

【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22年6月3日(2010.6.3)

【公表番号】特表2006-514006(P2006-514006A)

【公表日】平成18年4月27日(2006.4.27)

【年通号数】公開・登録公報2006-017

【出願番号】特願2004-550483(P2004-550483)

【国際特許分類】

C 0 7 D 413/04 (2006.01)
C 0 7 D 413/14 (2006.01)
A 6 1 K 45/00 (2006.01)
A 6 1 K 31/538 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
A 6 1 P 37/00 (2006.01)
A 6 1 P 37/06 (2006.01)
A 6 1 P 25/00 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 35/02 (2006.01)
A 6 1 P 37/08 (2006.01)
A 6 1 P 11/06 (2006.01)
A 6 1 P 19/02 (2006.01)
A 6 1 P 21/04 (2006.01)
A 6 1 P 25/28 (2006.01)
A 6 1 P 25/16 (2006.01)
A 6 1 P 25/18 (2006.01)
A 6 1 P 29/00 (2006.01)
A 6 1 P 9/00 (2006.01)
A 6 1 P 19/00 (2006.01)
A 6 1 P 1/16 (2006.01)
A 6 1 P 7/00 (2006.01)
A 6 1 P 37/04 (2006.01)
A 6 1 P 31/18 (2006.01)
A 6 1 P 5/00 (2006.01)
A 6 1 P 3/10 (2006.01)
A 6 1 P 19/10 (2006.01)
A 6 1 P 31/00 (2006.01)
A 6 1 P 31/12 (2006.01)
A 6 1 P 9/10 (2006.01)
A 6 1 P 9/08 (2006.01)
A 6 1 P 7/02 (2006.01)
A 6 1 P 9/04 (2006.01)
A 6 1 P 25/14 (2006.01)
A 6 1 P 17/14 (2006.01)
A 6 1 P 17/06 (2006.01)
A 6 1 P 9/12 (2006.01)
A 6 1 P 15/06 (2006.01)
A 6 1 P 27/02 (2006.01)
A 6 1 P 15/10 (2006.01)
A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 29/02 (2006.01)
A 6 1 P 25/02 (2006.01)
A 6 1 P 11/02 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 413/04 C S P

C 0 7 D 413/14

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 31/538

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 37/00

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 43/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 21/04

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/18

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 19/00

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 7/00

A 6 1 P 37/04

A 6 1 P 31/18

A 6 1 P 5/00

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 31/00

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 9/08

A 6 1 P 7/02

A 6 1 P 9/10 1 0 3

A 6 1 P 9/04

A 6 1 P 25/14

A 6 1 P 17/14

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 15/06

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 15/10

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 29/02

A 6 1 P 25/02 1 0 1

A 6 1 P 11/02

【誤訳訂正書】

【提出日】平成22年4月14日(2010.4.14)

【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

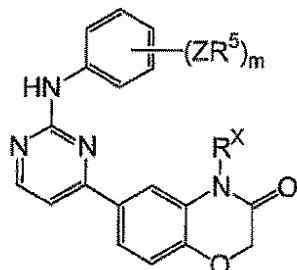
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式IVaの化合物またはそれらの薬学的に受容可能な塩：

【化1】



IVa

ここで：

R^Xは、水素または置換されていることもあるC₁~₆脂肪族であり；mは、0、1または2であり；そしてZR⁵は、C1、F、Br、メチル、エチル、t-ブチル、イソプロピル、シクロプロピル、ニトロ、CN、OMe、OEt、CF₃、NH₂、フェニル、ベンジル、ベンジルオキシ、OH、メチレンジオキシ、SO₂NH₂、CONH₂、CO₂Me、フェノキシ、O-ピリジニル、SO₂フェニル、ニトロフェノキシ、アミノフェノキシ、S-ジメチルピリミジン、NHフェニル、NH-メトキシフェニル、ピリジニル、アミノフェニル、フェノール、クロロ-フルオロ-フェニル、ジメチルアミノフェニル、CF₃-フェニル、ジメチルフェニル、クロロフェニル、フルオロフェニル、メトキシフェノキシ、クロロフェノキシ、エトキシフェノキシまたはフルオロフェノキシであり；

脂肪族基またはヘテロ脂肪族基または非芳香族複素環の飽和炭素は、ハロゲン；-R⁰；-OR⁰；-SR⁰；R⁰で置換されていることもあるフェニル(Ph)；R⁰で置換されていることもある-O(Ph)；R⁰で置換されていることもあります-C(=CH₂)_{1~2}(Ph)；R⁰で置換されていることもあります-CH=CH(Ph)；-NO₂；-CN；-N(R⁰)₂；-NR⁰C(O)R⁰；-NR⁰C(S)R⁰；-NR⁰C(O)N(R⁰)₂；-NR⁰C(S)N(R⁰)₂；-NR⁰CO₂R⁰；-NR⁰NR⁰C(O)R⁰；-NR⁰NR⁰C(O)N(R⁰)₂；-NR⁰NR⁰CO₂R⁰；-C(O)C(O)R⁰；-C(O)CH₂C(O)R⁰；-CO₂R⁰；-C(O)R⁰；-C(S)R⁰；-C(O)N(R⁰)₂；-OC(O)R⁰；-C(O)N(OR⁰)R⁰；-C(NOR⁰)R⁰；-S(O)₂R⁰；-S(O)₃R⁰；-SO₂N(R⁰)₂；-S(O)R⁰；-NR⁰SO₂N(R⁰)₂；-NR⁰SO₂R⁰；-N(OR⁰)R⁰；-C(=NH)-N(R⁰)₂；-P(O)₂R⁰；-PO(R⁰)₂；-OPO(R⁰)₂；-(CH₂)_{0~2}NHC(O)R⁰；R⁰で置換されていることもありますフェニル(Ph)；R⁰で置換されていることもあります-O(Ph)；R⁰で置換されていることもあります-(CH₂)_{1~2}(Ph)；R⁰で置換されていることもあります-CH=CH(Ph)；=O、=S、=NNH^{R*}、=NN(R^{*})₂、=NNHC(O)R^{*}、=NNHCO₂(アルキル)、=NNHSO₂(アルキル)または=NR^{*}で置換されていることもあります；

ここで、各 R^0 は、別個に、水素、置換されていることもある C_{1-6} 脂肪族、非置換 5 員～6 員ヘテロアリールまたは複素環、フェニル、-O(Ph)または-CH₂(Ph)から選択され；ここで、各 R^* は、別個に、水素または置換されていることもある C_{1-6} 脂肪族基から選択され；各 R^0 は、別個に、水素、置換されていることもあります C_{1-6} 脂肪族、非置換 5 員～6 員ヘテロアリールまたは複素環、フェニル、-O(Ph)または-CH₂(Ph)から選択され；

または、2 個の別個の R^0 は、同じ置換基または異なる置換基上にて、各 R^0 基が結合する原子と一緒にになって、置換されていることもある 3 員～12 員の飽和、部分不飽和または完全不飽和の単環式または二環式の環を形成し、この環は、別個に、窒素、酸素またはイオウから選択される 0 個～4 個のヘテロ原子を有し；

R^0 の脂肪族基上の任意の置換基は、NH₂、NH(C_{1-4} 脂肪族)、N(C_{1-4} 脂肪族)₂、ハロゲン、 C_{1-4} 脂肪族、OH、O(C_{1-4} 脂肪族)、NO₂、CN、CO₂H、CO₂(C_{1-4} 脂肪族)、O(ハロC₁₋₄ 脂肪族)またはハロC₁₋₄ 脂肪族から選択され、ここで、 R^0 の前述の C_{1-4} 脂肪族基の各々は、非置換であり；

アリールまたはヘテロアリール基の不飽和炭素原子上の任意の置換基は、ハロゲン；-R⁰；-OR⁰；-SR⁰；R⁰で置換されていることもあるフェニル(Ph)；R⁰で置換されていることもある-O(Ph)；R⁰で置換されていることもあります-(CH₂)₁₋₂(Ph)；R⁰で置換されていることもあります-CH=CH(Ph)；-NO₂；-CN；-N(R⁰)₂；-NR⁰C(O)R⁰；-NR⁰C(S)R⁰；-NR⁰C(O)N(R⁰)₂；-NR⁰C(S)N(R⁰)₂；-NR⁰CO₂R⁰；-NR⁰NR⁰C(O)R⁰；-NR⁰NR⁰C(O)N(R⁰)₂；-NR⁰NR⁰CO₂R⁰；-C(O)C(O)R⁰；-C(O)CH₂C(O)R⁰；-CO₂R⁰；-C(O)R⁰；-C(S)R⁰；-C(O)N(R⁰)₂；-C(S)N(R⁰)₂；-OC(O)N(R⁰)₂；-OC(O)R⁰；-C(O)N(OR⁰)R⁰；-C(NOR⁰)R⁰；-S(O)₂R⁰；-S(O)₃R⁰；-SO₂N(R⁰)₂；-S(O)R⁰；-NR⁰SO₂R⁰；-N(OR⁰)R⁰；-C(=NH)-N(R⁰)₂；-P(O)₂R⁰；-PO(R⁰)₂；-OPO(R⁰)₂；-(CH₂)₀₋₂NHC(O)R⁰；R⁰で置換されていることもありますフェニル(Ph)；R⁰で置換されていることもあります-O(Ph)；R⁰で置換されていることもあります-(CH₂)₁₋₂(Ph)；またはR⁰で置換されていることもあります-CH=CH(Ph)から選択され；そして、

