

【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18年11月9日(2006.11.9)

【公表番号】特表2006-515317(P2006-515317A)

【公表日】平成18年5月25日(2006.5.25)

【年通号数】公開・登録公報2006-020

【出願番号】特願2005-500378(P2005-500378)

【国際特許分類】

C 0 7 D 209/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/404 (2006.01)

C 0 7 D 209/48 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

C 0 7 D 475/08 (2006.01)

C 0 7 D 519/00 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4985 (2006.01)

C 0 7 D 253/08 (2006.01)

A 6 1 K 31/53 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

C 0 7 D 475/02 (2006.01)

C 0 7 D 475/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

C 0 7 D 241/44 (2006.01)

A 6 1 K 31/498 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/704 (2006.01)

A 6 1 K 31/337 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 K 39/395 (2006.01)

A 6 1 K 31/661 (2006.01)

C 0 7 D 405/04 (2006.01)

A 6 1 J 1/05 (2006.01)

A 6 1 J 3/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 209/14 C S P

A 6 1 K 31/404

C 0 7 D 209/48 Z

A 6 1 K 31/4439

C 0 7 D 475/08
C 0 7 D 519/00 3 1 1
C 0 7 D 471/04 1 2 0
A 6 1 K 31/4985
C 0 7 D 253/08
A 6 1 K 31/53
C 0 7 D 487/04 1 5 7
C 0 7 D 475/02
C 0 7 D 475/06
A 6 1 K 31/519
C 0 7 D 241/44
A 6 1 K 31/498
A 6 1 P 9/00
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 19/02
A 6 1 P 27/02
A 6 1 P 37/06
A 6 1 P 29/00
A 6 1 P 17/02
A 6 1 P 11/00
A 6 1 P 43/00 1 2 1
A 6 1 K 31/704
A 6 1 K 31/337
A 6 1 K 37/02
A 6 1 K 39/395 E
A 6 1 K 31/661
C 0 7 D 405/04
A 6 1 J 1/00 3 1 1
A 6 1 J 3/00 3 0 0 Z
A 6 1 K 31/5377
C 0 7 D 405/12

【誤訳訂正書】

【提出日】平成18年9月25日(2006.9.25)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

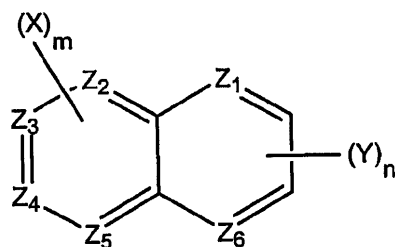
【訂正対象項目名】請求項5

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【請求項5】

構造(III)の化合物：



III

[式中、 Z_1 - Z_6 は各々独立して、C、 $-C=O$ 、N、または NR^a であり、 R^a は、 $-H$ 、アルキル、または置換されたアルキルであり、置換基は、ハロゲン、ヒドロキシ、オキソまたはアミノであり；

各Xは独立して、ハロゲン、 $-OR^b$ 、 $-NR^b_2$ 、または $-SR^b$ であり、 R^b は、 $-H$ 、低級アルキル、 $-(CH_2)_2NH(CH_2CH_3)$ 、 $-(CH_2)_3$ モルホリン-1-イル、 $-(CH_2)_3$ (N-メチルピペラジニン-1-イル)、アリール、ヘテロアリール、 $-(NH-NH-R^c)$ 、 $-(N=N-NH-R^c)$ であり、 R^c は、Hまたは低級アルキルであり；

各Yは、独立して $-OR^d$ 、 $-NR^d_2$ 、 $-SR^d$ 、もしくは $-OPO_3H_2$ であり、 R^d は、 $-H$ 、低級アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(CH_2)_2NH(CH_2CH_3)$ 、 $-(CH_2)_3$ モルホリン-1-イル、または $-(CH_2)_3$ (N-メチルピペラジニン-1-イル)であり；または

各Yは独立して、アルキル、置換されたアルキル、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、もしくはハロゲンであり、置換基は、ハロゲン、 $-OR^e$ 、 $-NR^e_2$ 、 $-SR^e$ 、 $-P(O)(OH)_2$ から選択され、 R^e は、 $-H$ 、低級アルキル、アリール、もしくはヘテロアリールであるか；または

