

【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4月20日(2006.4.20)

【公表番号】特表2004-521913(P2004-521913A)

【公表日】平成16年7月22日(2004.7.22)

【年通号数】公開・登録公報2004-028

【出願番号】特願2002-565973(P2002-565973)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/4545 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 P 1/02 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 1/18 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/14 (2006.01)

A 6 1 P 19/06 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/08 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/04 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 401/04

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/4545

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 P 1/02

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 1/16

A 6 1 P 1/18

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	17/14	
A 6 1 P	19/06	
A 6 1 P	19/10	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	25/08	
A 6 1 P	25/28	
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	31/12	
A 6 1 P	31/18	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	37/00	
A 6 1 P	37/02	
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	37/08	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
C 0 7 D	401/14	

【誤訳訂正書】

【提出日】平成18年2月28日(2006.2.28)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0 0 5 1

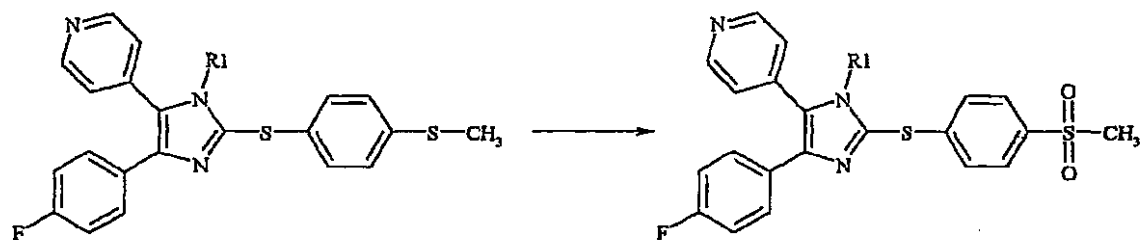
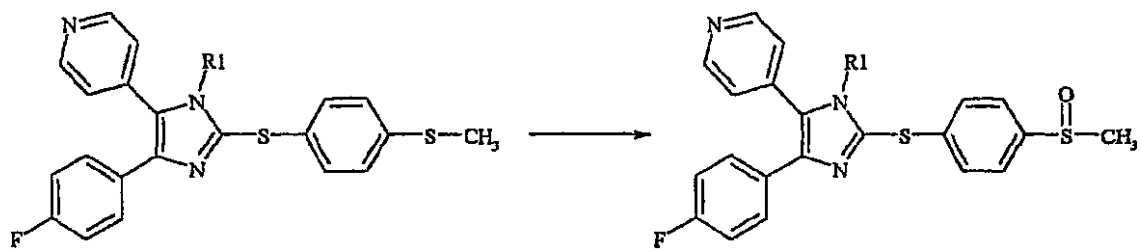
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0 0 5 1】

スキーム7

【化 8】



【誤訳訂正 2】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0065

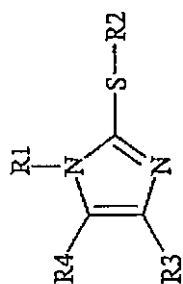
【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0065】

in vitro試験の結果を以下の表1及び2に示す。

【表 1 . 1】



実施例	R1	R2	R3	R4	Yield ^{b)}	TNF- α ^{a)}	IL-1 β ^{a)}
1	CH ₃	H	4- <i>p</i> -フェニル	4-ピリジル	36	19	3.6
2	C ₂ H ₅	H	4- <i>p</i> -フェニル	4-ピリジル	11	41	1.3
3	<i>n</i> -C ₃ H ₇	H	4- <i>p</i> -フェニル	4-ピリジル	31/22	32	2.4
4	<i>i</i> -C ₃ H ₇	H	4- <i>p</i> -フェニル	4-ピリジル	15	46%	2.2
5	シクロヘキシル	H	4- <i>p</i> -フェニル	4-ピリジル	9	33	5.4
6	シクロプロピル	H	4- <i>p</i> -フェニル	4-ピリジル	33	^{b)}	-
7	フェニル	H	4- <i>p</i> -フェニル	4-ピリジル	7	37	2.3
8	ベンジル	H	4- <i>p</i> -フェニル	4-ピリジル	8	20	1.0
9	4-ジメチルアミノフェニル	H	4- <i>p</i> -フェニル	4-ピリジル	8	15	1.8
10	3-ピリジル	H	4- <i>p</i> -フェニル	4-ピリジル	16	42%	8.0
11	ジメチルアミノエチル	H	4- <i>p</i> -フェニル	4-ピリジル	15	19%	12
12	2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル	H	4- <i>p</i> -フェニル	4-ピリジル	13	45	1.6
13	ジメチルアミノプロピル	H	4- <i>p</i> -フェニル	4-ピリジル	22	-	-

【表 1 . 2】

14	N-モルホリノプロピル	H	4-F-フェニル	4-ピリジル	38	100	18
15	4-メチルスルファニルフェニル	H	4-F-フェニル	4-ピリジル	13	-	-
16	N-モルホリノエチル	H	4-F-フェニル	4-ピリジル	16	34%	44%
17	3-ヒドロキシプロピル	H	4-F-フェニル	4-ピリジル	13	49%	7.3
18	1-ベンジルピペリジン-4-イル	H	4-F-フェニル	4-ピリジル	18	38	5.8
19	アリル	H	4-F-フェニル	4-ピリジル	28	-	-
20	CH ₃	CH ₃	4-F-フェニル	4-ピリジル	15	2.5	0.45
21	n-C ₃ H ₇	CH ₃	4-F-フェニル	4-ピリジル	6	1.3	0.36
22	シクロプロピル	CH ₃	4-F-フェニル	4-ピリジル	12	1.1	0.34
23	N-モルホリノエチル	CH ₃	4-F-フェニル	4-ピリジル	3	-	-
24	N-モルホリノプロピル	CH ₃	4-F-フェニル	4-ピリジル	4	2.7	1.0
25	2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル	CH ₃	4-F-フェニル	4-ピリジル	11	16	0.85
26	1-ベンジルピペリジン-4-イル	CH ₃	4-F-フェニル	4-ピリジル	3	-	-
27	C ₂ H ₅	4-CH ₃ -SO ₂ -ベンジル	4-F-フェニル	4-ピリジル	6	4.1	0.95
28	n-C ₃ H ₇	ベンジル	4-F-フェニル	4-ピリジル	24	29	0.65
29	n-C ₃ H ₇	4-Cl-ベンジル	4-F-フェニル	4-ピリジル	20	62	1.3
30	n-C ₃ H ₇	4-CH ₃ -ベンジル	4-F-フェニル	4-ピリジル	20	22	1.3
31	n-C ₃ H ₇	4-CH ₃ -S-ベンジル	4-F-フェニル	4-ピリジル	12	35%	4.7
32	n-C ₃ H ₇	4-CH ₃ -SO-ベンジル	4-F-フェニル	4-ピリジル	3	24	1.6
33	n-C ₃ H ₇	4-CH ₃ -SO ₂ -ベンジル	4-F-フェニル	4-ピリジル	9	6.8	0.72
34	i-C ₃ H ₇	4-Cl-ベンジル	4-F-フェニル	4-ピリジル	6	53	5.3
35	i-C ₃ H ₇	4-CH ₃ -SO ₂ -ベンジル	4-F-フェニル	4-ピリジル	7	2.7	1.5
36	シクロプロピル	-CH ₂ -CH=CH-フェニル	4-F-フェニル	4-ピリジル	27	-	-
37	シクロプロピル	-CH ₂ -CH=CH-4-Cl-フェニル (トランス)	4-F-フェニル	4-ピリジル	11	-	-
38	シクロプロピル	-CH ₂ -CH=CH-フェニル	4-F-フェニル	4-ピリジル	12	-	-
39	シクロヘキシル	4-CH ₃ -SO ₂ -ベンジル	4-F-フェニル	4-ピリジル	5	13	1.8
40	フェニル	4-CH ₃ -SO ₂ -ベンジル	4-F-フェニル	4-ピリジル	2	3.4	1.3
41	ベンジル	4-CH ₃ -SO ₂ -ベンジル	4-F-フェニル	4-ピリジル	3	1.0	0.36
42	N-モルホリノエチル	ベンジル	4-F-フェニル	4-ピリジル	5	11	1.3

