

【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 19 年 6 月 21 日 (2007.6.21)

【公表番号】特表 2002-543121 (P2002-543121A)

【公表日】平成 14 年 12 月 17 日 (2002.12.17)

【出願番号】特願 2000-614991 (P2000-614991)

【国際特許分類】

C 0 7 D 243/14 (2006.01)
A 6 1 K 31/5513 (2006.01)
A 6 1 K 45/00 (2006.01)
A 6 1 P 1/00 (2006.01)
A 6 1 P 9/10 (2006.01)
A 6 1 P 11/06 (2006.01)
A 6 1 P 15/00 (2006.01)
A 6 1 P 17/06 (2006.01)
A 6 1 P 19/02 (2006.01)
A 6 1 P 19/04 (2006.01)
A 6 1 P 21/04 (2006.01)
A 6 1 P 29/00 (2006.01)
A 6 1 P 31/12 (2006.01)
A 6 1 P 31/18 (2006.01)
A 6 1 P 31/22 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 37/02 (2006.01)
A 6 1 P 37/06 (2006.01)
C 0 7 D 243/24 (2006.01)
C 0 7 D 401/12 (2006.01)
C 0 7 D 403/12 (2006.01)
C 0 7 D 413/12 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 243/14
 A 6 1 K 31/5513
 A 6 1 K 45/00
 A 6 1 P 1/00
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 11/06
 A 6 1 P 15/00
 A 6 1 P 17/06
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 19/04
 A 6 1 P 21/04
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 31/12
 A 6 1 P 31/18
 A 6 1 P 31/22
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 37/02
 A 6 1 P 37/06

C 0 7 D 243/24
 C 0 7 D 401/12
 C 0 7 D 403/12
 C 0 7 D 413/12
 C 0 7 M 7:00

【手続補正書】

【提出日】平成19年4月26日(2007.4.26)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

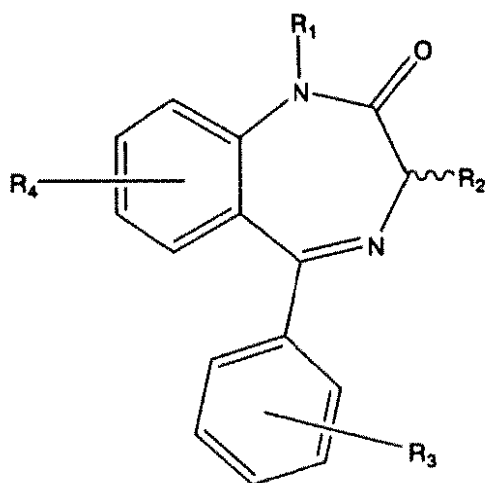
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 ベンゾジアゼピン化合物を含む、免疫障害、過剰増殖障害または慢性炎症状態に対する医薬であって、該ベンゾジアゼピン化合物が、以下の式：

【化1】



、またはその塩もしくはエステル、または、その鏡像異性体もしくはラセミ混合物を含み、ここで、

R_1 は、脂肪族またはアリールであり；

R_2 は、脂肪族、アリール、 $-NH_2$ 、 $-NHC(=O)-R_5$ 、または水素結合形成に関与する部分であり、

ここで R_5 は、アリール、複素環式、 $-R_6-NH-C(=O)-R_7$ または $-R_6-C(=O)-NH-R_7$ であり、ここで R_6 は、1～6個の炭素の脂肪族リンカーであり、そして R_7 は、脂肪族、アリール、または複素環式であり；ならびに

R_3 および R_4 は、水素、ヒドロキシル、アルコキシ、ハロ、アミノ、低級アルキル置換アミノ、アセチルアミノ、ヒドロキシアミノ、1～8個の炭素および1～20個の水素を有する脂肪族基、アリール、または複素環式からなる群より独立して選択される、医薬

