

【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5月22日(2014.5.22)

【公表番号】特表2012-528858(P2012-528858A)

【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2012-513932(P2012-513932)

【国際特許分類】

C 07 D 215/36 (2006.01)
A 61 K 31/47 (2006.01)
C 07 D 417/12 (2006.01)
A 61 K 31/4709 (2006.01)
C 07 D 401/12 (2006.01)
C 07 D 215/38 (2006.01)
A 61 K 31/496 (2006.01)
C 07 D 405/12 (2006.01)
C 07 D 403/12 (2006.01)
A 61 K 31/55 (2006.01)
A 61 K 31/4725 (2006.01)
A 61 K 31/506 (2006.01)
C 07 D 409/12 (2006.01)
C 07 D 487/04 (2006.01)
C 07 D 491/113 (2006.01)
A 61 K 31/5377 (2006.01)
C 07 D 409/14 (2006.01)
C 07 D 405/14 (2006.01)
A 61 P 25/28 (2006.01)
A 61 P 35/00 (2006.01)
A 61 P 3/10 (2006.01)
A 61 P 37/00 (2006.01)
A 61 P 29/00 (2006.01)
A 61 P 9/00 (2006.01)
A 61 P 17/00 (2006.01)
A 61 P 13/12 (2006.01)
A 61 P 27/02 (2006.01)
A 61 P 25/00 (2006.01)
A 61 P 25/02 (2006.01)
A 61 P 35/02 (2006.01)
A 61 P 1/04 (2006.01)
A 61 P 19/02 (2006.01)
A 61 P 21/04 (2006.01)
A 61 P 5/14 (2006.01)
A 61 P 7/06 (2006.01)
A 61 P 17/06 (2006.01)
A 61 P 17/14 (2006.01)
A 61 P 3/00 (2006.01)
A 61 P 13/10 (2006.01)
A 61 P 15/00 (2006.01)
A 61 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)
A 6 1 P 21/00 (2006.01)
A 6 1 P 27/16 (2006.01)
A 6 1 P 13/08 (2006.01)
A 6 1 P 31/12 (2006.01)
A 6 1 P 31/04 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
A 6 1 P 7/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 215/36 C S P

A 6 1 K 31/47

C 0 7 D 417/12

A 6 1 K 31/4709

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 215/38

A 6 1 K 31/496

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 403/12

A 6 1 K 31/55

A 6 1 K 31/4725

A 6 1 K 31/506

C 0 7 D 409/12

C 0 7 D 487/04 1 3 6

C 0 7 D 491/113

A 6 1 K 31/5377

C 0 7 D 409/14

C 0 7 D 405/14

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 37/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/02

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 21/04

A 6 1 P 5/14

A 6 1 P 7/06

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 17/14

A 6 1 P 3/00

A 6 1 P 13/10

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 11/00
A 6 1 P 21/00
A 6 1 P 27/16
A 6 1 P 13/08
A 6 1 P 31/12
A 6 1 P 31/04
A 6 1 P 43/00 1 1 1
A 6 1 P 7/00

【手続補正書】

【提出日】平成26年3月27日(2014.3.27)

【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

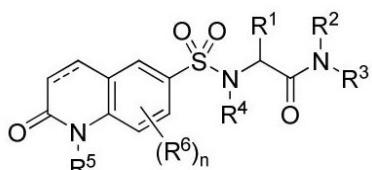
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I) :

【化1】



(I)

式中：

【化2】

は、単結合または二重結合を示し；

R¹は、環式もしくは非環式の、置換もしくは非置換の、分枝状もしくは非分枝状の脂肪族基；環式もしくは非環式の、置換もしくは非置換の、分枝状もしくは非分枝状のヘテロ脂肪族基；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；置換もしくは非置換の分枝状もしくは非分枝状アリールアルキル；または置換もしくは非置換の、分枝状もしくは非分枝状のヘテロアリールアルキルであり；

R²およびR³は、独立して環式もしくは非環式の、置換もしくは非置換の、分枝状もしくは非分枝状の脂肪族基；環式もしくは非環式の、置換もしくは非置換の、分枝状もしくは非分枝状のヘテロ脂肪族基；置換もしくは非置換の、分枝状もしくは非分枝状のアシル；置換もしくは非置換のアリール；置換もしくは非置換のヘテロアリール；置換もしくは非置換の、分枝状もしくは非分枝状のアリールアルキル；置換もしくは非置換の、分枝状もしくは非分枝状のヘテロアリールアルキル；-C(=O)R^B；-SOR^B；-SO₂R^B；または-C(R^B)₃であり；ここで、R^Bの各々の存在は、独立して水素；ハロゲン；保護基；脂肪族基；ヘテロ脂肪族基；アシル；アリール；ヘテロアリール；ヒドロキシル；アルコキシ；アリールオキシ；アミノ；アルキルアミノ；ジアルキルアミノ；またはヘテロアリールオキシであり；あるいは

