

【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27年11月12日 (2015.11.12)

【公表番号】特表2013-526586(P2013-526586A)

【公表日】平成25年6月24日 (2013.6.24)

【年通号数】公開・登録公報2013-033

【出願番号】特願2013-511397(P2013-511397)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/52 (2006.01)

A 6 1 K 31/53 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/14 C S P

C 0 7 D 487/04 1 4 4

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 K 31/52

A 6 1 K 31/53

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/506

【誤訳訂正書】

【提出日】平成27年9月24日 (2015.9.24)

【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

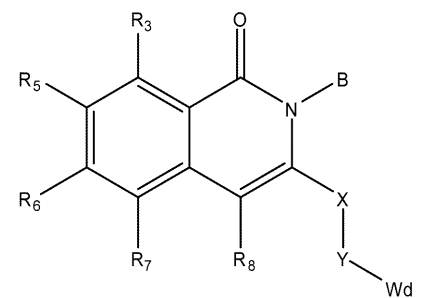
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 ( I b ) の化合物、又はその薬学的に許容される塩：

## 【化 1】

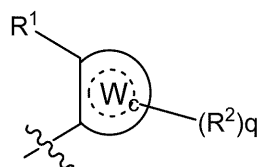


式 (Ib)

(式中、

B は、水素、アルキル、アミノ、ヘテロアルキル、または部分、式 I I :

## 【化 2】



式 II

であり、

ここで、 $W_c$  は、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクロアルキル、またはシクロアルキルであり、 $q$  は、整数 0、1、2、3 または 4 であり；

X は、 $-(CH(R^9))_z-$  であり、 $z$  は、整数 1 であり；

Y は、 $-NH-$  であり；

$R^1$  は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アミド、アルコシカルボニル、スルホンアミド、ハロ、シアノ、またはニトロであり；

各  $R^2$  は独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、アルコシカルボニル、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、ホスファート、尿素、またはカルボナートであり；

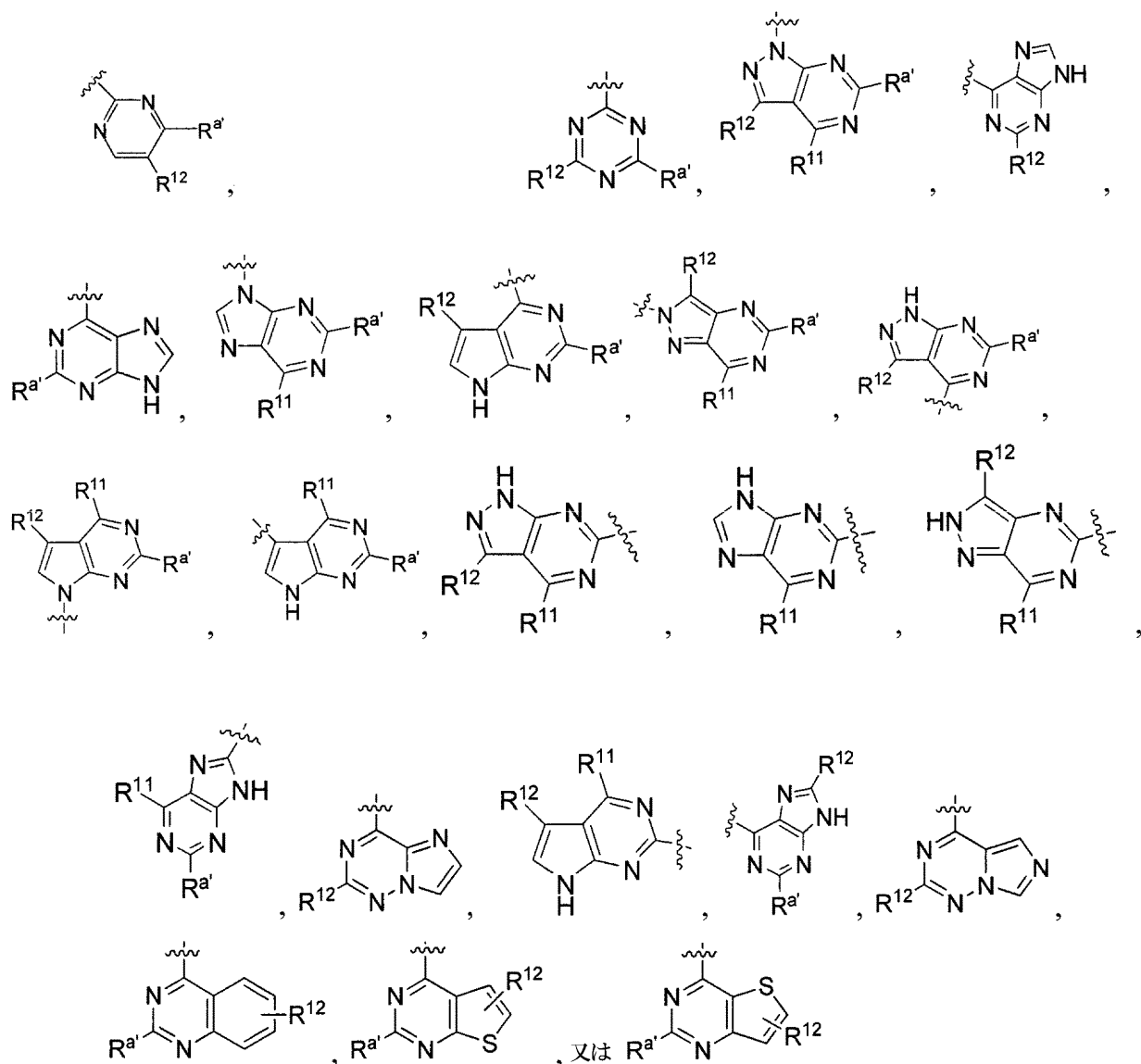
$R^3$  は、五員ヘテロアリール、五員非芳香族ヘテロシクリル、六員ヘテロアリール、又は六員非芳香族ヘテロシクリルであり；ここで、上記ヘテロアリール又はヘテロシクリルのそれぞれは、独立に、 0、1、2 または 3 個の  $R^{1-3}$  で置換されていてもよく；

