

【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 07D 401/04 (2006.01)

A 61P 35/00 (2006.01)

A 61P 37/02 (2006.01)

A 61P 29/00 (2006.01)

A 61P 19/08 (2006.01)

A 61P 19/02 (2006.01)

A 61P 17/06 (2006.01)

A 61P 25/00 (2006.01)

A 61P 1/04 (2006.01)

A 61K 31/506 (2006.01)

C 07D 407/14 (2006.01)

C 07D 401/14 (2006.01)

A 61K 31/53 (2006.01)

C 07D 515/04 (2006.01)

A 61K 31/5395 (2006.01)

A 61P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 07D 401/04 C S P

A 61P 35/00

A 61P 37/02

A 61P 29/00

A 61P 19/08

A 61P 19/02

A 61P 17/06

A 61P 29/00 1 0 1

A 61P 25/00

A 61P 1/04

A 61K 31/506

C 07D 407/14

C 07D 401/14

A 61K 31/53

C 07D 515/04

A 61K 31/5395

A 61P 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

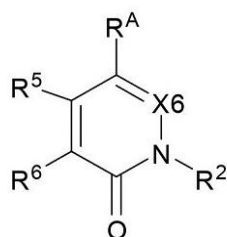
【補正の内容】

【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って、

【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、

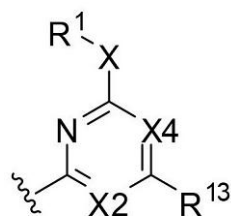
X⁶ は、C - H、C - F、C - Cl、C - Br、または N であり、

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、-OR^{2 2}、または-N(R^{2 2})₂であり、

R^A は以下であり、

【化 2】



R^{1 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、-SO₂R^{2 1}、-N(R^{2 2})SO₂R^{2 1}、-SO₂N(R^{2 2})₂、-N(R^{2 2})SO₂N(R^{2 2})₂、-CON(R^{2 2})₂、-N(R^{2 2})CO₂R^{2 1}、-N(R^{2 2})CON(R^{2 2})₂、-N(R^{2 2})COR^{2 1}、-COR^{2 1}、-OC(O)N(R^{2 2})₂、-OSO₂N(R^{2 2})₂、-OSO₂R^{2 1}、-N(R^{2 2})SO₃R^{2 1}、-N(R^{2 2})₂、または -CN から選択され、

X² は N または C - R^{1 2} であり、ここで、R^{1 2} 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 - R^{1 4} であり、ここで、R^{1 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、

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、

R^{2 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】

X 6 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】

R^5 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】

R^6 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 - CH₂ - 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 ($R^{2,2}$) SO₂ $R^{2,1}$ であり、あるいは、Z は - N ($R^{2,2}$) CO₂ $R^{2,1}$
であり、 $R^{2,1}$ 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、 $R^{2,2}$ 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 - SO₂ $R^{2,1}$ であり、 $R^{2,1}$ 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】

X 2 は N であり、X 4 は C - H であり、
X 4 は N であり、X 2 は C - H であり、あるいは、
X 2 は N であり、X 4 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 - CH₂ - 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。

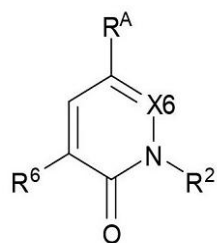
【請求項 10】

R^1 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 (I a) の構造を有し、

【化 3】



式 (Ia)

式中、

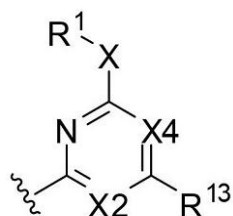
R^2 は、アルキル、アリール、アラルキル、シクロアルキル、シクロアルキルアルキル、ヘテロシクリル、ヘテロシクリルアルキル、ヘテロアリール、またはヘテロアリールアルキルであり、

X_6 は C - H または N であり、

R^6 は水素、ハロゲン、または $C_1 - C_3$ アルキルであり、

R^A は以下であり、

【化 4】



R^{13} は - Y - Z であり、

Y は単結合、- CH₂ -、または - CH ($C_1 - C_4$ アルキル) - から選択され、

Z は、- SO₂ R^{21} 、- N (R^{22}) SO₂ R^{21} 、- SO₂ N (R^{22})₂、- N (R^{22}) SO₂ N (R^{22})₂、- CON (R^{22})₂、- N (R^{22}) CO₂ R^{21} 、- N (R^{22}) CON (R^{22})₂、- N (R^{22}) COR²¹、- COR²¹、- OC (O) N (R^{22})₂、- OSO₂ N (R^{22})₂、または - N (R^{22}) SO₃ R^{21} から選択され、

X_2 は N または C - H であり、

X_4 は N または C - R^{14} であり、

R^{14} 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 -、- N (R^7) -、または - CH ($C_1 - C_5$ アルキル) - であり、

R^7 は H または $C_1 - C_6$ アルキルであり、

R^1 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、

R^{21} 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^{22} 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 a) 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 - スルホンアミド ;

(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 - スルホンアミド ;

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】

Th 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。