

【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7月6日(2006.7.6)

【公表番号】特表2006-513192(P2006-513192A)

【公表日】平成18年4月20日(2006.4.20)

【年通号数】公開・登録公報2006-016

【出願番号】特願2004-563181(P2004-563181)

【国際特許分類】

C 0 7 D 409/14 (2006.01)
C 0 7 D 417/14 (2006.01)
C 0 7 D 417/12 (2006.01)
C 0 7 D 473/38 (2006.01)
C 0 7 D 495/04 (2006.01)
A 6 1 K 31/517 (2006.01)
A 6 1 K 31/52 (2006.01)
A 6 1 K 31/5377 (2006.01)
A 6 1 K 31/4709 (2006.01)
A 6 1 K 31/519 (2006.01)
A 6 1 P 37/02 (2006.01)
A 6 1 P 25/28 (2006.01)
A 6 1 P 37/08 (2006.01)
A 6 1 P 11/06 (2006.01)
A 6 1 P 37/06 (2006.01)
A 6 1 P 19/02 (2006.01)
A 6 1 P 21/00 (2006.01)
A 6 1 P 35/02 (2006.01)
A 6 1 K 45/00 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 409/14
 C 0 7 D 417/14 C S P
 C 0 7 D 417/12
 C 0 7 D 473/38
 C 0 7 D 495/04 1 0 5 Z
 A 6 1 K 31/517
 A 6 1 K 31/52
 A 6 1 K 31/5377
 A 6 1 K 31/4709
 A 6 1 K 31/519
 A 6 1 P 37/02
 A 6 1 P 25/28
 A 6 1 P 37/08
 A 6 1 P 11/06
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 19/02
 A 6 1 P 21/00
 A 6 1 P 35/02
 A 6 1 K 45/00
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成18年4月19日(2006.4.19)

【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

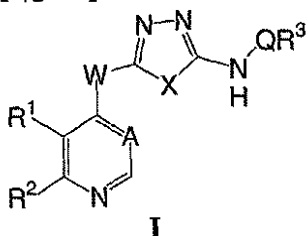
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物：

【化1】



またはその薬学的に受容可能な塩であって、
ここで：

WおよびXは、各々独立して、酸素または硫黄であり；

Aは、窒素、CH、C-CN、またはC-(C₁₋₃脂肪族)であり；

R¹およびR²は、一緒になって、必要に応じて置換された、3~7員の、飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和の環を形成し、該環は、窒素、酸素、または硫黄から独立して選択される、0~3個のヘテロ原子を有し；

Qは、原子価結合、-C(O)-、-C(O)NR-、-C(O)C(O)-、-CO₂-、-C(O)CO₂-、-SO₂-、または必要に応じて置換されたC₁₋₆アルキリデン鎖であり、ここで：

Qの1つまたは2つの隣接しないメチレン単位は、必要に応じて、独立して、-O-、-S-、-NR-、-C(O)-、-CO₂-、-C(O)NR-、-OC(O)NR-、-NRC(O)-、NRCO₂-、-NRC(O)NR-、-S(O)-、-SO₂-、-NRSO₂-、-SO₂NR-、または-NRSO₂NR-によって置き換えられ；

各Rは、独立して、水素、または必要に応じて置換されたC₁₋₆脂肪族基であって、
ここで：

同じ窒素原子に結合する2つのRは、必要に応じて、該窒素と一緒に、必要に応じて置換された3~7員の、飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和の環を形成し、該環は、該環に結合する窒素に加えて、窒素、酸素、または硫黄から独立して選択される0~2個のヘテロ原子を有し；

R³は、RまたはArであり；そして

Arは、必要に応じて置換された、以下：

(a) 3~8員の単環式、または8~10員の二環式の、飽和環、部分的に不飽和の環、またはアリール環；

(b) 3~7員の複素環式環であって、該環は、窒素、酸素、または硫黄から独立して選択される、1~3個のヘテロ原子を有する、環；あるいは

(c) 5~6員の単環式、または8~10員の二環式の、ヘテロアリール環であって、窒素、酸素、または硫黄から独立して選択される、1~4個のヘテロ原子を有する、環、から選択される環であり、

ただし、該化合物は、以下：

3 - クロロ - ベンゾ [b] チオフェン - 2 - カルボン酸 [5 - (7 - クロロ - キノリン - 4 - イルスルファニル) - [1 , 3 , 4] チアジアゾール - 2 - イル] アミド ;
 N - [5 - (7 - クロロ - キノリン - 4 - イルスルファニル) - [1 , 3 , 4] チアジアゾール - 2 - イル] - 2 - フェノキシ - ニコチンアミド ;
 5 - メチル - 2 - フェニル - 2 H - [1 , 2 , 3] トリアゾール - 4 - カルボン酸 [5 - (7 - クロロ - キノリン - 4 - イルスルファニル) - [1 , 3 , 4] チアジアゾール - 2 - イル] - アミド ;
 シクロプロパンカルボン酸 [5 - (7 - クロロ - キノリン - 4 - イルスルファニル) - [1 , 3 , 4] チアジアゾール - 2 - イル] - アミド ;
 N - ヘプチル [5 - (7 - クロロ - キノリン - 4 - イルスルファニル) - [1 , 3 , 4] チアジアゾール - 2 - イル] - アセトアミド ;
 チオフェン - 2 - カルボン酸 [5 - (7 - クロロ - キノリン - 4 - イルスルファニル) - [1 , 3 , 4] チアジアゾール - 2 - イル] - アミド ;
 5 - (6 - エチル - チエノ [2 , 3 - d] ピリミジン - 4 - イルスルファニル) - [1 , 3 , 4] チアジアゾール - 2 - イルアミン ;
 5 - (2 - クロロ - チエノ [2 , 3 - b] ピリジン - 4 - イルスルファニル) - [1 , 3 , 4] チアジアゾール - 2 - イルアミン ;
 2 - クロロ - N - [5 - (7 - クロロ - キノリン - 4 - イルスルファニル) - [1 , 3 , 4] チアジアゾール - 2 - イル] - 2 - メチル - プロピオンアミド ;
 2 - クロロ - N - [5 - (7 - クロロ - キノリン - 4 - イルスルファニル) - [1 , 3 , 4] チアジアゾール - 2 - イル] - 2 - メチル - プロピオンアミド ;
 4 - ヒドロキシ - 2 - オキソ - 2 , 3 - ジヒドロ - キノリン - 3 - カルボン酸 [5 - (7 - クロロ - キノリン - 4 - イルスルファニル) - [1 , 3 , 4] チアジアゾール - 2 - イル] - アミド ;
 1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 2 - アミン , 5 - [(7 - メチルチエノ [3 , 2 - d] ピリミジン - 4 - イル) チオ] - ; および
 アセトアミド , N [5 - (1 H - プリン - 6 - イルチオ) - 1 , 3 , 4 - チアジアゾール - 2 - イル

からなる群より選択される化合物ではない、化合物。

【請求項 2】

R¹ および R² が、一緒になって、必要に応じて置換された、5 ~ 7 員の、飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和の環を形成し、該環が、窒素、酸素、または硫黄から独立して選択される 0 ~ 2 個のヘテロ原子を有する、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R¹ および R² が、一緒になって、必要に応じて置換されたベンゾ環、チエノ環、シクロヘキソ環、ピリド環、テトラヒドロピリド環、またはピリミド環を形成する、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

Q が、原子価結合、- C (O) -、- C (O) N R -、- C O₂ -、- C (O) C O₂ -、- S O₂ -、または必要に応じて置換された C₁ - 4 アルキリデン鎖であり、ここで：

Q の 1 つまたは 2 つの隣接しないメチレン単位は、必要に応じて、独立して、- O -、- S -、- N R -、- C (O) -、- C O₂ -、または - S O₂ - によって置き換えられている、

請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

R³ が、必要に応じて置換された C₁ - 6 脂肪族基、または必要に応じて置換された、以下：

(a) 3 ~ 6 員の単環式の飽和環またはアリール環；

(b) 5～6員の複素環式環であって、該環は、窒素、酸素、または硫黄から独立して選択される、1～2個のヘテロ原子を有する、環；あるいは

(c) 5～6員の単環式、または9～10員の二環式の、ヘテロアリアル環であって、窒素、酸素、または硫黄から独立して選択される、1～3個のヘテロ原子を有する、環、から選択される環である、請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

R³が、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、イソブチル、tert-ブチル、シクロプロピル、シクロペンチル、シクロヘキシル、フェニル、ピリジル、チエニル、フラニル、イソオキサゾリル、チアゾリル、ベンゾチエニル、またはベンゾ[1,3]ジオキサゾリルからなる群より選択される、必要に応じて置換された基である、請求項5に記載の化合物。

【請求項7】

Wが硫黄である、請求項1～6のいずれか1項に記載の化合物。

【請求項8】

Xが硫黄である、請求項7に記載の化合物。

【請求項9】

Aが窒素である、請求項8に記載の化合物。

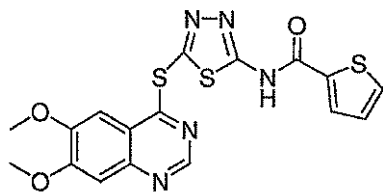
【請求項10】

AがCHである、請求項8に記載の化合物。

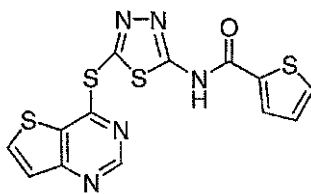
【請求項11】

以下の化合物：

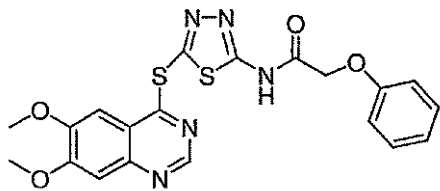
【化 2】



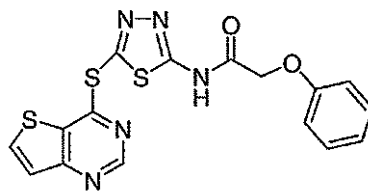
I-2



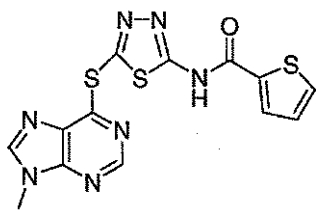
I-3



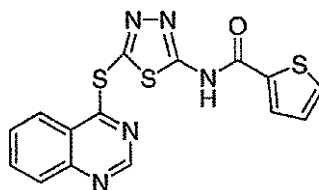
I-4



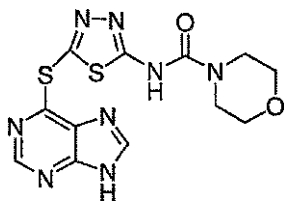
I-5



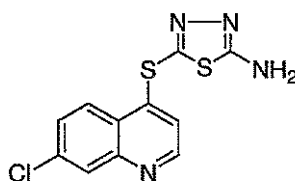
I-7



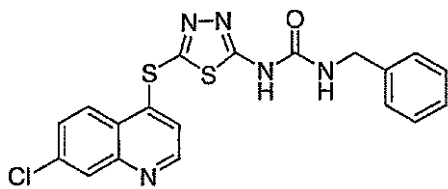
I-8



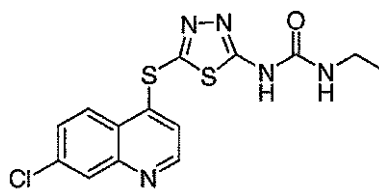
I-9



I-10

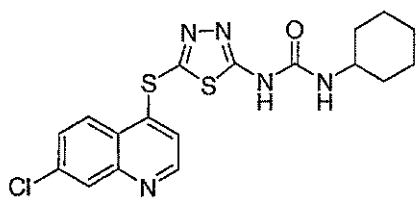


I-13

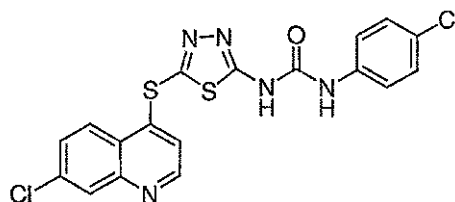


I-14

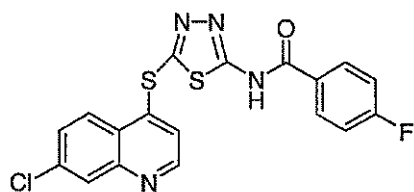
【化 3】



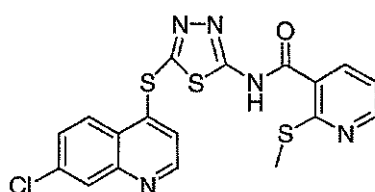
I-15



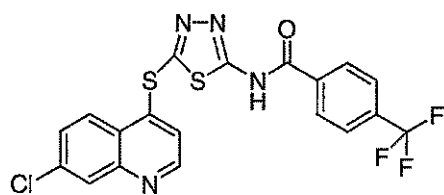
I-16



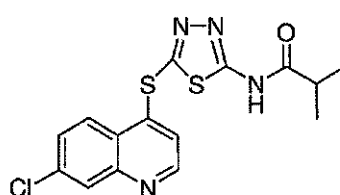
I-17



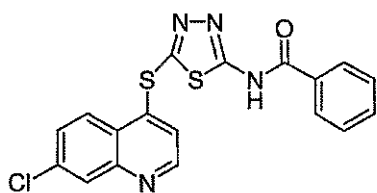
I-18



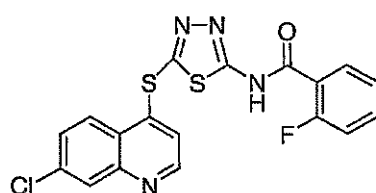
I-19



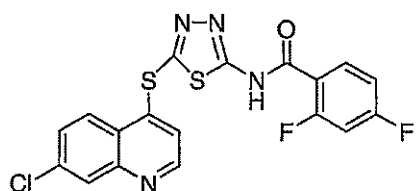
I-20



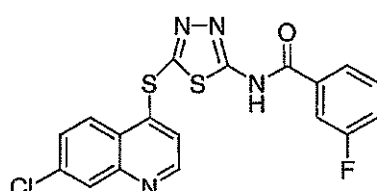
I-21



I-22

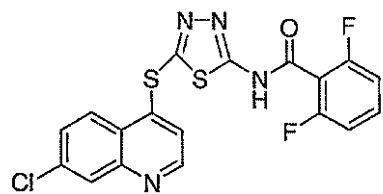


I-23

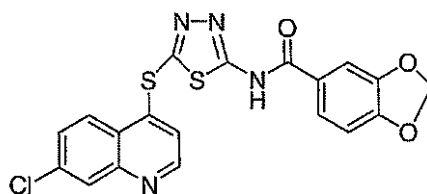


I-24

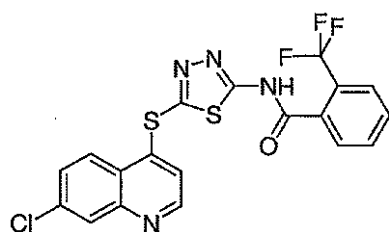
【化 4】



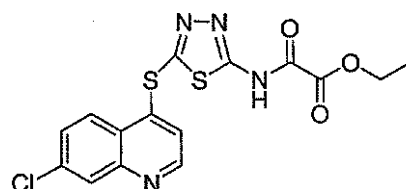
I-25



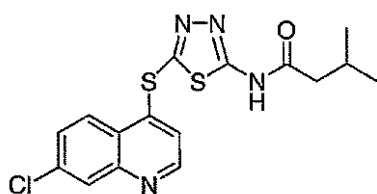
I-26



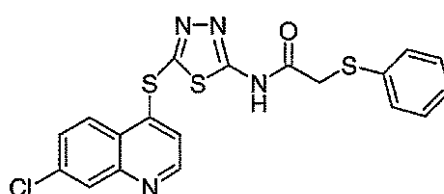
I-27



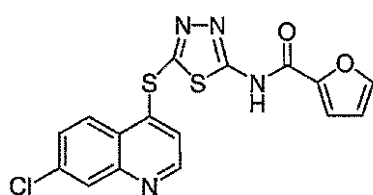
I-28



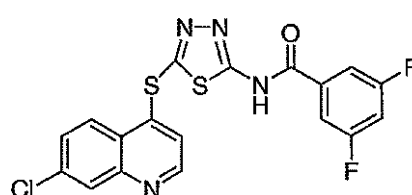
I-29



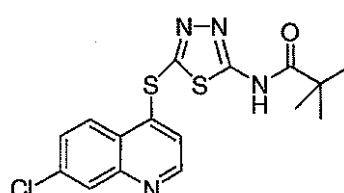
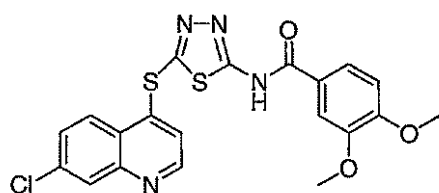
I-30



I-31

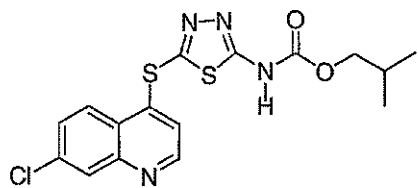


I-32

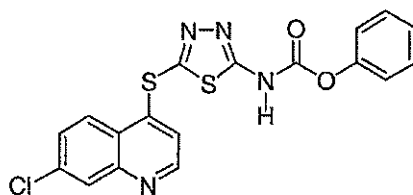


【化 5】

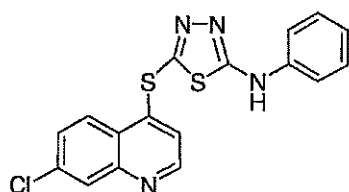
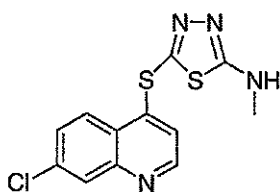
I-33



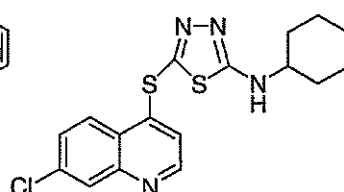
I-34



I-35



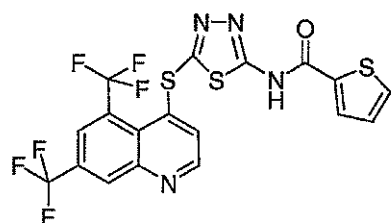
I-36



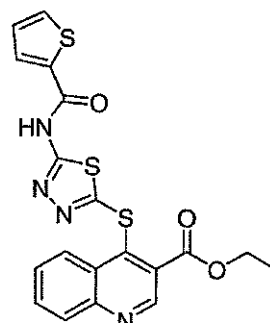
I-37

I-38

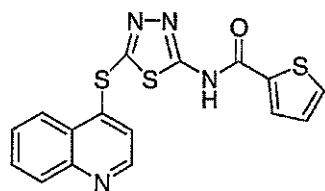
I-39



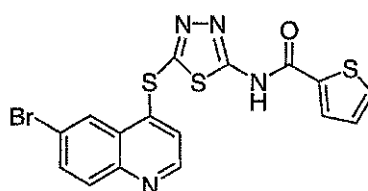
I-40



I-41

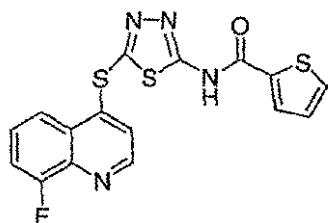


I-42

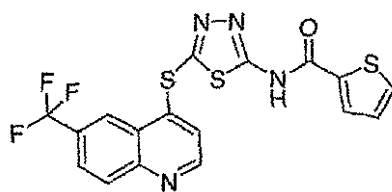


I-43

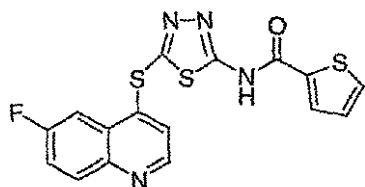
【化 6】



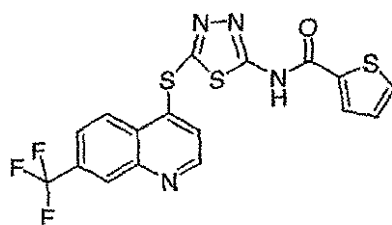
I-44



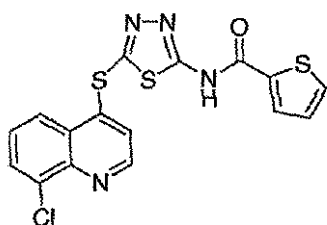
I-45



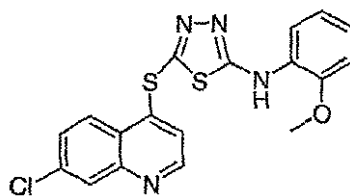
I-46



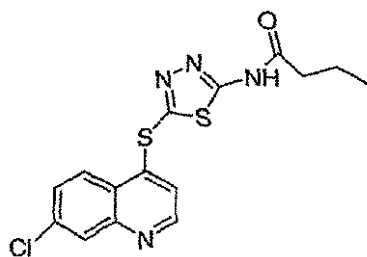
I-47



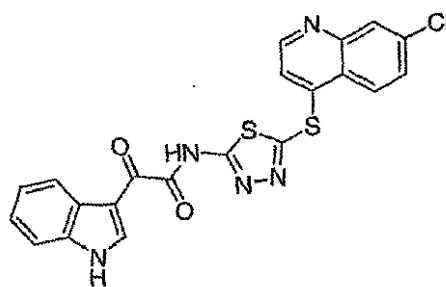
I-48



I-49

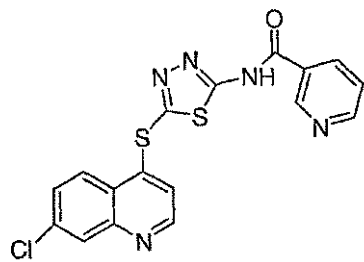


I-50

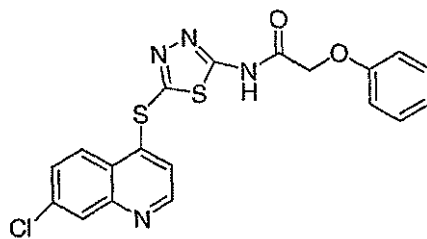


I-51

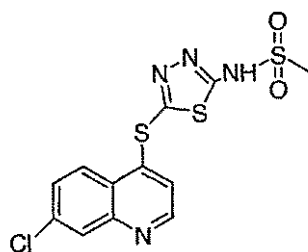
【化7】



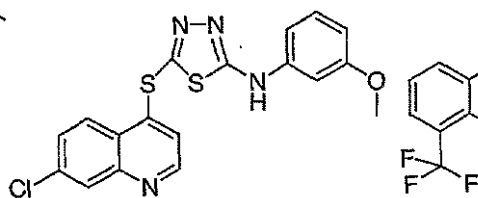
I-52



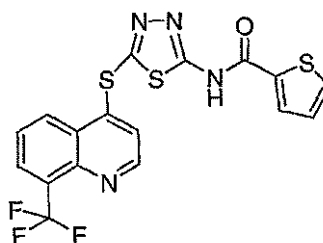
I-53



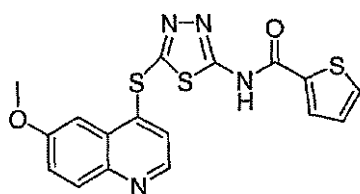
I-54



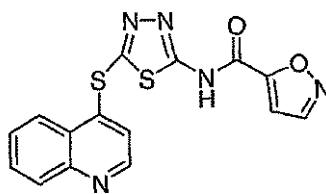
I-55



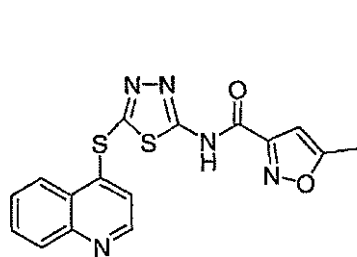
I-56



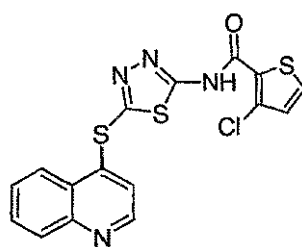
I-57



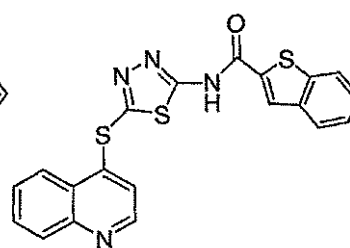
I-58



I-59

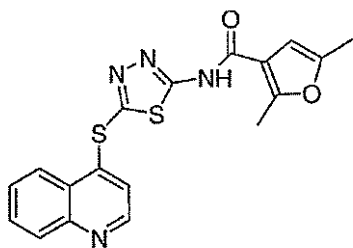


I-60

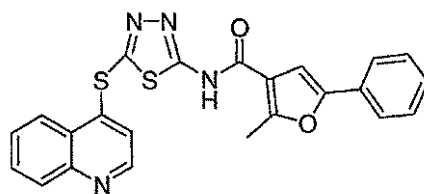


I-61

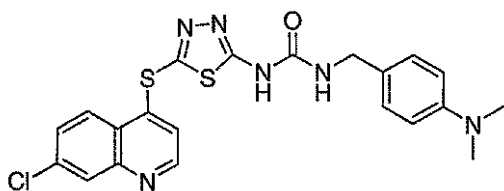
【化 8】



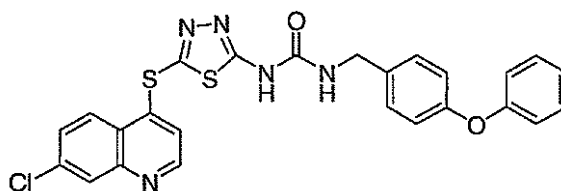
I-62



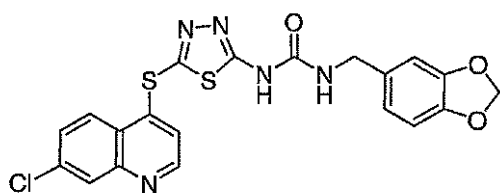
I-63



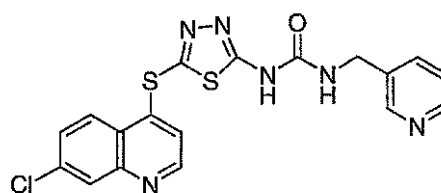
I-64



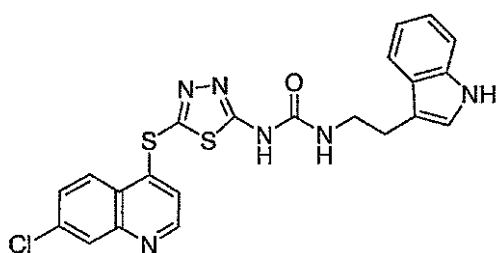
I-65



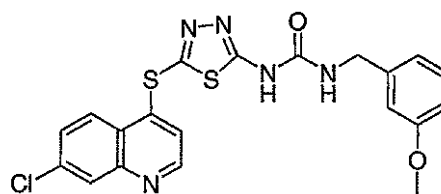
I-66



I-67

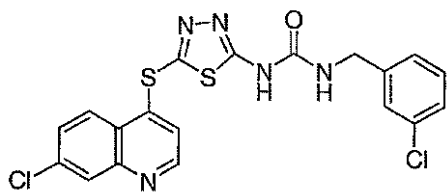


I-68

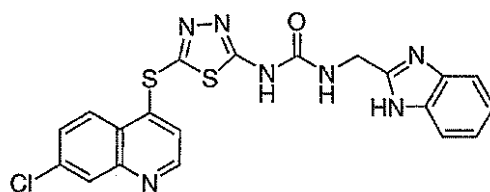


I-69

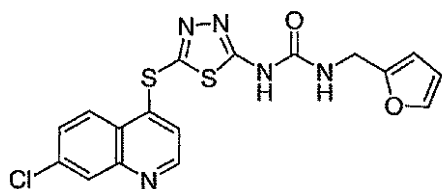
【化 9】



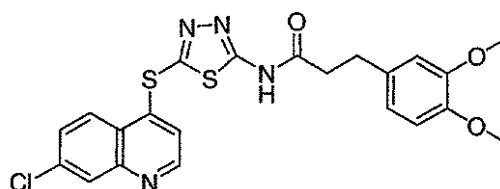
I-70



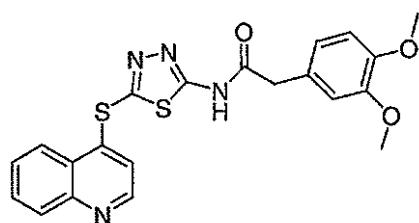
I-71



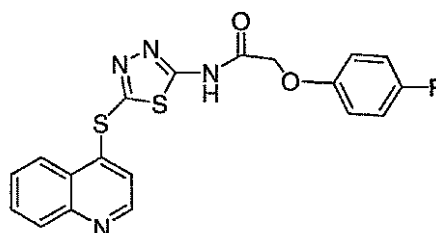
I-72



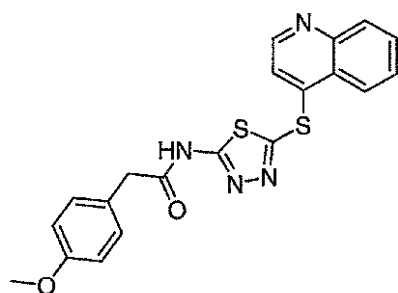
I-73



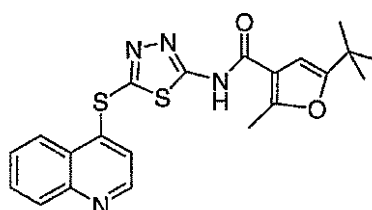
I-78



I-79

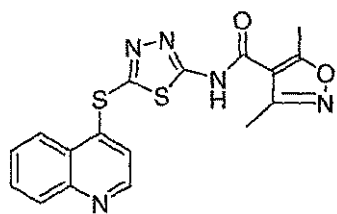


I-80

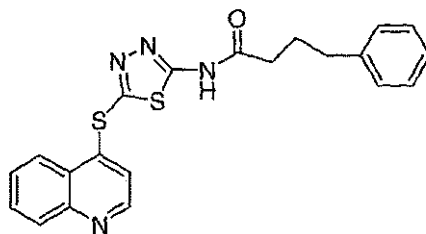


I-81

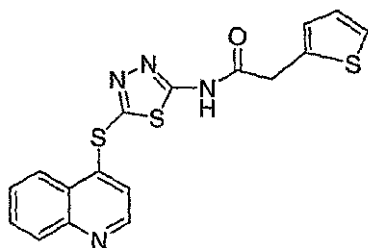
【化 10】



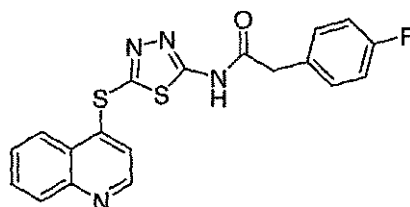
I-82



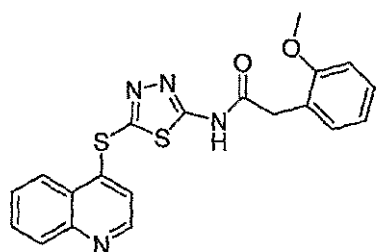
I-83



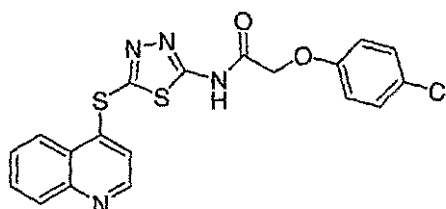
I-84



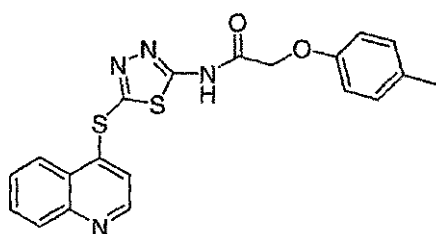
I-85



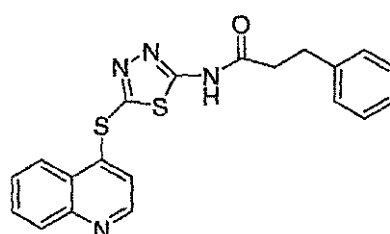
I-86



I-87

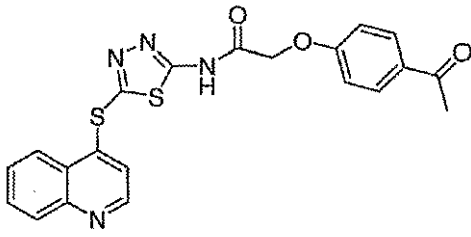


I-88

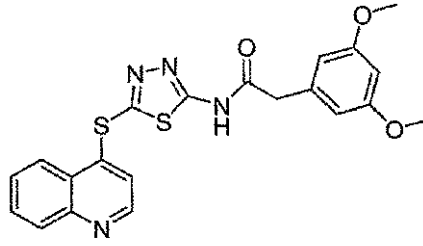


I-89

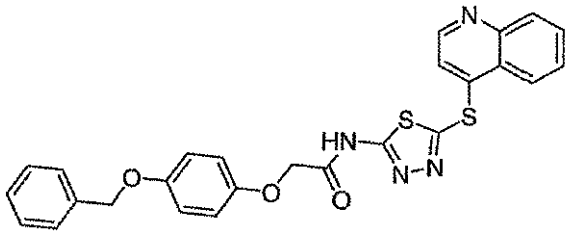
【化 1 1】



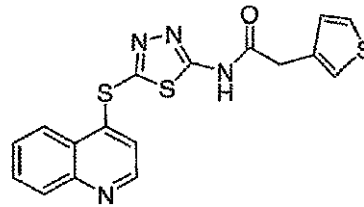
I-90



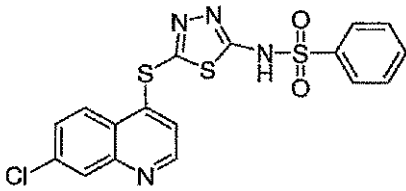
I-91



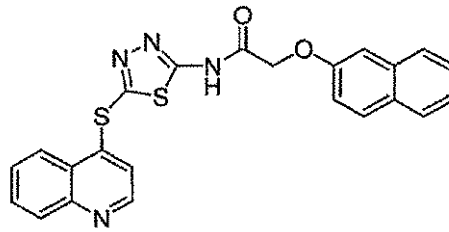
I-92



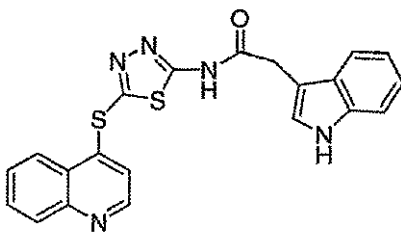
I-93



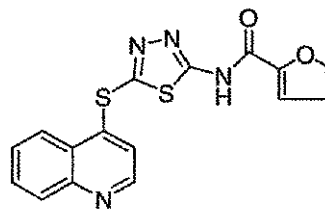
I-94



I-95

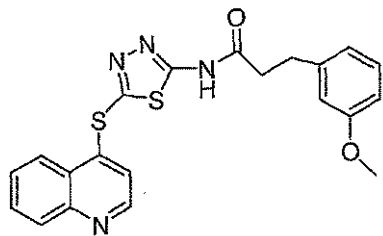


I-96

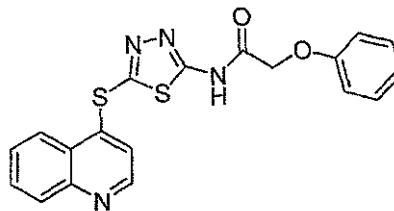


I-97

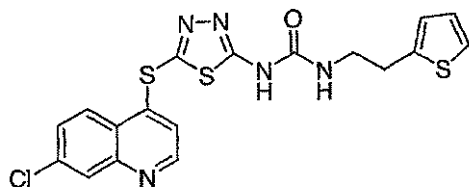
【化 1 2】



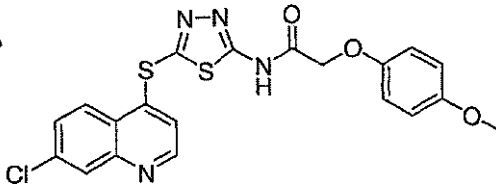
I-98



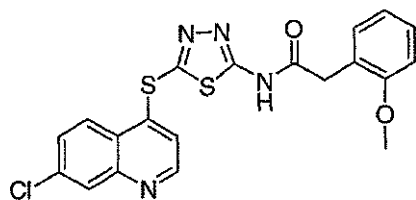
I-99



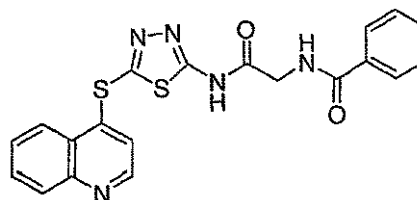
I-100



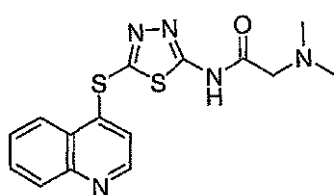
I-101



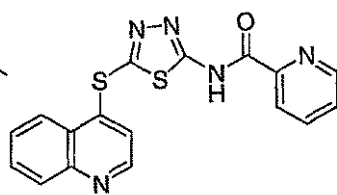
I-102



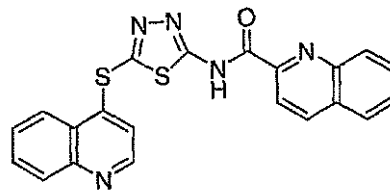
I-103



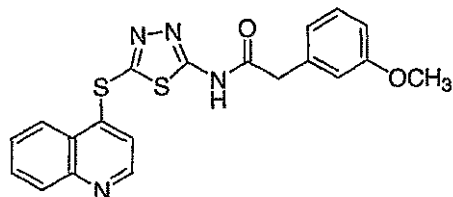