$R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  および  $R^8$  は、水素であり；

$R^9$  は、アルキルであり；

$W_d$  は、

## 【化 3】



であり；

$R^{11}$  は、水素、アルキル、ハロ、アミノ、アミド、ヒドロキシ、アルコキシ、ホスファート、尿素、またはカルボナートであり；

$R^{12}$  は、水素、アルキル、ハロアルキル、アルキニル、アルケニル、ハロ、 $-C(O)NH_2$ 、 $-NH_2$ 、シアノ、アリール、ヘテロアリール、非芳香族ヘテロシクリル、またはシクロアルキルであり；

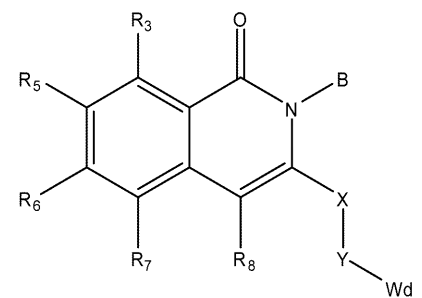
$R^{a'}$  は、水素、アルキル、 $-NH_2$ 、シアノ、またはハロゲンであり；

各  $R^{13}$  は独立して、 $C_1 \sim C_6$  アルキル、 $C_1 \sim C_6$  アルコキシ、またはハロゲンである。）。

## 【請求項 2】

式 (I b) の化合物、又はその薬学的に許容される塩；

## 【化 4】

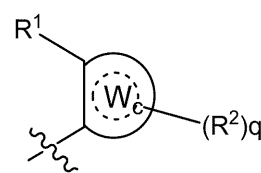


式 (Ib)

( 式中、

B は、水素、アルキル、アミノ、ヘテロアルキル、または部分、式 I I :

## 【化 5】



式 II

であり、

ここで、 $W_c$  は、アリーール、ヘテロアリーール、ヘテロシクロアルキル、またはシクロアルキルであり、 $q$  は、整数 0、1、2、3 または 4 であり；

$X$  は、 $-(CH(R^9))_z-$  であり、 $z$  は、整数 1 であり；

$Y$  は、 $-NH-$  であり；

$R^1$  は、水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アルコキシ、アミド、アルコシカルボニル、スルホンアミド、ハロ、シアノ、またはニトロであり；

各  $R^2$  は独立して、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリーール、ヘテロアリーール、アリーールアルキル、ヘテロアリーールアルキル、アルコキシ、アミド、アミノ、アシル、アシルオキシ、アルコシカルボニル、スルホンアミド、ハロ、シアノ、ヒドロキシ、ニトロ、ホスファート、尿素、またはカルボナートであり；

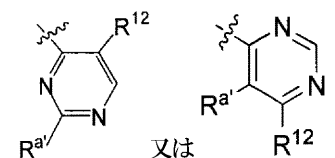
$R^3$  は、0、1、2 または 3 個の  $R^{13}$  で置換された五員ヘテロアリーールであり；

