-、-OC(O)- または -C(O)O- で置換され；-Cy- が、3 ~ 7 員の飽和または部分的に不飽和のシクロアルキレン環、窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 7 員の飽和または部分的に不飽和のヘテロシクロアルキレン環、フェニレン、窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 6 員の単環式ヘテロアリーレン、8 ~ 10 員の二環式アリーレン、あるいは窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 8 ~ 10 員の二環式ヘテロアリーレンから選択される、任意に置換された二価の環であり；各 R が、独立して、任意に置換された C₁ ~ 8 アルキル；C₂ ~ 8 アルケニル；C₂ ~ 8 アルキニル；ハロアルキル；フェニル；3 ~ 7 員の飽和もしくは部分的に不飽和のシクロアルキル環；8 ~ 10 員の二環式の飽和の、部分的に不飽和のもしくはアリーの炭素環；窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 7 員の飽和もしくは部分的に不飽和のヘテロシクロアルキル環；窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される 1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する 5 ~ 6 員の単環式ヘテロアリール環；または窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される 1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する 8 ~ 10 員の二環式ヘテロアリール環であり；あるいは：同じ窒素上の 2 つの R が、それらの間にある原子と一緒に、窒素、酸素、および硫黄から独立して選択される 1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する 4 ~ 7 員の複素環を形成し、R^{3'} が、-CH(CH₃)₂ である)の化合物またはその薬学的に許容できる塩。