R²およびR³は、随意に、介在する窒素と一緒にになって、飽和の、または不飽和の、置換されているか、または非置換の複素環部分を形成してもよく；

R⁴は、水素、C₁～₆脂肪族または保護基であり；

R^5 は、水素、 $C_{1\sim 6}$ 脂肪族または保護基であり；

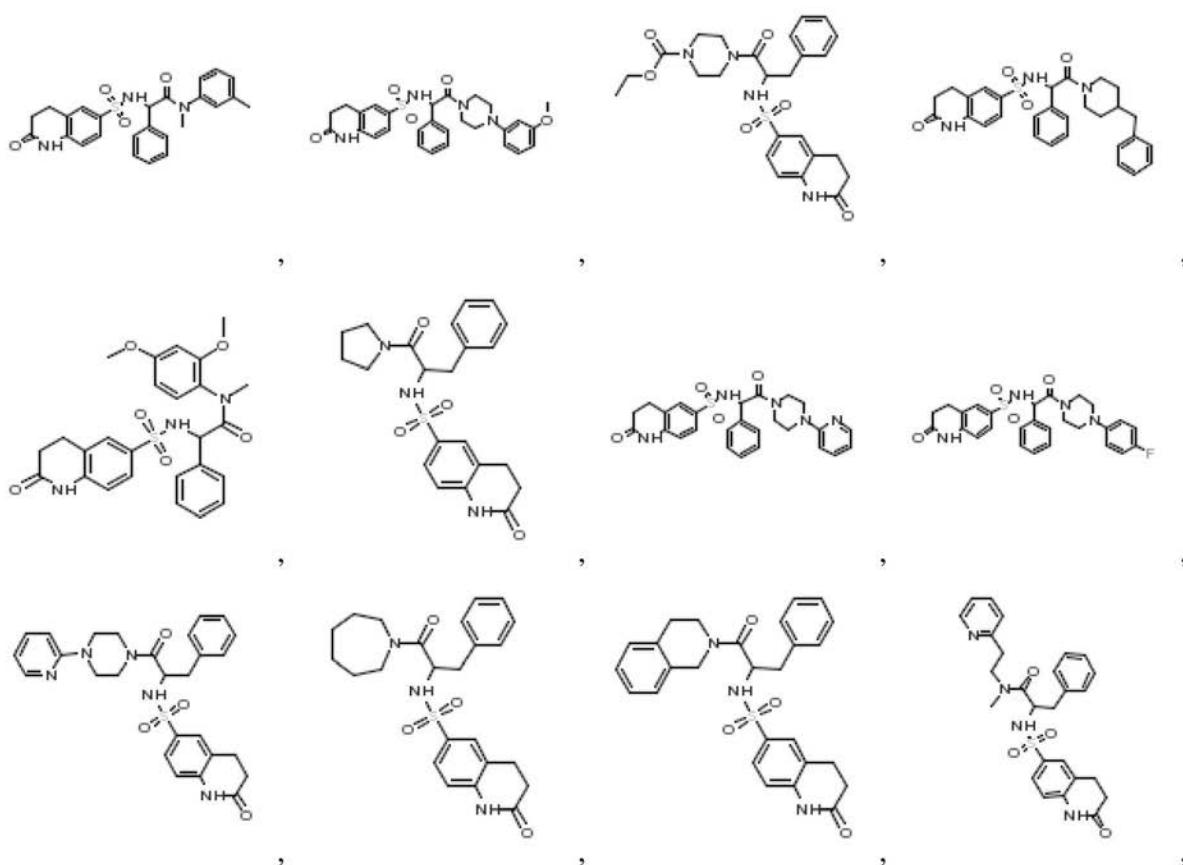
R^6 は、水素；ハロゲン；環式もしくは非環式の、置換もしくは非置換の、分枝状もしくは非分枝状の脂肪族基；環式もしくは非環式の、置換もしくは非置換の、分枝状もしくは非分枝状のヘテロ脂肪族基；置換もしくは非置換の、分枝状もしくは非分枝状のアシル；置換もしくは非置換の、分枝状もしくは非分枝状のアリール；置換もしくは非置換の、分枝状もしくは非分枝状のヘテロアリール； $-OR^F$ ； $-C(=O)R^F$ ； $-CO_2R^F$ ； $-C(=O)N(R^F)_2$ ； $-CN$ ； $-SCN$ ； $-SR^F$ ； $-SOR^F$ ； $-SO_2R^F$ ； $-NO_2$ ； $-N(R^F)_2$ ； $-NHCO(O)R^F$ ；または $-C(R^F)_3$ であり；ここで、 R^F の各々の存在は、独立して水素；ハロゲン；保護基；脂肪族基；ヘテロ脂肪族基；アシル；アリール部分；ヘテロアリール；ヒドロキシ；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオキシ；アリールチオキシ；アミノ；アルキルアミノ；ジアルキルアミノ；ヘテロアリールオキシ；またはヘテロアリールチオキシであり；また