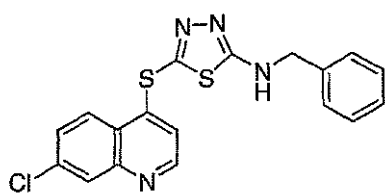
I-104



I-105

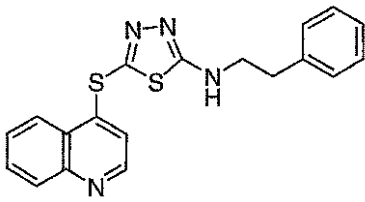


I-106

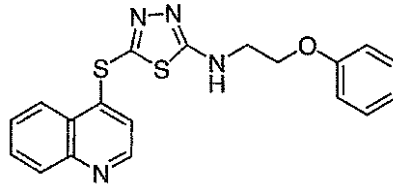


【化 1 3】

I-107

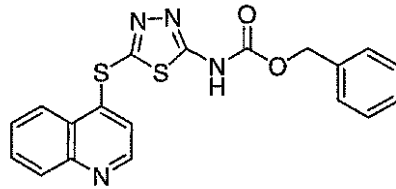


I-108



I-109

I-110



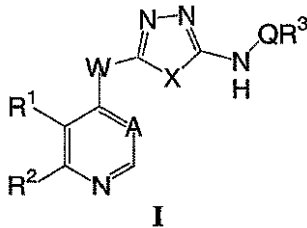
I-111

から選択される、化合物。

【請求項 1 2】

有効量の、式 I の化合物：

【化 1 4】



またはその薬学的に受容可能な塩、および薬学的に受容可能なキャリア、アジュバント、またはビヒクルを含有する組成物であって、ここで：

W および X は、各々独立して、酸素または硫黄であり；

A は、窒素、CH、C-CN、またはC-(C₁-₃脂肪族)であり；

R¹ および R² は、一緒になって、必要に応じて置換された、3~7員の、飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和の環を形成し、該環は、窒素、酸素、または硫黄から独立して選択される、0~3個のヘテロ原子を有し；

Q は、原子価結合、-C(O)-、-C(O)NR-、-C(O)C(O)-、-CO₂-、-C(O)CO₂-、-SO₂-、または必要に応じて置換されたC₁-₆アルキリデン鎖であり、ここで：

Q の 1 つまたは 2 つの隣接しないメチレン単位は、必要に応じて、独立して、-O-、-S-、-NR-、-C(O)-、-CO₂-、-C(O)NR-、-OC(O)NR-、-NRC(O)-、NRCO₂-、-NRC(O)NR-、-S(O)-、-SO₂-、-NRSO₂-、-SO₂NR-、または-NRSO₂NR-によって置き換えられ；

各 R は、独立して、水素、または必要に応じて置換されたC₁-₆脂肪族基であって、ここで：

同じ窒素原子に結合する 2 つの R は、必要に応じて、該窒素と一緒に、必要に

応じて置換された 3 ~ 7 員の、飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和の環を形成し、該環は、該環に結合する窒素に加えて、窒素、酸素、または硫黄から独して選択される 0 ~ 2 個のヘテロ原子を有し；

