

【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29年8月17日(2017.8.17)

【公表番号】特表2016-528209(P2016-528209A)

【公表日】平成28年9月15日(2016.9.15)

【年通号数】公開・登録公報2016-055

【出願番号】特願2016-525833(P2016-525833)

【国際特許分類】

C 0 7 D 239/47	(2006.01)
C 0 7 D 239/52	(2006.01)
A 6 1 K 31/506	(2006.01)
C 0 7 D 239/48	(2006.01)
C 0 7 D 487/04	(2006.01)
C 0 7 D 403/12	(2006.01)
C 0 7 D 519/00	(2006.01)
A 6 1 K 31/519	(2006.01)
C 0 7 D 401/12	(2006.01)
C 0 7 D 417/12	(2006.01)
A 6 1 P 35/00	(2006.01)
A 6 1 P 29/00	(2006.01)
A 6 1 P 35/02	(2006.01)
A 6 1 P 37/06	(2006.01)
A 6 1 P 17/06	(2006.01)
A 6 1 P 17/02	(2006.01)
A 6 1 P 27/02	(2006.01)
A 6 1 P 43/00	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D 239/47	Z
C 0 7 D 239/52	C S P
A 6 1 K 31/506	
C 0 7 D 239/48	
C 0 7 D 487/04	1 4 0
C 0 7 D 403/12	
C 0 7 D 519/00	3 0 1
A 6 1 K 31/519	
C 0 7 D 401/12	
C 0 7 D 487/04	1 4 4
C 0 7 D 417/12	
A 6 1 P 35/00	
A 6 1 P 29/00	
A 6 1 P 35/02	
A 6 1 P 37/06	
A 6 1 P 17/06	
A 6 1 P 17/02	
A 6 1 P 27/02	
A 6 1 P 43/00	1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成29年7月3日(2017.7.3)

## 【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

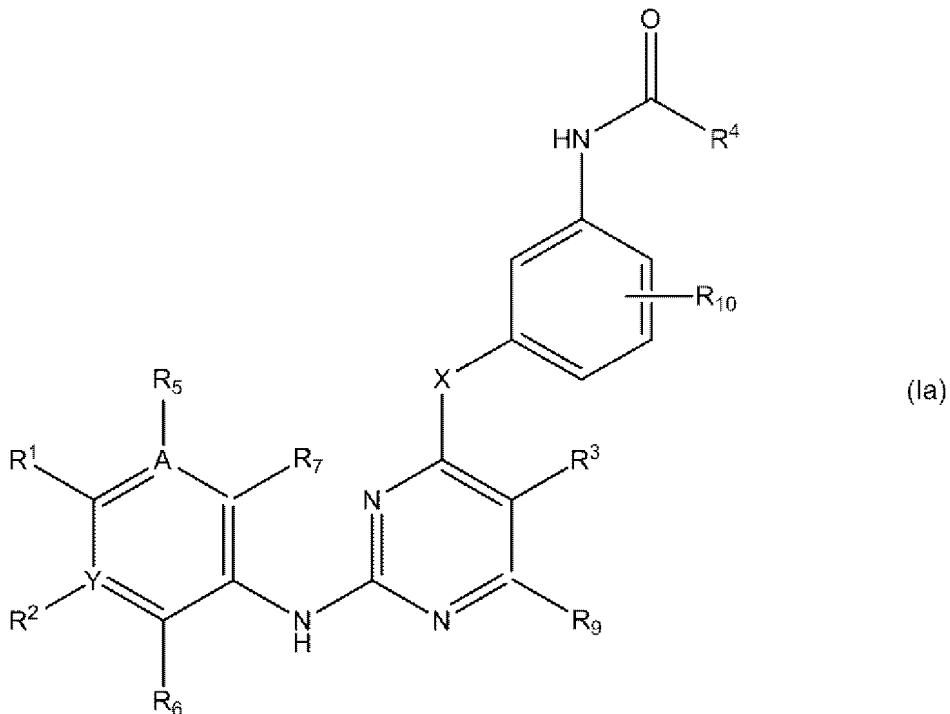
## 【補正の内容】

## 【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

式 ( I a ) :