【請求項 5】

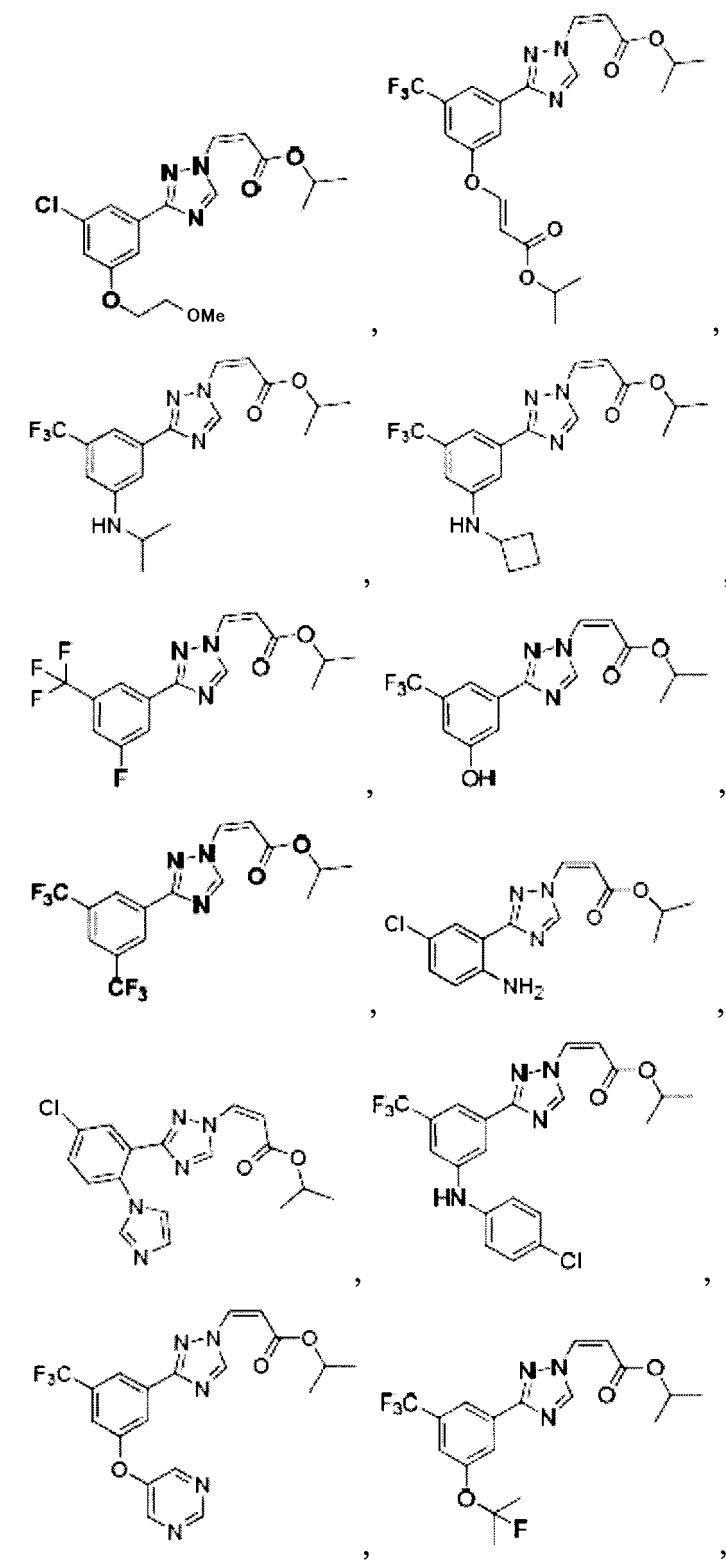
【化 4】



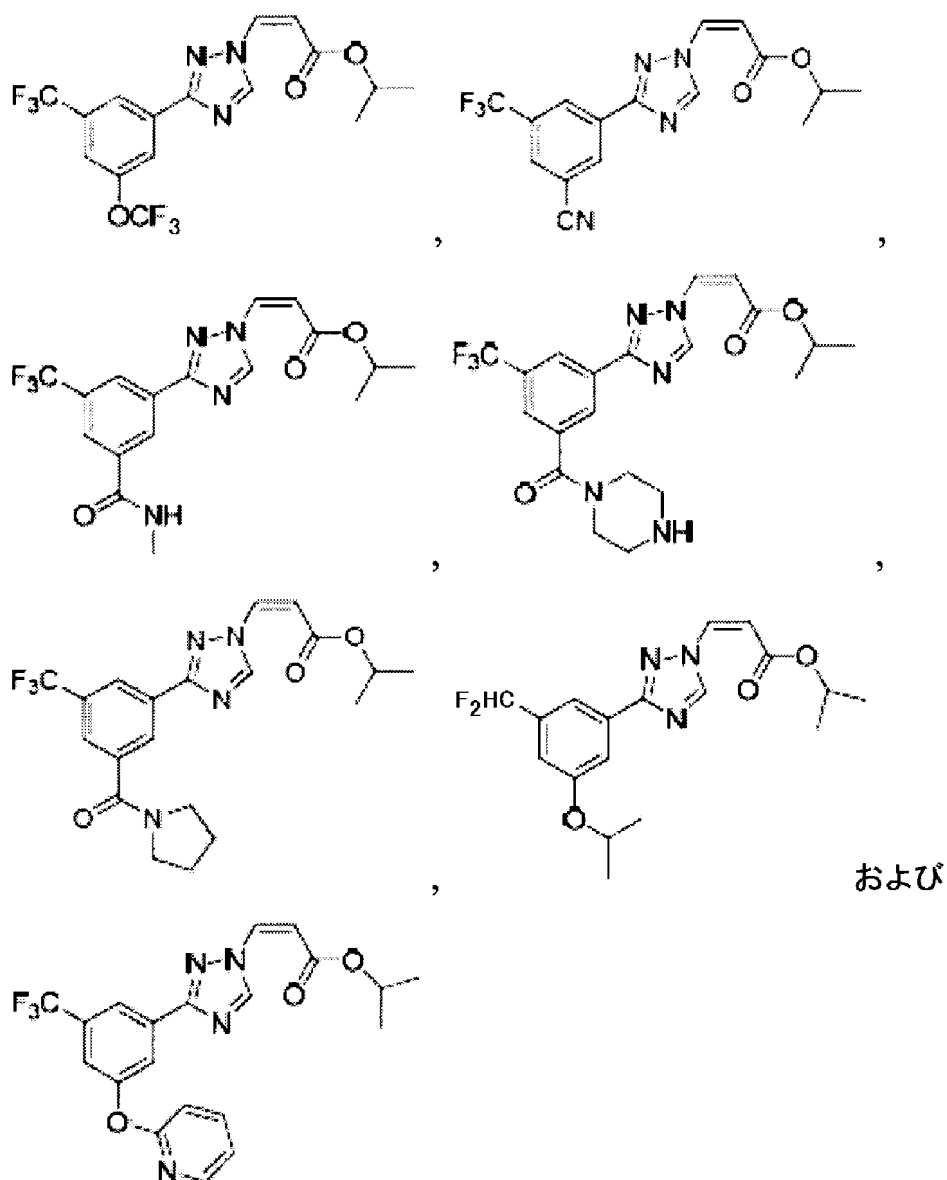