$R^5$ 、 $R^6$ 、 $R^7$  および  $R^8$  は、水素であり；

$R^9$  は、アルキルであり；

$W_d$  は、

## 【化 6】

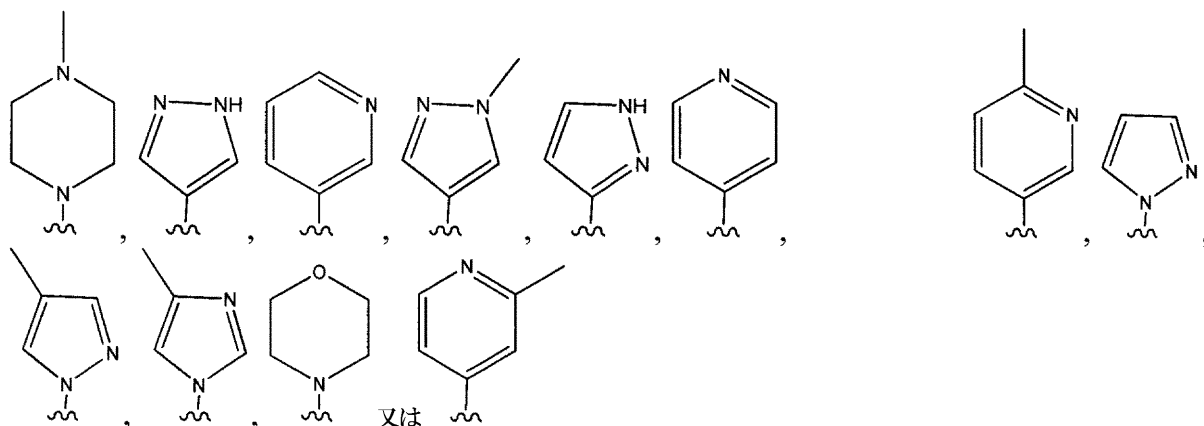


であり；

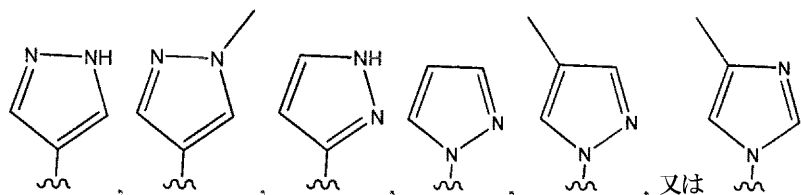
$R^{11}$  は、水素、アルキル、ハロ、アミノ、アミド、ヒドロキシ、アルコキシ、ホスファート、尿素、またはカルボナートであり；

$R^{12}$  は、水素、アルキル、ハロアルキル、アルキニル、アルケニル、ハロ、 $-C(O)NH_2$ 、 $-NH_2$ 、シアノ、アリーール、ヘテロアリーール、非芳香族ヘテロシクリル、ま

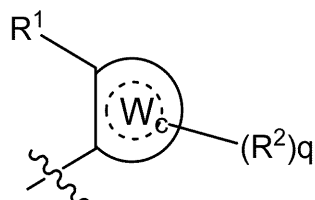
【化 7】



【化 8】



【化 9】



式 II

○

【請求項 9】

q が 1 であり、 $R^2$  がアルキル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリール、アリールアルキル、ヘテロアリールアルキル、アルコキシ、アミノ、ハロ、シアノ、ヒドロキシまたはニトロである、請求項 7 に記載の化合物。

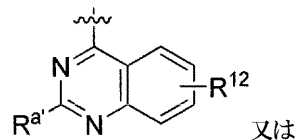
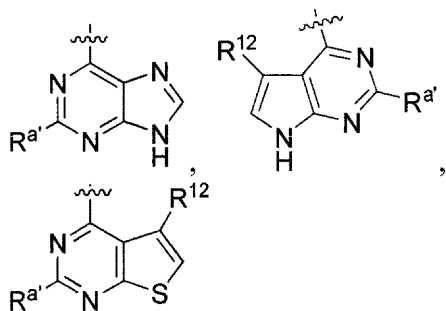
【請求項 10】

$R^9$  がメチルである、請求項 1 から 9 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 11】