【化 1】



の化合物またはその薬学的に受容可能な塩であって、式（Ia）において

$R^{-1}$  は、  $H$  であるか、あるいは

$N R^c R^d$  であって、ここで

$R^c$  は、  $H$ 、  $C_{1 \sim 4}$  アルキル、  $C_{1 \sim 4}$  アルケニル、または 3 員 ~ 7 員の環式環であり、該  $C_{1 \sim 4}$  アルキル、  $C_{1 \sim 4}$  アルケニル、または 3 員 ~ 7 員の環式環は、  $OZ$  もしくは  $NR_{1 \sim 1}R_{1 \sim 2}$  で必要に応じて置換されており、ここで  $Z$ 、  $R_{1 \sim 1}$ 、  $R_{1 \sim 2}$  は独立して、  $H$  もしくは  $C_{1 \sim 4}$  アルキルであるか、または該 3 員 ~ 7 員の環式環は、  $C_{1 \sim 4}$  アルキルで必要に応じて置換されており、該  $C_{1 \sim 4}$  アルキルはさらに、  $OZ$  または  $NR_{1 \sim 1}R_{1 \sim 2}$  で必要に応じて置換されており、ここで  $Z$ 、  $R_{1 \sim 1}$ 、  $R_{1 \sim 2}$  は独立して、  $H$  または  $C_{1 \sim 4}$  アルキルであるか、または該 3 員 ~ 7 員の環式環は、  $SO_2(CH_2)_qH$  で必要に応じて置換されており、ここで  $q$  は 1 ~ 4 であるか、または該 3 員 ~ 7 員の環式環は、  $C_{1 \sim 4}$  アルキルで必要に応じて置換されており、該  $C_{1 \sim 4}$  アルキルはさらに、  $SO_2(CH_2)_qH$  で必要に応じて置換されており、ここで  $q$  は 1 ~ 4 であるか、または該 3 員 ~ 7 員の環式環は、  $R_8CO$  で必要に応じて置換されており、ここで  $R_8$  は  $C_{1 \sim 4}$  アルキルであり、そして

$R^d$  は、H、 $C_{1 \sim 4}$  アルキル、 $C_{1 \sim 4}$  アルケニル、または3員～7員の環式環であり、該  $C_{1 \sim 4}$  アルキル、 $C_{1 \sim 4}$  アルケニルまたは3員～7員の環式環は、OZ または  $NR_{1 \sim 1}R_{1 \sim 2}$  で必要に応じて置換されており、ここでZ、 $R_{1 \sim 1}$ 、 $R_{1 \sim 2}$  は独立して、H または  $C_{1 \sim 4}$  アルキルであるか；あるいは

$R^a$  で置換された 3 員 ~ 7 員の環式環であって、ここで  $R^a$  は、必要に応じてハロ、 $C_{1~4}$  アルコキシまたは  $SO_2(CH_2)_nH$  で置換された、 $C_{2~8}$  アルキルであり

、ここで $q$ は1～4であるか；あるいは

$O(C_2H_5)_mSO_2(C_2H_5)_nH$ であって、ここで $m$ は1～4であり、そして $n$ は1～4であり；

$R^2$ は、存在しないか、あるいはH、ハロ、 $C_{1\sim4}$ アルキル、 $C_{2\sim4}$ アルコキシ、またはアルキルアミン( $NR_{1\sim2}R_{1\sim2}$ )であり、ここで $R_{1\sim1}$ および $R_{1\sim2}$ は独立して、Hまたは $C_{1\sim4}$ アルキルであり；

$R^3$ は、H、ヒドロキシル、ハロ、 $C_{1\sim4}$ アルキル、 $C_{1\sim4}$ アルコキシ、またはアルキルアミン( $NR_{1\sim2}R_{1\sim2}$ )であり、ここで $R_{1\sim1}$ および $R_{1\sim2}$ は独立して、Hまたは $C_{1\sim4}$ アルキルであり；

$R^5$ は、存在しないか、あるいはH、ハロ、 $C_{1\sim4}$ アルキル、 $C_{2\sim4}$ アルコキシ、またはアルキルアミン( $NR_{1\sim2}R_{1\sim2}$ )であり、ここで $R_{1\sim1}$ および $R_{1\sim2}$ は独立して、Hまたは $C_{1\sim4}$ アルキルであり；

$R^6$ は、H、ハロ、 $C_{1\sim4}$ アルキル、 $C_{2\sim4}$ アルコキシ；またはアルキルアミン( $NR_{1\sim2}R_{1\sim2}$ )であり、ここで $R_{1\sim1}$ および $R_{1\sim2}$ は独立して、Hまたは $C_{1\sim4}$ アルキルであり；

$R^7$ は、H、ハロ、 $C_{1\sim4}$ アルキル、 $C_{2\sim4}$ アルコキシ、またはアルキルアミン( $NR_{1\sim2}R_{1\sim2}$ )であり、ここで $R_{1\sim1}$ および $R_{1\sim2}$ は独立して、Hまたは $C_{1\sim4}$ アルキルであり；

