

【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28年12月8日(2016.12.8)

【公表番号】特表2015-534990(P2015-534990A)

【公表日】平成27年12月7日(2015.12.7)

【年通号数】公開・登録公報2015-076

【出願番号】特願2015-538124(P2015-538124)

【国際特許分類】

C 0 7 D	417/04	(2006.01)
C 0 7 D	417/14	(2006.01)
A 6 1 K	31/427	(2006.01)
A 6 1 K	31/496	(2006.01)
A 6 1 K	31/454	(2006.01)
A 6 1 K	31/5377	(2006.01)
A 6 1 K	31/541	(2006.01)
A 6 1 K	45/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/00	(2006.01)
A 6 1 P	35/00	(2006.01)
A 6 1 P	25/28	(2006.01)
A 6 1 P	25/16	(2006.01)
A 6 1 P	25/04	(2006.01)
A 6 1 P	25/14	(2006.01)
A 6 1 P	25/02	(2006.01)
A 6 1 P	25/18	(2006.01)
A 6 1 K	31/551	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D	417/04	C S P
C 0 7 D	417/14	
A 6 1 K	31/427	
A 6 1 K	31/496	
A 6 1 K	31/454	
A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 K	31/541	
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/04	
A 6 1 P	25/14	
A 6 1 P	25/02	
A 6 1 P	25/18	
A 6 1 K	31/551	

【手続補正書】

【提出日】平成28年10月20日(2016.10.20)

【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

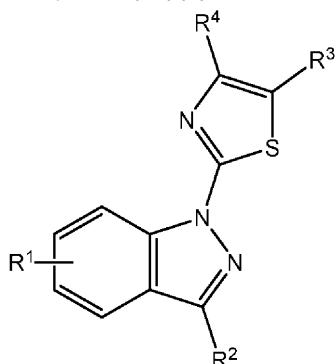
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I の化合物であって、



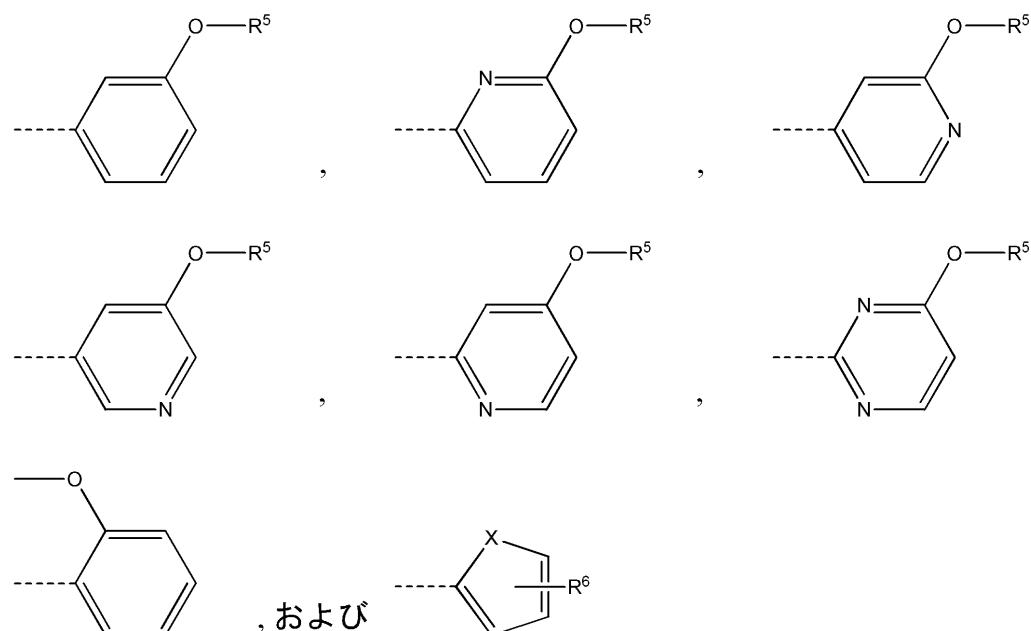
式 I

式中、R¹は、アルキル、ハロアルキル、ハライド、C1、CF₃、CF₂、アルコキシ、アリール、スルホン、スルホキシド、ニトリル、カルボキシ、カルボキサミド、カルバメート、ウレタン、アミド、スルファミド、環式アルキル、アミノ及びそれらの置換されていてもよい種から成る群より選択され、

R²は、カルボキシ、ヒドロキシ、アミノ、アミノカルボキサミド、アリール、ヘテロアリール、アルキル、アルキルカルボキシ、アルキルカルボキサミド及びそれらの置換されていてもよい種から成る群より選択され、

R³は、H、アルキル、ハロ、ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシル、アミノ又は置換アミノから成る群より選択され、