$W_d$  が

【化 10】

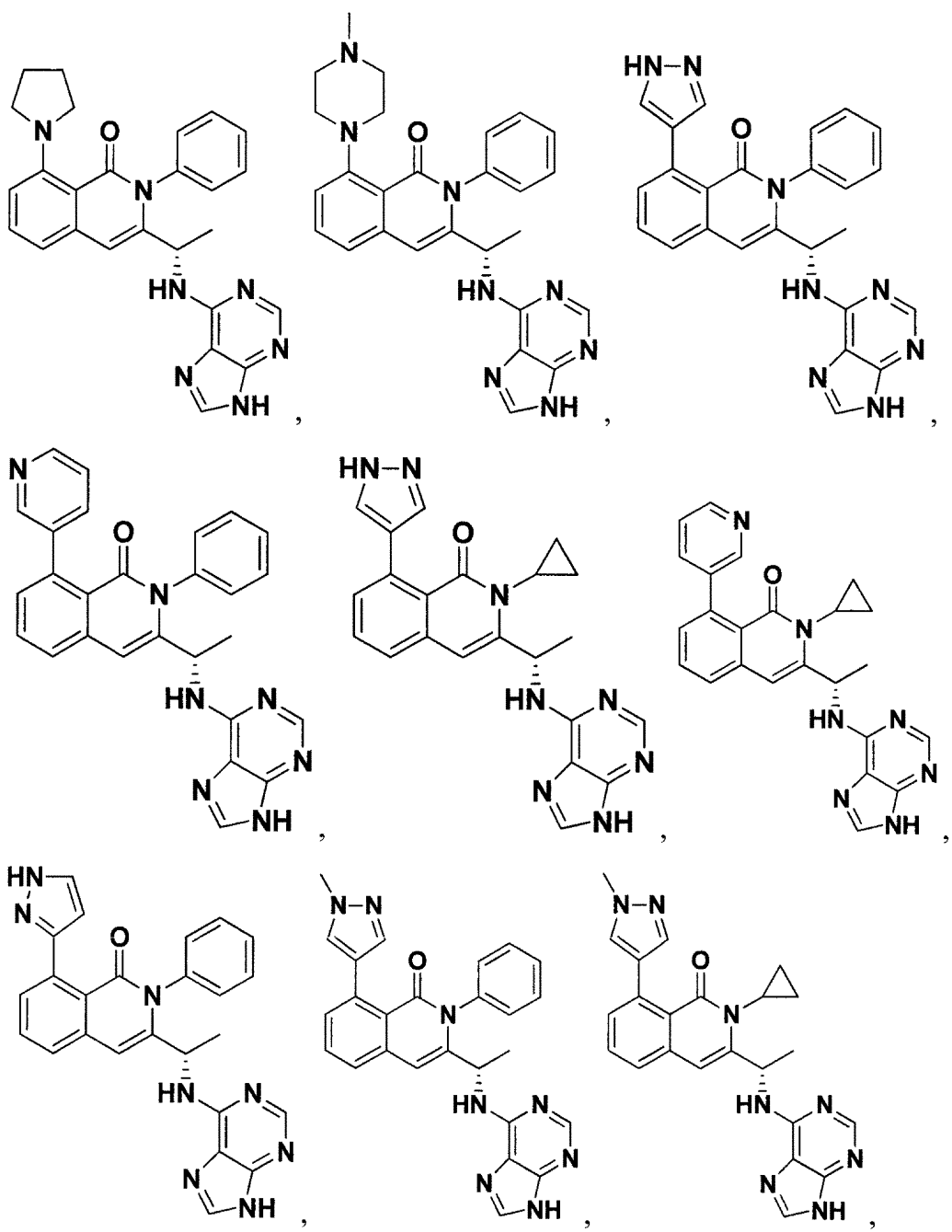


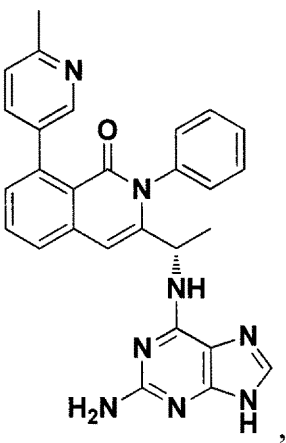
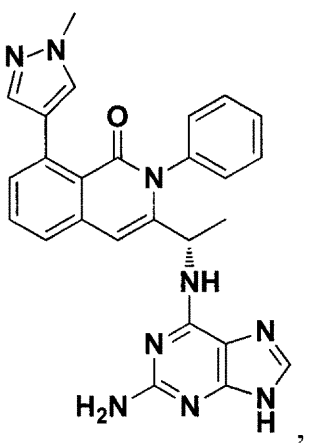
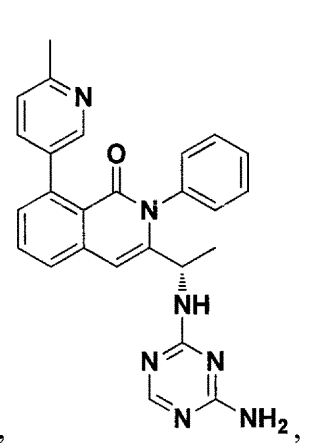
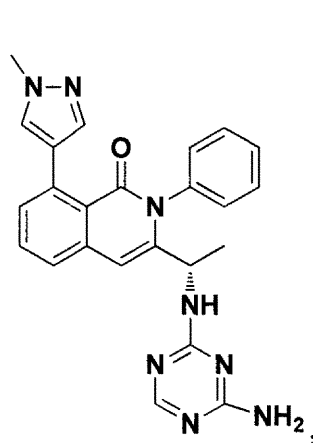
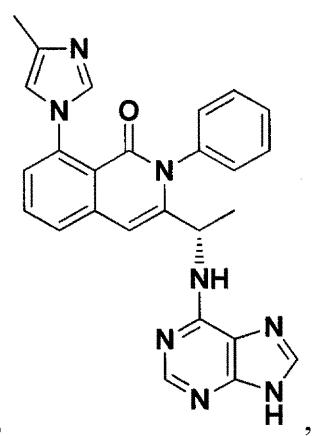
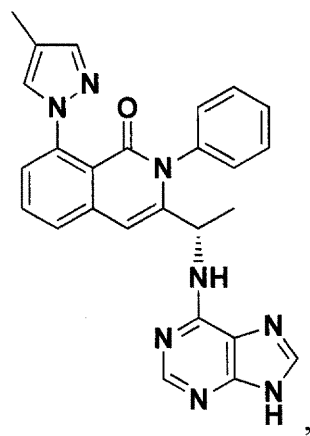
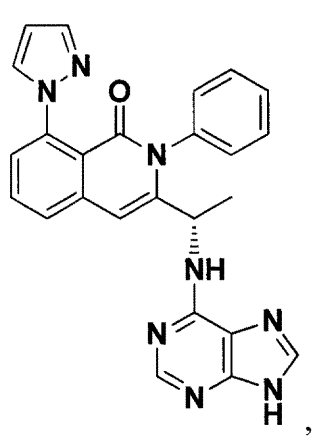
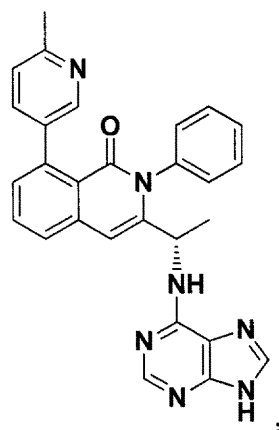
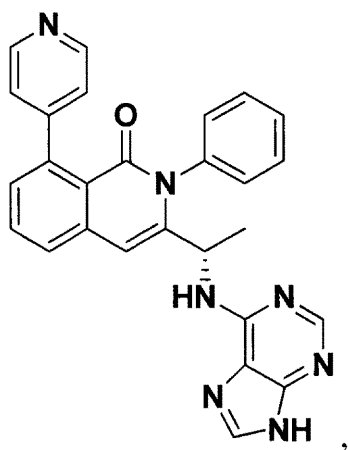
である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 12】

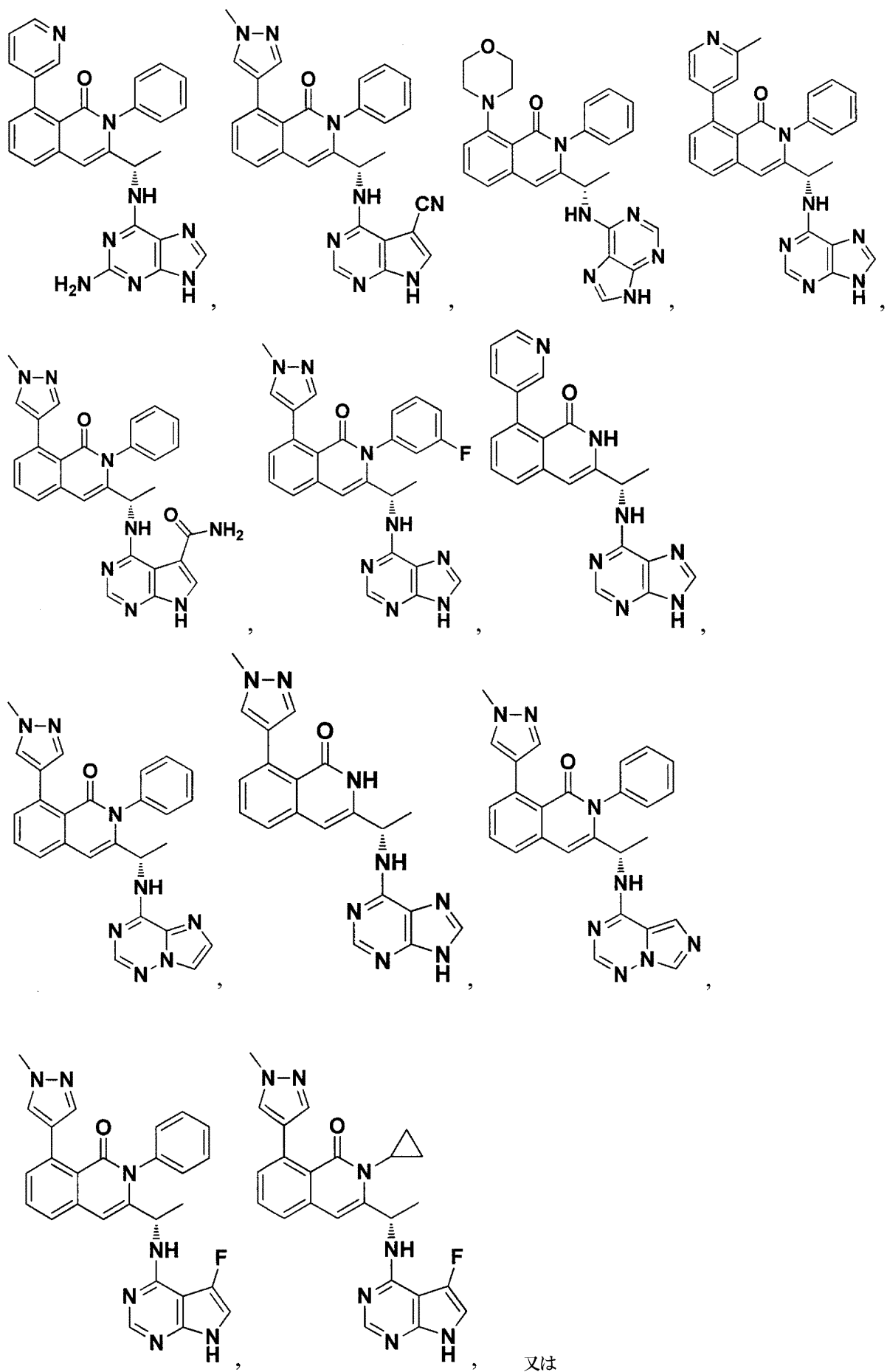
前記化合物、またはその薬学的に許容される塩が、下記である、請求項 1 に記載の化合物  
:

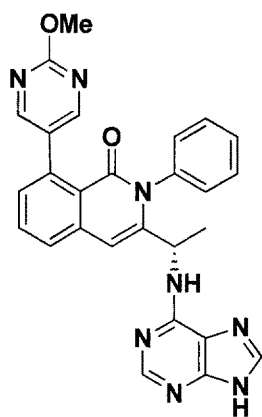
【化 1 1】











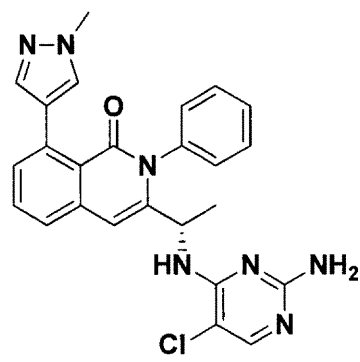
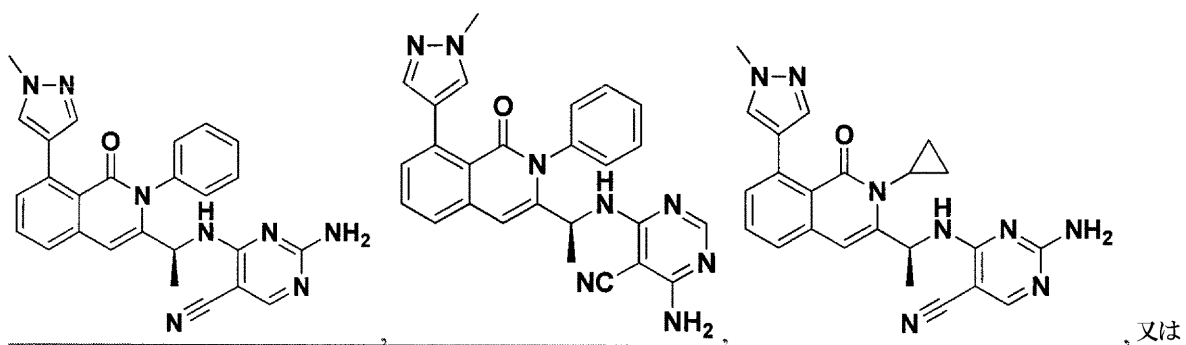
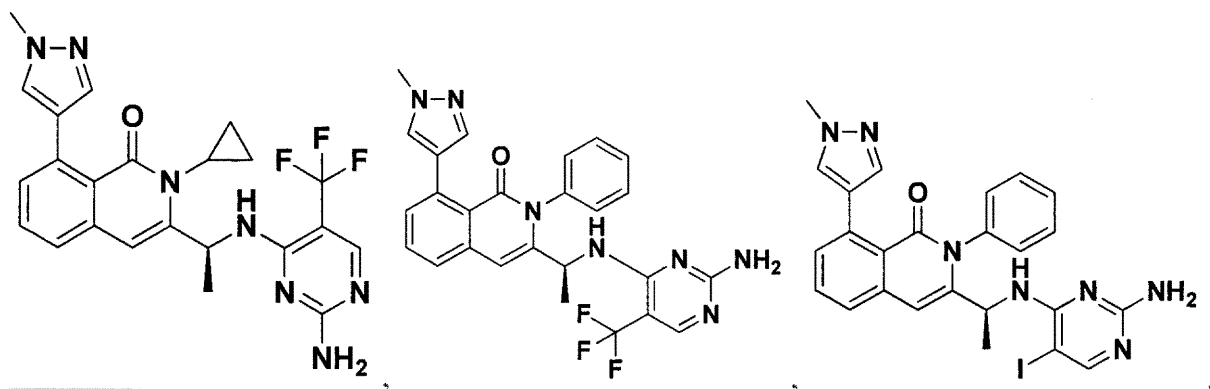
。

【請求項 13】

前記化合物、またはその薬学的に許容される塩が、下記である、請求項 2 記載の化合物

：

【化 12】



。

## 【請求項 1 4】

請求項 1 から 1 3 のいずれか一項に記載の化合物および 1 つ以上の薬学的に許容される賦形剤を含む医薬組成物。

## 【請求項 1 5】

対象の P I 3 K 媒介障害の治療のための薬剤の製造における、請求項 1 から 1 3 のいずれか一項に記載の化合物または請求項 1 4 に記載の医薬組成物の使用。