【化 5】



【化 6】



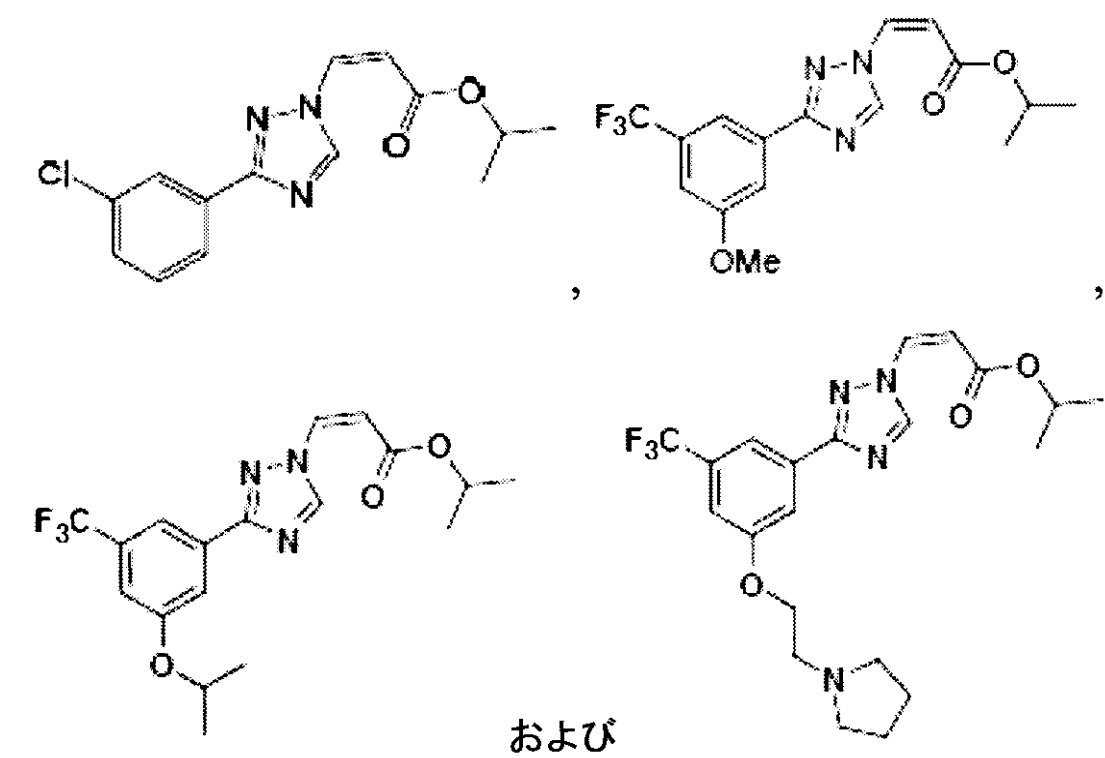
【化 7】