R⁴は、アリール、置換アリール、

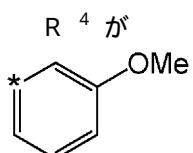


から成る群より選択され、ここで破線は、結合の場所を示し、

R⁵は、Hであるか、又は、それが結合される芳香環と同じ平面にとどまる基であり、かつ

R⁶は、水素、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシル又はアルコキシである、化合物
。

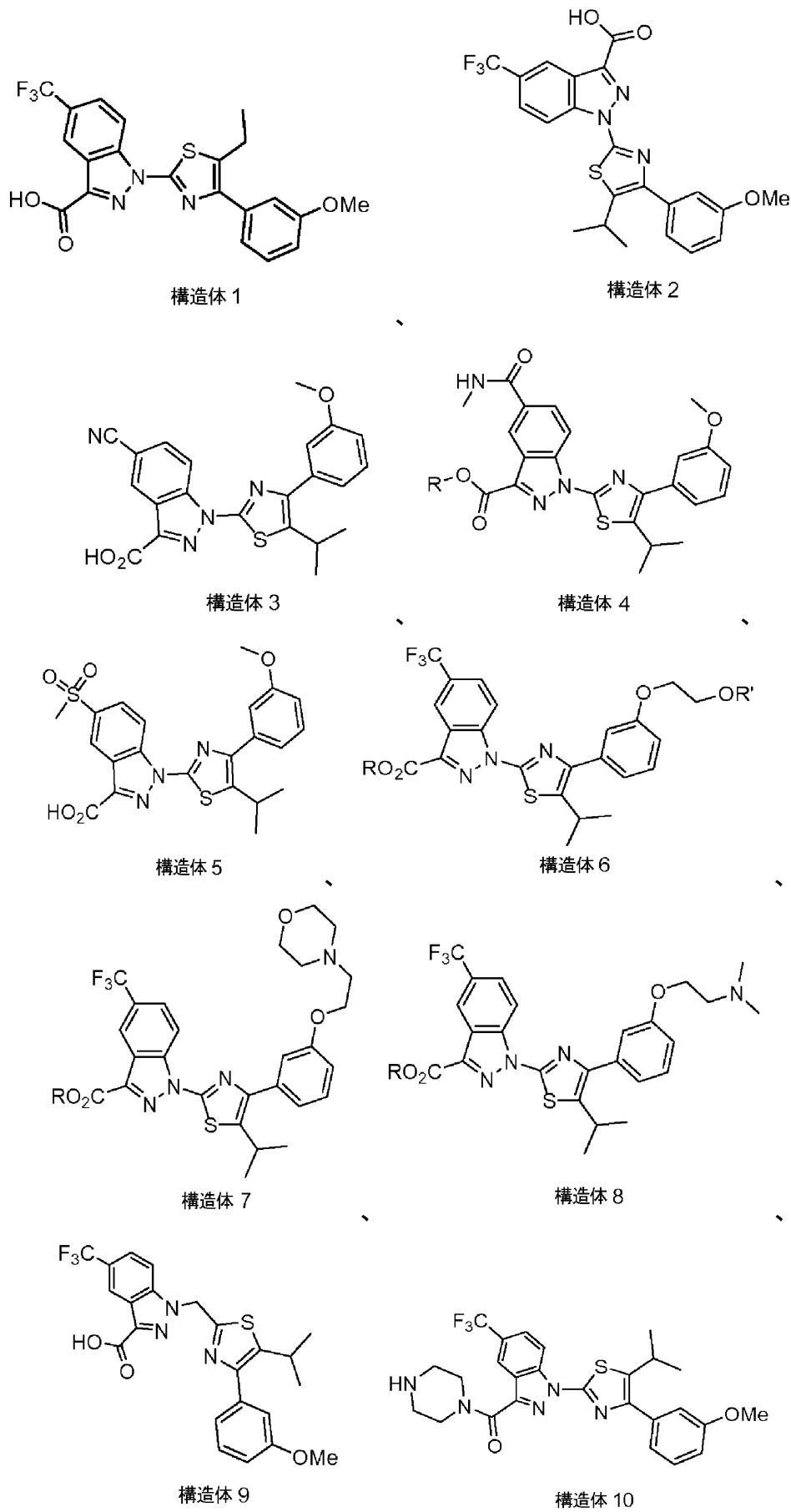
【請求項 2】

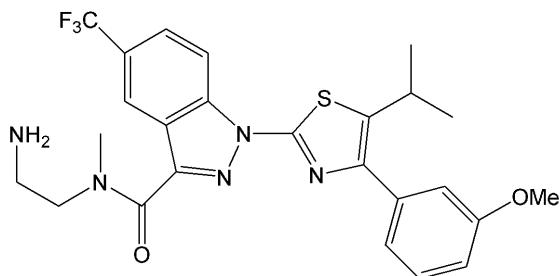


である、請求項 1 に記載の化合物。

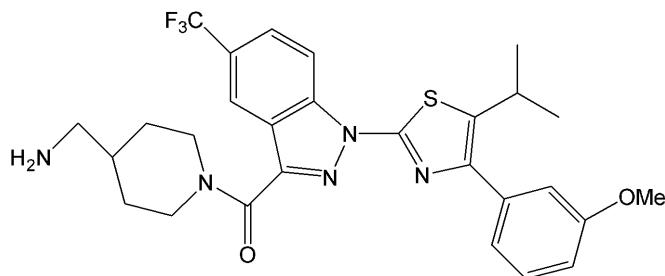
【請求項 3】

以下の構造体から成る群より選択される、請求項 1 に記載の化合物：

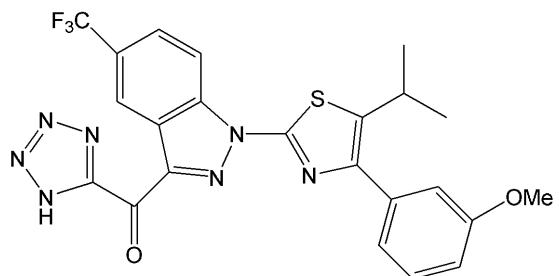




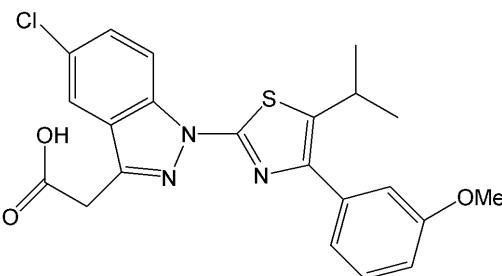
構造体 11



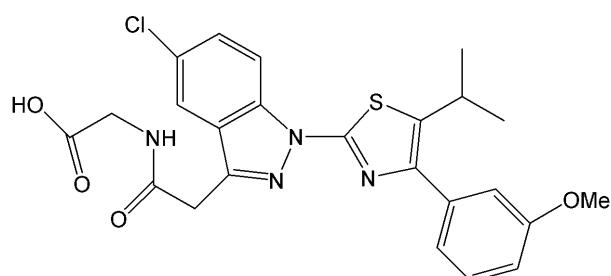
構造体 12



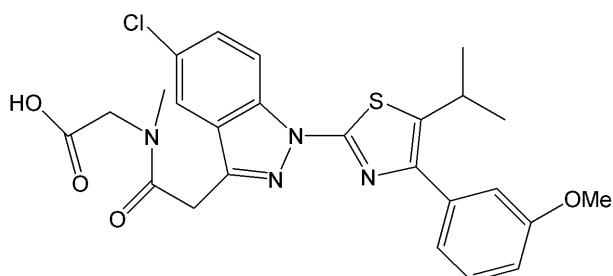
構造体 13



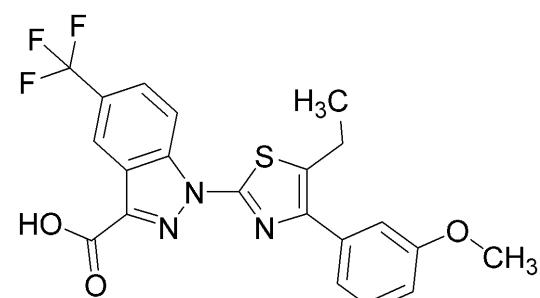
構造体 14



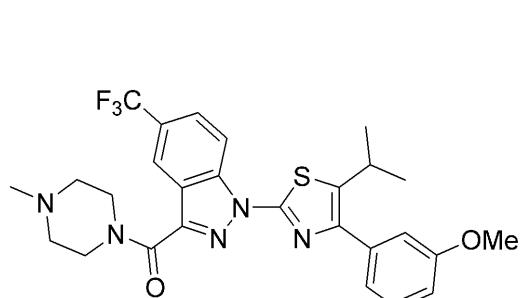
構造体 15



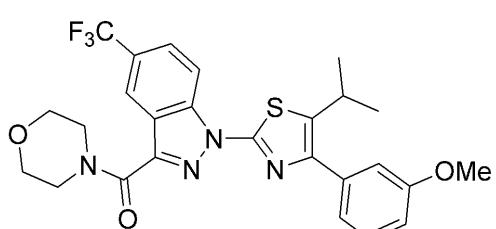
構造体 16



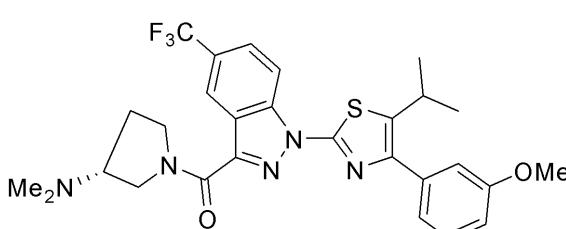
構造体 17



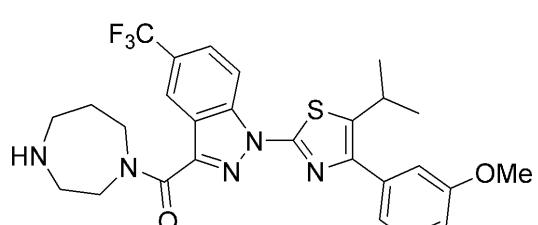
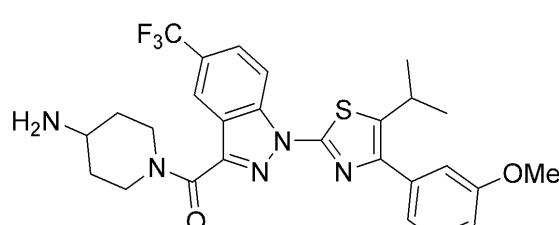
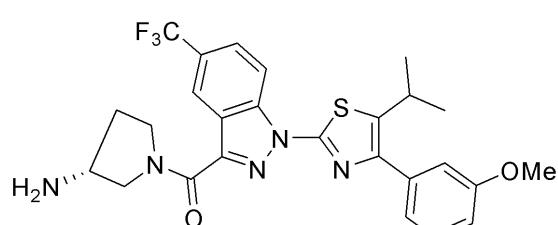
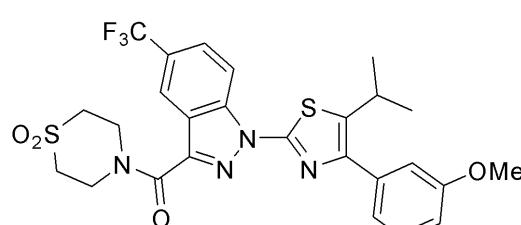
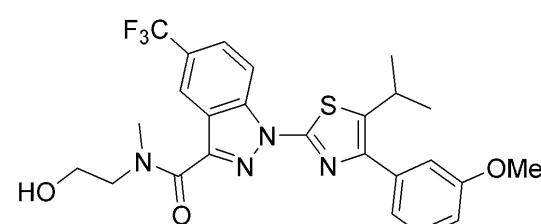
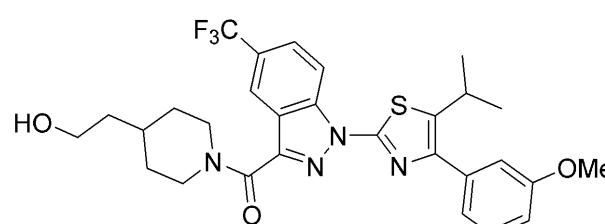
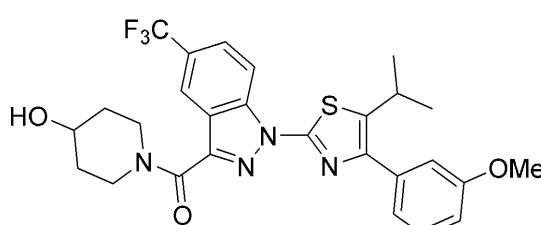
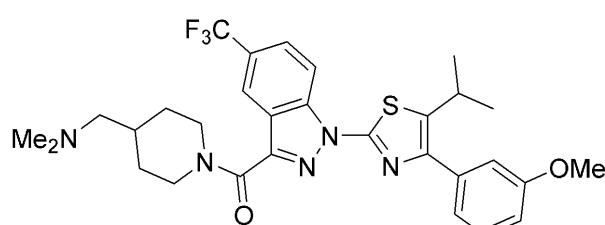
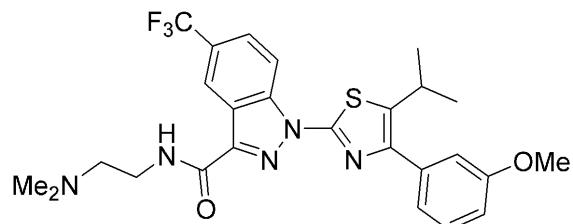
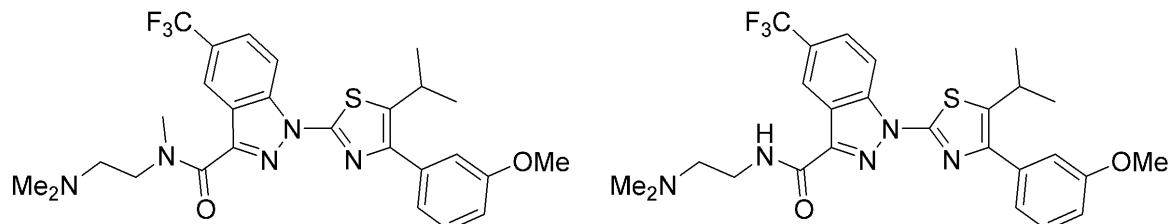
構造体 18

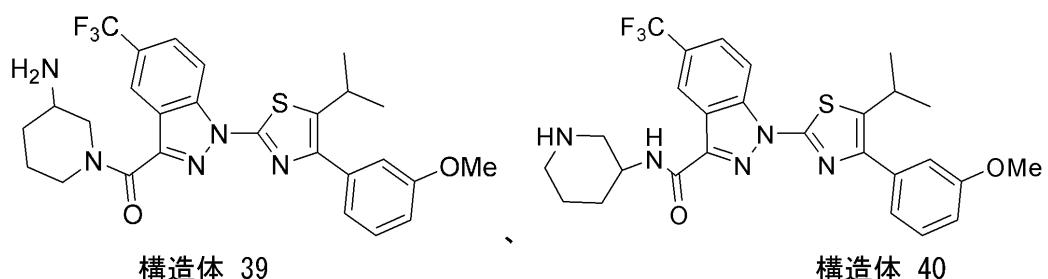
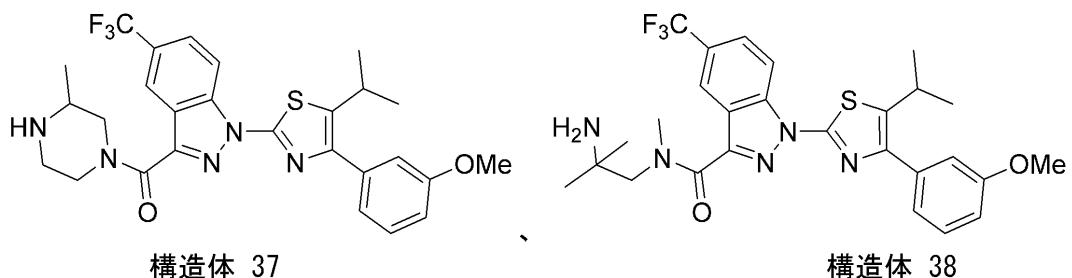
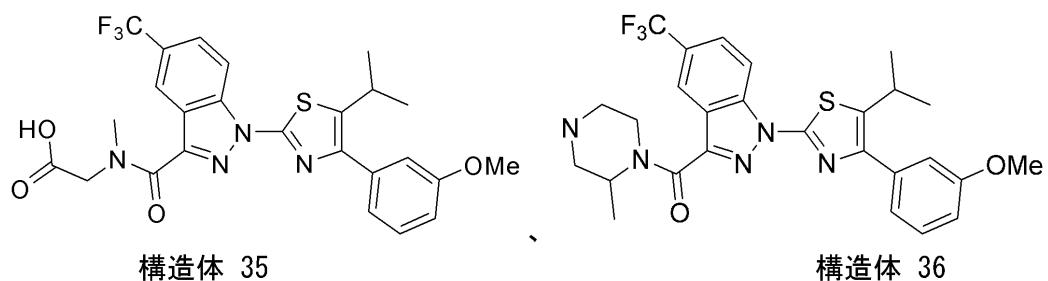
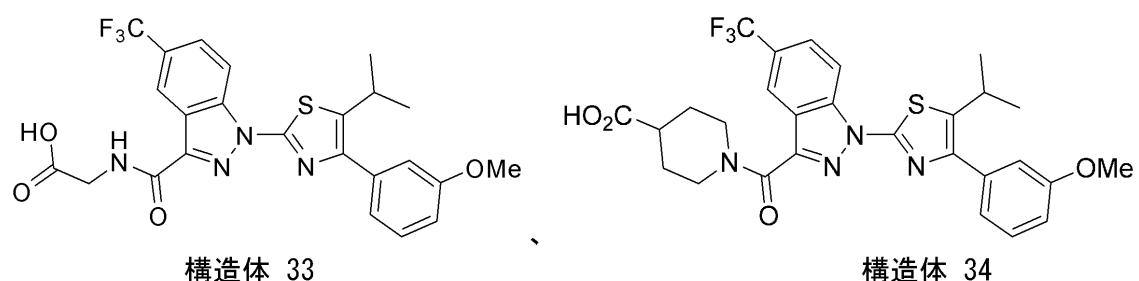
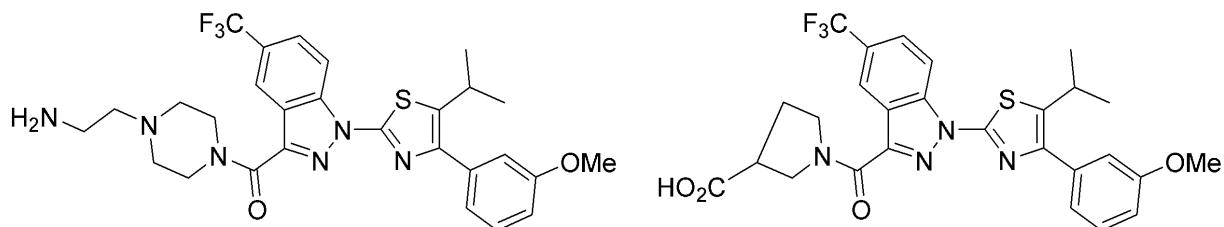