## 【請求項 1 6】

前記障害が、癌、炎症性疾患、または自己免疫疾患である、請求項 1 5 記載の使用。

## 【請求項 1 7】

前記障害が、癌である、請求項 1 5 記載の使用。

## 【請求項 1 8】

前記癌が、乳癌、腺癌、膠様癌、管状癌、炎症性乳房癌、卵巣癌、上皮卵巣腫瘍、腺癌、子宮癌、子宮頸癌、扁平上皮細胞癌、前立腺癌、膀胱癌、類上皮癌、膀胱癌、移行上皮癌、尿路上皮癌、小細胞癌、急性リンパ性白血病、毛様細胞性白血病、骨髄異形成、骨髄増殖性疾患、急性骨髄性白血病(AML)、慢性骨髄性白血病(CML)、肥満細胞症、慢性リンパ球性白血病(CLL)、多発性骨髄腫(MM)、骨髄異形成症候群(MDS)、骨癌、肺癌、非小細胞肺癌(NSCLC)、未分化大細胞癌、小細胞肺癌、皮膚癌、基底細胞癌、黒色腫、日光角化症、眼網膜芽細胞腫、皮膚黒色腫、眼球内黒色腫、原発性肝癌、腎臓癌、甲状腺癌、AIDS-関連リンパ腫、びまん性大型 B 細胞リンパ腫、B 細胞免疫芽細胞リンパ腫、小型非切れ込み核細胞性リンパ腫、カポジ肉腫、ウイルス誘発性癌、肝炎 B ウイルス(HBV)、肝炎 C ウイルス(HCV)、肝細胞癌、ヒト白血球ウイルス - タイプ 1 (HTLV-1)、成人 T 細胞白血病 / リンパ腫、ヒトパピローマウイルス(HPV)、中枢神経系癌(CNS)、原発性脳腫瘍、神経膠腫、星状細胞腫、未分化星状細胞腫、多形神経膠芽腫、乏突起神経膠腫、上衣腫、髄膜腫、リンパ腫、シュワン腫、髄芽腫、末梢神経系(PNS)癌、聴神経腫、悪性末梢神経鞘腫(MPNST)、神経線維腫、悪性線維性組織球腫、悪性髄膜腫、悪性中皮腫、悪性ニューラ管混合腫瘍、口腔および口腔咽頭癌、下咽頭癌、喉頭癌、上咽頭癌、胃癌、胃の間質腫瘍、カルチノイド腫瘍、精巣癌、胚細胞性腫瘍(GCTs)、精上皮腫、非セミノーマ、性腺間質腫瘍、ライディッヒ細胞腫、セルトリ細胞腫、胸腺癌、胸腺腫、ホジキン病、非ホジキンリンパ腫、直腸癌、結腸癌、又はマントル細胞リンパ腫である、請求項 1 7 記載の使用。

## 【請求項 1 9】

前記障害が、炎症性疾患、または自己免疫疾患である、請求項 1 5 記載の使用。

## 【請求項 2 0】

前記炎症性疾患、または自己免疫疾患が、急性散在性脳脊髄炎(ADEM)、アジソン病、抗リン脂質抗体症候群(APS)、再生不良性貧血、自己免疫性肝炎、セリアック病、クローン病、糖尿病(1型)、グッドパスチャー症候群、グレーブス病、ギラン - バレー症候群(GBS)、橋本病、紅斑性狼瘡、多発性硬化症、重症筋無力症、オプソクローヌスミオクローヌス症候群(OMS)、視神経炎、O r d 甲状腺炎、天疱瘡、多発性関節炎、原発性胆汁性肝硬変、乾癬、関節リウマチ、ライター症候群、高安動脈炎、一時的動脈炎、温式自己免疫性溶血性貧血、ウェゲナー肉芽腫症、全身性脱毛症、シャーガス病、慢性疲労症候群、自律神経障害、子宮内膜症、汗腺膿瘍、間質性膀胱炎、神経性筋強直症、サルコイドーシス、強皮症、潰瘍性大腸炎、白斑、外陰部痛、喘息、肺気腫、アレルギー、皮膚炎、または移植片対宿主病である、請求項 1 9 記載の使用。

## 【請求項 2 1】

有効量の第 2 治療剤をさらに含む、請求項 1 5 から 2 0 のいずれか一項記載の使用。

## 【請求項 2 2】

前記第 2 治療剤が、I g E 産生または活性を阻害する薬剤；mTOR阻害薬；TORC1阻害薬；TORC2阻害薬；抗-IgE抗体；非ステロイド系抗炎症薬(NSAIDs)；コルチコステロイド；抗凝固剤；有糸分裂阻害薬、アルキル化剤、代謝拮抗薬、挿入抗生物質、増殖因子阻害薬、細胞周期阻害薬、酵素、トポイソメラーゼ阻害薬、生体反応修飾物質、抗ホルモン剤、血管形成阻害薬、抗アンドロゲン薬、細胞傷害性薬剤、非ペプチド小分子、ナイトロジェ