からなる群より選択される請求項 4 記載の化合物またはその薬学的に許容できる塩。

【請求項 6】

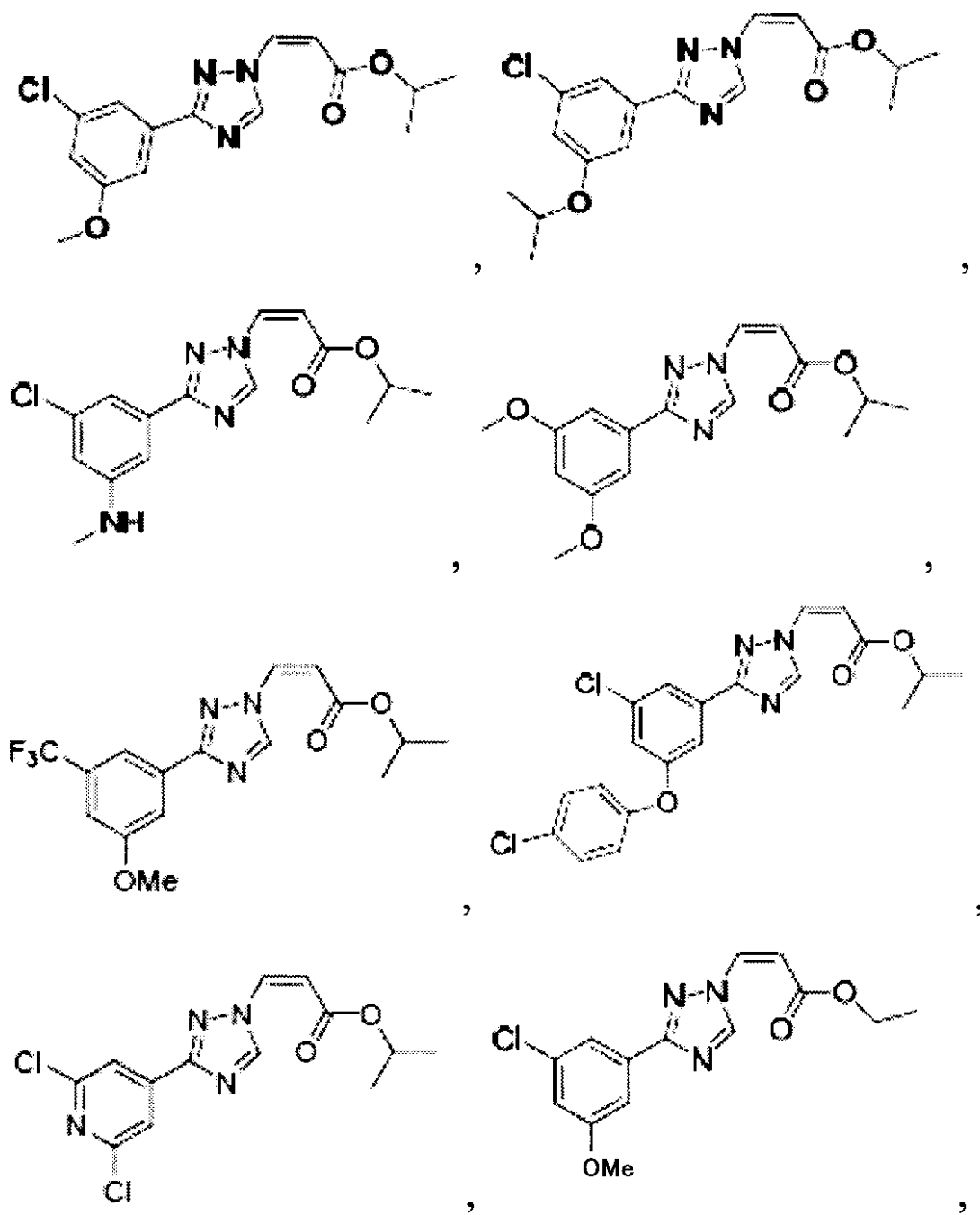
【化 8】