。

【請求項2】 R_1 が、メチルである、請求項1に記載の医薬。

【請求項3】 R_2 が、置換アリールである、請求項1に記載の医薬。

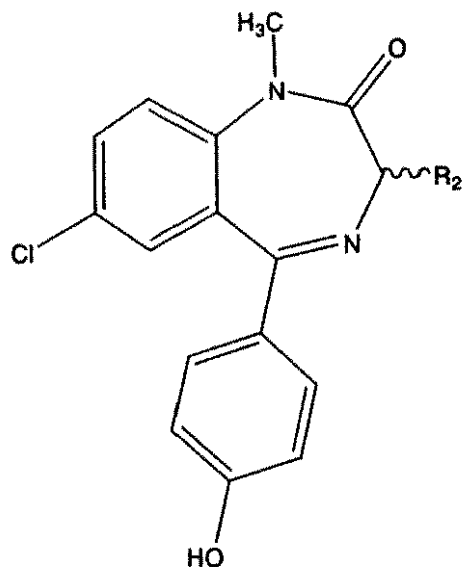
【請求項4】 R_4 が、ハロゲンである、請求項1に記載の医薬。

【請求項5】 前記ハロゲンが、塩素である、請求項4に記載の医薬。

【請求項6】 R_3 が、ヒドロキシルである、請求項1に記載の医薬。

【請求項7】 請求項1に記載の医薬であって、前記ベンゾジアゼピン化合物が、以下の式：

【化 2】

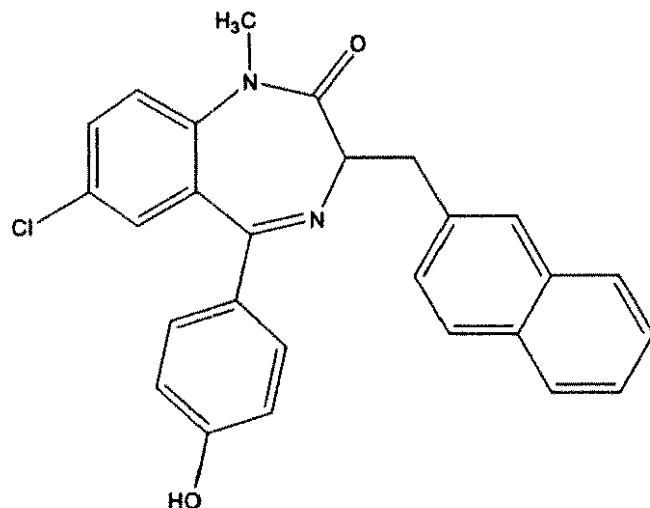


を含み、ここで、

R₂ は、脂肪族、アリール、-NH₂、-NHC(=O)-R₅、または水素結合形成に
関与する部分である、医薬。

【請求項 8】 請求項 1 に記載の医薬であって、前記ベンゾジアゼピンが、以下の構
造：

【化 3】



を含む、医薬。

【請求項 9】 前記免疫障害が、対宿主性移植片病である、請求項 1 に記載の医薬。

【請求項 10】 前記免疫障害が、慢性関節リウマチである、請求項 1 に記載の医薬

。

【請求項 11】 前記免疫障害が、全身性エリテマトーデスである、請求項 1 に記載
の医薬。

【請求項 12】 前記過剰増殖障害が、癌である、請求項 1 に記載の医薬。

【請求項 13】 前記癌が、腫瘍、新生物、リンパ腫または白血病である、請求項 1
2 に記載の医薬。

【請求項 14】 前記慢性炎症状態が、ぜん息である、請求項 1 に記載の医薬。

【請求項 15】 前記慢性炎症状態が、乾癬である、請求項 1 に記載の医薬。

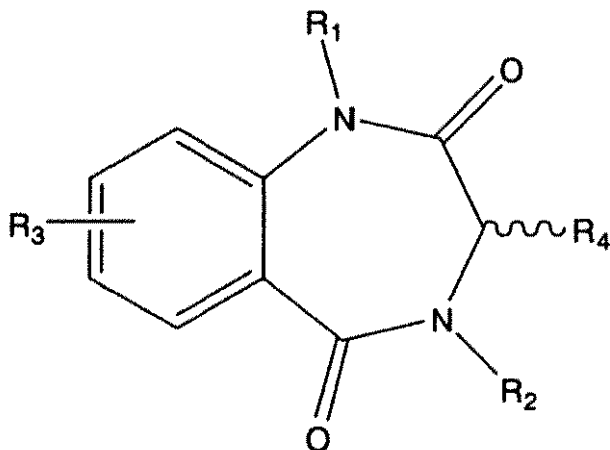
【請求項 16】 前記免疫障害を処置するための追加の薬剤をさらに含む、請求項 1
に記載の医薬。

