

【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25年9月5日 (2013.9.5)

【公表番号】特表2011-508756(P2011-508756A)

【公表日】平成23年3月17日 (2011.3.17)

【年通号数】公開・登録公報2011-011

【出願番号】特願2010-541062(P2010-541062)

【国際特許分類】

C 07 D 239/95 (2006.01)

A 61 K 31/517 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 37/02 (2006.01)

A 61 P 37/08 (2006.01)

A 61 P 11/06 (2006.01)

A 61 P 11/00 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 P 21/04 (2006.01)

A 61 P 37/06 (2006.01)

A 61 P 27/02 (2006.01)

A 61 P 7/06 (2006.01)

A 61 P 7/04 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

A 61 P 17/00 (2006.01)

A 61 P 1/16 (2006.01)

A 61 P 15/00 (2006.01)

A 61 P 5/38 (2006.01)

A 61 P 21/00 (2006.01)

A 61 P 17/06 (2006.01)

A 61 P 11/02 (2006.01)

A 61 P 5/14 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 17/04 (2006.01)

A 61 P 17/02 (2006.01)

A 61 P 31/04 (2006.01)

【 F I 】

C 07 D 239/95 C S P

A 61 K 31/517

A 61 P 43/00 1 1 3

A 61 P 37/02

A 61 P 37/08

A 61 P 11/06

A 61 P 11/00

A 61 P 9/10

A 61 P 19/02

A 6 1 P 29/00 1 0 1
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 21/04
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 27/02
 A 6 1 P 7/06
 A 6 1 P 7/04
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 17/00
 A 6 1 P 1/16
 A 6 1 P 15/00
 A 6 1 P 5/38
 A 6 1 P 21/00
 A 6 1 P 17/06
 A 6 1 P 11/02
 A 6 1 P 5/14
 A 6 1 P 3/10
 A 6 1 P 35/00
 A 6 1 P 17/04
 A 6 1 P 17/02
 A 6 1 P 31/04

【誤訳訂正書】

【提出日】平成25年7月12日(2013.7.12)

【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】全文

【訂正方法】変更

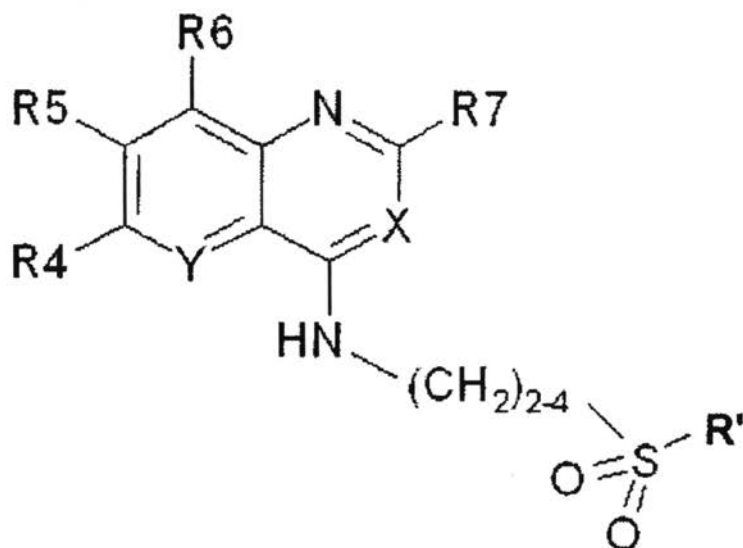
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

次式の化合物

【化1】



(式中、

Xは、 CR^1 またはNであり；

Yは、 CR^3 またはNであり；

R^1 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、および R^6 は、それぞれ独立に、H、F、Cl、Br、I、または1個もしくは複数のヘテロ原子を任意選択で有する炭化水素基であり；

R^7 は、1個または複数のN原子を含む複素環基であり；

R^1 は、 NR^YR^Z であり、ここで R^Y および R^Z は、各々H、アルキル、シクロアルキル、アリール、またはヘテロシクリルであるか、またはN原子と共に R^Y および R^Z によって形成された環状基を含めて、C原子が最大で20個であり、N、O、およびSから選択されるヘテロ原子をさらに最大で3個任意選択で含む）