からなる群より選択される請求項 5 記載の化合物またはその薬学的に許容できる塩。

【請求項 7】

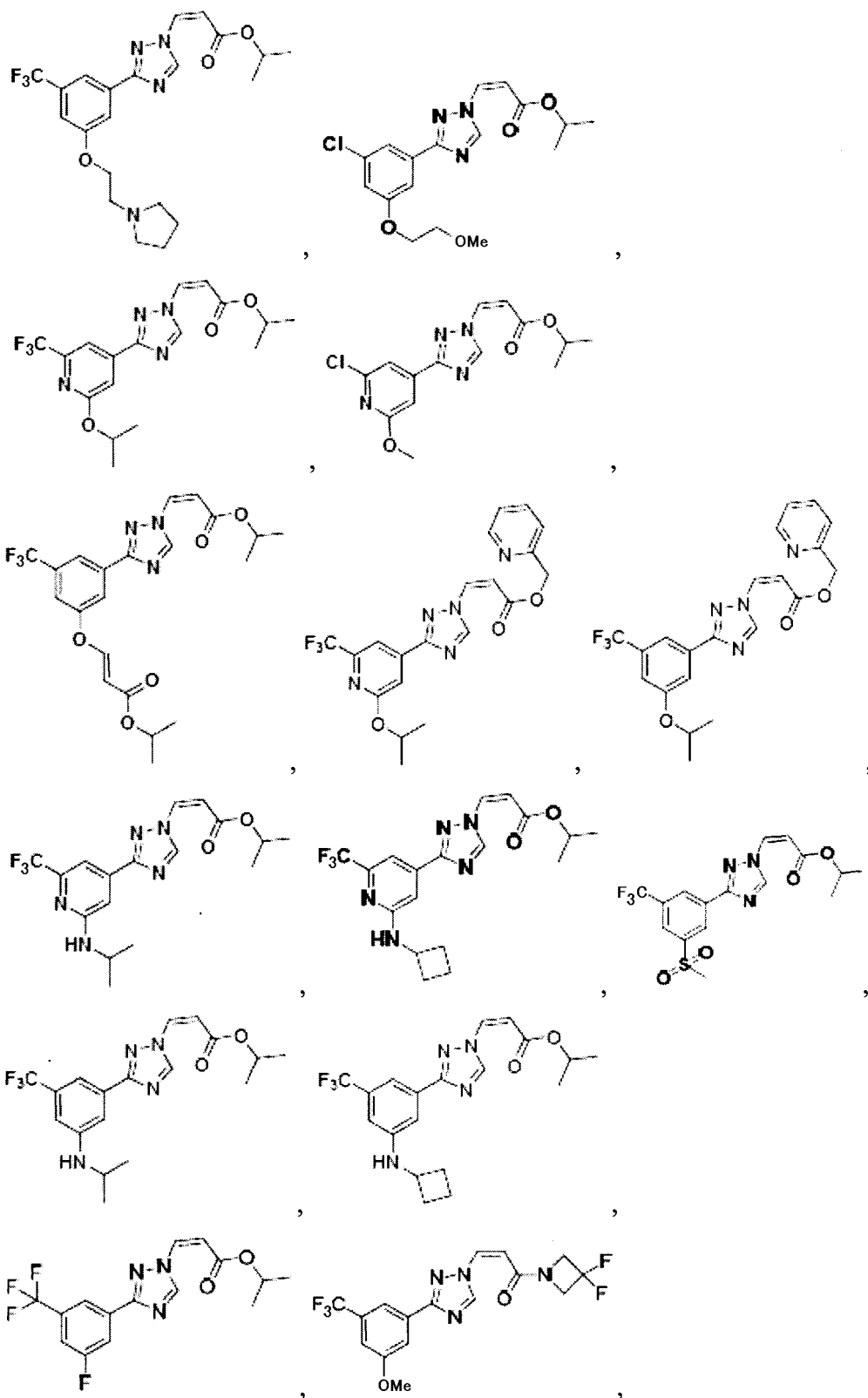
