

【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】令和2年5月21日(2020.5.21)

【公表番号】特表2019-513804(P2019-513804A)

【公表日】令和1年5月30日(2019.5.30)

【年通号数】公開・登録公報2019-020

【出願番号】特願2018-554572(P2018-554572)

【国際特許分類】

C 07 D 401/04	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 37/02	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 19/08	(2006.01)
A 61 P 19/02	(2006.01)
A 61 P 17/06	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 1/04	(2006.01)
A 61 K 31/506	(2006.01)
C 07 D 407/14	(2006.01)
C 07 D 401/14	(2006.01)
A 61 K 31/53	(2006.01)
C 07 D 515/04	(2006.01)
A 61 K 31/5395	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 401/04	C S P
A 61 P 35/00	
A 61 P 37/02	
A 61 P 29/00	
A 61 P 19/08	
A 61 P 19/02	
A 61 P 17/06	
A 61 P 29/00	1 0 1
A 61 P 25/00	
A 61 P 1/04	
A 61 K 31/506	
C 07 D 407/14	
C 07 D 401/14	
A 61 K 31/53	
C 07 D 515/04	
A 61 K 31/5395	
A 61 P 43/00	1 0 5

【手続補正書】

【提出日】令和2年4月8日(2020.4.8)

【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

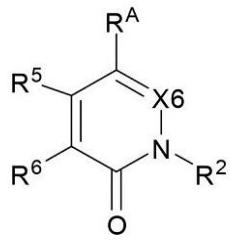
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式(I)の構造を有する化合物またはその薬学的に許容可能な塩であつて、
【化1】



式(I)

式中、

R²は、水素、アルキル、アリール、アラルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルであり、

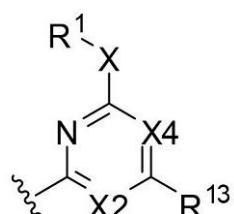
X₆は、C-H、C-F、C-Cl、C-Br、またはNであり、

R⁵は、水素、ハロゲン、-CN、アルキル、シクロアルキル、またはアルコキシであり、

R⁶は、水素、ハロゲン、-CN、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、-OR²₂、または-N(R²₂)₂であり、

R^Aは以下であり、

【化2】



R¹-Zは-Y-Zであり、

Yは単結合、-CH₂-、または-CH(C₁-C₄アルキル)-から選択され、

Zは、-SO₂R²₁、-N(R²₂)SO₂R²₁、-SO₂N(R²₂)₂、-N(R²₂)SO₂N(R²₂)₂、-CON(R²₂)₂、-N(R²₂)CO₂R²₁、-N(R²₂)CON(R²₂)₂、-N(R²₂)COR²₁、-COR²₁、-OC(O)N(R²₂)₂、-OSO₂N(R²₂)₂、-OSO₂R²₁、-N(R²₂)SO₃R²₁、-N(R²₂)₂、または-CNから選択され、

X₂はNまたはC-R¹₂であり、ここで、R¹₂は、水素、ハロゲン、-CN、アルキル、シクロアルキル、またはアルコキシであり、

X₄はNまたはC-R¹₄であり、ここで、R¹₄は水素、ハロゲン、-CN、アルキル、シクロアルキル、またはアルコキシであり、

Xは単結合、-O-、-S-、-N(R⁷)-、-CH₂-、-CF(H)-、-CF₂-、または-CH-(C₁-C₅アルキル)-であり、

R⁷はHまたはC₁-C₆アルキルであり、

R¹は、アルキル、アリール、アラルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルであり、

R²₁はそれぞれ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロア

リールアルキルから独立して選択され、

R^{2-2} はそれぞれ、水素、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルから独立して選択され、

ただし、式(I)の化合物が、N-[2-(2,4-ジフルオロフェノキシ)-6-(1,5-ジメチル-6-オキソピリジン-3-イル)ピリミジン-4-イル]エタンスルホンアミドではないとする、化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項2】

X₆はC-HまたはNである、請求項1に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項3】

R⁵は水素またはアルキルである、請求項1-2のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項4】

R⁶は水素またはメチルである、請求項1-3のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項5】

Yは単結合または-C H₂-から選択される、請求項1-4のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項6】

Zは-N(R²⁻²)SO₂R²⁻¹であり、あるいは、Zは-N(R²⁻²)CO₂R²⁻¹であり、R²⁻¹はアルキル、シクロアルキル、またはシクロアルキルアルキルであり、および、R²⁻²は水素またはアルキルである、請求項1-5のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項7】

Zは-SO₂R²⁻¹であり、R²⁻¹はアルキルである、請求項1-6のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項8】

X₂はNであり、X₄はC-Hであり、

X₄はNであり、X₂はC-Hであり、あるいは、

X₂はNであり、X₄はNである、請求項1-7のいずれか1つに記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項9】

Xは-O-または-C H₂-である、請求項1-8のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

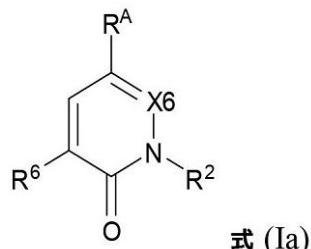
【請求項10】

R¹は、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルである、請求項1-9のいずれかに記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項11】