各Yは独立して、 CH_2 グリシニル、 CH_2NH エトキシ、 CH_2NHCH_2 アルキル、 CH_2NHCH_2 t-Bu、 $C_6H_5NHCH_2$ アリール、 CH_2NHCH_2 置換されたアリール、 CH_2NHCH_2 ヘテロアリール、 CH_2NHCH_2 置換されたヘテロアリールであり；または

nが2である場合、各Yは一体となって融合した芳香環またはヘテロ芳香環システムを形成し；ならびに

mおよびnは各々独立して、1~4であり；

Z_1 、 Z_3 、 Z_5 、および Z_6 が各々Nである場合、Xは、 NH_2 であり、ならびに $m=n=2$ である場合、Yはフェニルまたは4-ヒドロキシフェニルではない。]、またはそれらの互変異性体。

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】請求項136

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【請求項136】

化学療法剤が、メトトレキセート、シスプラチン／カルボプラチン；カンブシル；ダクチノマイシン；タキソール（パクリタキソール）、抗葉酸剤、コルヒチン、デメコリン、エトポシド、タキサン／タキソール、ドセタキソール、ドキソルビシン、アントラサイクリン系抗生物質、ドキソルビシン、ダウノルビシン、カルミノマイシン、エピルビシン、イダルビシン、ミトキサントロン、4-デメトキシ-ダウノマイシン、11-デオキシダウノルビシン、13-デオキシダウノルビシン、アドリアマイシン-14-ベンゾエート、アドリアマイシン-14-オクタノエートまたはアドリアマイシン-14-ナフタレンアセテートである、請求項131記載の方法。

【誤訳訂正3】

【訂正対象書類名】明細書

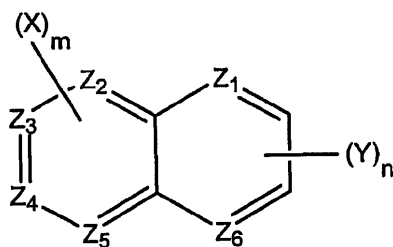
【訂正対象項目名】0013

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0013】

別の態様において、構造(III)を有する化合物が：



III

(式中、

Z_1 - Z_6 は各々独立して、C、 $-C=O$ 、N、または NR^a であり、ここで R^a は、 $-H$ 、アルキル、または置換されたアルキルであり、ここで該置換基は、ハロゲン、ヒドロキシ、オキソまたはアミノであり、

各Xは独立して、ハロゲン、 $-OR^b$ 、 $-NR^b_2$ 、または $-SR^b$ であり、ここで R^b は、 $-H$ 、低級アルキル、 $-(CH_2)_2NH(CH_2CH_3)$ 、 $-(CH_2)_3$ モルホリン-1-イル、 $-(CH_2)_3$ (N-メチルピペラジニン-1-イル)、アリール、ヘテロアリール、 $-(NH-NH-R^c)$ 、 $-(N=N-NH-R^c)$ であり、ここで R^c は、Hまたは低級アルキルであり、

各Yは、独立して $-OR^d$ 、 $-NR^d_2$ 、 $-SR^d$ 、または $-OPO_3H_2$ であり、ここで R^d は、 $-H$ 、低級アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(CH_2)_2NH(CH_2CH_3)$ 、 $-(CH_2)_3$ モルホリン-1-イル、または $-(CH_2)_3$ (N-メチルピペラジニン-1-イル)であり；または

各Yは独立して、アルキル、置換されたアルキル、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、またはハロゲンであり、ここで該置換基は、ハロゲン、 $-OR^e$ 、 $-NR^e_2$ 、 $-SR^e$ 、 $-P(O)(OH)_2$ から選択され、ここで R^e は、 $-H$ 、低級アルキル、アリール、またはヘテロアリールであるか；もしくは、各Yは独立して、 CH_2 グリシニル、 CH_2NH エトキシ、 CH_2NHCH_2 アルキル、 CH_2NHCH_2 t-Bu、 CH_2NHCH_2 アリール、 CH_2NHCH_2 置換されたアリール、 CH_2NHCH_2 ヘテロアリール、 CH_2NHCH_2 置換されたヘテロアリールであり；または、nが2である場合、各Yは一緒に、融合した芳香環またはヘテロ芳香環システムを形成し；ならびに

mおよびnは各々独立して、1~4であり；

ここで Z_1 、 Z_3 、 Z_5 、および Z_6 が各々Nである場合、Xは、 NH_2 であり、ならびに $m=n=2$ であり、Yはフェニルまたは4-ヒドロキシフェニルではない。)