ンマスタート、および抗-CD20抗体から選択される化学療法剤；抗血管形成剤；シグナル伝達阻害薬；抗増殖剤；解糖阻害薬；自食作用阻害薬；免疫調節剤；免疫抑制剤；寛容原；及び免疫増強薬から選択される、請求項2\_1記載の使用。

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0308

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0308】

本明細書に開示の方法に従って、本明細書に開示の化合物、または前記化合物の薬学的に許容される形態、塩、エステル、プロドラッグもしくは誘導体を用いて治療できる患者には、例えば、以下を有すると診断された患者が含まれるが、これらに限定されない。乾癬；再狭窄；アテローム性動脈硬化症；BPH；乳腺の管組織の腺管癌、髓様癌、膠様癌、管状癌および炎症性乳房癌などの乳房癌；卵巣の腺癌および卵巣から腹腔に転位した腺癌などの上皮卵巣腫瘍を含む卵巣癌；子宮癌；扁平上皮細胞癌および腺癌を含む頸部上皮における線癌などの子宮頸癌；腺癌または骨に転移した腺癌\*adenocarcinomaから選択される前立腺癌などの前立腺癌；膵臓管組織の類上皮癌\*epithelioidおよび膵臓管の腺癌などの膵臓癌；膀胱の移行上皮癌、尿路上皮癌（移行上皮癌）、膀胱の内側を覆う尿路上皮細胞の腫瘍、扁平上皮細胞癌、腺癌および小細胞癌などの膀胱癌；急性骨髄性白血病（myeloid leukemia）（AML）、急性リンパ性白血病、慢性リンパ性白血病、慢性骨髄性白血病、毛様細胞性白血病、脊髄形成異常症、骨髄増殖性疾患、急性骨髄性白血病（myelogenous leukemia）（AML）、慢性骨髄性白血病（CML）、肥満細胞症、慢性リンパ性白血病（CLL）、多発性骨髄腫（MM）および骨髄異形成症候群（MDS）などの白血病；骨癌；扁平上皮細胞癌、腺癌および未分化大細胞癌に分割される非小細胞肺癌（NSCLC）ならびに小細胞肺癌などの肺癌；基底細胞癌、黒色腫、扁平上皮細胞癌および時に扁平上皮細胞癌に進展する皮膚状態である日光角化症などの皮膚癌；眼網膜芽細胞腫；皮膚または眼内（目）黒色腫；原発性肝癌（肝臓から始まる癌）；腎臓癌；乳頭、濾胞、髓質および未分化などの甲状腺癌；びまん性大型B細胞リンパ腫、B細胞免疫芽細胞リンパ腫および小型非切れ込み核細胞性リンパ腫などのAIDS関連リンパ腫；カポジ肉腫；肝炎Bウイルス（HBV）、肝炎Cウイルス（HCV）および肝細胞癌を含むウイルス誘発性癌；ヒト白血球ウイルス-タイプ1（HTLV-1）および成人T細胞白血病/リンパ腫；ならびにヒトパピローマウイルス（HPV）および子宮頸癌；神経膠腫（星状細胞腫、未分化星状細胞腫または多形神経膠芽腫）、乏突起神経膠腫、上衣腫、髓膜腫、リンパ腫、シュワン腫および髓芽腫を含む、原発性脳腫瘍などの中枢神経系癌（CNS）；聴神経腫ならびに神経線維腫およびシュワン腫を含む悪性末梢神経鞘腫（MPNST）、悪性線維性組織球腫（fibrous cytoma）、悪性線維性組織球腫（fibrous histiocytoma）、悪性髓膜腫、悪性中皮腫ならびに悪性ミューラー管混合腫瘍などの末梢神経系（PNS）癌；下咽頭癌、喉頭癌、上咽頭癌および口腔咽頭癌などの口腔および口腔咽頭癌；リンパ腫、胃の間質腫瘍およびカルチノイド腫瘍などの胃癌；精上皮腫および非セミノーマを含む胚細胞性腫瘍（GCT）ならびにライディッヒ細胞腫およびセルトリ細胞腫を含む性腺間質腫瘍などの精巣癌；胸腺腫、胸腺癌、ホジキン病、非ホジキンリンパ腫カルチノイドまたはカルチノイド腫瘍などの胸腺癌；直腸癌；ならびに結腸癌。

【誤訳訂正3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0348

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0348】

さらに、免疫調節のために使用される治療剤、例えば免疫調節剤、免疫抑制剤、寛容原

および免疫増強薬などが本明細書の方法で企図されている。さらに、血液および造血器官において作用する治療剤、造血剤、増殖因子、ミネラルおよびビタミン、抗凝固剤、血栓溶解剤および抗血小板薬である。