n は、0、1、2 または 3 である、

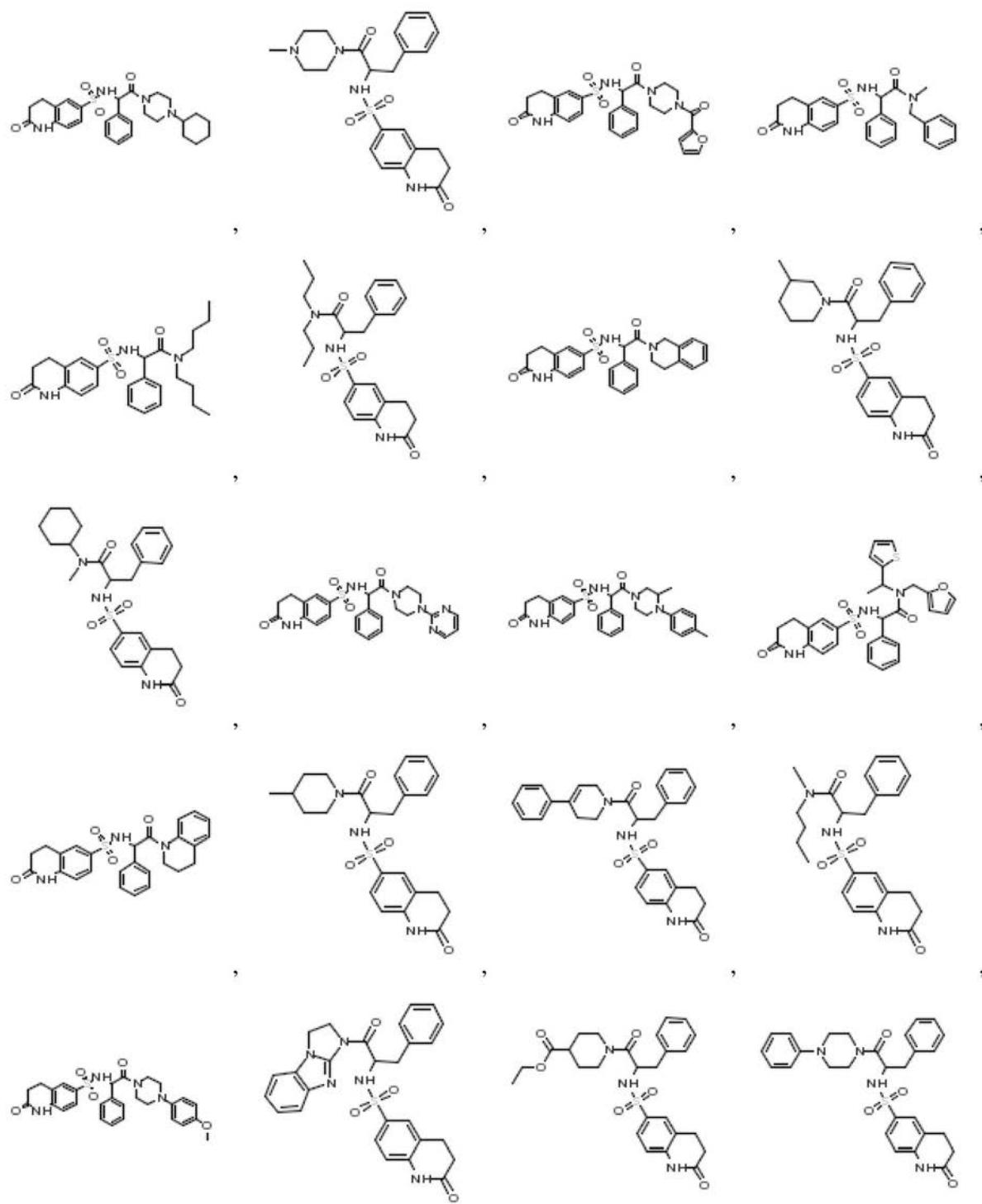
で表される化合物またはその薬学的に許容し得る塩であって、

式(I)で表される化合物が、以下のもの

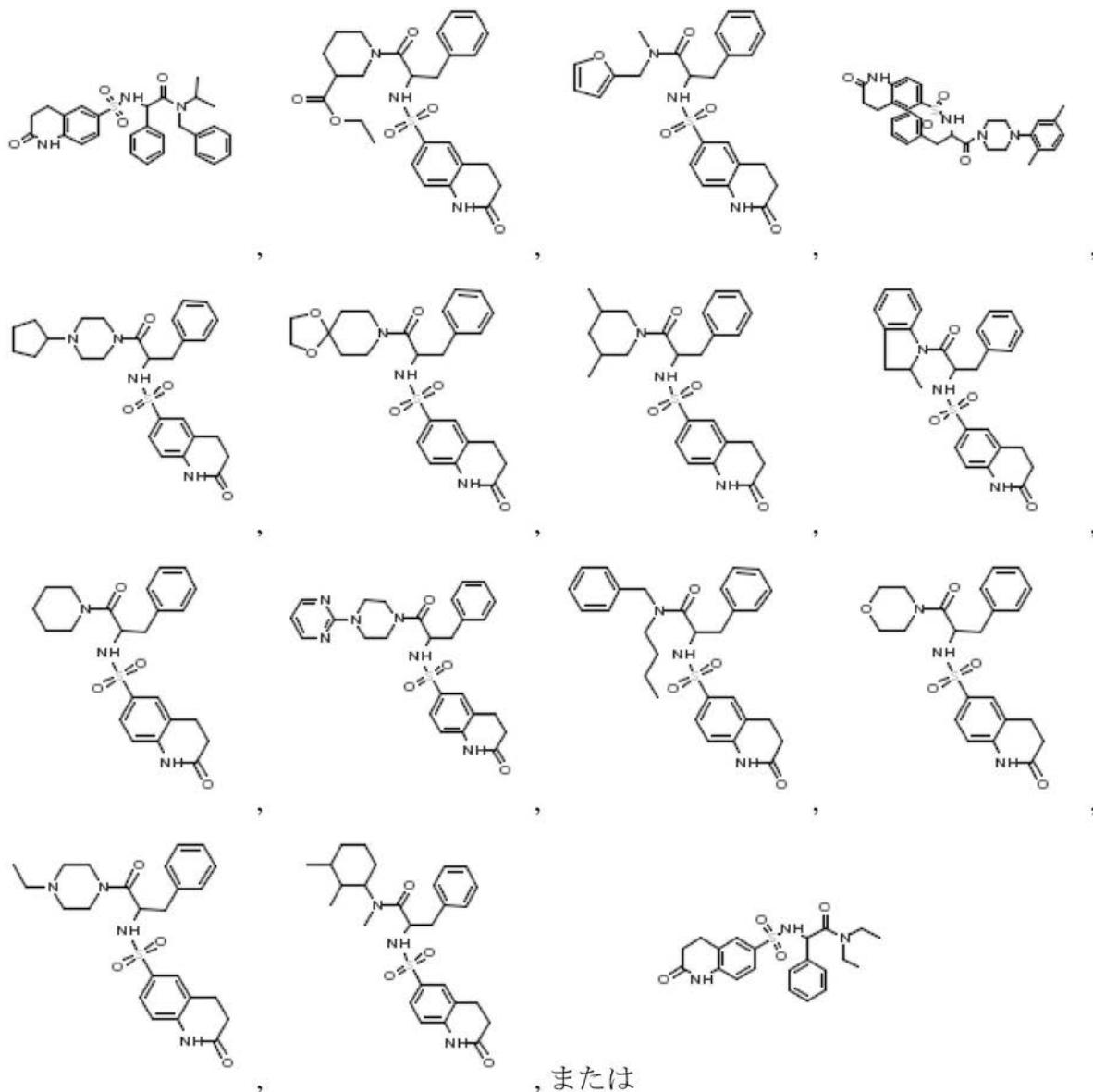
【化3】



【化 4】



【化 5】



の 1 種ではない、前記化合物。

【請求項2】

【化 6】

が単結合であり、R¹がフェニルまたはベンジルではない、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

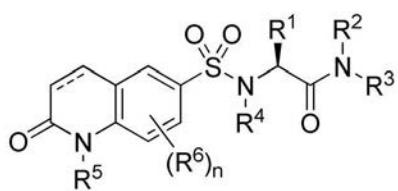
【化 7】

が二重結合である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項4】

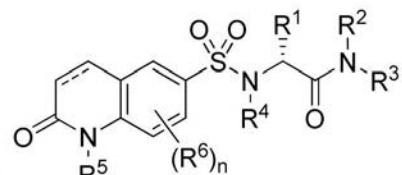
化合物が、式（I a）または（I b）：

【化 8】



または

(Ia)