【請求項 17】 前記過剰増殖障害を処置するための追加の薬剤をさらに含む、請求項 1 に記載の医薬。

【請求項 18】 前記慢性炎症状態を処置するための追加の薬剤をさらに含む、請求項 1 に記載の医薬。

【請求項 19】 ベンゾ - 2 , 5 - ジオン化合物を含む、免疫障害、過剰増殖障害または慢性炎症状態に対する医薬であって、該ベンゾ - 2 , 5 - ジオン化合物が、以下の式

【化 4】



を有する化合物、それらの鏡像異性体および薬学的に受容可能な塩を含み、ここで、

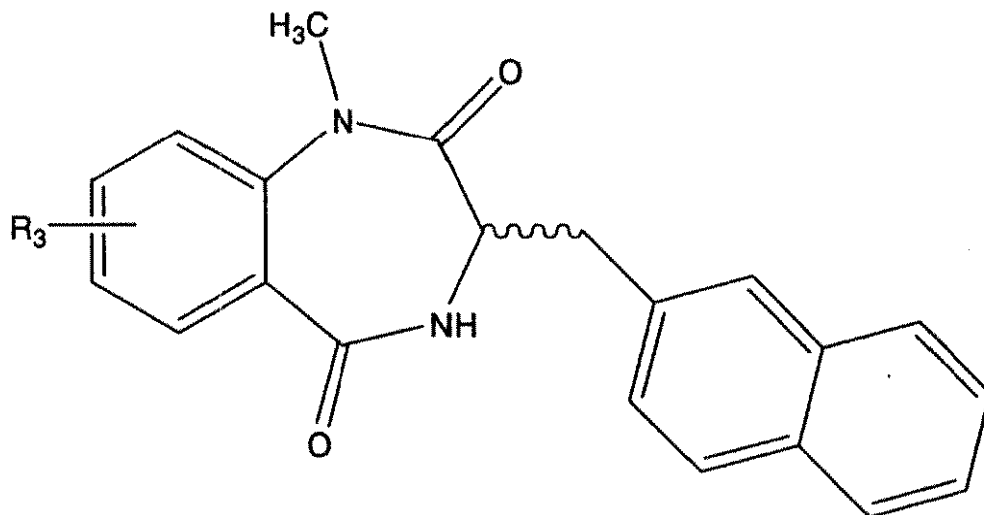
R₁ は、1 ~ 20 個の炭素原子および 1 ~ 20 個の水素原子を有する脂肪族基、または 20 個までの炭素原子および 20 個までの水素原子を有するアリール基であり；

R₂ および R₃ のそれぞれは、水素、ヒドロキシル、C₁ ~ 4 アルコキシ、ハロ、アミノ、C₁ ~ 4 アルキル置換アミノ、アセチルアミノ、ヒドロキシアミノ、1 ~ 8 個の炭素および 1 ~ 20 個の水素を有する脂肪族基、6 ~ 14 個の炭素原子を有するアリール基、ならびに、窒素、酸素および硫黄から選択される 1 つ以上のヘテロ原子を含む 3 ~ 6 員の芳香族環または非芳香族環を有する複素環式からなる群より、独立して選択され、