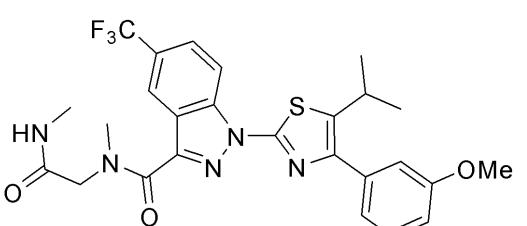
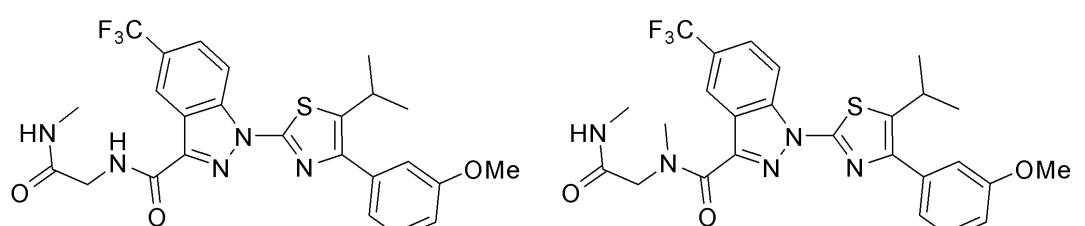
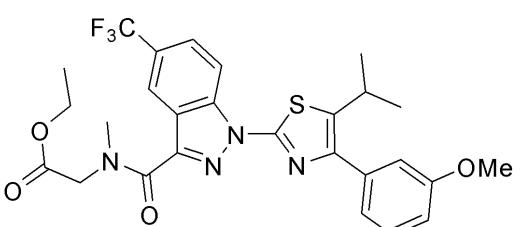
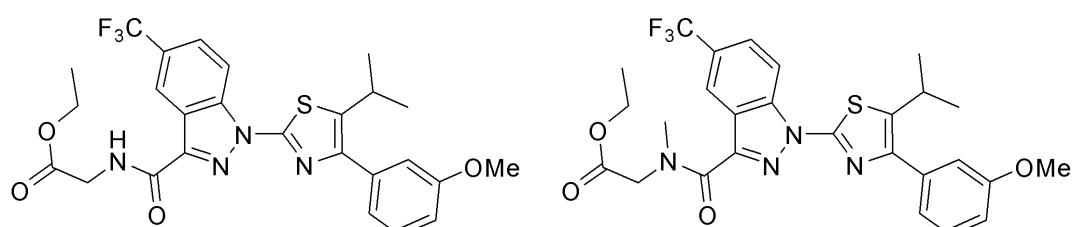
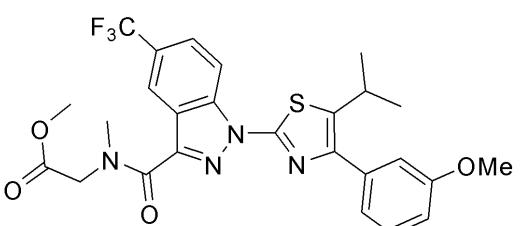
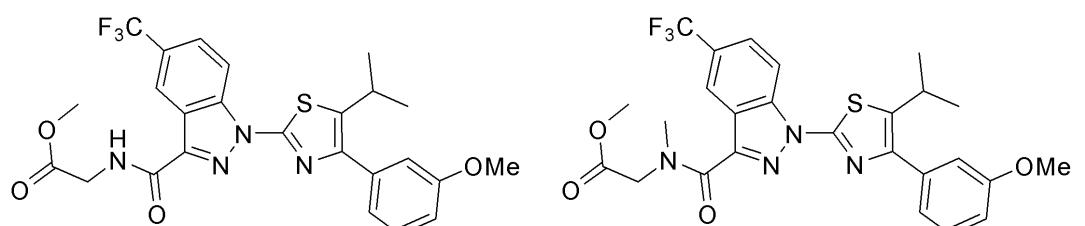
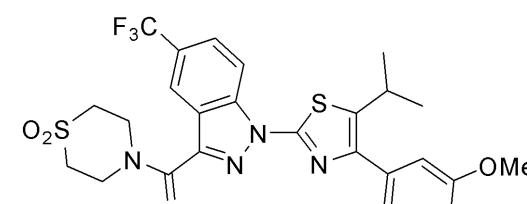
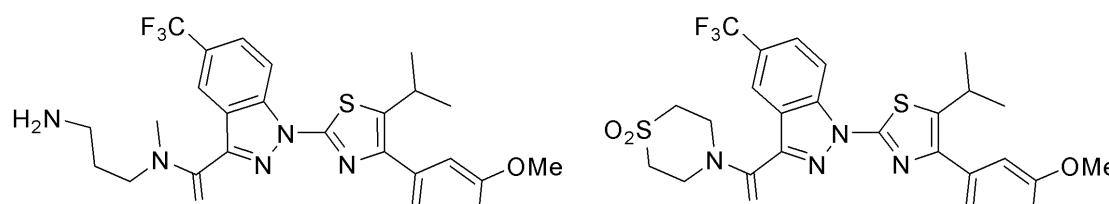
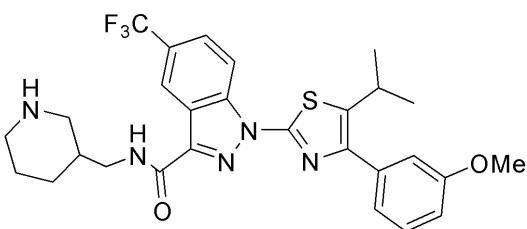
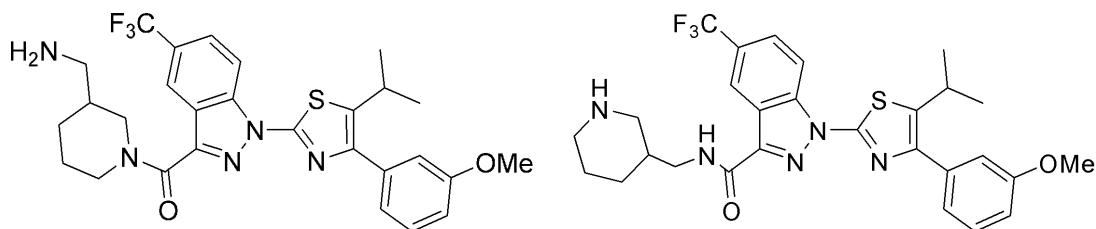
構造体 19