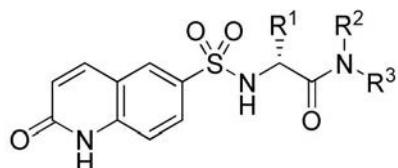
(Ib)

で表される立体化学を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

式 :

【化 9】



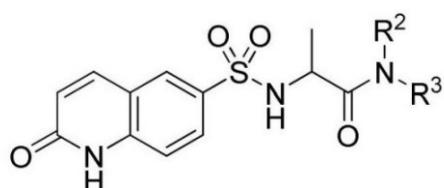
または

で表される、請求項 1 に記載の化合物。

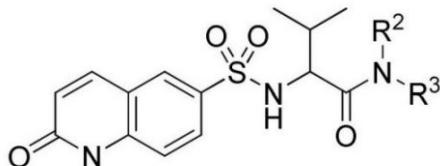
【請求項 6】

以下

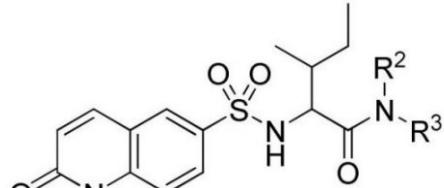
【化 10】



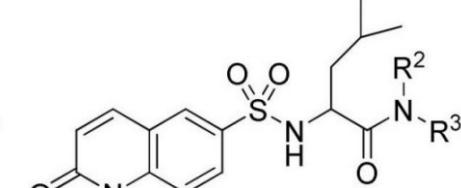
,



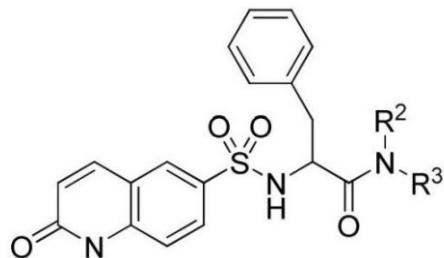
,



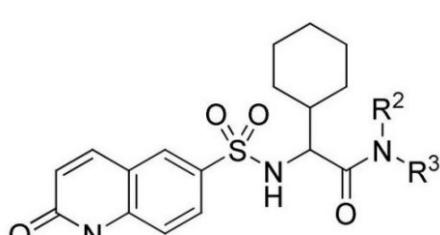
,



,

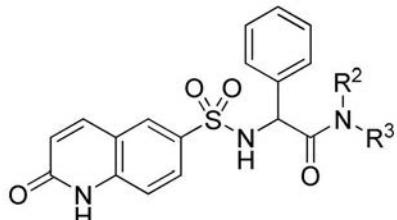
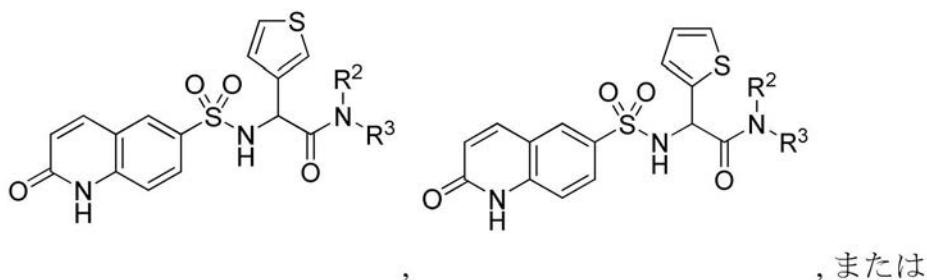