式(Ia)の構造を有し、

【化3】



式中、

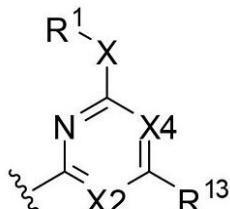
R²は、アルキル、アリール、アラルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルであり、

X₆はC-HまたはNであり、

R⁶は水素、ハロゲン、またはC₁-C₃アルキルであり、

R^Aは以下であり、

【化4】



R¹⁻³は-Y-Zであり、

Yは単結合、-CH₂-、または-CH(C₁-C₄アルキル)-から選択され、

Zは、-SO₂R²⁻¹、-N(R²⁻²)SO₂R²⁻¹、-SO₂N(R²⁻²)₂、-N(R²⁻²)SO₂N(R²⁻²)₂、-CON(R²⁻²)₂、-N(R²⁻²)CO₂R²⁻¹、

-N(R²⁻²)CON(R²⁻²)₂、-N(R²⁻²)COR²⁻¹、-COR²⁻¹、-OC

(O)N(R²⁻²)₂、-OSO₂N(R²⁻²)₂、または-N(R²⁻²)SO₃R²⁻¹

から選択され、

X₂はNまたはC-Hであり、

X₄はNまたはC-R¹⁻⁴であり、

R¹⁻⁴は、水素、ハロゲン、-CN、アルキル、シクロアルキル、またはアルコキシであり、

X₅は単結合、-O-、-N(R⁷)-、または-CH(C₁-C₅アルキル)-であり、

R⁷はHまたはC₁-C₆アルキルであり、

R¹は、アルキル、アリール、アラルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルであり、

R²⁻¹はそれぞれ、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルから独立して選択され、

R²⁻²はそれぞれ、水素、アルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、アリール、アラルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルから独立して選択され、

ただし、式(Ia)の化合物が、N-[2-(2,4-ジフルオロフェノキシ)-6-(1,5-ジメチル-6-オキソピリジン-3-イル)ピリミジン-4-イル]エタンスルホンアミドではないとする、請求項1に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項12】

ブタン-1-スルホン酸[2-(2-クロロ-6-メチル-フェノキシ)-6-(1,5-ジメチル-6-オキソ-1,6-ジヒドロ-ピリジン-3-イル)-ピリミジン-4-イル]-アミド；

プロパン-2-スルホン酸[2-(2,4-ジクロロ-6-メチル-フェノキシ)-6-(1,5-ジメチル-6-オキソ-1,6-ジヒドロ-ピリジン-3-イル)-ピリミジン-4-イル]-アミド；

ブタン-1-スルホン酸[2-(2-フルオロ-6-メチル-フェノキシ)-6-(1-メチル-6-オキソ-1,6-ジヒドロ-ピリジン-3-イル)-ピリミジン-4-イル]-アミド；

(S) - N - (2 - (2 - フルオロ - 6 - メチルフェノキシ) - 6 - (1 - メチル - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロピリジン - 3 -イル) ピリミジン - 4 -イル) ブタン - 2 - スルホニアミド;

(R) - N - (2 - (2 - フルオロ - 6 - メチルフェノキシ) - 6 - (1 - メチル - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロピリジン - 3 -イル) ピリミジン - 4 -イル) ブタン - 2 - スルホニアミド;

3 , 3 , 3 - トリフルオロ - プロパン - 1 - スルホン酸 [2 - (2 - フルオロ - 6 - メチル - フェノキシ) - 6 - (1 - メチル - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロ - ピリジン - 3 - イル) - ピリミジン - 4 -イル] - アミド; または、

4 , 4 , 4 - トリフルオロ - ブタン - 1 - スルホン酸 [2 - (2 - フルオロ - 6 - メチル - フェノキシ) - 6 - (1 - メチル - 6 - オキソ - 1 , 6 - ジヒドロ - ピリジン - 3 - イル) - ピリミジン - 4 -イル] - アミド

から選択される、化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 3】

請求項 1 または請求項 1 2 の化合物、あるいはその薬学的に許容可能な塩、および薬学的に許容可能な賦形剤を含む、医薬組成物。

【請求項 1 4】

炎症性または免疫性の障害、癌、あるいは腫瘍性疾患の処置で使用するための請求項 1 または請求項 1 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 5】

炎症性または免疫性の障害、癌、あるいは腫瘍性疾患の処置で使用するための請求項 1 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 6】

炎症性または免疫性の障害、癌、あるいは腫瘍性疾患は、強直性脊椎炎、乾癬、乾癬性関節炎、関節リウマチ、クローン病、あるいは多発性硬化症から選択される、請求項 1 4 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 1 7】

炎症性または免疫性の障害、癌、あるいは腫瘍性疾患は、強直性脊椎炎、乾癬、乾癬性関節炎、関節リウマチ、クローン病、あるいは多発性硬化症から選択される、請求項 1 5 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

T h 1 7 細胞機能阻害剤としての請求項 1 または請求項 1 2 に記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩。