

【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8月17日(2006.8.17)

【公表番号】特表2005-538975(P2005-538975A)

【公表日】平成17年12月22日(2005.12.22)

【年通号数】公開・登録公報2005-050

【出願番号】特願2004-518947(P2004-518947)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/65 (2006.01)
A 6 1 K 31/44 (2006.01)
A 6 1 K 31/4406 (2006.01)
A 6 1 K 31/4409 (2006.01)
A 6 1 K 31/443 (2006.01)
A 6 1 K 31/4436 (2006.01)
A 6 1 K 31/4439 (2006.01)
A 6 1 K 31/444 (2006.01)
A 6 1 K 31/4965 (2006.01)
A 6 1 K 31/497 (2006.01)
A 6 1 K 31/506 (2006.01)
A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
A 6 1 P 1/04 (2006.01)
A 6 1 P 9/10 (2006.01)
A 6 1 P 11/00 (2006.01)
A 6 1 P 17/02 (2006.01)
A 6 1 P 17/06 (2006.01)
A 6 1 P 19/02 (2006.01)
A 6 1 P 19/06 (2006.01)
A 6 1 P 19/10 (2006.01)
A 6 1 P 21/00 (2006.01)
A 6 1 P 29/00 (2006.01)
A 6 1 P 31/04 (2006.01)
A 6 1 P 31/06 (2006.01)
A 6 1 P 31/16 (2006.01)
A 6 1 P 31/18 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 37/06 (2006.01)
A 6 1 P 39/02 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
C 0 7 D 213/73 (2006.01)
C 0 7 D 213/74 (2006.01)
C 0 7 D 213/81 (2006.01)
C 0 7 D 241/18 (2006.01)
C 0 7 D 241/20 (2006.01)
C 0 7 D 401/12 (2006.01)
C 0 7 D 403/12 (2006.01)
C 0 7 D 403/14 (2006.01)
C 0 7 D 405/12 (2006.01)
C 0 7 D 405/14 (2006.01)
C 0 7 D 409/12 (2006.01)

C 0 7 D 413/12 (2006.01)
C 0 7 D 417/12 (2006.01)
C 0 7 D 417/14 (2006.01)
C 0 7 D 513/04 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 213/65	C S P
A 6 1 K 31/44	
A 6 1 K 31/4406	
A 6 1 K 31/4409	
A 6 1 K 31/443	
A 6 1 K 31/4436	
A 6 1 K 31/4439	
A 6 1 K 31/444	
A 6 1 K 31/4965	
A 6 1 K 31/497	
A 6 1 K 31/506	
A 6 1 K 31/5377	
A 6 1 P 1/04	
A 6 1 P 9/10	
A 6 1 P 11/00	
A 6 1 P 17/02	
A 6 1 P 17/06	
A 6 1 P 19/02	
A 6 1 P 19/06	
A 6 1 P 19/10	
A 6 1 P 21/00	
A 6 1 P 29/00	
A 6 1 P 29/00	1 0 1
A 6 1 P 31/04	
A 6 1 P 31/06	
A 6 1 P 31/16	
A 6 1 P 31/18	
A 6 1 P 35/00	
A 6 1 P 37/06	
A 6 1 P 39/02	
A 6 1 P 43/00	1 1 1
A 6 1 P 43/00	1 2 3
C 0 7 D 213/73	
C 0 7 D 213/74	
C 0 7 D 213/81	
C 0 7 D 241/18	
C 0 7 D 241/20	
C 0 7 D 401/12	
C 0 7 D 403/12	
C 0 7 D 403/14	
C 0 7 D 405/12	
C 0 7 D 405/14	
C 0 7 D 409/12	
C 0 7 D 413/12	
C 0 7 D 417/12	

C 0 7 D 417/14

C 0 7 D 513/04 3 3 1

【手続補正書】

【提出日】平成18年6月29日(2006.6.29)

【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

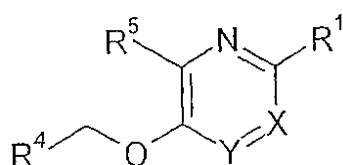
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

治療方法で使用するための下記式Iの化合物および該化合物の製薬上許容される塩。

【化1】



[式中、

-X=Y-は、-CR²=CR³-および-CR²=N-から選択され；

R¹は、H、ハロ、NRR'、NHC(=O)R、NHC(=O)NRR'、NH₂SO₂RおよびC(=O)NRR'から選択され；RおよびR'はHおよびC₁₋₄アルキルから独立に選択され、OH、NH₂、SO₂-NH₂、C₅₋₂₀カルボアリール、C₅₋₂₀ヘテロアリールおよびC₃₋₂₀複素環によって置換されているとしても良く、あるいは一体となって、それらが結合している窒素原子とともに、置換されているとしても良い窒素含有C₅₋₇複素環基を形成しているとしても良く；

R²およびR³(存在する場合)は独立に、H、置換されているとしても良いC₁₋₇アルキル、置換されているとしても良いC₅₋₂₀アリール、置換されているとしても良いC₃₋₂₀複素環、ハロ、アミノ、アミド、ヒドロキシ、エーテル、チオ、チオエーテル、アシルアミド、ウレイドおよびスルホンアミノから選択され；

R⁴は、置換されているとしても良いC₅₋₂₀カルボアリールまたはC₅₋₂₀ヘテロアリール基であり；

R⁵は、R⁵、ハロ、NHR⁵、C(=O)NHR⁵、OR⁵、SR⁵、NHC(=O)R⁵、NHC(=O)NHR⁵、NHS(=O)₂R⁵から選択され；R⁵はHまたはC₁₋₃アルキル(ハロ、NH₂、OH、SHによって置換されているとしても良い)である。]

【請求項2】

-X=Y-が-CR²=N-である請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R⁵がR⁵、ハロ、NHR⁵、OR⁵、SR⁵から選択され；R⁵がHまたはC₁₋₃アルキル(ハロ、NH₂、OH、SHによって置換されているとしても良い)である請求項1または2に記載の化合物。

【請求項4】

R⁵がHおよびNH₂から選択される請求項3に記載の化合物。

【請求項5】

R¹がH、NRR'、NHC(=O)R、NHC(=O)NRR'およびNH₂SO₂Rから選択される請求項1~4のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項6】

R¹がHおよびNH₂から選択される請求項6に記載の化合物。

【請求項7】

R²およびR³(存在する場合)が独立に、H、ハロ、アミノ、ヒドロキシおよびチオから選

択される請求項 1 ~ 6 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 8】

R^2 および R^3 (存在する場合) が H およびハロゲンから選択される請求項 7 に記載の化合物。

【請求項 9】

R^4 が置換されていても良い C_{5-10} アリール基である請求項 1 ~ 8 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 10】

R^4 が C_{5-10} カルボアリール基および 1 個もしくは 2 個の窒素環原子を有する C_{5-10} ヘテロアリール基から選択される請求項 9 に記載の化合物。

【請求項 11】

R^4 が、置換されていても良いフェニルまたはナフチル基である請求項 10 に記載の化合物。

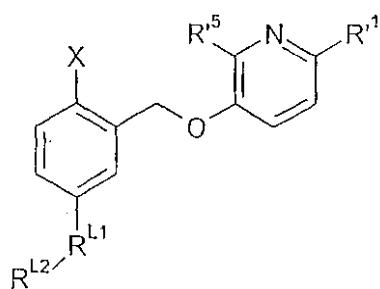
【請求項 12】

R^4 が、独立にハロゲン、エーテル、 C_{1-7} アルキル、 C_{5-20} アリール、アミド、アシルアミド、ウレイド、カーバメートおよび逆カーバメートから選択される 1 個もしくは 2 個の置換基で置換されたフェニル基である請求項 11 に記載の化合物。

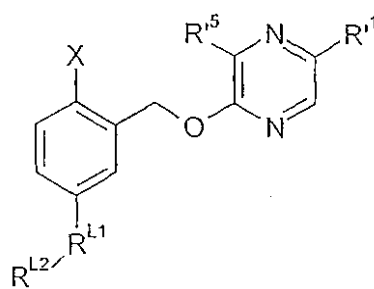
【請求項 13】

下記式 IIa または下記式 IIb の構造を有する請求項 1 に記載の化合物。

【化 2】



(IIa)



(IIb)

[式中、

R^1 は、H、 $NR^{C1}R^{C2}$ 、 $NHC(=O)R^{C1}$ 、 $NHC(=O)NR^{C1}R^{C2}$ 、 $NH_2SO_2R^{C1}$ および $C(=O)NR^{C1}R^{C2}$ から選択され； R^{C1} および R^{C2} は独立に、H および C_{1-4} アルキルから選択され、OH、 NH_2 、 C_{5-20} カルボアリールおよび C_{5-20} ヘテロアリールによって置換されていても良く、あるいは一体となって、それらが結合している窒素原子とともに、置換されていても良い窒素含有 C_{5-7} 複素環基を形成していても良く；

R^5 は、H および NH_2 から選択され；

X は、H およびハロゲンから選択され；

R^{L1} は、 $-NH-C(=O)-$ 、 $-NH-C(=O)-NH-$ 、 $-NH-C(=O)-O-$ または $-O-C(=O)-NH-$ から選択され；

R^{L2} は、H、置換されていても良い C_{5-20} カルボアリールおよび置換されていても良い C_{5-20} ヘテロアリールから選択され；ただし R^{L1} が $-NH-C(=O)-O-$ である場合には、 R^{L2} は H であることはできない。]

【請求項 14】

式 IIa の構造を有する請求項 13 に記載の化合物。

【請求項 15】

R^1 が H および $NR^{C1}R^{C2}$ から選択される請求項 14 に記載の化合物。

【請求項 16】

R^1 が H および NHR^{C1} から選択される請求項 15 に記載の化合物。

【請求項 17】

R^5 が H である請求項 14 ~ 16 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 18】

Xがハロゲンである請求項 14 ~ 17 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 19】

R^{L1} が $-NH-C(=O)-$ である請求項 14 ~ 18 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 20】

R^{L2} が C_{5-20} カルボアリールまたは C_{5-20} ヘテロアリール基である請求項 14 ~ 19 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 21】

式 IIb の構造を有する請求項 13 に記載の化合物。

【請求項 22】

R^{1} が H および $NR^{C1}R^{C2}$ から選択される請求項 21 に記載の化合物。

【請求項 23】

R^{5} が H である請求項 21 または請求項 22 に記載の化合物。

【請求項 24】

Xがハロゲンである請求項 21 ~ 23 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 25】

R^{L1} が $-NH-C(=O)-NH-$ である請求項 21 ~ 24 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 26】

R^{L2} が C_{5-20} カルボアリールまたは C_{5-20} ヘテロアリール基である請求項 21 ~ 25 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 27】

請求項 13 ~ 26 のいずれか 1 項に記載の式 IIa もしくは IIb の化合物あるいは該化合物の異性体、塩、溶媒和物またはプロドラッグ。

【請求項 28】

請求項 1 ~ 26 のいずれか 1 項に記載の化合物および製薬上許容される担体または希釈剤を含む組成物。

【請求項 29】

p38MAPキナーゼ阻害によって改善される状態の治療に使用するための医薬の製造における請求項 1 ~ 26 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 30】

p38MAPキナーゼ阻害によって改善される前記状態が関節炎状態である請求項 29 に記載の使用。