$R^9$ は、H、ヒドロキシル、ハロ、 $C_{1\sim4}$ アルキル、 $C_{1\sim4}$ アルコキシ、またはアルキルアミン( $NR_{1\sim2}R_{1\sim2}$ )であり、ここで $R_{1\sim1}$ および $R_{1\sim2}$ は独立して、Hまたは $C_{1\sim4}$ アルキルであり；

$R^{10}$ は、H、ヒドロキシル、ハロ、 $C_{1\sim4}$ アルキル、 $C_{1\sim4}$ アルコキシ、またはアルキルアミン( $NR_{1\sim2}R_{1\sim2}$ )であり、ここで $R_{1\sim1}$ および $R_{1\sim2}$ は独立して、Hまたは $C_{1\sim4}$ アルキルであるか；あるいは

$R^1$ および $R^5$ は、3員～7員の環式環の一部分であり、該3員～7員の環式は、必要に応じてOZもしくは $NR_{1\sim2}R_{1\sim2}$ で置換された $C_{1\sim4}$ アルキルで必要に応じて置換されており、ここでZ、 $R_{1\sim1}$ および $R_{1\sim2}$ は独立して、Hもしくは $C_{1\sim4}$ アルキルであるか、または該3員～7員の環式は、 $R_8CO$ で必要に応じて置換されており、ここで $R_8$ は $C_{1\sim4}$ アルキルであるか、または該3員～7員の環式は、 $SO_2(C_2H_5)_qH$ で必要に応じて置換されており、ここで $q$ は1～4であるか；あるいは

$R^1$ および $R^2$ は、 $C_{1\sim4}$ アルキルで必要に応じて置換された3員～7員の環式環の一部分であり、該 $C_{1\sim4}$ アルキルはさらに、ハロ、OZ、もしくは $NR_{1\sim2}R_{1\sim2}$ で必要に応じて置換されており、ここでZ、 $R_{1\sim1}$ および $R_{1\sim2}$ は独立して、Hもしくは $C_{1\sim4}$ アルキルであるか、または該3員～7員の環式環の1つもしくは複数のメンバーは必要に応じて、カルボニル基もしくはスルホニル基の一部分であるか；あるいは

$R^2$ および $R^6$ は、 $C_{1\sim4}$ アルキルで必要に応じて置換された3員～7員の環式環の一部分であり、該 $C_{1\sim4}$ アルキルは、OZまたは $NR_{1\sim2}R_{1\sim2}$ で必要に応じて置換されており、ここでZ、 $R_{1\sim1}$ および $R_{1\sim2}$ は独立して、Hまたは $C_{1\sim4}$ アルキルであり；

$R^4$ は、 $C_{1\sim4}$ アルキル、 $-CH_2OC_2H_5$ 、または $-CH_2N(C_2H_5)_2$ で必要に応じて置換された、 $C_2$ アルケニルであり；

Xは、O、必要に応じてハロで置換された $C_{1\sim4}$ アルキル、または $NR^b$ であり、ここで $R^b$ は、H、または必要に応じてハロで置換された $C_{1\sim8}$ アルキルであり；

Yは、C、必要に応じてハロで置換されたCH、またはNであり；

Aは、C、必要に応じてハロで置換されたCH、またはNであり；そして

ここで $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^5$ および $R^6$ のうちの少なくとも1つはHではない、化合物またはその薬学的に受容可能な塩。

### 【請求項2】

$R^1$ は $NR^cR^d$ であり、そして $R^c$ はHである、請求項1に記載の化合物。

### 【請求項3】

$R^1$  は  $N R^c R^d$  であり、そして  $R^c$  は、必要に応じて  $OZ$  または  $NR_{1,1}R_{1,2}$  で置換された、 $C_{1 \sim 4}$  アルキルであり、ここで  $Z$ 、 $R_{1,1}$ 、 $R_{1,2}$  は独立して、 $H$  または  $C_{1 \sim 4}$  アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

$R^1$  は  $N R^c R^d$  であり、そして  $R^c$  は、必要に応じて  $OZ$  または  $NR_{1,1}R_{1,2}$  で置換された、 $C_{1 \sim 4}$  アルケニルであり、ここで  $Z$ 、 $R_{1,1}$ 、 $R_{1,2}$  は独立して、 $H$  または  $C_{1 \sim 4}$  アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

$R^1$  は  $N R^c R^d$  であり、そして  $R^c$  は、必要に応じて  $OZ$  または  $NR_{1,1}R_{1,2}$  で置換された、3員～7員の環式環であり、ここで  $Z$ 、 $R_{1,1}$ 、 $R_{1,2}$  は独立して、 $H$  または  $C_{1 \sim 4}$  アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 6】

$R^1$  は  $N R^c R^d$  であり、そして  $R^c$  は、 $C_{1 \sim 4}$  アルキルで必要に応じて置換された3員～7員の環式環であり、該  $C_{1 \sim 4}$  アルキルはさらに、 $OZ$  または  $NR_{1,1}R_{1,2}$  で必要に応じて置換されており、ここで  $Z$ 、 $R_{1,1}$ 、 $R_{1,2}$  は独立して、 $H$  または  $C_{1 \sim 4}$  アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 7】

$R^1$  は  $N R^c R^d$  であり、そして  $R^c$  は、 $SO_2(CH_2)_qH$  で必要に応じて置換された3員～7員の環式環であり、ここで  $q$  は 1～4 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 8】

$R^1$  は  $N R^c R^d$  であり、そして  $R^c$  は、 $C_{1 \sim 4}$  アルキルで必要に応じて置換された3員～7員の環式環であり、該  $C_{1 \sim 4}$  アルキルはさらに、 $SO_2(CH_2)_qH$  で必要に応じて置換されており、ここで  $q$  は 1～4 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 9】

$R^1$  は  $N R^c R^d$  であり、そして  $R^c$  は、 $R_8CO$  で必要に応じて置換された3員～7員の環式環であり、ここで  $R_8$  は  $C_{1 \sim 4}$  アルキルである、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

$R^1$  は  $N R^c R^d$  であり、そして  $R^c$  は、 $N$  原子を含む5員環式環であり、該  $N$  原子に結合している  $H$  は、 $R_8CO$  で置き換えられており、ここで  $R_8$  は  $C_{1 \sim 4}$  アルキルである、請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

前記  $N$  原子に結合している  $H$  は、 $CH_3CO$  で置き換えられている、請求項 10 に記載の化合物。

【請求項 12】

$R^d$  は、必要に応じて  $OZ$  または  $NR_{1,1}R_{1,2}$  で置換された、 $C_{1 \sim 4}$  アルキルであり、ここで  $Z$ 、 $R_{1,1}$ 、 $R_{1,2}$  は独立して、 $H$  または  $C_{1 \sim 4}$  アルキルである、請求項 2～11 のいずれかに記載の化合物。

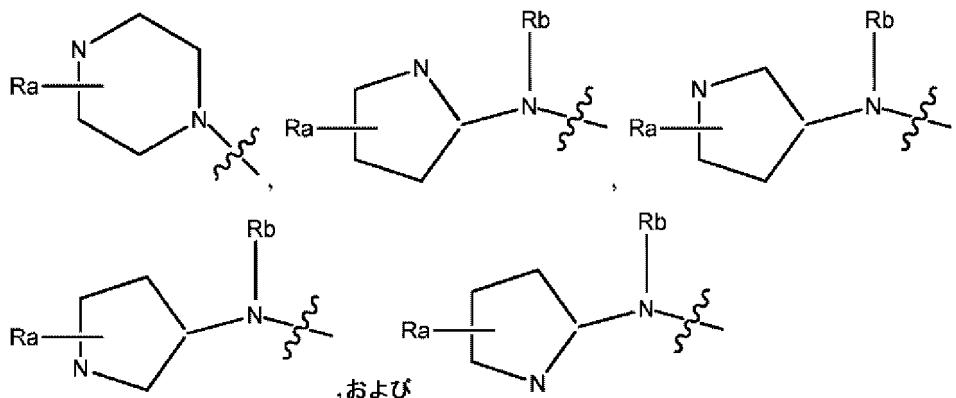
【請求項 13】

$R^1$  は、 $R^a$  で置換された3員～7員の環式環であり、ここで  $R^a$  は、必要に応じて八口、 $C_{1 \sim 4}$  アルコキシまたは  $SO_2(CH_2)_qH$  で置換された、 $C_{2 \sim 8}$  アルキルであり、ここで  $q$  は 1～4 である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 14】

$R^1$  は、

## 【化2】



からなる群より選択され、R<sup>a</sup>は、必要に応じてハロ、C<sub>1～4</sub>アルコキシまたはSO<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>Hで置換された、C<sub>2～8</sub>アルキルであり、ここでqは1～4であり、またはR<sup>a</sup>は、R<sub>8</sub>C<sub>0</sub>であり、ここでR<sub>8</sub>はC<sub>1～4</sub>アルキルであり、そしてR<sup>b</sup>は、H、または必要に応じてハロ、C<sub>1～4</sub>アルコキシまたはSO<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>q</sub>Hで置換されたC<sub>1～8</sub>アルキルであり、ここでqは1～4である、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項15】

R<sup>2</sup>は、Hまたはハロである、請求項1～14のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項16】

R<sup>3</sup>はC<sub>1～4</sub>アルコキシである、請求項1～15のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項17】

R<sup>5</sup>はHである、請求項1～16のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項18】