非芳香族複素環の窒素上の任意の置換基は、-R⁺、-N(R⁺)₂、-C(O)R⁺、-CO₂R⁺、-C(O)C(O)R⁺、-C(O)CH₂C(O)R⁺、-SO₂R⁺、-SO₂N(R⁺)₂、-C(=S)N(R⁺)₂、-C(=NH)-N(R⁺)₂または-NR⁺SO₂R⁺から選択され；ここで、R⁺は、水素、置換されていることもあります C_{1-6} 脂肪族基、置換されていることもありますフェニル、置換されていることもあります-O(Ph)、置換されていることもあります-CH₂(Ph)、置換されていることもあります-(CH₂)₁₋₂(Ph)、置換されていることもあります-CH=CH(Ph)；または、非置換 5 員～6 員ヘテロアリールまたは複素環（これは、窒素、酸素またはイオウから別個に選択される 1 個～4 個のヘテロ原子を有する）から選択されるか、または、上記定義にもかかわらず、2 個の別個の R⁺ は、同じ置換基または異なる置換基上にて、各 R⁺ 基が結合する原子と一緒にになって、置換されていることもあります 3 員～12 員の飽和、部分不飽和または完全不飽和の単環式または二環式の環を形成し、この環は、窒素、酸素またはイオウから別個に選択される 0 個～4 個のヘテロ原子を有し；R⁺ の脂肪族基またはフェニル環上の任意の置換基は、-NH₂、-NH(C_{1-4} 脂肪族)、-N(C_{1-4} 脂肪族)₂、ハロゲン、 C_{1-4} 脂肪族、-OH、-O(C_{1-4} 脂肪族)、-NO₂、-CN、-CO₂H、-CO₂(C_{1-4} 脂肪族)、-O(ハロC₁₋₄ 脂肪族)またはハロ(C₁₋₄ 脂肪族)から選択され、ここで、R⁺ の前述の C_{1-4} 脂肪族基の各々は、非置換である。

【請求項 2】

R^X が、水素、メチル、エチル、プロピル、n-ブチル、tert-ブチル、ペンチル、シクロペンチル、ヘキシル、シクロヘキシル、 $N(R)_2$ で置換した C_{1-6} アルキルまたは Ar^1 で置換した C_{1-6} アルキルであり；

各 R が、別個に、水素または置換されていることもある C_{1-4} 脂肪族であるか、または、同じ窒素原子に結合した 2 個の R は、該窒素原子と共に、3 ~ 7 員の飽和、部分不飽和または完全不飽和の環を形成していることもあり、該環は、窒素、酸素またはイオウから別個に選択される 0 個 ~ 2 個の追加ヘテロ原子を有し；そして、

Ar^1 が、5 ~ 7 員の飽和、部分不飽和または完全不飽和の単環（これは、窒素、酸素またはイオウから別個に選択される 0 個 ~ 3 個のヘテロ原子を有する）、または、8 ~ 12 員の飽和、部分不飽和または完全不飽和の二環式環系（これは、窒素、酸素またはイオウから別個に選択される 0 個 ~ 5 個のヘテロ原子を有する）であり；ここで、 Ar^1 は、 m 個の別個の $Z-R^5$ で置換されていることもあり；ここで、 m は、0 ~ 5 であり、 Z は、結合であるか、または C_{1-6} アルキリデン鎖であり、ここで、 Z の 2 個までのメチレン単位は、CO、CO₂、COCO、CONR、OCONR、NRNR、NRNRCO、NRCO、NRCO₂、NRCONR、SO、SO₂、NRSO₂、SO₂NR、NRSO₂NR、O、S または NR で置換されていてもよく；そして、各 R^5 は、別個に、水素、置換されていることもある脂肪族、ヘテロ脂肪族、アリールまたはヘテロアリール基、ハロゲン、NO₂、CN、OR、SR、N(R)₂、NRCOR、NRCON(R)₂、NRCO₂R、COR、CO₂R、OCOR、CON(R)₂、OCON(R)₂、SOR、SO₂R、SO₂N(R)₂、NRSO₂R、NRSO₂N(R)₂、COCOR または COCH₂COR である、

請求項 1 に記載の化合物。

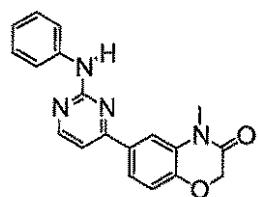
【請求項 3】

R^X が、水素、メチルまたは C_{1-2} アルキルであり、該アルキルが、置換されていることもあるフェニル、ピリジル、モルホリノ、ピペリジニルまたはピペラジニルから選択される基で置換されている、請求項 2 に記載の化合物。

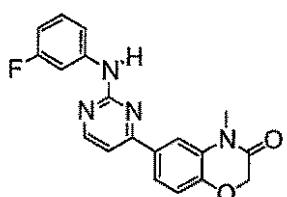
【請求項 4】

以下の化合物から選択される、請求項 1 に記載の化合物：

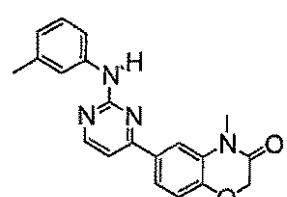
【化 2】



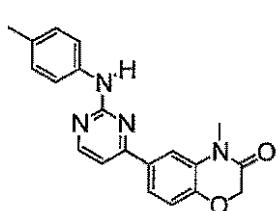
IVa-1



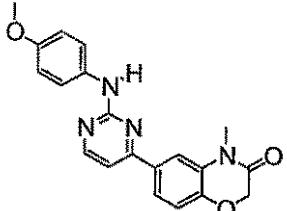
IVa-2



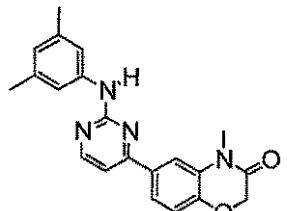
IVa-3



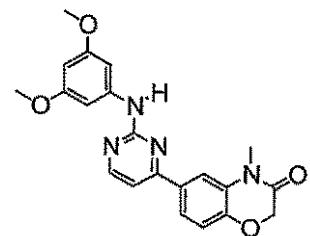
IVa-4



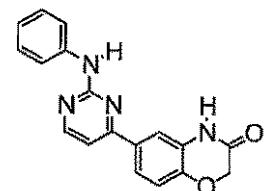
IVa-5



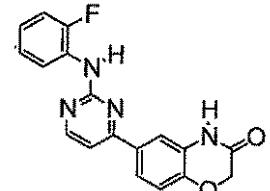
IVa-6



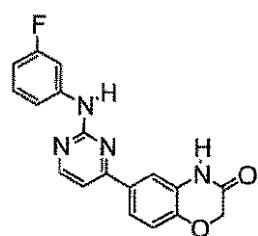
IVa-7



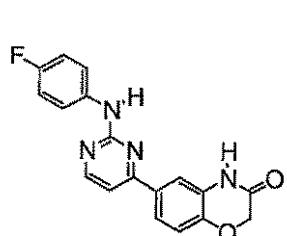
IVa-8



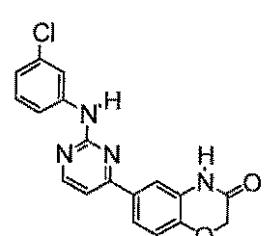
IVa-9



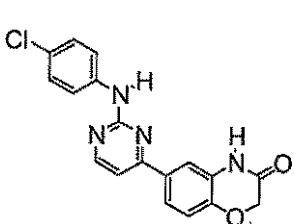
IVa-10



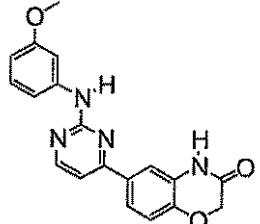
IVa-11



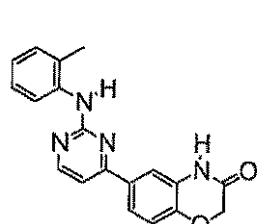
IVa-12



IVa-13

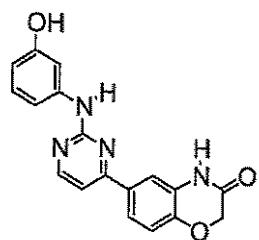


IVa-14

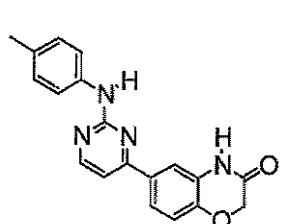


IVa-15

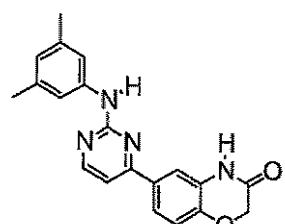
【化 3】



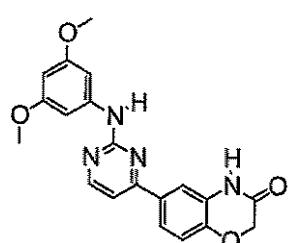
IVa-16



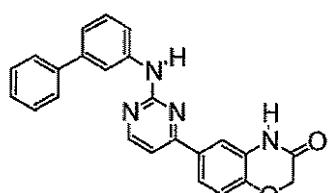
IVa-17



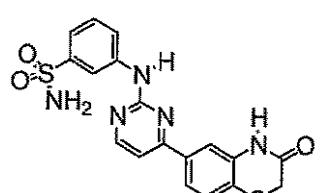
IVa-18



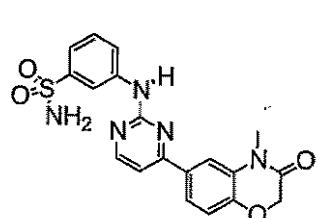
IVa-19



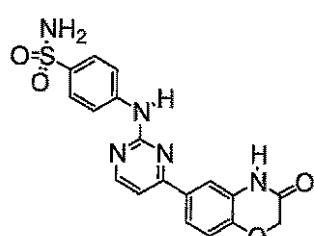
IVa-20



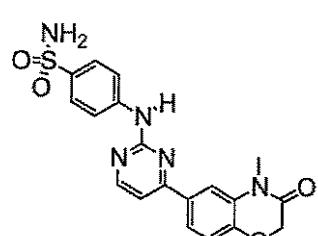
IVa-21



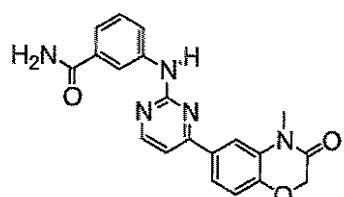
IVa-22



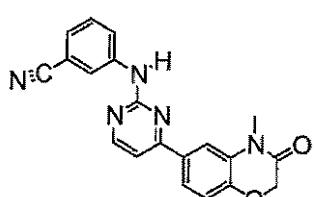
IVa-23



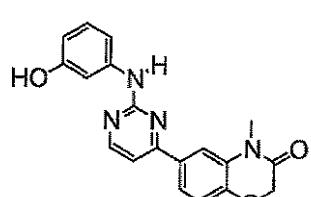
IVa-24



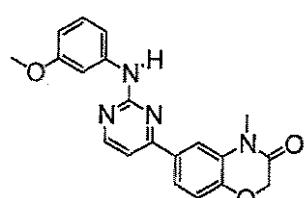
IVa-25



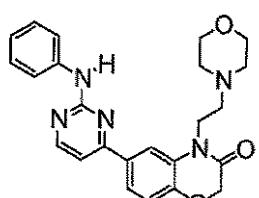
IVa-26



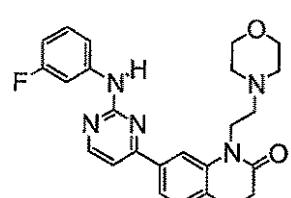
IVa-27



IVa-28

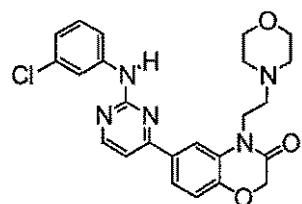


IVa-29

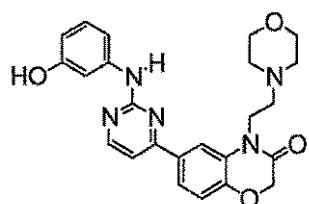


IVa-30

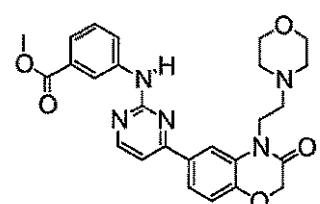
【化 4】



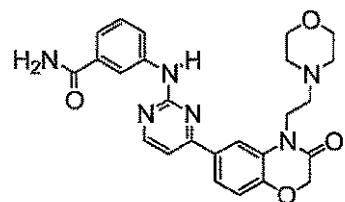
IVa-31



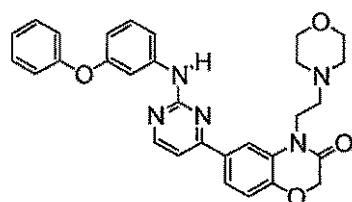
IVa-32



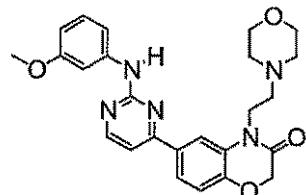
IVa-33



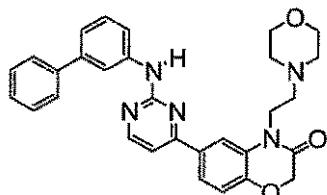
IVa-34



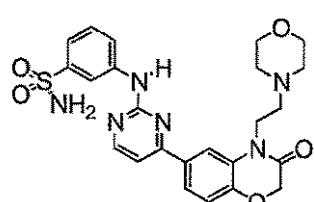
IVa-35



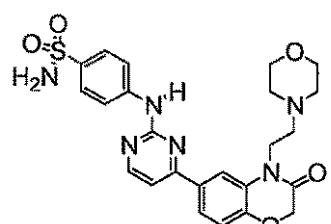
IVa-36



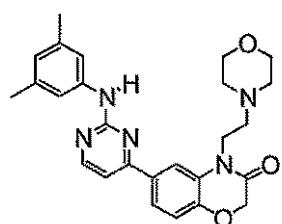
IVa-37



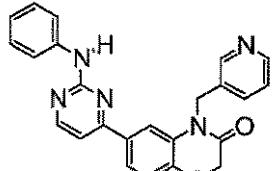
IVa-38



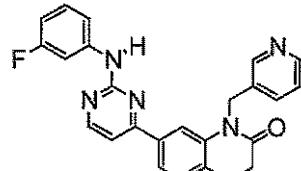
IVa-39



IVa-40

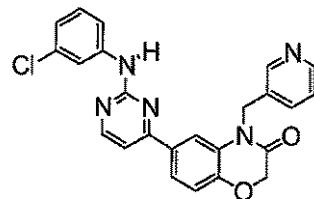


IVa-41

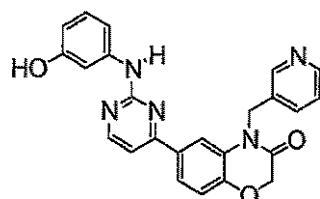


IVa-42

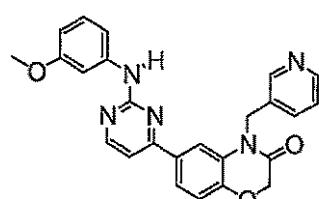
【化 5】



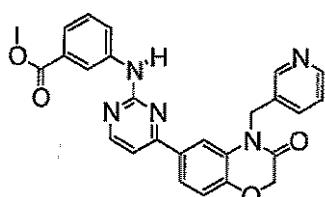
IVa-43



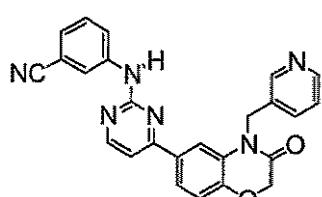
IVa-44



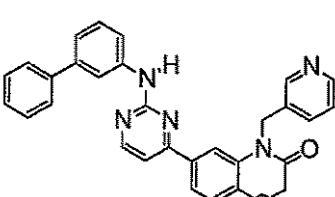
IVa-45



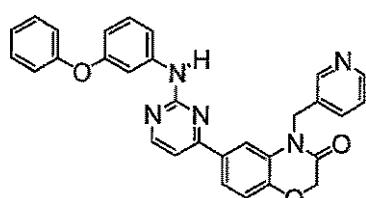
IVa-46



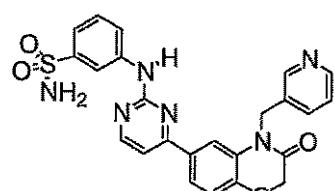
IVa-47



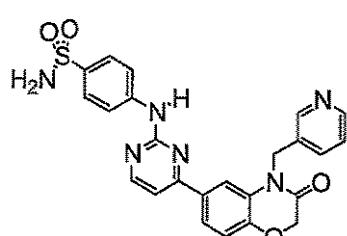
IVa-48



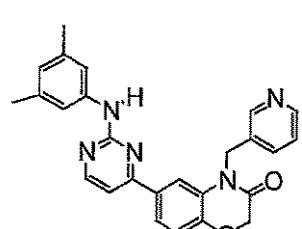
IVa-49



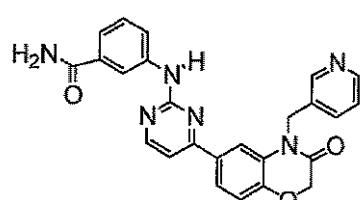
IVa-50



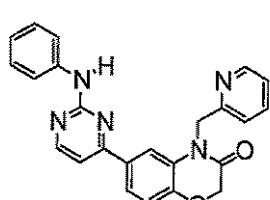
IVa-51



IVa-52

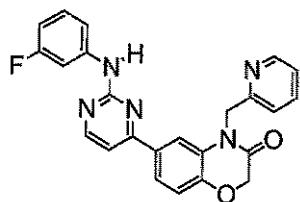


IVa-53

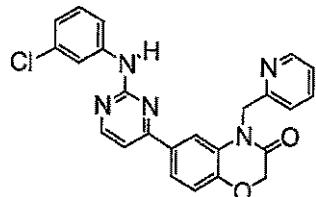


IVa-54

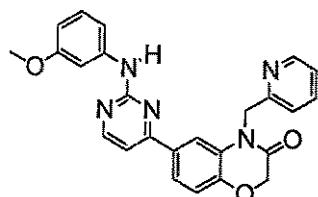
【化 6】



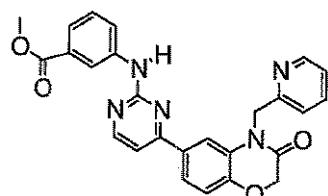
IVa-55



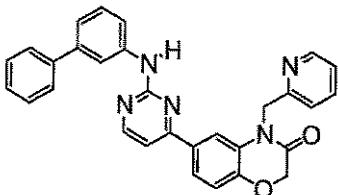
IVa-56



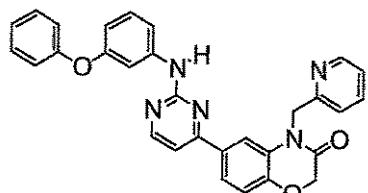
IVa-57



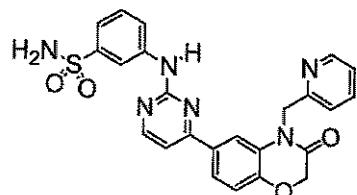
IVa-58



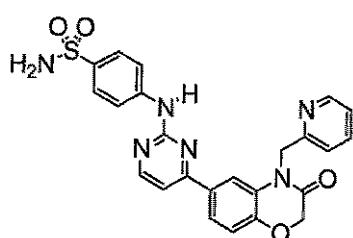
IVa-59



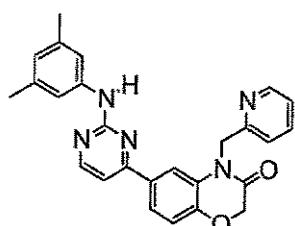
IVa-60



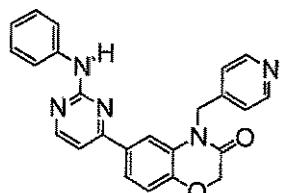
IVa-61



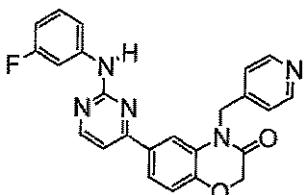
IVa-62



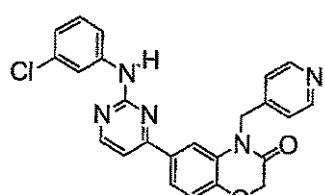
IVa-63



IVa-64

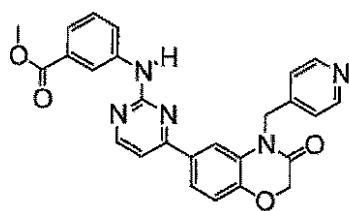


IVa-65

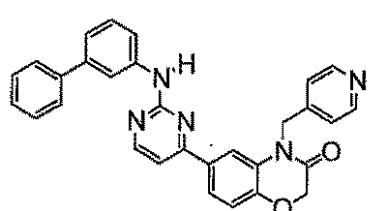


IVa-66

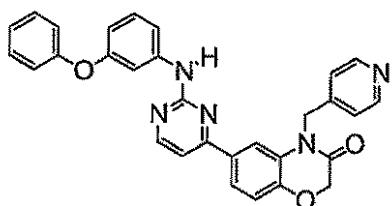
【化7】



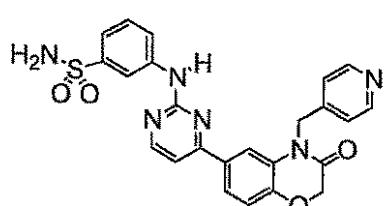
IVa-67



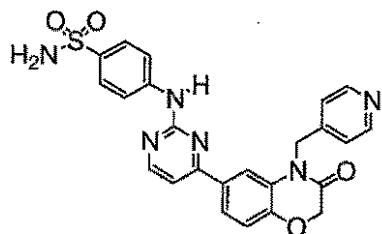
IVa-68



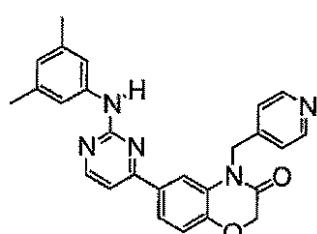
IVa-69



IVa-70



IVa-71



IVa-72

【請求項5】

請求項1ないし請求項4のいずれかに記載の化合物と、薬学的に受容可能な担体、アジュvantまたはビヒクルとを含有する、薬学的組成物。

【請求項6】

さらに、追加治療薬を含有し、該追加治療薬が、化学療法薬または抗増殖薬、アルツハイマー病治療薬、パーキンソン病治療薬、多発性硬化症(MS)治療薬、喘息治療薬、精神分裂病治療薬、抗炎症薬、免疫調節薬または免疫抑制薬、神経栄養性因子、循環器病治療薬、破壊的骨障害治療薬、肝疾患治療薬、血液疾患治療薬、または免疫不全障害治療薬から選択される、請求項5に記載の組成物。

【請求項7】

患者におけるJAK3キナーゼ活性を阻害するための、請求項1ないし請求項4のいずれかに記載の化合物または請求項5に記載の組成物。

【請求項8】

生物学的試料におけるJAK-3キナーゼ活性を阻害する方法であって、請求項1ないし請求項4のいずれかに記載の化合物または請求項5に記載の組成物を該生物学的試料と接触させる工程を包含する、方法。

【請求項9】

免疫応答、自己免疫疾患、神経変性、固形または血液悪性腫瘍から選択される疾患または障害、アレルギー性またはI型過感受性反応、喘息、移植片拒絶、移植片対宿主病、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から選択される疾患または障害の処置またはその重症度の軽減において使用するための、請求項1ないし請求項4のいずれかに記載の化合物または請求項5に記載の組成物。

【請求項 10】

化学療法薬または抗増殖薬、アルツハイマー病治療薬、パーキンソン病治療薬、多発性硬化症（M S）治療薬、喘息治療薬、精神分裂病治療薬、抗炎症薬、免疫調節薬または免疫抑制薬、神経栄養性因子、循環器病治療薬、破壊的骨障害治療薬、肝疾患治療薬、血液疾患治療薬、または免疫不全障害治療薬から選択される追加治療薬と共に使用するための、請求項 1 ないし請求項 4 のいずれかに記載の化合物または請求項 5 に記載の組成物。

【請求項 11】

免疫応答、自己免疫疾患、神経変性、固形または血液悪性腫瘍、アレルギー性またはI型過感受性反応、喘息、移植片拒絶、移植片対宿主病、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（F A L S）、白血病またはリンパ腫から選択される疾患または障害を処置するかその重症度を軽くするための薬剤の製造における、請求項 1 ないし請求項 4 のいずれかに記載の化合物または請求項 5 に記載の組成物の使用。

【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 5 3

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 5 3】

アリール（アラルキル、アラルコキシ、アリールオキシアルキルなどを含めて）基またはヘテロアリール（ヘテロアラルキルおよびヘテロアリールアルコキシなどを含めて）基は、1個またはそれ以上の置換基を含有し得、それゆえ、「必要に応じて置換され」得る。上でまたは本明細書中で定義していなければ、アリール基またはヘテロアリール基の不飽和炭素原子上の適当な置換基は、一般に、以下から選択される：ハロゲン；-R⁰；-OR⁰；-SR⁰；必要に応じてR⁰で置換したフェニル（Ph）；必要に応じてR⁰で置換した-O（Ph）；必要に応じてR⁰で置換した-(CH₂)_{1~2}(Ph)；必要に応じてR⁰で置換した-CH=CH(Ph)；-NO₂；-CN；-N(R⁰)₂；-NR⁰C(O)R⁰；-NR⁰C(S)R⁰；-NR⁰C(O)N(R⁰)₂；-NR⁰C(S)N(R⁰)₂；-NR⁰CO₂R⁰；-NR⁰NR⁰C(O)R⁰；-NR⁰NR⁰C(O)N(R⁰)₂；-NR⁰NR⁰CO₂R⁰；-C(O)C(O)R⁰；-C(O)CH₂C(O)R⁰；-CO₂R⁰；-C(O)R⁰；-C(S)R⁰；-C(O)N(R⁰)₂；-C(S)N(R⁰)₂；-OC(O)N(R⁰)₂；-OC(O)R⁰；-C(O)N(OR⁰)R⁰；-C(NOR⁰)R⁰；-S(O)₂R⁰；-S(O)₃R⁰；-SO₂N(R⁰)₂；-S(O)R⁰；-NR⁰SO₂N(R⁰)₂；-NR⁰SO₂R⁰；-N(OR⁰)R⁰；-C(=NH)-N(R⁰)₂；-P(O)₂R⁰；-PO(R⁰)₂；-OPO(R⁰)₂；-(CH₂)_{0~2}NHC(O)R⁰；必要に応じてR⁰で置換したフェニル（Ph）；必要に応じてR⁰で置換したフェニル-O（Ph）；必要に応じてR⁰で置換した-(CH₂)_{1~2}(Ph)；または必要に応じてR⁰で置換した-CH=CH(Ph)；ここで、R⁰の各出現例は、水素、必要に応じて置換したC_{1~6}脂肪族、非置換5員～6員ヘテロアリールまたは複素環、フェニル、-O(Ph)または-CH₂(Ph)、または上記定義にもかかわらず、R⁰の2個の別個の出現例は、同じ置換基または異なる置換基上にて、各R⁰基が結合する原子と一緒にになって、必要に応じて置換した3員～12員の飽和、部分不飽和または完全不飽和の単環式または二環式の環を形成し、この環は、0個～4個のヘテロ原子を有し、このヘテロ原子は、別個に、窒素、酸素またはイオウから選択される。