【化 9】



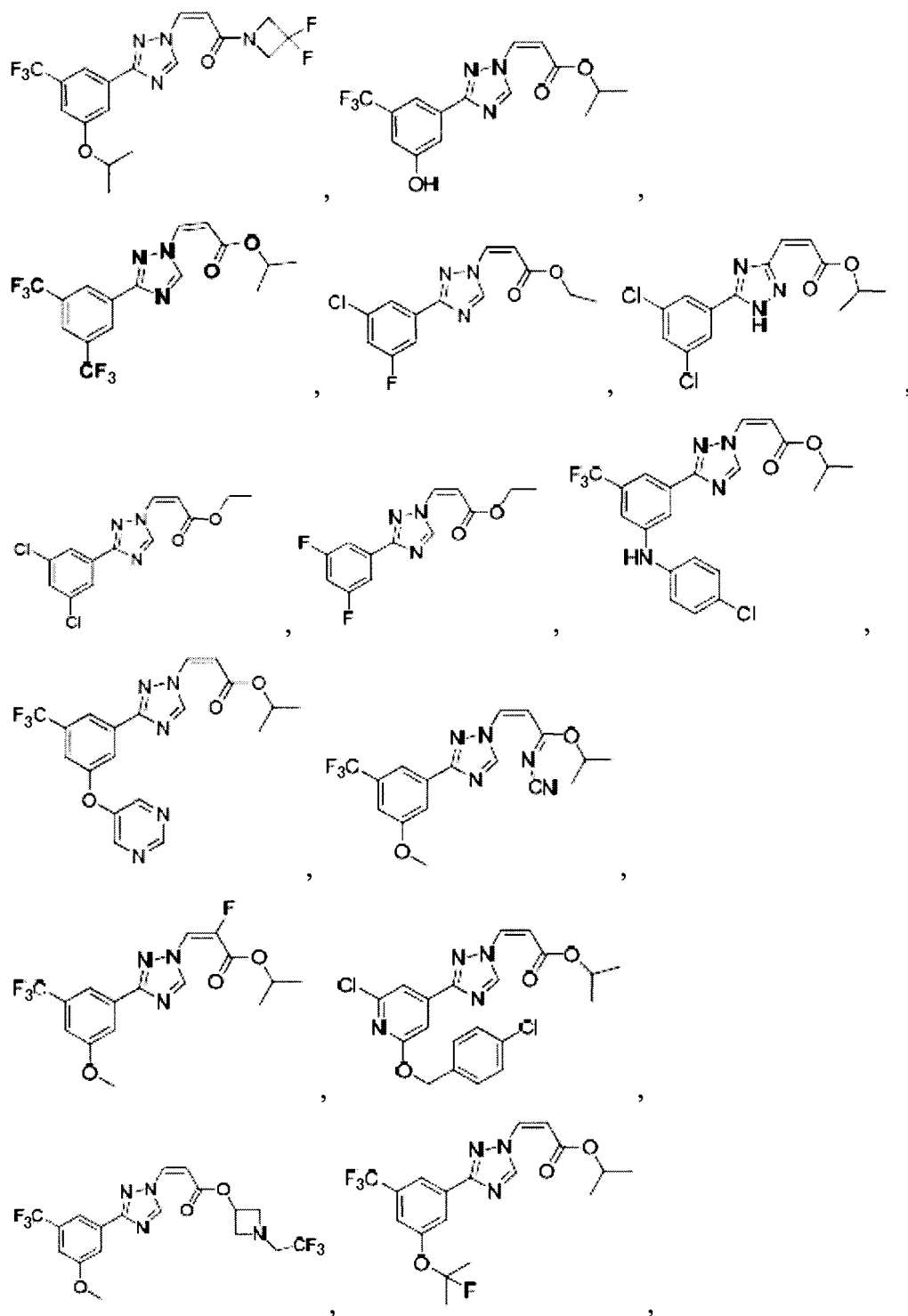
Chemical structures 1-10 are shown below:

- Structure 1: A pyridine ring substituted with a chlorine atom at the 3-position, a methoxy group at the 5-position, and a 1,2,4-benzimidazole-5-yl group at the 4-position. The benzimidazole ring is further substituted with an isopropoxy carbonyl group at the 2-position.
- Structure 2: A pyridine ring substituted with a chlorine atom at the 3-position, a trifluoromethoxy group at the 5-position, and a 1,2,4-benzimidazole-5-yl group at the 4-position. The benzimidazole ring is further substituted with an isopropoxy carbonyl group at the 2-position.
- Structure 3: A pyridine ring substituted with a chlorine atom at the 3-position, an isopropoxy group at the 5-position, and a 1,2,4-benzimidazole-5-yl group at the 4-position. The benzimidazole ring is further substituted with an isopropoxy carbonyl group at the 2-position.
- Structure 4: A pyridine ring substituted with a trifluoromethyl group at the 3-position, an isopropoxy group at the 5-position, and a 1,2,4-benzimidazole-5-yl group at the 4-position. The benzimidazole ring is further substituted with an isopropoxy carbonyl group at the 2-position.
- Structure 5: A pyridine ring substituted with a trifluoromethyl group at the 3-position, a dimethylaminoethoxy group at the 5-position, and a 1,2,4-benzimidazole-5-yl group at the 4-position. The benzimidazole ring is further substituted with an isopropoxy carbonyl group at the 2-position.
- Structure 6: A pyridine ring substituted with a trifluoromethyl group at the 3-position, a dimethylaminoethoxy group at the 5-position, and a 1,2,4-benzimidazole-5-yl group at the 4-position. The benzimidazole ring is further substituted with an isopropoxy carbonyl group at the 2-position.
- Structure 7: A pyridine ring substituted with a trifluoromethyl group at the 3-position, a methoxy group at the 5-position, and a 1,2,4-benzimidazole-5-yl group at the 4-position. The benzimidazole ring is further substituted with an isopropoxy carbonyl group at the 2-position.
- Structure 8: A pyridine ring substituted with a cyano group at the 3-position, an isopropoxy group at the 5-position, and a 1,2,4-benzimidazole-5-yl group at the 4-position. The benzimidazole ring is further substituted with an isopropoxy carbonyl group at the 2-position.
- Structure 9: A pyridine ring substituted with a chlorine atom at the 3-position, a chlorine atom at the 5-position, and a 1,2,4-benzimidazole-5-yl group at the 4-position. The benzimidazole ring is further substituted with an isopropoxy carbonyl group at the 2-position.
- Structure 10: A pyridine ring substituted with a chlorine atom at the 3-position, an isopropoxy group at the 5-position, and a 1,2,4-benzimidazole-5-yl group at the 4-position. The benzimidazole ring is further substituted with an isopropoxy carbonyl group at the 2-position.