R<sup>6</sup>はHである、請求項1～17のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項19】

R<sup>7</sup>はHである、請求項1～18のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項20】

R<sup>9</sup>はHである、請求項1～19のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項21】

R<sup>10</sup>はHである、請求項1～20のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項22】

XはOである、請求項1～22のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項24】

YはCである、請求項1～23のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項25】

AはCである、請求項1～24のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項26】

前記3員～7員の環式環は5員環式環である、請求項1～25のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項27】

前記3員～7員の環式環は複素環式環である、請求項1～26のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項28】

前記複素環式環はN原子を含む、請求項27に記載の化合物。

## 【請求項29】

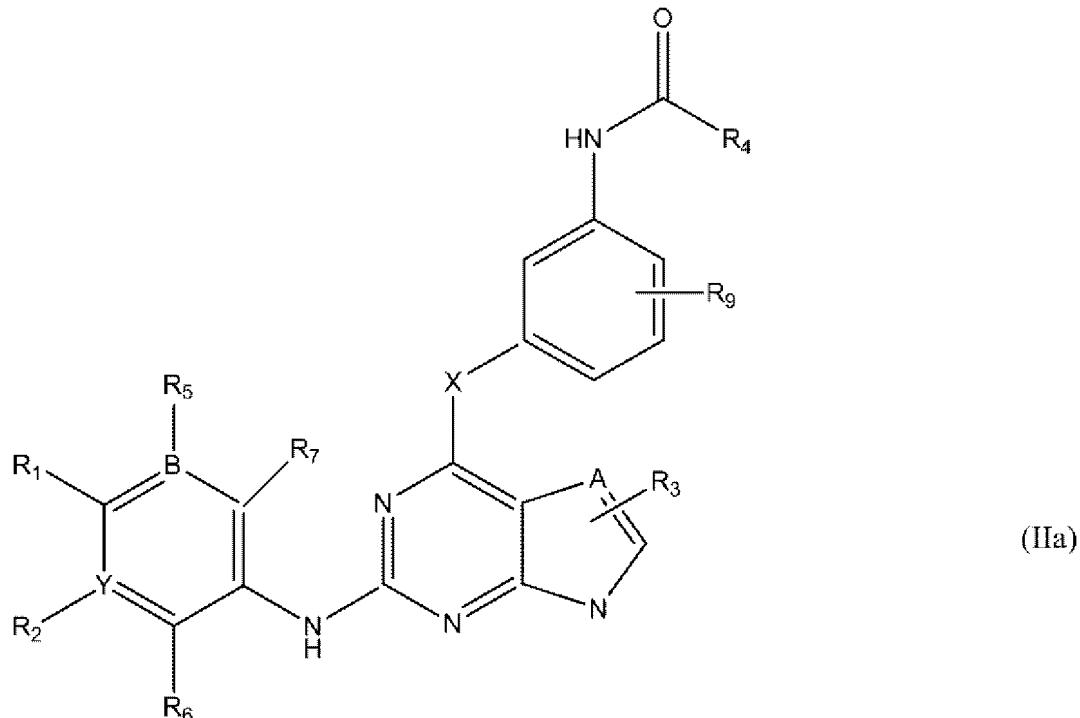
化合物I-3、I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、I-9、I-12、I-1

3、I - 14、I - 15、I - 16、I - 17、I - 18、I - 19、I - 20、I - 21、I - 22、I - 23、I - 24、I - 25、I - 41、I - 25a、I - 28a、I - 29a、I - 30a、I - 31a、I - 32a、I - 33a、I - 34a、I - 35a、I - 38a、I - 39a、I - 42a、I - 43a、I - 44a、I - 45a、I - 50a、I - 51a、I - 52a、I - 53a、I - 54a、I - 55a、I - 56a、I - 57a、I - 58a、I - 59a、I - 60a、I - 66a、I - 70a、およびI - 72aからなる群より選択される、請求項1に記載の化合物。

## 【請求項30】

式(I I a)：

## 【化3】



の化合物またはその薬学的に受容可能な塩であって、式(I I a)において

$R^1$ は、Hであるか、あるいは

$NR^cR^d$ であって、ここで $R^c$ は、H、 $C_{1~4}$ アルキルまたは3員～7員の環式環であり、該3員～7員の環式環は、必要に応じてOZもしくは $NR_{10}R_{11}$ で置換されている $C_{1~4}$ アルキルで必要に応じて置換されており、ここでZ、 $R_{10}$ および $R_{11}$ は独立して、Hもしくは $C_{1~4}$ アルキルであるか、または該3員～7員の環式環は、 $R_8CO$ で必要に応じて置換されており、ここで $R_8$ は $C_{1~4}$ アルキルであるか、または該3員～7員の環式環は、 $SO_2(CH_2)_qH$ で必要に応じて置換されており、ここでqは1～4であり、そして $R^d$ は、H、 $C_{1~4}$ アルキルであり、該 $C_{1~4}$ アルキルは、OZまたは $NR_{10}R_{11}$ で必要に応じて置換されており、ここでZ、 $R_{10}$ および $R_{11}$ は、Hまたは $C_{1~4}$ アルキルであるか；あるいは