またはそれらの互変異性体が提供される。

【誤訳訂正4】

【訂正対象書類名】明細書

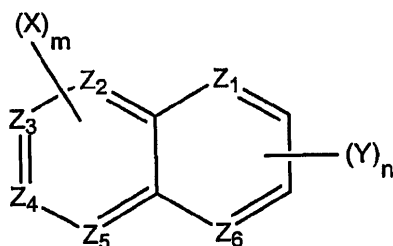
【訂正対象項目名】0056

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0056】

更に別の本発明の態様において、構造(III)の化合物：



III

(式中、

Z_1 - Z_6 は各々独立して、C、 $-C=O$ 、N、または NR^a であり、ここで R^a は、 $-H$ 、アルキル、または置換されたアルキルであり、ここで該置換基は、ハロゲン、ヒドロキシ、オキソまたはアミノであり、

各Xは独立して、ハロゲン、 $-OR^b$ 、 $-NR^b_2$ 、または $-SR^b$ であり、ここで R^b は、 $-H$ 、低級アルキル、 $-(CH_2)_2NH(CH_2CH_3)$ 、 $-(CH_2)_3$ モルホリン-1-イル、 $-(CH_2)_3$ (N-メチルピペラジニン-1-イル)、アリール、ヘテロアリール、 $-(NH-NH-R^c)$ 、 $-(N=N-NH-R^c)$ であり、ここで R^c は、Hまたは低級アルキルであり、

各Yは、独立して $-OR^d$ 、 $-NR^d_2$ 、 $-SR^d$ 、または $-OPO_3H_2$ であり、ここで R^d は、 $-H$ 、低級アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-(CH_2)_2NH(CH_2CH_3)$ 、 $-(CH_2)_3$ モルホリン-1-イル、または $-(CH_2)_3$ (N-メチルピペラジニン-1-イル)であり；または

各Yは独立して、アルキル、置換されたアルキル、アリール、置換されたアリール、ヘテロアリール、置換されたヘテロアリール、またはハロゲンであり、ここで該置換基は、ハロゲン、 $-OR^e$ 、 $-NR^e_2$ 、 $-SR^e$ 、 $-P(O)(OH)_2$ から選択され、ここで R^e は、 $-H$ 、低級アルキル、アリール、またはヘテロアリールであるか；もしくは、各Yは独立して、 CH_2 グリシニル、 CH_2NH エトキシ、 CH_2NHCH_2 アルキル、 CH_2NHCH_2 t-Bu、 CH_2NHCH_2 アリール、 CH_2NHCH_2 置換されたアリール、 CH_2NHCH_2 ヘテロアリール、 CH_2NHCH_2 置換されたヘテロアリールであり；または、nが2である場合、各Yは一緒に、融合した芳香環またはヘテロ芳香環システムを形成し；ならびに

mおよびnは各々独立して、1~4であり；

ここで Z_1 、 Z_3 、 Z_5 、および Z_6 が各々Nである場合、Xは、 NH_2 であり、ならびにm=n=2であり、Yはフェニルまたは4-ヒドロキシフェニルではない。)、またはそれらの互変異性体が提供される。

【誤訳訂正5】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0151

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0151】

ひとつの局面において、本発明の化合物は、抗炎症剤、抗ヒスタミン剤、化学療法剤、免疫調節剤、治療用抗体またはプロテインキナーゼインヒビター、例えばチロシンキナーゼインヒビターと組合せて、そのような治療が必要な対象へ投与することができる。限定を意図するものではないが、化学療法剤は、メトトレキセートなどの代謝拮抗物質、シスプラチン／カルボプラチンなどのDNA架橋物質；カンブシル(canbusil)などのアルキル化剤；ダクチノマイシンなどのトポイソメラーゼIインヒビター；タキソール(パクリタキソール)などの微小管インヒビターなどを含む。他の化学療法剤は、例えば、ビンカアルカロイド、マイトマイシン系抗生物質、ブレオマイシン系抗生物質、抗葉酸剤、コルヒチン、デメコリン(demecoline)、エトポシド、タキサン、アントラサイクリン系抗生物質、ドキソルビシン、ダウノルビシン、カルミノマイシン、エピルビシン、イダルビシン、ミトキサントロン、4-デメトキシ-ダウノマイシン、11-デオキシダウノルビシン、13-デオキシダウノルビシン、アドリアマイシン-14-安息香酸エステル、アドリアマイシン-14-オクタ酸エステル、アドリアマイシン-14-ナフタレン酢酸エステル、アムサクリン、カルムスチン、シクロホスファミド、シタラビン、エトポシド、ロバスタチン、メルファラン、トペテカン(topotecan)、オキサリプラチン、クロラムブシル、メトトレキセート、ロムスチン、チオグアニン、アスパラギナーゼ、ビンブラスチン、ビンデシン、タモキシフェンまたはメクロレタミンを含む。限定することを欲するものではないが、治療用抗体は、HER2蛋白質に対する抗体、例えばトラスツマブ；増殖因子または増殖因子受容体に対する抗体、例えば血管内皮増殖因子を標的とするベバシツマブ、および上皮増殖因子を標的とするOSI-774；インテグリン受容体を標的とする抗体、例えばVitaxin(MEDI-522としても公知)などがある。本発明の組成物および方法における使用に適した抗癌剤の種類は、以