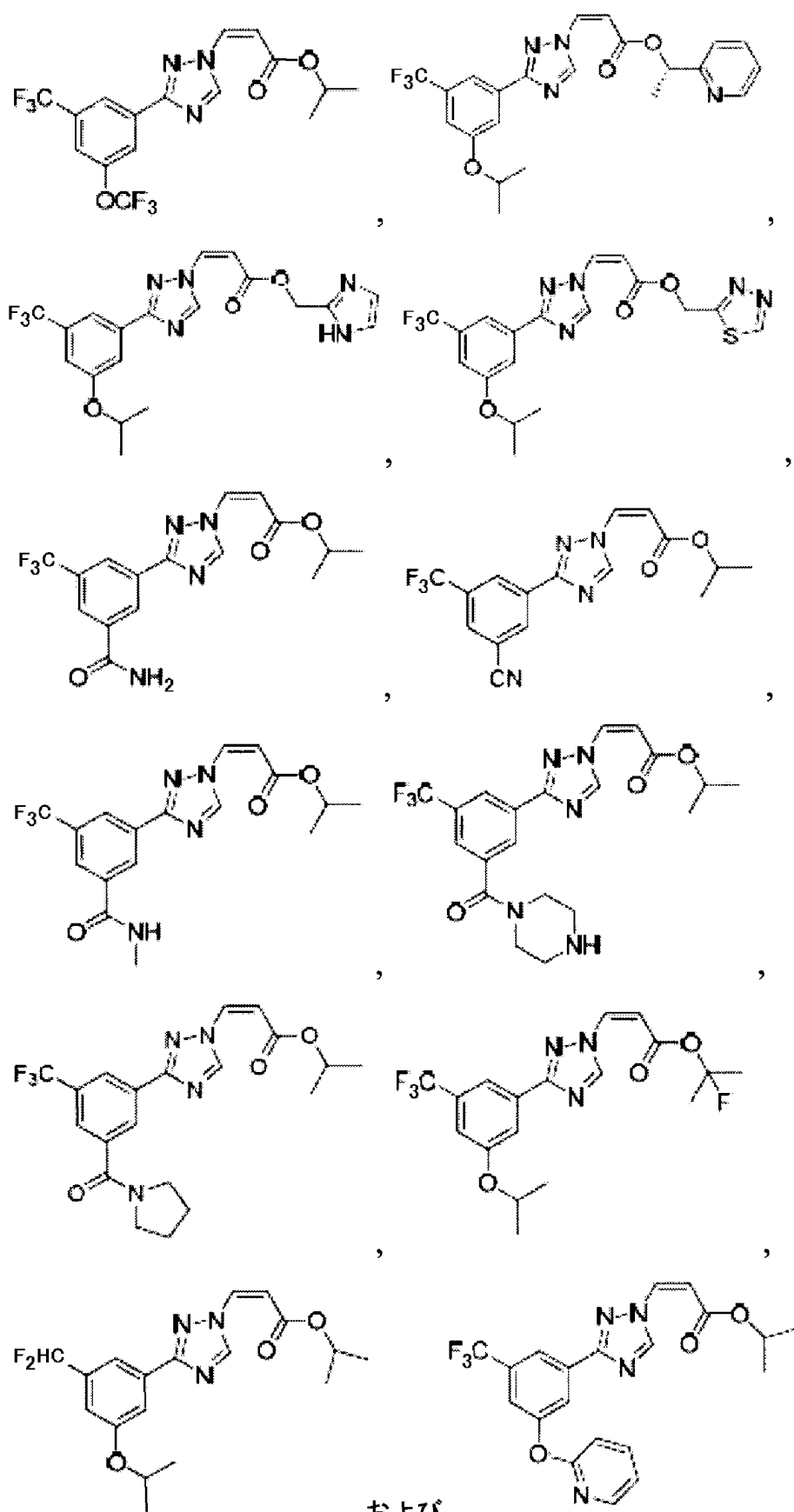
【化 1 1】



【化 1 2】



【化 1 3】



からなる群より選択される化合物またはその薬学的に許容できる塩。

【請求項 8】

請求項 1 ～ 7 いずれか記載の化合物またはその薬学的に許容できる塩と、薬学的に許容できる補助剤または媒体とを含む医薬組成物。

【請求項 9】

請求項 1 ～ 7 いずれか記載の化合物またはその薬学的に許容できる塩を含む、CRM 1 を調節するための医薬組成物。

【請求項 10】

請求項 1 ～ 7 いずれか記載の化合物またはその薬学的に許容できる塩を含む、CRM 1 に関連する障害を治療、調節、および / または予防するための医薬組成物。

【請求項 11】

前記障害が、癌および他の腫瘍性障害；炎症性疾患；心筋症、肺線維症、肝線維症、糸球体腎炎および他の腎障害を含む異常な組織増殖の障害および線維症；ならびに急性および慢性ウイルス感染からなる群より選択される、請求項 10 記載の医薬組成物。