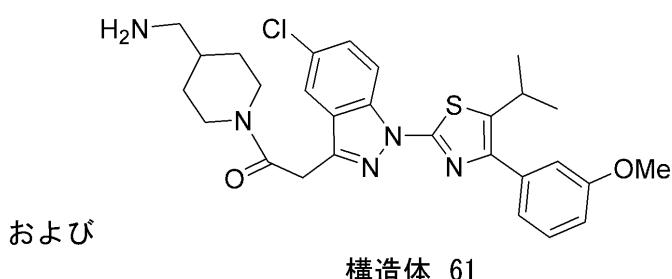
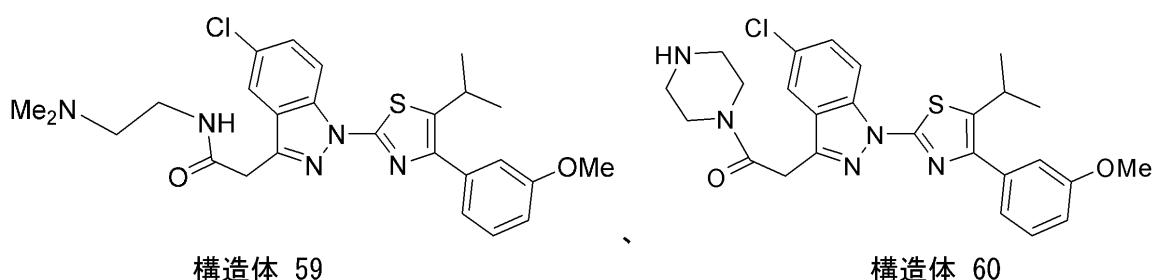
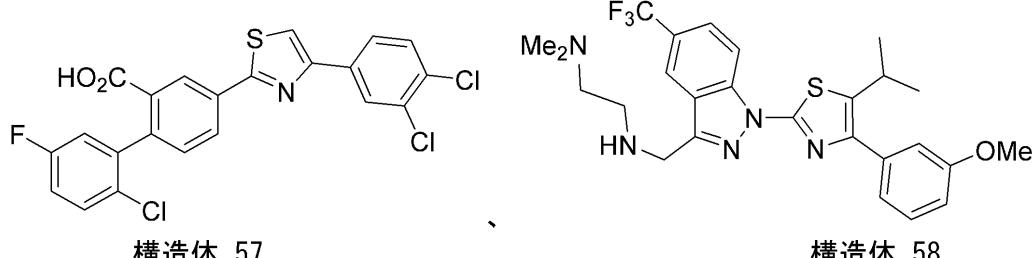
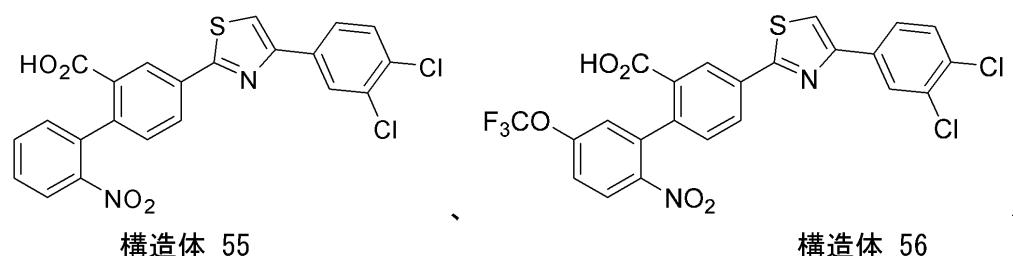
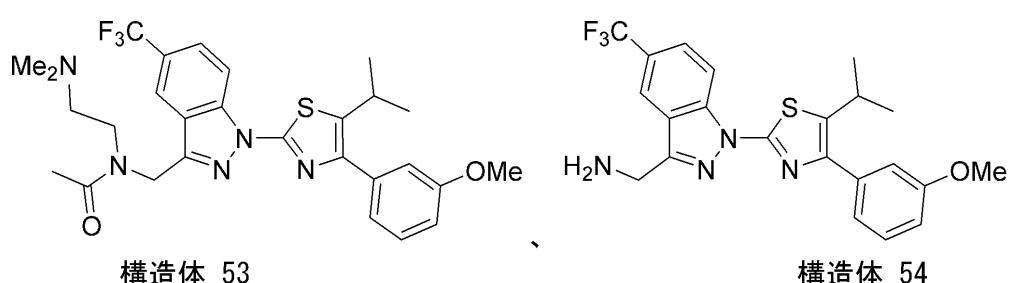
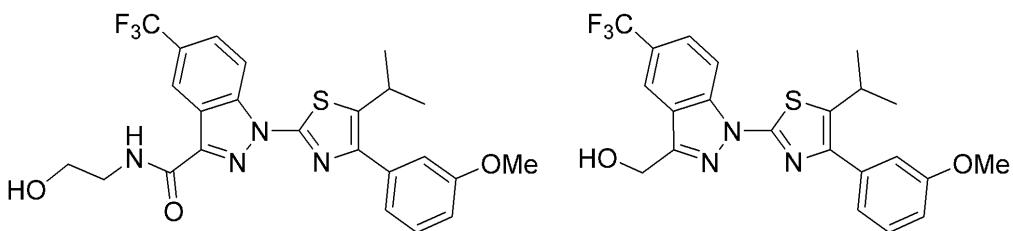


構造体 20







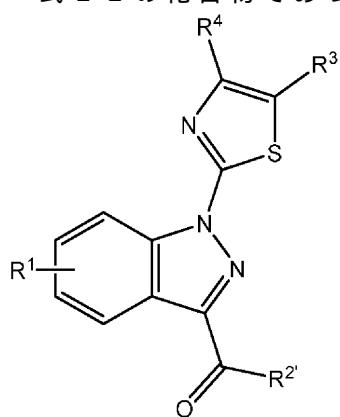


【請求項 4】

R^3 がアリールである場合に、 R^4 がHである、請求項1に記載の化合物。

【請求項 5】

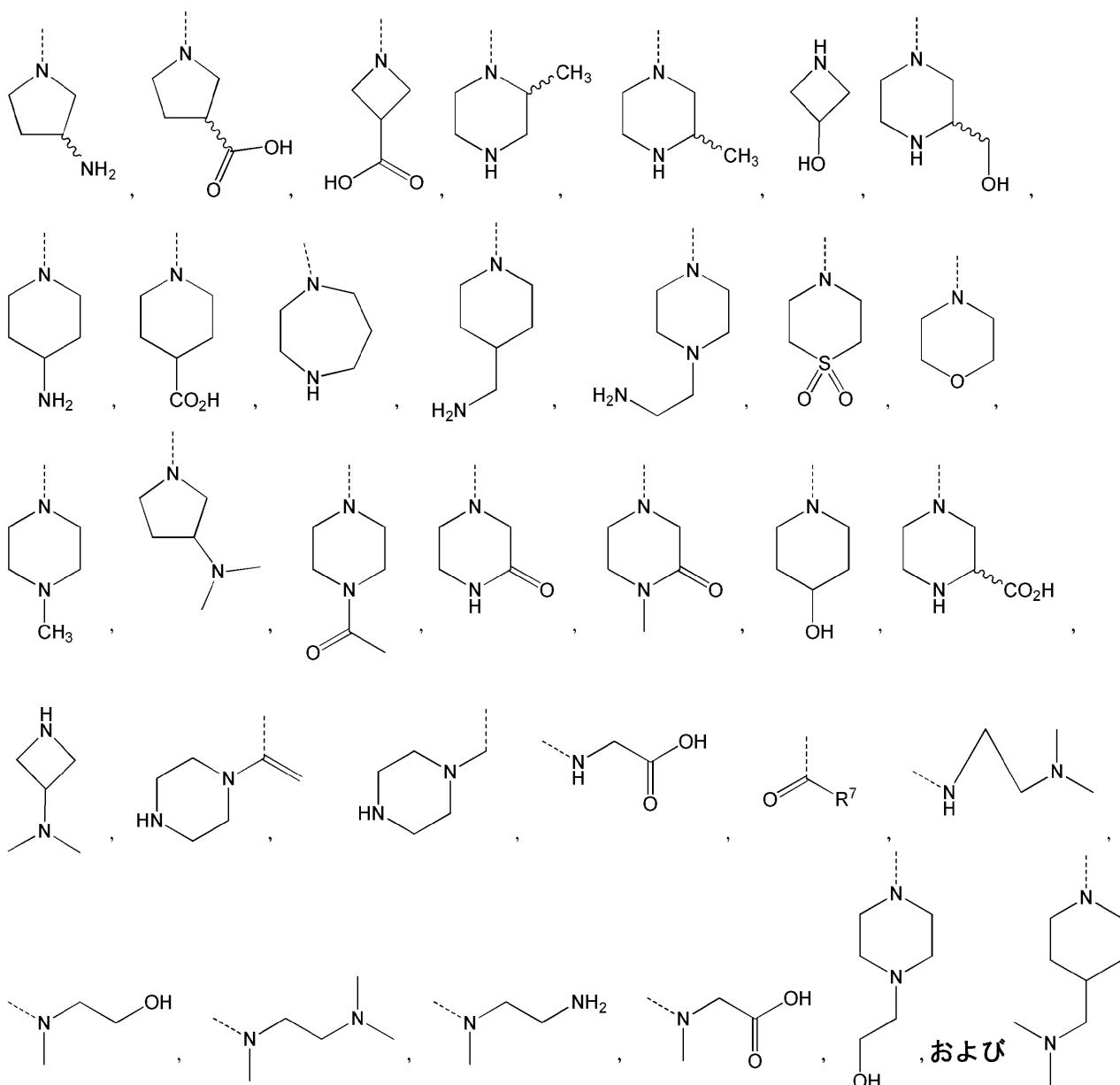
式IIの化合物であって、



式II

式中、 R^1 は、アルキル、ハロアルキル、ハライド、Cl、CF₃、CF₂、アルコキシ、アリール、スルホン、スルホキシド、ニトリル、カルボキシ、カルボキサミド、カルバメート、ウレタン、アミド、スルファミド、環式アルキル、アミノ及びそれらの置換されていてもよい種から成る群より選択され、