R₄ は、脂肪族またはアリールである、医薬。

【請求項 20】 請求項 19 に記載の医薬であって、前記ベンゾ - 2 , 5 - ジオンが、以下の構造：

【化 5】



を含む、医薬。

【請求項 21】 前記免疫障害が、対宿主性移植片病である、請求項 19 に記載の医

薬。

【請求項 2 2】 前記免疫障害が、慢性関節リウマチである、請求項 1 9 に記載の医薬。

【請求項 2 3】 前記免疫障害が、全身性エリテマトーデスである、請求項 1 9 に記載の医薬。

【請求項 2 4】 前記過剰増殖障害が、癌である、請求項 1 9 に記載の医薬。

【請求項 2 5】 前記癌が、腫瘍、新生物、リンパ腫または白血病である、請求項 2 4 に記載の医薬。

【請求項 2 6】 前記慢性炎症状態が、ぜん息である、請求項 1 9 に記載の医薬。

【請求項 2 7】 前記慢性炎症状態が、乾癬である、請求項 1 9 に記載の医薬。

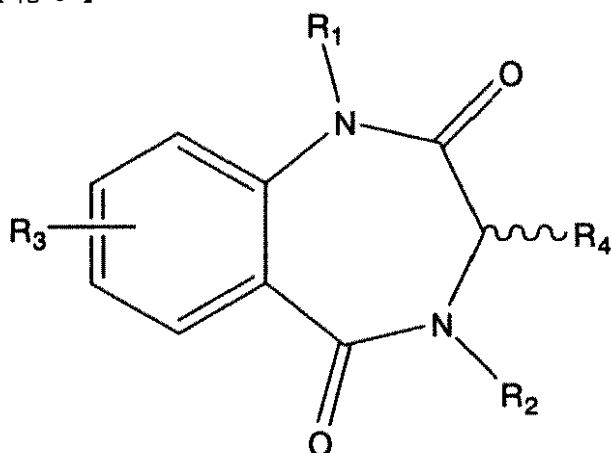
【請求項 2 8】 前記免疫障害を処置するための追加の薬剤をさらに含む、請求項 1 9 に記載の医薬。

【請求項 2 9】 前記過剰増殖障害を処置するための追加の薬剤をさらに含む、請求項 1 9 に記載の医薬。

【請求項 3 0】 前記慢性炎症状態を処置するための追加の薬剤をさらに含む、請求項 1 9 に記載の医薬。

【請求項 3 1】 以下の式：

【化 6】



を含むベンゾ - 2 , 5 - ジオン化合物、それらの鏡像異性体および薬学的に受容可能な塩であり、ここで、

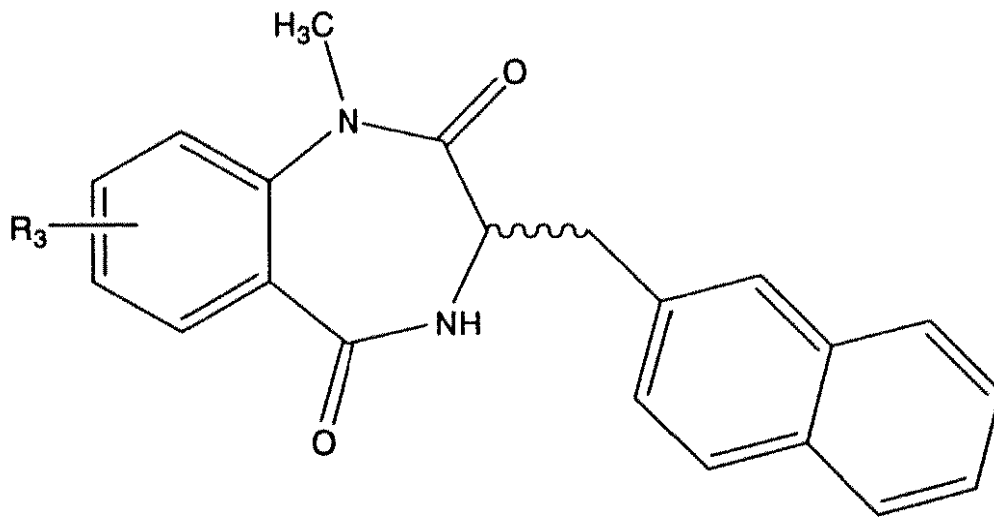
R₁ は、1 ~ 2 0 個の炭素原子および 1 ~ 2 0 個の水素原子を有する脂肪族基、または 2 0 個までの炭素原子および 2 0 個までの水素原子を有するアリール基であり；

R₂ および R₃ のそれぞれは、水素、ヒドロキシル、C₁ ~ 4 アルコキシ、ハロ、アミノ、C₁ ~ 4 アルキル置換アミノ、アセチルアミノ、ヒドロキシアミノ、1 ~ 8 個の炭素および 1 ~ 2 0 個の水素を有する脂肪族基、6 ~ 1 4 個の炭素原子を有するアリール基、ならびに、窒素、酸素および硫黄から選択される 1 つ以上のヘテロ原子を含む 3 ~ 6 員の芳香族環または非芳香族環を有する複素環式基からなる群より、独立して選択され、

R₄ は、脂肪族またはアリールである、ベンゾ - 2 , 5 - ジオン化合物、それらの鏡像異性体および薬学的に受容可能な塩。

【請求項 3 2】 前記ベンゾ - 2 , 5 - ジオンが、以下の構造：

【化 7】



を含む、請求項 3 1 に記載のベンゾ - 2 , 5 - ジオン化合物。