または薬学的に許容されるその塩もしくは溶媒和物。

【請求項2】

R^1 が、H、F、Cl、Br、I、 $C_1\sim 4$ アルキル、 $C_2\sim 5$ アルケニル、 $C_1\sim 4$ アルコキシ、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-C_1\sim 4$ アルキル-アリール、 $C_1\sim 4$ アルキル-ヘテロアリール、アリールエチルO-アリール、O-ヘテロアリール、NH-アリール、NH-ヘテロアリール、S-アリール、S-フェニル、S-ヘテロアリール、O- $C_1\sim 4$ アルキル-アリール、O- $C_1\sim 4$ アルキル-ヘテロアリール、O- $C_1\sim 4$ アルキル-アリール、NH- $C_1\sim 4$ アルキル-アリール、NH- $C_1\sim 4$ アルキル-ヘテロアリール、ヒドラジノ、ヒドロキシルアミノ、 NH_2 、O- $C_1\sim 4$ アルキル- $N(CH_3)_2$ 、または NR^aR^b から選択され、

ここで、 R^a は存在せず、かつ R^b はアシルであるか、または R^a および R^b の各々は、それぞれ独立に、H、 $C_1\sim 4$ アルキル、シクロアルキル、フェニル、ベンジル、もしくはフェネチルから選択されるかのいずれかであり、前記アリール、ヘテロアリール、アルキル、アシル、フェニル、およびシクロアルキル部分のいずれも、 $C_1\sim 4$ アルキル、ハロゲン、ヒドロキシル、アミノ、および $C_1\sim 3$ アルコキシから選択される1～3個の置換基で任意選択で置換されている、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R^3 、 R^4 、 R^5 、および R^6 が、それぞれ独立に、H、F、Cl、Br、I、 $C_1\sim 4$ アルキル、 $C_2\sim 5$ アルケニル、 $C_2\sim 5$ アルキニル、 $C_1\sim 4$ アルコキシ、 $C_1\sim 4$ アルキルチオ、 $C_3\sim 6$ シクロアルキル、O- $C_3\sim 6$ シクロアルキル、フェニル、ベンジル、O-フェニル、NH-フェニル、S-フェニル、O- $C_1\sim 4$ アルキル-フェニル、 $C_1\sim 4$ アルキル-フェニル、 CF_3 、O- CF_3 、S- CF_3 、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、O- $C_1\sim 4$ アルキル- $N(CH_3)_2$ 、および NR^aR^b から選択され、ここで、 R^a および R^b は、それぞれ独立に、H、 $C_1\sim 4$ アルキル、フェニル、ベンジル、およびフェネチルから選択され、フェニル、アルキル、またはシクロアルキル部分はいずれも、 $C_1\sim 3$ アルキル、ハロゲン、ヒドロキシ、アミノ、および $C_1\sim 3$ アルコキシから選択された1～3個の置換基で任意選択で置換されている、請求項1または請求項2に記載の化合物。

【請求項4】

R^3 、 R^4 、 R^5 、および R^6 のうちの3個または4個すべてが、Hである、請求項3に記載の化合物。

【請求項5】

R^7 が、4～7員ヘテロシクリル、 $C_3\sim 7$ シクロアルキル-4～7員ヘテロシクリル、およびビス-(4～7員ヘテロシクリル)から選択される、請求項1から4のいずれかに記載の化合物。