$NR^eR^f$ であって、ここで $R^e$ は $C_{1~4}$ アルキルであり、そして $R^f$ は、必要に応じてハロで置換された $C_{1~4}$ アルキルで必要に応じて置換された3員～7員の環式環であるか；あるいは

$OR^g$ であって、ここで $R^g$ は、 $CH_3O^-$ 、 $CH_3CH_2O^-$ 、 $CH_3(O)_2S^-$ 、 $CF_3O^-$ 、

【化4】



で置換された、 $C_{1\sim 4}$ アルキルであるか、あるいは

$R^a$ で置換された3員～7員の環式環であって、ここで $R^a$ は、必要に応じてハロ、 $C_{1\sim 4}$ アルコキシもしくは $S O_2 (C H_2)_q H$ で置換された、 $C_{2\sim 8}$ アルキルであり、ここで $q$ は1～4であるか、または該3員～7員の環式環は、 $R_8 C O$ で必要に応じて置換されており、ここで $R_8$ は $C_{1\sim 4}$ アルキルであり；

$R^2$ は、存在しないか、あるいはH、ハロ、 $C_{1\sim 4}$ アルキル、 $C_{2\sim 4}$ アルコキシ、またはアルキルアミン( $N R_{10} R_{11}$ )であり、ここで $R_{10}$ および $R_{11}$ は独立して、Hまたは $C_{1\sim 4}$ アルキルであり；

$R^3$ は、存在しないか、あるいはH、ハロ、 $C_{1\sim 4}$ アルキル、または $C_{1\sim 4}$ アルコキシ、またはアルキルアミン( $N R_{10} R_{11}$ )であり、ここで $R_{10}$ および $R_{11}$ は独立して、Hまたは $C_{1\sim 4}$ アルキルであり；

$R^5$ は、存在しないか、あるいはH、ハロ、 $C_{1\sim 4}$ アルキル、または $C_{2\sim 4}$ アルコキシ、またはアルキルアミン( $N R_{10} R_{11}$ )であり、ここで $R_{10}$ および $R_{11}$ は独立して、Hまたは $C_{1\sim 4}$ アルキルであり；

$R^6$ は、H、ハロ、 $C_{1\sim 4}$ アルキル、または $C_{2\sim 4}$ アルコキシ、またはアルキルアミン( $N R_{10} R_{11}$ )であり、ここで $R_{10}$ および $R_{11}$ は独立して、Hまたは $C_{1\sim 4}$ アルキルであり；

$R^7$ は、H、ハロ、 $C_{1\sim 4}$ アルキル、 $C_{2\sim 4}$ アルコキシ、またはアルキルアミン( $N R_{10} R_{11}$ )であり、ここで $R_{10}$ および $R_{11}$ は独立して、Hまたは $C_{1\sim 4}$ アルキルであり；

$R^9$ は、H、ハロ、 $C_{1\sim 4}$ アルキル、または $C_{1\sim 4}$ アルコキシ、またはアルキルアミン( $N R_{10} R_{11}$ )であり、ここで $R_{10}$ および $R_{11}$ は独立して、Hまたは $C_{1\sim 4}$ アルキルであるか；あるいは

$R^1$ および $R^5$ は、必要に応じて $O Z$ または $N R_{10} R_{11}$ で置換された $C_{1\sim 4}$ アルキルで必要に応じて置換された3員～7員の環式環の一部分であり、ここで $Z$ 、 $R_{10}$ および $R_{11}$ は独立して、Hまたは $C_{1\sim 4}$ アルキルであるか；あるいは

$R^1$ および $R^2$ は、必要に応じて $O Z$ または $R_{10}$ および $R_{11}$ で置換された $C_{1\sim 4}$ アルキルで必要に応じて置換された3員～7員の環式環の一部分であり、ここで $Z$ 、 $R_{10}$ および $R_{11}$ は独立して、Hまたは $C_{1\sim 4}$ アルキルであるか；あるいは

$R^2$ および $R^6$ は、必要に応じて $O Z$ または $R_{10}$ および $R_{11}$ で置換された $C_{1\sim 4}$ アルキルで必要に応じて置換された3員～7員の環式環の一部分であり、ここで $Z$ 、 $R_{10}$ および $R_{11}$ は独立して、Hまたは $C_{1\sim 4}$ アルキルである；