,



,

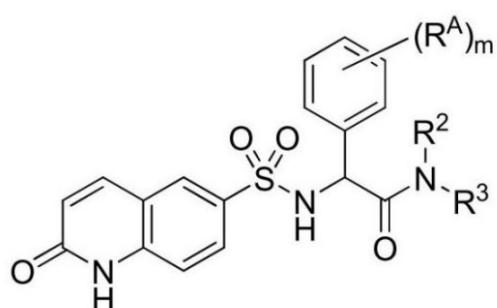
【化11】

から選択される式で表される、請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

式：

【化12】

式中、

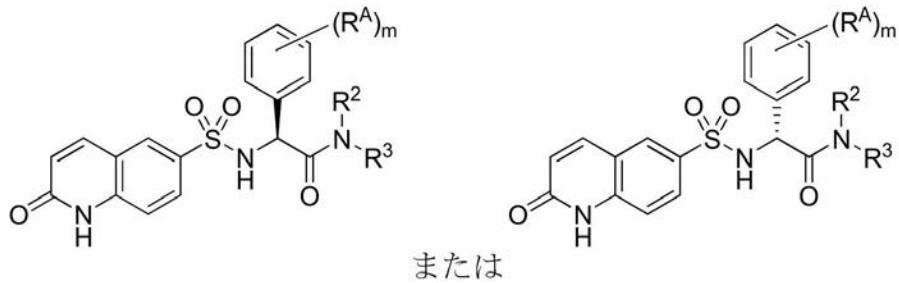
R^Aは、水素；ハロゲン；環式もしくは非環式の、置換もしくは非置換の、分枝状もしくは非分枝状の脂肪族基；環式もしくは非環式の、置換もしくは非置換の、分枝状もしくは非分枝状のヘテロ脂肪族基；置換もしくは非置換の、分枝状もしくは非分枝状のアシル；置換もしくは非置換の、分枝状もしくは非分枝状のアリール；置換もしくは非置換の、分枝状もしくは非分枝状のヘテロアリール；-OR；-C(=O)R；-CO₂R；-C(=O)N(R)₂；-CN；-SCN；-SR；-SOR；-SO₂R；-NO₂；-N(R)₂；-NHCO(O)R；または-C(R)₃であり；ここで、Rの各々の存在は、独立して水素；ハロゲン；保護基；脂肪族基；ヘテロ脂肪族基；アシル；アリール部分；ヘテロアリール；アルコキシ；アリールオキシ；アルキルチオキシ；アリールチオキシ；アミノ；アルキルアミノ；ジアルキルアミノ；ヘテロアリールオキシ；またはヘテロアリールチオキシであり；また

mは、0～5（両端を含む）である、で表される、請求項1に記載の化合物。

【請求項8】

化合物が、式：

【化13】



で表される立体化学を有する、請求項7に記載の化合物。

【請求項9】

R^Aがハロゲンであり、mが1である、請求項7に記載の化合物。

【請求項10】

R^Aがクロロである、請求項9に記載の化合物。

【請求項11】

R²およびR³が一緒になって複素環式環を形成する、請求項1に記載の化合物。

【請求項12】

R²およびR³が一緒になって6員環の複素環式環を形成する、請求項11に記載の化合物。

【請求項13】

R²およびR³が一緒になって、随意に置換されているピロリジン、ピペリジンまたはホモピペリジン環を形成する、請求項11または12に記載の化合物。

【請求項14】

R²およびR³が一緒になって、随意に置換されているピペラジン環を形成し、随意の置換基が、随意に置換されているアリールまたはヘテロアリール部分である、請求項11または12に記載の化合物。

【請求項15】

R²およびR³の少なくとも一方が、C₁~₆アルキル、C₁~₆ヘテロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アリールアルキルまたはヘテロアリールアルキルである、請求項1に記載の化合物。