下を含むが、これらに限定されるものではない：1)アルカロイドで、微小管インヒビター(例えばビンクリスチン、ビンブラスチンおよびビンデシンなど)、微小管安定化剤(例えばパクリタキソール[タキソール]、およびドセタキセル、タキソテレなど)、ならびにエポドフィロトキシシンなどのトポイソメラーゼインヒビター(例えば、エトポシド[VP-16]、およびテニポシド[VM-26]など)、およびトポイソメラーゼIを標的化する物質(例えばカンプトテシンおよびIsirinotecan[CPT-11]など)を含むクロマチン機能インヒビターを含むもの；2)共有的DNA-結合物質[アルキル化剤]で、ナイトロジェンマスタード(例えばメクロレタミン、クロラムブシル、シクロホスファミド、Iホスファミド、およびブスルファン[Myleran]など)、ニトロソ尿素(例えばカルムスチン、ロムスチン、およびセムスチンなど)、および他のアルキル化剤(例えばダカルバジン、ヒドロキシメチルメルアミン、チオテパ、およびマイトマイシンなど)を含むもの；3)非共有的DNA結合剤[抗腫瘍抗生物質]であり、核酸インヒビター(例えばダクチノマイシン[アクチノマイシンD]など)、アントラサイクリン(例えばダウノルビシン[ダウノマイシン、およびセルビジン]、ドキソルビシン[アドリアマイシン]、およびイダルビシン[イダマイシン]など)、アントラセンジオン(例えば[ミトキサントロン]のようなアントラサイクリンアナログなど)、ブレオマイシン(ブレオキササン)など、ならびにプリカマイシン(ミトラマイシン)などを含むもの；4)代謝拮抗物質であり、抗葉酸剤(例えばメトトレキセート、フォレックス、およびメキセートなど)、プリン代謝拮抗物質(例えば6-メルカプトプリン[6-MP、プリネトール]、6-チオグアニン[6-TG]、アザチオプリン、アシクロビル、ガンシクロビル、クロロデオキシアデノシン、2-クロロデオキシアデノシン[CdA]、および2'-デオキシコフォルマイシン[ペントスタチン]など)、ピリミジンアンタゴニスト(例えばフルオロピリミジン[例えば5-フルオロウラシル(Adrucil)、5-フルオロデオキシウリジン(FdUrd)(Floxuridine)]など)、およびシトシンアラビノシド(例えばCytosar[ara-C]およびフルダラビンなど)を含むもの；5)L-アスパラギナーゼ、およびヒドロキシ尿素などを含む、酵素；6)糖質コルチコイド、抗エストロゲン(例えばタモキシフェンなど)、非ステロイド系抗アンドロゲン(例えばフルタミドなど)、およびアロマターゼ阻害薬(例えばアナトロゾール[Arimidex]など)を含む、ホルモン；7)白金化合物(例えばシスプラチンおよびカルボプラチンなど)；8)抗癌剤、毒素および／または放射性物質などと複合された、モノクローナル抗体；9)生体反応修飾剤(例えばインターフェロン[例えばIFN- α など]およびインターロイキン[例えばIL-2など]など)；10)養子免疫療法；11)造血系増殖因子；12)腫瘍細胞分化を誘導する物質(例えば全て-trans-レチノール酸など)；13)遺伝子療法技術；14)アンチセンス療法技術；15)腫瘍ワクチン；16)腫瘍転移に対する治療(例えばBatimistatなど)；および、17)新脈管形成のインヒビター。