$R^4$ は、必要に応じて $C_{1\sim 4}$ アルキル、 $-C H_2 O C H_3$ 、または $-C H_2 N (C H_3)_2$ で置換された、 $C_2$ アルケニルであり；

$X$ は、O、必要に応じてハロで置換された $C_{1\sim 4}$ アルキル、または $N R^b$ であり、ここで $R^b$ は、H、または必要に応じてハロで置換された $C_{1\sim 8}$ アルキルであり；

$Y$ は、C、必要に応じてハロで置換された $C H$ 、またはNであり；

$A$ は、C、必要に応じてハロで置換された $C H$ 、またはNであり；そして

$B$ は、C、必要に応じてハロで置換された $C H$ 、またはNである、化合物またはその薬学的に受容可能な塩。

【請求項31】

化合物I-10、I-11、I-26、I-27、I-28、I-29、I-30、I-31、I-32、I-33、I-34、I-35、I-36、I-37、I-38、I-39、I-40、I-24a、I-26a、I-27a、I-36a、I-37a、I-

- 4 0 a、I - 4 1 a、I - 4 6 a、I - 4 7 a、I - 4 8 a、I - 4 9 a、I - 6 1 a、I - 6 2 a、I - 6 3 a、I - 6 4 a、I - 6 5 a、I - 6 7 a、I - 6 8 a、I - 6 9 a、およびI - 7 1 aからなる群より選択される、請求項3 0に記載の化合物。

【請求項 3 2】

少なくとも 1 種の薬学的に受容可能なキャリアまたは賦形剤と混合された、請求項 1 ~ 3 1 のいずれかに記載の化合物を含有する薬学的組成物。

【請求項 3 3】

医薬の製造のための請求項 1 ~ 3 1 のいずれかに記載の化合物の使用。

【請求項 3 4】

増殖性障害、がん、腫瘍、炎症性疾患、自己免疫疾患、乾癬、乾燥眼もしくは免疫学的に関連する疾患、または狼瘡を処置または予防するための医薬の製造における有効量の請求項 1 ~ 3 1 のいずれかに記載の化合物または請求項 3 2 に記載の薬学的組成物の使用。

【請求項 3 5】

被験体における増殖性障害、がん、腫瘍、炎症性疾患、自己免疫疾患、乾癬、乾燥眼もしくは免疫学的に関連する疾患または狼瘡を処置および/または予防するための組み合わせ物であって、該組み合わせ物は、有効量の請求項 1 ~ 3 1 のいずれかに記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩、ならびに有効量の、被験体における増殖性障害、がん、腫瘍、炎症性疾患、自己免疫疾患、乾癬、乾燥眼もしくは免疫学的に関連する疾患または狼瘡を処置および/または予防するための第二の予防剤または治療剤を含有する、組み合わせ物。

【請求項 3 6】

増殖性障害、がん、腫瘍、炎症性疾患、自己免疫疾患、乾癬、乾燥眼もしくは免疫学的に関連する疾患または狼瘡を処置および/または予防するための医薬の製造における有効量の請求項 3 5 に記載の組み合わせ物の使用。

【請求項 3 7】

細胞または被験体において、ブルトン型チロシンキナーゼ (Btk もしくは BTK) またはヤヌスキナーゼ (JAK)、EGFR (HER を含めて)、ALK、PDGFR、BLK、BMX / ETK、FLT3 (D835Y)、ITK、TEC、TXK、およびそのそれぞれの経路の活性を阻害する方法であって、該方法は、その必要がある細胞または被験体に、有効量の請求項 1 ~ 3 1 のいずれかに記載の化合物、または請求項 3 2 に記載の薬学的組成物、または請求項 3 5 に記載の組み合わせ物を投与する工程を包含する、方法。

【請求項 3 8】

前記 JAK は、JAK 1、JAK 2 または JAK 3 である、請求項 3 7 に記載の方法。

【請求項 3 9】

前記増殖性障害は、肉腫、類表皮がん、線維肉腫、子宮頸部がん、胃癌腫、皮膚がん、白血病、リンパ腫、肺がん、非小細胞肺がん、結腸がん、CNSのがん、黒色腫、卵巣がん、腎がん、前立腺がん、乳がん、肝がん、頭頸部がん、および肺がんからなる群より選択される、請求項 3 4 に記載の使用。