R^3 は、R または Ar から選択され；そして

Ar は、必要に応じて置換された、以下：

(a) 3 ~ 8 員の単環式、または 8 ~ 10 員の二環式の、飽和環、部分的に不飽和の環、またはアリール環；

(b) 3 ~ 7 員の複素環式環であって、該環は、窒素、酸素、または硫黄から独立して選択される、1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する、環；あるいは

(c) 5 ~ 6 員の単環式、または 8 ~ 10 員の二環式の、ヘテロアリール環であって、窒素、酸素、または硫黄から独立して選択される、1 ~ 4 個のヘテロ原子を有する、環、から選択される環である、

組成物。

【請求項 13】

R^1 および R^2 が、一緒になって、必要に応じて置換された、5 ~ 7 員の、飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和の環を形成し、該環が、窒素、酸素、または硫黄から独立して選択される 0 ~ 2 個のヘテロ原子を有する、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 14】

Q が、原子価結合、 $-C(O)-$ 、 $-C(O)NR-$ 、 $-CO_2-$ 、 $-C(O)CO_2-$ 、 $-SO_2-$ 、または必要に応じて置換された C_{1-4} アルキリデン鎖であり、ここで：

Q の 1 つまたは 2 つの隣接しないメチレン単位は、必要に応じて、独立して、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-NR-$ 、 $-C(O)-$ 、 $-CO_2-$ 、または $-SO_2-$ によって置き換えられている、

請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 15】

R^3 が、必要に応じて置換された C_{1-6} 脂肪族基、または必要に応じて置換された、以下：

(a) 3 ~ 6 員の単環式の飽和環またはアリール環；

(b) 5 ~ 6 員の複素環式環であって、該環は、窒素、酸素、または硫黄から独立して選択される、1 ~ 2 個のヘテロ原子を有する、環；あるいは

(c) 5 ~ 6 員の単環式、または 9 ~ 10 員の二環式の、ヘテロアリール環であって、窒素、酸素、または硫黄から独立して選択される、1 ~ 3 個のヘテロ原子を有する、環、から選択される環である、

請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 16】

W が硫黄である、請求項 12 ~ 15 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 17】

X が硫黄である、請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 18】

A が窒素である、請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 19】

A が CH である、請求項 16 に記載の組成物。

【請求項 20】

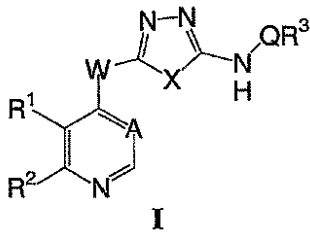
抗増殖剤、抗炎症剤、免疫調節剤、神経栄養因子、または心臓血管疾患を処置するための薬剤から選択されるさらなる治療剤をさらに含有する、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 21】

JAK-3 キナーゼ活性を阻害するための組成物であって；

該組成物は、請求項 12 に記載の組成物、または式 I の化合物

【化 15】



もしくはその薬学的に受容可能な塩を含有し、

化合物 I において：

W および X は、各々独立して、酸素または硫黄であり；

A は、窒素、CH、C-CN、または C-(C₁₋₃ 脂肪族) であり；

R¹ および R² は、一緒になって、必要に応じて置換された、3～7員の、飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和の環を形成し、該環は、窒素、酸素、または硫黄から独立して選択される、0～3個のヘテロ原子を有し；

Q は、原子価結合、-C(O)-、-C(O)NR-、-C(O)C(O)-、-CO₂-、-C(O)CO₂-、-SO₂-、または必要に応じて置換された C₁₋₆ アルキリデン鎖であり、ここで：

Q の 1 つまたは 2 つの隣接しないメチレン単位は、必要に応じて、独立して、-O-、-S-、-NR-、-C(O)-、-CO₂-、-C(O)NR-、-OC(O)NR-、-NRC(O)-、NRCO₂-、-NRC(O)NR-、-S(O)-、-SO₂-、-NRSO₂-、-SO₂NR-、または -NRSO₂NR- によって置き換えられ；

各 R は、独立して、水素、または必要に応じて置換された C₁₋₆ 脂肪族基であって、ここで：

同じ窒素原子に結合する 2 つの R は、必要に応じて、該窒素と一緒に、必要に応じて置換された 3～7員の、飽和、部分的に不飽和、または完全に不飽和の環を形成し、該環は、該環に結合する窒素に加えて、窒素、酸素、または硫黄から独立して選択される 0～2 個のヘテロ原子を有し；

R³ は、R または Ar であり；そして

Ar は、必要に応じて置換された、以下：

(a) 3～8員の単環式、または 8～10員の二環式の、飽和環、部分的に不飽和の環、またはアリール環；

(b) 3～7員の複素環式環であって、該環は、窒素、酸素、または硫黄から独立して選択される、1～3個のヘテロ原子を有する、環；あるいは

(c) 5～6員の単環式、または 8～10員の二環式の、ヘテロアリール環であって、窒素、酸素、または硫黄から独立して選択される、1～4個のヘテロ原子を有する、環、から選択される環である、

組成物。

【請求項 22】

自己免疫疾患、神経変性障害、または血液学的異常を処置するか、またはその重篤度を減少させるための、請求項 12 に記載の組成物。

【請求項 23】

前記疾患または状態が、アレルギー性反応または I 型過敏症反応、喘息、移植拒絶、対宿主性移植片病、慢性関節リウマチ、筋萎縮性側索硬化症、多発性硬化症、家族性筋萎縮性側索硬化症 (FALS)、白血病、またはリンパ腫である、請求項 22 に記載の組成物。

【請求項 24】

抗増殖剤、抗炎症剤、免疫調節剤、神経栄養因子、または心臓血管疾患を処置するため

の薬剤から選択されるさらなる治療剤を含有し、ここで：

該さらなる治療剤が、処置される疾患に適切であり；そして

該さらなる治療剤が、前記組成物と一緒に、単一の投薬形態として投与されるか、または該組成物とは別に、複数投薬形態の一部として投与される、請求項 2 2 に記載の組成物。