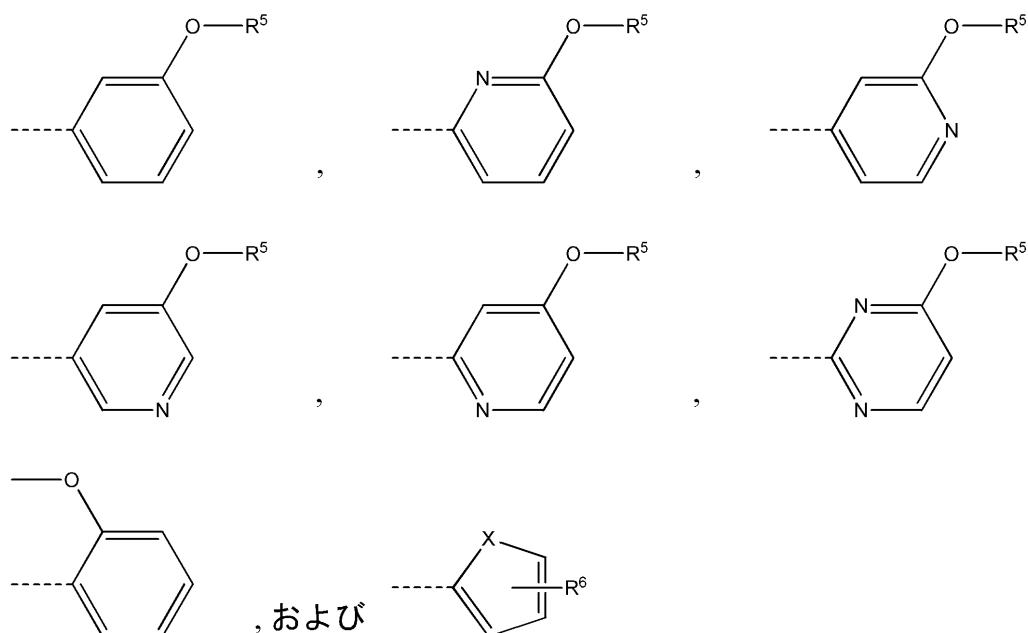
R^2' は、カルボキシ、ヒドロキシ、アミノ、アミノカルボキサミド、アリール、ヘテロアリール、アルキル、アルキルカルボキシ、アルキルカルボキサミド、



、並びにそれらの置換されてもよい種から成る群より選択され、ここで破線は、結合の場所を示し、

R^3 は、H、アルキル、ハロ、ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシリ、アミノ又は置換アミノから成る群より選択され、かつ

R^4 は、アリール、置換アリール、



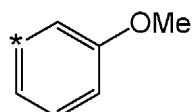
から成る群より選択され、ここで破線は、結合の場所を示し、

R⁵ は、Hであるか、又は、それが結合される芳香環と同じ平面にとどまる基であり、かつ

R⁶ は、水素、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシリル又はアルコキシである、化合物。

【請求項 6】

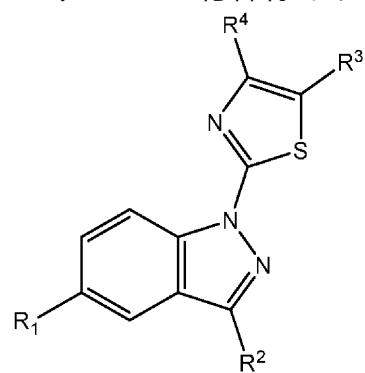
R⁴ が



である、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

式 I I I の化合物であって、



式III

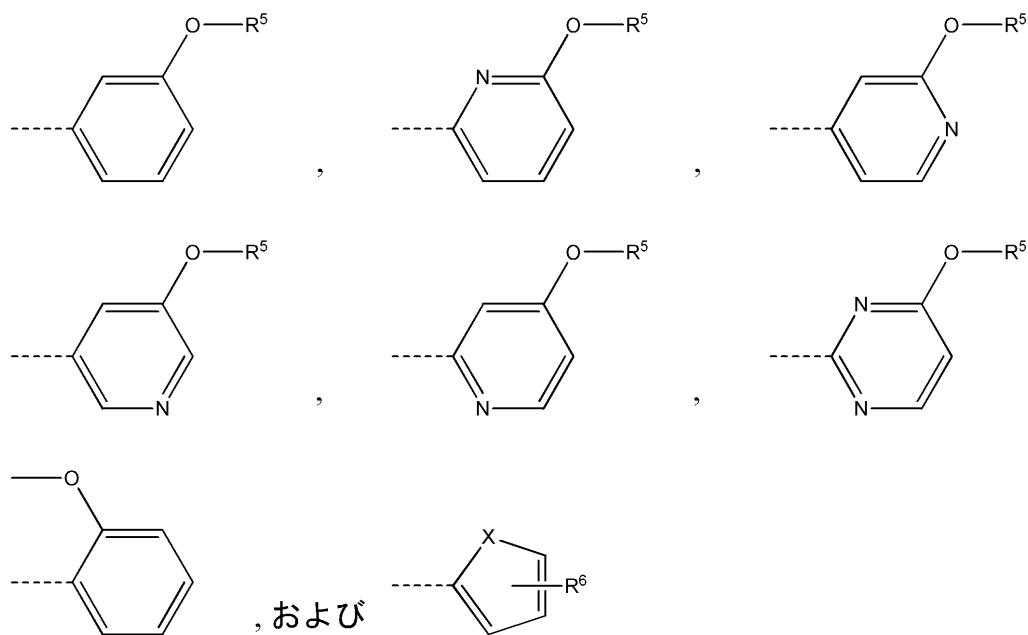
式中、R¹ は、アルキル、ハロアルキル、ハライド、C₁、C_F₃、C_F₂、アルコキシ、アリール、スルホン、スルホキシド、ニトリル、カルボキシ、カルボキサミド、カルバメート、ウレタン、アミド、スルファミド、環式アルキル、アミノ及びそれらの置換されていてもよい種から成る群より選択され、

R² は、カルボキシ、ヒドロキシ、アミノ、アミノカルボキサミド、アリール、ヘテロアリール、アルキル、アルキルカルボキシ、アルキルカルボキサミド及びそれらの置換されていてもよい種から成る群より選択され、

R³ は、H、アルキル、ハロ、ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ

ル、アミノ又は置換アミノから成る群より選択され、かつ

R⁴ は、アリール、置換アリール、



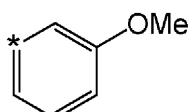
から成る群より選択され、ここで破線は、結合の場所を示し、

R⁵ は、Hであるか、又は、それが結合される芳香環と同じ平面にとどまる基であり、
かつ

R⁶ は、水素、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシリル又はアルコキシである、化合物
。

【請求項 8】

R⁴ が



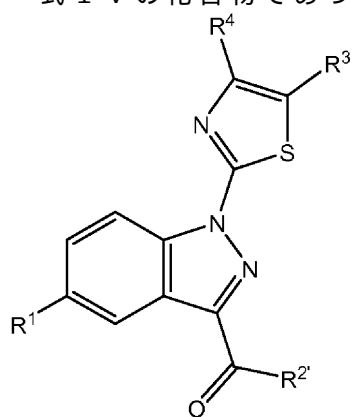
である、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

R¹ が、CN、CF₃ 及びCl から成る群より選択される、請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 10】