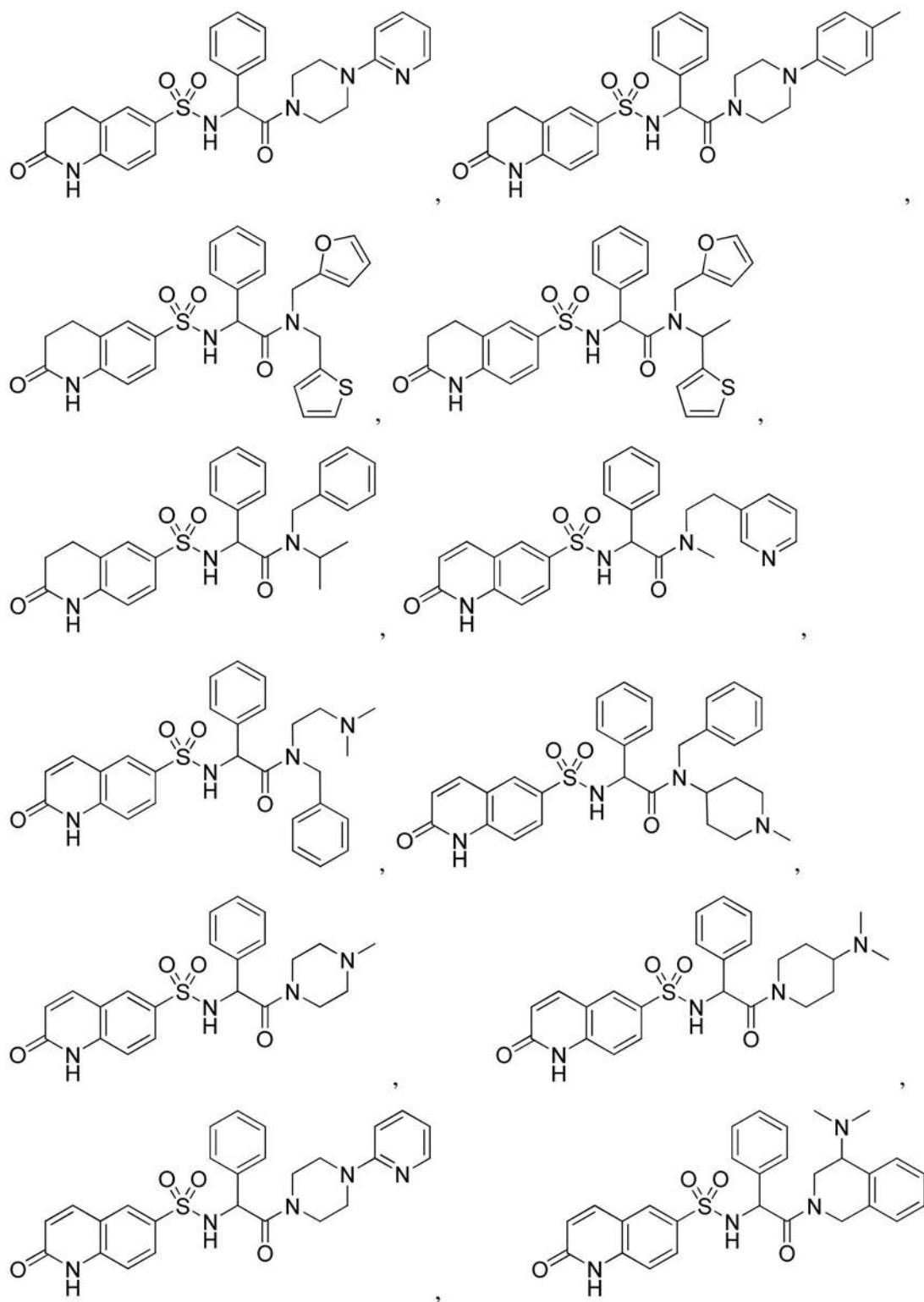
【請求項16】

R²およびR³の各々が、アリールアルキルまたはヘテロアリールアルキルである、請求項15に記載の化合物。

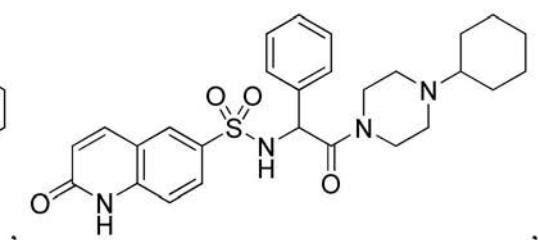
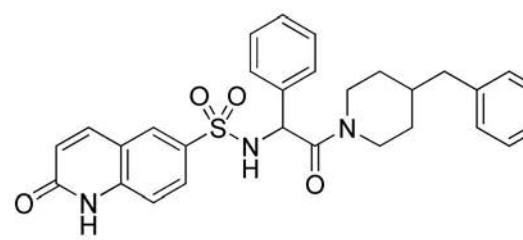
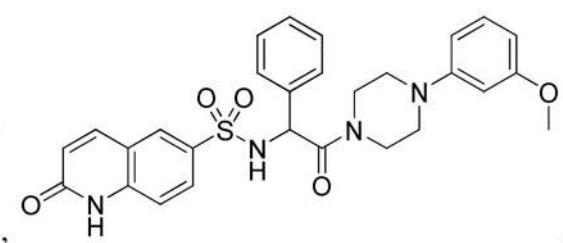
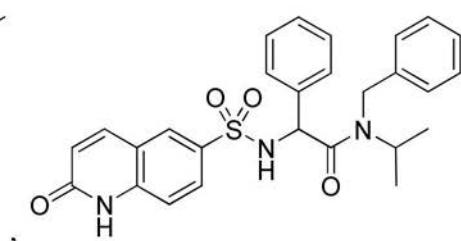
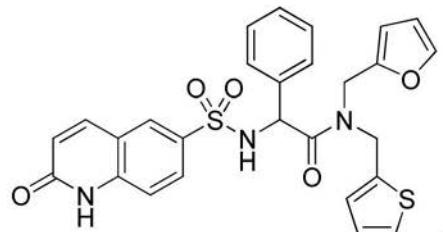
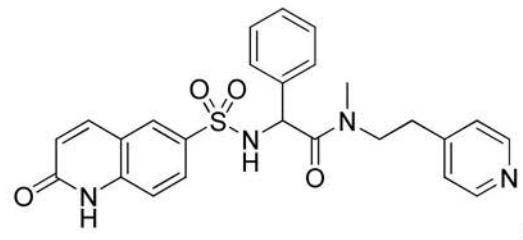
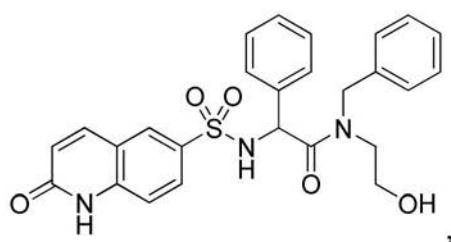
【請求項17】