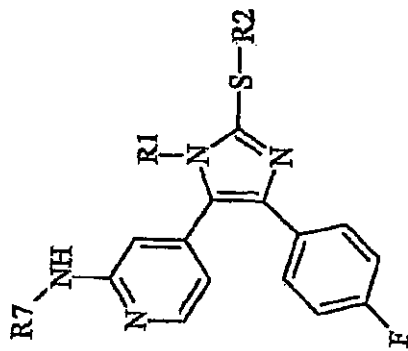
【表 1 . 3】

43	N-モルホリノプロピル	ベンジル	4-F-フェニル	4-ピリジル	25	5.4	0.89
44	N-モルホリノプロピル	4-CH ₃ -SO ₂ -ベンジル	4-F-フェニル	4-ピリジル	31	12	1.4
45	N-モルホリノプロピル	4-CH ₃ -SO ₂ -ベンジル	4-F-フェニル	4-ピリジル	4	12	2.4
46	2,2,6,6-テトラメチルピペリジン-4-イル	ベンジル	4-F-フェニル	4-ピリジル	9	12	0.87
47	CH ₃	N-モルホリノエチル	4-F-フェニル	4-ピリジル	26	28	1.7
48	CH ₃	シス-ブフェニルエチニル	4-F-フェニル	4-ピリジル	10	22	1.7
49	n-C ₃ H ₇	シス-ブフェニルエチニル	4-F-フェニル	4-ピリジル	20	-	-
50	シクロプロピル	シス-ブフェニルエチニル	4-F-フェニル	4-ピリジル	3	-	-
51	n-C ₃ H ₇	-CHBr-CHBr-フェニル	4-F-フェニル	4-ピリジル	20	-	-
52	n-C ₃ H ₇	フェニル	4-F-フェニル	4-ピリジル	26	14	1.0
53	n-C ₃ H ₇	4-Cl-フェニル	4-F-フェニル	4-ピリジル	25	29	3.3
54	n-C ₃ H ₇	4-CH ₃ -S-フェニル	4-F-フェニル	4-ピリジル	22	68	2.5
55	n-C ₃ H ₇	4-CH ₃ -SO-フェニル	4-F-フェニル	4-ピリジル	16	6.2	0.72
56	n-C ₃ H ₇	4-CH ₃ -SO ₂ -フェニル	4-F-フェニル	4-ピリジル	15	19	1.5
57	4-F-フェニル	H	CH ₃	4-ピリジル	7	34%	19
58	3-ピリジル	H	4-F-フェニル	CH ₃	15	32%	28
59	n-C ₃ H ₇	H	4-ピリジル	4-F-フェニル	5	83	16%
60	N-モルホリノエチル	H	4-ピリジル	4-F-フェニル	5	-	-

a) IC₅₀[$\mu\text{mol} \times \text{l}^{-1}$]

b) 全段階を通しての総収率(%)

【表 2】



実施例	R1	R7	R2	TNF- α^a	IL-1 β^a
61	CH ₃	-COCH ₃	CH ₃	0.87	0.07
62	C ₃ H ₇	-COCH ₃	CH ₃	0.49	0.12
63	2, 2, 6, 6-テトラメチルピペリジン-4-イル	-COCH ₃	CH ₃	4.5	0.46
64	N-モルホリノプロピル	-COCH ₃	CH ₃	-	-
65	3-ヒドロキシプロピル	-COCH ₃	CH ₃	-	-
66	CH ₃	-H..	CH ₃	2.3	0.27
67	CH ₃	p-メトキシベンゾイル	CH ₃	0.64	0.44
68	CH ₃	-CO-シクロプロピル	CH ₃	-	-
69	CH ₃	-CO-シクロペンチル	CH ₃	-	-
70	CH ₃	-Bz	CH ₃	0.39	0.08
71	CH ₃	-1-フェニルエチル	CH ₃	0.13	0.01
73	CH ₃	-C ₂ H ₅	CH ₃	0.35	0.05
74	C ₃ H ₇	-C ₂ H ₅	CH ₃	0.41	0.15
75	2, 2, 6, 6-テトラメチルピペリジン-4-イル	-C ₂ H ₅	CH ₃	2.9	0.62
76	N-モルホリノプロピル	-COCH ₃	4-メチルスルフィニルベンジル	-	-

c) IC₅₀[μ mol x l⁻¹] Bz = ベンジル