【請求項6】

R^7 が、4-メチルピペラジノである、請求項5に記載の化合物。

【請求項7】

Xが、Nであり、Yが、 CR^3 である、請求項1から6のいずれかに記載の化合物。

【請求項8】

Xが、 CR^1 であり、Yが、 CR^3 である、請求項1から6のいずれかに記載の化合物。

【請求項 9】

R' が、複素環またはヘテロアリアル基である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 10】

R' が、NH₂である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 11】

2 - (6 - クロロ - 2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) キナゾリン - 4 - アミノ) - N - メチル - N - フェニルエタンスルホンアミド、
 2 - (6 - クロロ - 2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) キナゾリン - 4 - アミノ) - N - フェニルエタンスルホンアミド、
 2 - (6 - クロロ - 2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) キナゾリン - 4 - アミノ) - N - フェニルエタンスルホンアミド、
 2 - (6 - クロロ - 2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) キナゾリン - 4 - アミノ) - N , N - ジメチルエタンスルホンアミド、
 2 - (6 - クロロ - 2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) キナゾリン - 4 - アミノ) - N - メチルエタンスルホンアミド、
 2 - (6 - クロロ - 2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) キナゾリン - 4 - アミノ) - エタンスルホンアミド、
 6 - クロロ - 2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - N - (2 - (モルホリノスルホニル) エチル) キナゾリン - 4 - アミン、
 2 - (6 - クロロ - 2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) キナゾリン - 4 - アミノ) - N - (4 - ヨードフェニル) エタンスルホンアミド、
 2 - (6 - クロロ - 2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) キナゾリン - 4 - アミノ) - S - メチルエタンスルホン、
 3 - (6 - クロロ - 2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) キナゾリン - 4 - アミノ) - N - メチルプロパンスルホンアミド、
 2 - (5 - トリフルオロメチル - 2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) キナゾリン - 4 - アミノ) - N - フェニルエタンスルホンアミド、
 2 - (6 , 7 - ジクロロ - 2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) キナゾリン - 4 - アミノ) - N - フェニルエタンスルホンアミド、
 2 - (6 - プロモ - 7 - クロロ - 2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) キナゾリン - 4 - アミノ) - N - フェニルエタンスルホンアミド、
 2 - (6 , 7 - ジクロロ - 2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) キナゾリン - 4 - アミノ) - N - フェニルエタンスルホンアミド、
 2 - (6 - ヨード - 2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) キナゾリン - 4 - アミノ) - N - フェニルエタンスルホンアミド、
 2 - (7 , 8 - ジクロロ - 2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) キナゾリン - 4 - アミノ) - N - フェニルエタンスルホンアミド、および
 2 - (5 , 7 - ジクロロ - 2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) キナゾリン - 4 - アミノ) - N - フェニルエタンスルホンアミド

から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 12】

請求項 1 から 11 のいずれかに記載の化合物と、少なくとも 1 種の薬学的に許容される添加剤とを含む医薬組成物。

【請求項 13】

ヒスタミン H₄ 受容体でのアンタゴニズム、インバーサアゴニズム、またはアゴニズムが関与する状態の治療のための請求項 12 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

物理的刺激、化学的刺激、感染、対象にとって異物である物体の侵入、アレルギー、喘息、慢性閉塞性肺疾患、アテローム性動脈硬化症、関節リウマチ、多発性硬化症、炎症性腸疾患、重症筋無力症、自己免疫性神経障害、自己免疫性ブドウ膜炎、自己免疫性溶血性貧

血、悪性貧血、自己免疫性血小板減少症、側頭動脈炎、抗リン脂質抗体症候群、血管炎、ベーチェット病、疱疹状皮膚炎、尋常性天疱瘡、ピティリジオ、原発性胆汁性肝硬変、自己免疫性肝炎、自己免疫性卵巣炎、自己免疫性精巣炎、副腎の自己免疫疾患、多発性筋炎、皮膚筋炎、脊椎関節症、およびシェーグレン症候群に対する応答である、対象における障害または不快感の治療のための請求項 1 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

急性炎症、アレルギー性炎症、慢性炎症、クローン病、潰瘍性大腸炎、乾癬、アレルギー性鼻炎、強皮症、自己免疫性甲状腺疾患、免疫介在性真性糖尿病、癌、そう痒、および狼瘡の治療のための請求項 1 2 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 6】

請求項 1 3 から 1 5 のいずれかに記載の治療で使用される医薬品の製造のための、請求項 1 から 1 1 のいずれかに記載の化合物の使用。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 1 2

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 1 2】

(式中、

Q は、C R 1 または N であり；

X は、C R 2 または N であり、但し、Q と X が同時に N であることはなく；

Y は、C R 3 または N であり；

Z は、C H または N であり；

R 1、R 2、R 3、R 4、R 5、および R 6 は、それぞれ独立に、H、F、C l、B r、I、または 1 個もしくは複数のヘテロ原子を任意選択で有する炭化水素基であり；R 7 は、1 個または複数の N 原子を含む複素環基である）または薬学的に許容されるその塩、エステル、もしくは溶媒和物を開示している。