以下の式：

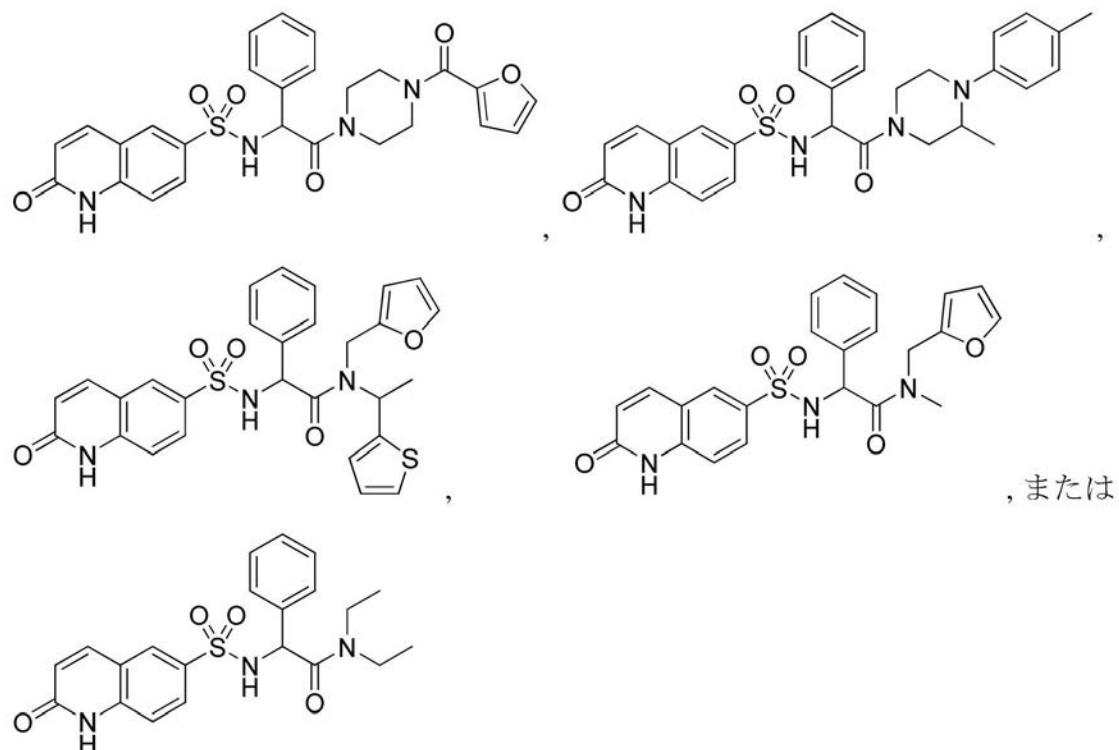
【化 1 4】



【化 15】



【化16】



を有する、請求項1に記載の化合物。

【請求項18】

請求項1～17のいずれか一項に記載の化合物の治療的に有効な量；および薬学的に許容し得る賦形剤を含む、医薬組成物。

【請求項19】

対象の体重に対して1日あたり0.001mg/kg～100mg/kgを送達するのに十分な量において投与される、請求項18に記載の組成物。

【請求項20】

対象におけるOGT関連疾患または状態を処置するための組成物であって、請求項1～17のいずれか一項に記載の化合物あるいは請求項18または19に記載の組成物の治療的に有効な量を含む、前記組成物。

【請求項21】

OGT関連疾患または状態が、神経変性疾患、癌、I型真性糖尿病、II型真性糖尿病、インスリン抵抗性、糖尿病の合併症、自己免疫疾患または炎症性疾患である、請求項20に記載の組成物。

【請求項22】

細胞におけるOGT活性を阻害するin vitro方法であって、細胞を請求項1～17のいずれか一項に記載の化合物あるいは請求項18または19に記載の組成物の有効な量と接触させて、OGTを阻害することを含む、前記方法。