式 I V の化合物であって、

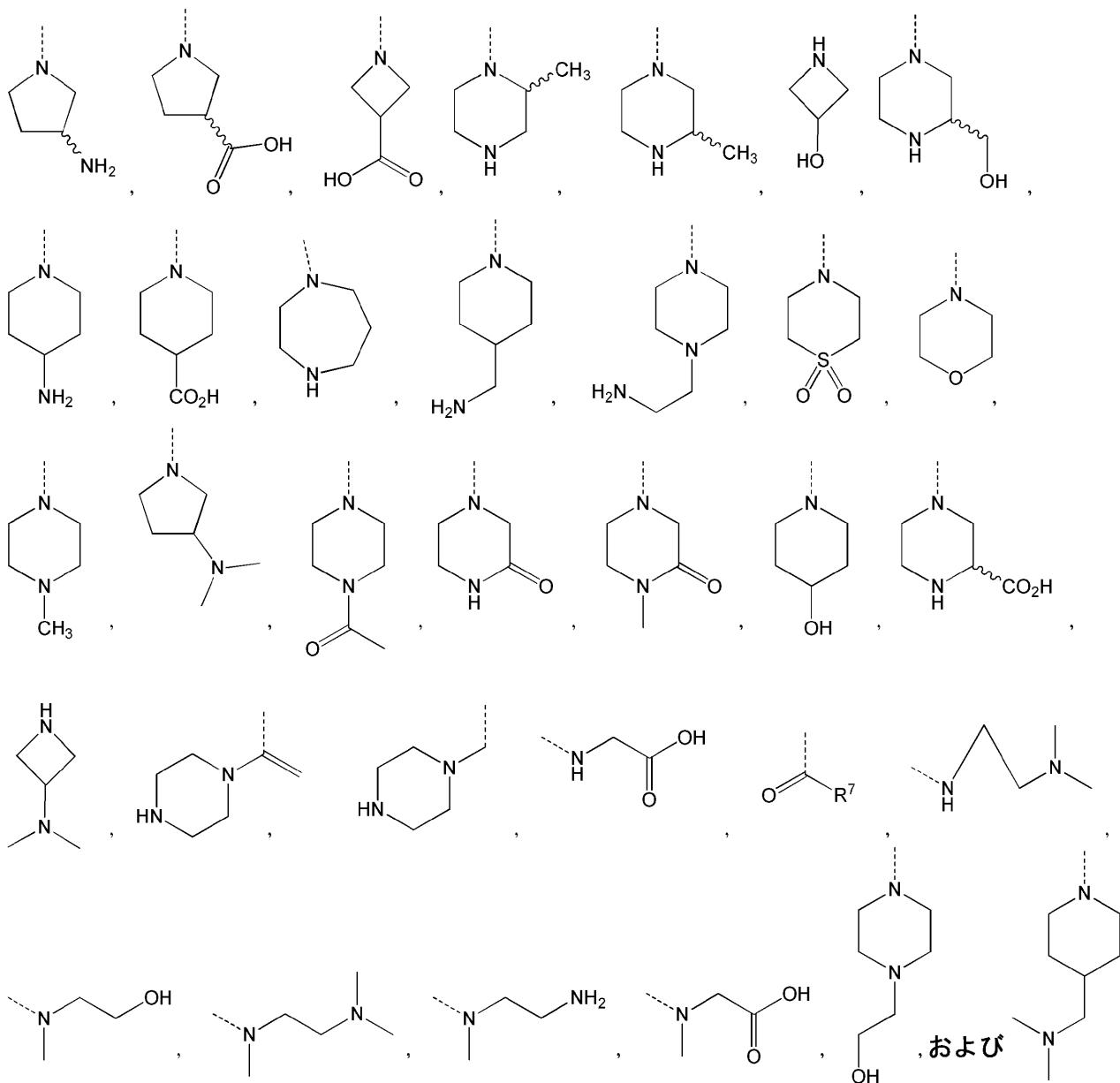


式IV

式中、R¹ は、アルキル、ハロアルキル、ハライド、Cl、CF₃、CF₂、アルコキシ、アリール、スルホン、スルホキシド、ニトリル、カルボキシ、カルボキサミド、カルバメート、ウレタン、アミド、スルファミド、環式アルキル、アミノ及びそれらの置換さ

れていてもよい種から成る群より選択され、

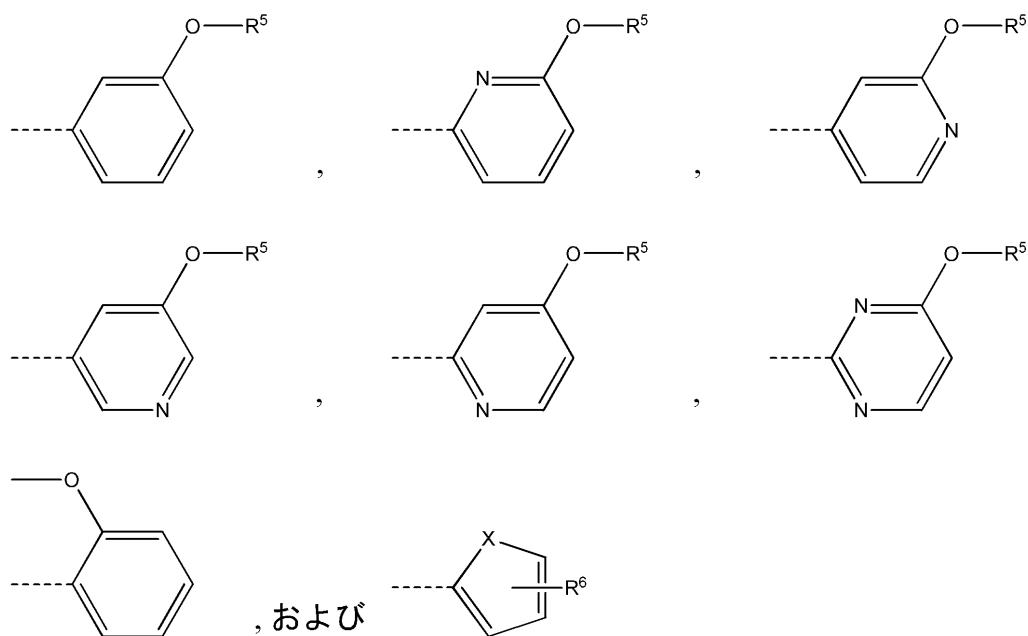
R^2' は、カルボキシ、ヒドロキシ、アミノ、アミノカルボキサミド、アリール、ヘテロアリール、アルキル、アルキルカルボキシ、アルキルカルボキサミド、



、並びにそれらの置換されてもよい種から成る群より選択され、ここで破線は、結合の場所を示し、

R^3 は、H、アルキル、ハロ、ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシル、アミノ又は置換アミノから成る群より選択され、かつ

R^4 は、アリール、置換アリール、



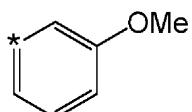
から成る群より選択され、ここで破線は、結合の場所を示し、

R⁵ は、Hであるか、又は、それが結合される芳香環と同じ平面にとどまる基であり、かつ

R⁶ は、水素、アルキル、ハロアルキル、ヒドロキシリル又はアルコキシである、化合物。

【請求項 1 1】

R⁴ が



である、請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 1 2】

請求項 1 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の化合物の有効量を含む、対象における過剰増殖性障害又は神経疾患若しくは障害を治療又は予防するための医薬組成物。

【請求項 1 3】

対象が、過剰増殖性障害又は神経疾患若しくは障害を発症していると診断されているか、又はこれを発症するリスクがある、請求項 1 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 4】

過剰増殖性障害が癌である、請求項 1 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

請求項 1 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の化合物を含む、医薬組成物。

【請求項 1 6】

請求項 1 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の化合物の有効量を含む、対象における自閉症を治療又は予防するための医薬組成物。

【請求項 1 7】

別の治療剤と組み合わせて投与されるように用いられる、請求項 1 6 に記載の医薬組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 1 1

【補正方法】変更

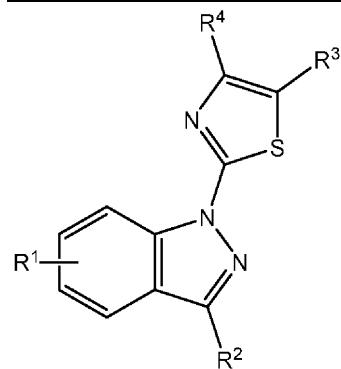
【補正の内容】

【0011】

一実施形態は、本明細書に記載される化合物の有効量を投与することを含む、自閉症スペクトラムの疾患又は障害を治療又は予防する方法に関する。特定の実施形態では、対象は、自閉症スペクトラムの疾患又は障害を発症していると診断されているか、又はこれを発症するリスクがある。特定の実施形態では、疾患又は障害は、自閉症である。特定の実施形態では、本化合物は、別の治療剤と組み合わせて投与される。