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 1 5

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 1 5】

本発明によれば、新規化合物は、上記で定義した式 I であるが、式中、Z は、N であり、X は、C - N H - (C H 2) 2 ~ 4 - S O 2 R ' であり、R ' は、R x または N R y R z であり、ここで、R x、R y、および R z は、各々 H であるか、または C 原子を最大で 2 0 個および任意選択でヘテロ原子も有する同一もしくは異なる基である。

【誤訳訂正 4】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 1 8

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 1 8】

好ましくは、R¹ は、H、F、C l、B r、I、C₁ ~₄ アルキル、C₂ ~₅ アルケニル、C₁ ~₄ アルコキシ、シクロアルキル、アリール（例えば、フェニルなど）、ヘテロアリール、- C₁ ~₄ アルキル - アリール、例えば、ベンジルまたはフェネチルなど、- C₁ ~₄ アルキル - ヘテロアリール、例えば、ヘテロアリールエチルなど、O - アリール、例えば、O - フェニルアリール、O - ヘテロアリールなど、NH - アリール、例えば、NH - フェニル、NH - ヘテロアリールなど、S - アリール（例えば、S - フェニルなど）、S - ヘテロアリール、O - C₁ ~₄ アルキル - アリール、例えば、O - C H 2 - フェニル、O - (

$\text{CH}_2)_2$ - フェニル、または $\text{O} - (\text{CH}_2)_4$ - フェニルなど、 $\text{O} - \text{C}_1 \sim 4$ アルキル - ヘテロアリール、例えば、 $\text{O} - (\text{CH}_2)_2$ - ヘテロアリールや $\text{O} - (\text{CH}_2)_4$ - ヘテロアリールなど、 $\text{C}_1 \sim 4$ アルキル - ヘテロアリール、例えば、 CH_2CH_2 - ヘテロアリールなど、 $\text{NH} - \text{C}_1 \sim 4$ アルキル - アリール、例えば、 NHCH_2 - フェニルなど、 $\text{NH} - \text{C}_1 \sim 4$ アルキル - ヘテロアリール、ヒドラジノ、ヒドロキシルアミノ、 NH_2 、 $\text{O} - (\text{CH}_2)_3 - \text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、および NR^aR^b から選択され、ここで、 R^a は存在せず、かつ R^b はアシルであるか、または R^a および R^b の各々は、それぞれ独立に、 H 、 $\text{C}_1 \sim 4$ アルキル、シクロアルキル、フェニル、ベンジル、およびフェネチルから選択されるかのいずれかであり、前記アリール、ヘテロアリール、アルキル、アシル、フェニル、およびシクロアルキル部分のいずれも、例えば、 $\text{C}_1 \sim 4$ アルキル、ハロゲン、ヒドロキシル、アミノ、および $\text{C}_1 \sim 3$ アルコキシから選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択で置換されている。

【誤訳訂正 5】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0019

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0019】

好ましくは、 R^3 、 R^4 、 R^5 、および R^6 は、それぞれ独立に、 H 、 F 、 Cl 、 Br 、 I 、 $\text{C}_1 \sim 4$ アルキル、 $\text{C}_2 \sim 5$ アルケニル、 $\text{C}_2 \sim 5$ アルキニル、 $\text{C}_1 \sim 4$ アルコキシ、 $\text{C}_1 \sim 4$ アルキルチオ、 $\text{C}_3 \sim 6$ シクロアルキル、 $\text{O} - \text{C}_3 \sim 6$ シクロアルキル、フェニル、ベンジル、 O - フェニル、 NH - フェニル、 S - フェニル、 $\text{O} - \text{C}_1 \sim 4$ アルキル - フェニル、例えば、 $\text{O} - (\text{CH}_2)_2$ - フェニルまたは $\text{O} - (\text{CH}_2)_4$ - フェニルなど、 $\text{C}_1 \sim 4$ アルキル - アリール、例えば、 CH_2CH_2 - フェニルなど、 CF_3 、 $\text{O} - \text{CF}_3$ 、 $\text{S} - \text{CF}_3$ 、ヒドロキシ、ニトロ、シアノ、 $\text{O} - \text{C}_1 \sim 4$ アルキル - $\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $\text{O} - (\text{CH}_2)_3 - \text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、および NR^aR^b から選択され、ここで、 R^a および R^b の各々は、それぞれ独立に、 H 、 $\text{C}_1 \sim 4$ アルキル、フェニル、ベンジル、およびフェネチルから選択され、フェニル、アルキル、またはシクロアルキル部分はいずれも、 $\text{C}_1 \sim 3$ アルキル、ハロゲン、ヒドロキシ、アミノ、および $\text{C}_1 \sim 3$ アルコキシから選択される 1 ~ 3 個の置換基で任意選択で置換されている。