【請求項 4 0】

前記化合物は、化合物 I - 3、I - 4、I - 5、I - 6、I - 7、I - 8、I - 9、I - 12、I - 13、I - 14、I - 15、I - 16、I - 17、I - 18、I - 19、I - 20、I - 21、I - 22、I - 23、I - 24、I - 25、I - 41、I - 25 a、I - 28 a、I - 29 a、I - 30 a、I - 31 a、I - 32 a、I - 33 a、I - 34 a、I - 35 a、I - 38 a、I - 39 a、I - 42 a、I - 43 a、I - 44 a、I - 45 a、I - 50 a、I - 51 a、I - 52 a、I - 53 a、I - 54 a、I - 55 a、I - 56 a、I - 57 a、I - 58 a、I - 59 a、I - 60 a、I - 66 a、I - 70 a、I - 72 a、I - 10、I - 11、I - 26、I - 27、I - 28、I - 29、I - 30、I - 31、I - 32、I - 33、I - 34、I - 35、I - 36、I - 37、I -

38、I-39、I-40、I-24a、I-26a、I-27a、I-36a、I-37a、I-40a、I-41a、I-46a、I-47a、I-48a、I-49a、I-61a、I-62a、I-63a、I-64a、I-65a、I-67a、I-68a、I-69a、およびI-71aからなる群より選択される、請求項34に記載の使用。

**【請求項41】**

前記化合物は、化合物I-3、I-4、I-5、I-6、I-7、I-8、I-9、I-12、I-13、I-14、I-15、I-16、I-17、I-18、I-19、I-20、I-21、I-22、I-23、I-24、I-25、I-41、I-25a、I-28a、I-29a、I-30a、I-31a、I-32a、I-33a、I-34a、I-35a、I-38a、I-39a、I-42a、I-43a、I-44a、I-45a、I-50a、I-51a、I-52a、I-53a、I-54a、I-55a、I-56a、I-57a、I-58a、I-59a、I-60a、I-66a、I-70a、I-72a、I-10、I-11、I-26、I-27、I-28、I-29、I-30、I-31、I-32、I-33、I-34、I-35、I-36、I-37、I-38、I-39、I-40、I-24a、I-26a、I-27a、I-36a、I-37a、I-40a、I-41a、I-46a、I-47a、I-48a、I-49a、I-61a、I-62a、I-63a、I-64a、I-65a、I-67a、I-68a、I-69a、およびI-71aからなる群より選択される、請求項37または38に記載の方法。

**【請求項42】**

化合物I-1、I-2およびI-23aからなる群より選択される、化合物。

**【請求項43】**

医薬の製造における有効量の請求項42に記載の化合物の使用。

**【請求項44】**

増殖性障害、がん、腫瘍、炎症性疾患、自己免疫疾患、乾癬、乾燥眼もしくは免疫学的に関連する疾患、または狼瘡を処置および/または予防するための医薬の製造における有効量の請求項42に記載の化合物の使用。

**【請求項45】**

被験体における増殖性障害、がん、腫瘍、炎症性疾患、自己免疫疾患、乾癬、乾燥眼もしくは免疫学的に関連する疾患または狼瘡を処置および/または予防するための組み合わせ物であって、該組み合わせ物は、有効量の請求項42に記載の化合物、またはその薬学的に受容可能な塩、ならびに有効量の、被験体における増殖性障害、がん、腫瘍、炎症性疾患、自己免疫疾患、乾癬、乾燥眼もしくは免疫学的に関連する疾患または狼瘡を処置および/または予防するための第二の予防剤または治療剤を含有する、組み合わせ物。

**【請求項46】**

増殖性障害、がん、腫瘍、炎症性疾患、自己免疫疾患、乾癬、乾燥眼もしくは免疫学的に関連する疾患、または狼瘡を処置および/または予防するための医薬の製造における有効量の請求項45に記載の組み合わせ物の使用。

**【請求項47】**

細胞または被験体において、ブルトン型チロシンキナーゼ(BtkもしくはBTK)またはヤヌスキナーゼ(JAK)、EGFR(HERを含めて)、ALK、PDGFR、BLK、BMX/ETK、FLT3(D835Y)、ITK、TEC、TXK、およびそのそれぞれの経路の活性を阻害する方法であって、該方法は、その必要がある細胞または被験体に、有効量の請求項42に記載の化合物、または請求項45に記載の組み合わせ物を投与する工程を包含する、方法。

**【請求項48】**

前記JAKは、JAK1、JAK2またはJAK3である、請求項47に記載の方法。

**【請求項49】**

前記増殖性障害は、肉腫、類表皮がん、線維肉腫、子宮頸部がん、胃癌腫、皮膚がん、白血病、リンパ腫、肺がん、非小細胞肺がん、結腸がん、CNSのがん、黒色腫、卵巣が

ん、腎がん、前立腺がん、乳がん、肝がん、頭頸部がん、および脾がんからなる群より選択される、請求項44に記載の使用。