[本発明1001]

式Iの化合物であって、



式I

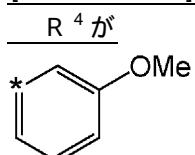
式中、R¹は、アルキル、ハロアルキル、ハライド、C₁、C_{F₃}、C_{F₂}、アルコキシ、アリール、スルホン、スルホキシド、ニトリル、カルボキシ、カルボキサミド、カルバメート、ウレタン、アミド、スルファミド、環式アルキル、アミノ及びそれらの置換されていてもよい種から成る群より選択され、

R²は、カルボキシ、ヒドロキシ、アミノ、アミノカルボキサミド、アリール、ヘテロアリール、アルキル、アルキルカルボキシ、アルキルカルボキサミド及びそれらの置換されていてもよい種から成る群より選択され、

R³は、H、アルキル、ハロ、ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシル、アミノ又は置換アミノから成る群より選択され、かつ

R⁴は、アリール、置換アリール及び表IIの置換基から成る群より選択される、化合物。

[本発明1002]



である、本発明1001の化合物。

[本発明1003]

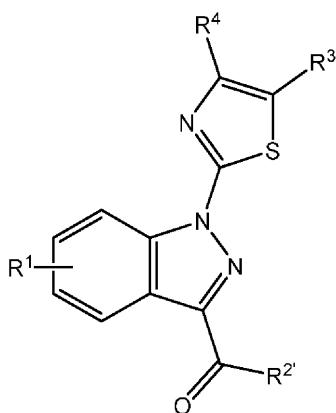
表IV及び図16の構造体から成る群より選択される、本発明1001の化合物。

[本発明1004]

R³がアリールである場合に、R⁴がHである、本発明1001の化合物。

[本発明1005]

式IIの化合物であって、



式II

式中、R¹は、アルキル、ハロアルキル、ハライド、C1、CF₃、CF₂、アルコキシ、アリール、スルホン、スルホキシド、ニトリル、カルボキシ、カルボキサミド、カルバメート、ウレタン、アミド、スルファミド、環式アルキル、アミノ及びそれらの置換されていてもよい種から成る群より選択され、

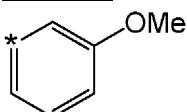
R^{2'}は、カルボキシ、ヒドロキシ、アミノ、アミノカルボキサミド、アリール、ヘテロアリール、アルキル、アルキルカルボキシ、アルキルカルボキサミド、表Iに記載される構造及びそれらの置換されていてもよい種から成る群より選択され、

R³は、H、アルキル、ハロ、ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシル、アミノ又は置換アミノから成る群より選択され、かつ

R⁴は、アリール、置換アリール及び表IIの置換基から成る群より選択される、化合物。

[本発明1006]

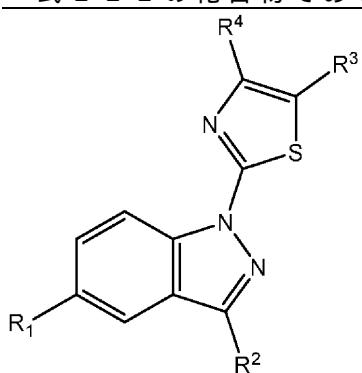
R⁴が



である、本発明1005の化合物。

[本発明1007]

式IIIの化合物であって、



式III

式中、R¹は、アルキル、ハロアルキル、ハライド、C1、CF₃、CF₂、アルコキシ、アリール、スルホン、スルホキシド、ニトリル、カルボキシ、カルボキサミド、カルバメート、ウレタン、アミド、スルファミド、環式アルキル、アミノ及びそれらの置換されていてもよい種から成る群より選択され、

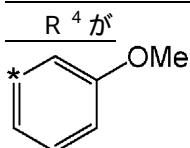
R²は、カルボキシ、ヒドロキシ、アミノ、アミノカルボキサミド、アリール、ヘテロアリール、アルキル、アルキルカルボキシ、アルキルカルボキサミド及びそれらの置換されていてもよい種から成る群より選択され、

R³は、H、アルキル、ハロ、ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシ

ル、アミノ又は置換アミノから成る群より選択され、かつ

R⁴は、アリール、置換アリール及び表Ⅱの置換基から成る群より選択される、化合物。

[本発明1008]



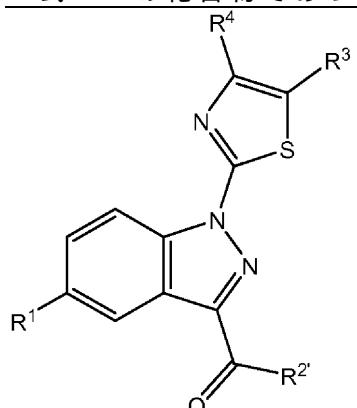
である、本発明1007の化合物。

[本発明1009]

R¹が、CN、CF₃及びClから成る群より選択される、本発明1007の化合物。

[本発明1010]

式IVの化合物であって、



式中、R¹は、アルキル、ハロアルキル、ハライド、Cl、CF₃、CF₂、アルコキシ、アリール、スルホン、スルホキシド、ニトリル、カルボキシ、カルボキサミド、カルバメート、ウレタン、アミド、スルファミド、環式アルキル、アミノ及びそれらの置換されていてもよい種から成る群より選択され、

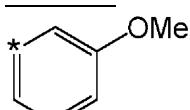
R^{2'}は、カルボキシ、ヒドロキシ、アミノ、アミノカルボキサミド、アリール、ヘテロアリール、アルキル、アルキルカルボキシ、アルキルカルボキサミド、表Ⅰに記載される構造及びそれらの置換されていてもよい種から成る群より選択され、

R³は、H、アルキル、ハロ、ハロアルキル、アリール、ヘテロアリール、ヒドロキシル、アミノ又は置換アミノから成る群より選択され、かつ

R⁴は、アリール、置換アリール及び表Ⅱの置換基から成る群より選択される、化合物。

[本発明1011]

R⁴が



である、本発明1010の化合物。

[本発明1012]

本発明1001～1011のいずれかの化合物の有効量を投与することを含む、過剰増殖性障害又は神経疾患若しくは障害を治療又は予防する方法。

[本発明1013]

対象が、過剰増殖性障害又は神経疾患若しくは障害を発症していると診断されているか、又はこれを発症するリスクがある、本発明1012の方法。

[本発明1014]

過剰増殖性障害が癌である、本発明1013の方法。

[本発明1015]

前記化合物が、別の治療剤と組み合わせて投与される、本発明1012の方法。

[本発明1016]

本発明1001～1011のいずれかの化合物を含む、医薬組成物。

[本発明1017]

過剰増殖性障害、神経変性疾患若しくは障害、又は自閉症の治療又は予防のための医薬を生産するための、本発明1001～1011のいずれかの化合物又は製剤の使用。

[本発明1018]

過剰増殖性障害が癌である、本発明1017の使用。

[本発明1019]

神経変性障害が、アルツハイマー病又はパーキンソン病である、本発明1017の使用。

[本発明1020]

本発明1001～1011のいずれかの化合物の有効量を投与することを含む、神経変性疾患又は障害を治療又は予防する方法。

[本発明1021]

対象が、神経変性疾患又は障害を発症していると診断されているか、又はこれを発症するリスクがある、本発明1020の方法。

[本発明1022]

神経変性疾患又は障害が、アルツハイマー病又はパーキンソン病である、本発明1020の方法。

[本発明1023]

前記化合物が、別の治療剤と組み合わせて投与される、本発明1020の方法。

[本発明1024]

本発明1001～1011のいずれかの化合物の有効量を投与することを含む、自閉症スペクトラムの疾患又は障害を治療又は予防する方法。

[本発明1025]

対象が、自閉症スペクトラムの疾患又は障害を発症していると診断されているか、又はこれを発症するリスクがある、本発明1024の方法。

[本発明1026]

疾患又は障害が、自閉症である、本発明1024の方法。

[本発明1027]

前記化合物が、別の治療剤と組み合わせて投与される、本発明1024の方法。