【誤訳訂正 6】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0020

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0020】

上記のように、 R^7 は、1 個または複数の N 原子を含む複素環基である。 R^7 は N または C 原子を介して二環式核と結合しているが、 N を介した結合が好ましい。この基は、単環式でも二環式でもよく、置換基、例えば、上記で定義した置換基を任意選択で有している。

【誤訳訂正 7】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0024

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0024】

式中、

n は、1 または 2 であり；

R^8 および R^9 は、それぞれ独立に、 H または $\text{C}_1 \sim 3$ アルキルであり；

R^{10} は、 H 、 R^{10} が結合している窒素メンバーと直接結合している sp^2 - 炭素メンバーを含まない $\text{C}_3 \sim 5$ アルケニル、 R^{10} が結合している窒素メンバーと直接結合している sp

- 炭素メンバーを含まない $C_3 \sim 5$ アルキニル、 CH_2CH_2OH 、 $C_1 \sim 4$ アルキル - O - $C_1 \sim 4$ アルキル、またはハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、カルボキシ、アミノ、 $C_1 \sim 6$ アルキルアミノ、N, N - ジ ($C_1 \sim 6$ アルキル) アミノ、 $C_1 \sim 6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、もしくは $C_3 \sim 8$ シクロアルキルで任意選択で置換されている $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

あるいは、 R^{10} は、 R^9 と一緒になってもよく、ここで、 R^9 が結合している炭素メンバーおよび R^{10} が結合している窒素メンバーは、5、6、または7員の複素環を形成し、前記環は、O、S、NH、および $NC_1 \sim 6$ アルキルから選択される0または1個のさらなるヘテロ原子を有し、前記複素環は、 $C_1 \sim 3$ アルキル、ハロゲン、ヒドロキシ、アミノ、および $C_1 \sim 3$ アルコキシから各々選択される0、1、2、または3個の置換基で置換されており；

q は、1、2、または3であり；

r は、0または1であり；

R^{11} は、水素原子であるか、またはハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、カルボキシ、アミノ、N - ($C_1 \sim 6$ アルキル) アミノ、N, N - ジ ($C_1 \sim 6$ アルキル) アミノ、 $C_1 \sim 6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、もしくは $C_3 \sim 8$ シクロアルキルで任意選択で置換されている $C_1 \sim 6$ アルキルであり；

R^{12} 、 R^{13} 、 R^{14} 、および R^{15} は、それぞれ独立に、水素であるか、またはハロゲン、シアノ、ヒドロキシ、カルボキシ、アミノ、 $C_1 \sim 6$ アルキルアミノ、N - ($C_1 \sim 6$ アルキル) アミノ、N, N - ジ ($C_1 \sim 6$ アルキル) アミノ、 $C_1 \sim 6$ アルキルチオ、 $C_1 \sim 6$ アルコキシ、もしくは $C_3 \sim 8$ シクロアルキルで任意選択で置換されている $C_1 \sim 6$ アルキルである。

【誤訳訂正8】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0047

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0047】

R' は、好ましくは、ヘテロアリール (任意選択で置換されている)、またはモルホリノなどの複素環を含む NR_yR_z である。あるいは、 R_y および R_z の一方または両方を、Hとすることができる。 SO_2R' の例は、次のものである。