

【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】令和2年11月19日(2020.11.19)

【公表番号】特表2019-535672(P2019-535672A)

【公表日】令和1年12月12日(2019.12.12)

【年通号数】公開・登録公報2019-050

【出願番号】特願2019-521131(P2019-521131)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/444 (2006.01)  
A 6 1 K 31/496 (2006.01)  
A 6 1 K 31/501 (2006.01)  
A 6 1 K 31/506 (2006.01)  
A 6 1 K 31/5377 (2006.01)  
A 6 1 P 17/00 (2006.01)  
A 6 1 P 17/06 (2006.01)  
A 6 1 P 19/04 (2006.01)  
A 6 1 P 37/08 (2006.01)  
A 6 1 K 31/4545 (2006.01)  
C 07 D 401/14 (2006.01)  
C 07 D 405/14 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/444  
A 6 1 K 31/496  
A 6 1 K 31/501  
A 6 1 K 31/506  
A 6 1 K 31/5377  
A 6 1 P 17/00  
A 6 1 P 17/06  
A 6 1 P 19/04  
A 6 1 P 37/08  
A 6 1 K 31/4545  
C 07 D 401/14 C S P  
C 07 D 405/14

【手続補正書】

【提出日】令和2年10月9日(2020.10.9)

【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

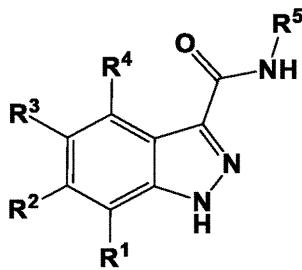
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

対象における疾患または状態を治療するための薬学的組成物であって、式1：



**I**の構造を有する化合物またはその薬学的に許容される塩を含み、該疾患または状態が、腱障害、皮膚炎、乾癬、モルフェア、魚鱗癬、レイノー症候群、およびダリエー病より選択され、

式中、

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>およびR<sup>4</sup>は、H、C<sub>1-9</sub>アルキル、ハロゲン化物、-N(R<sup>10</sup>)<sub>2</sub>、-XR<sup>10</sup>、CN、-OCF<sub>3</sub>および-CF<sub>3</sub>からなる群より独立して選択され、

R<sup>3</sup>は、カルボシクリルR<sup>6</sup>、ヘテロシクリルR<sup>6</sup>、アリールR<sup>6</sup>およびヘテロアリールR<sup>6</sup>からなる群より選択され、

R<sup>5</sup>は、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>カルボシクリルR<sup>7</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロシクリルR<sup>7</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>アリールR<sup>7</sup>および-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロアリールR<sup>7</sup>からなる群より選択され、

各R<sup>6</sup>は、H、C<sub>1-9</sub>アルキル、ハロゲン化物、アミノ、-OCF<sub>3</sub>、-CF<sub>3</sub>、-CN、-XR<sup>10</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>カルボシクリルR<sup>8</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロシクリルR<sup>8</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>アリールR<sup>8</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロアリールR<sup>8</sup>、-C(=O)R<sup>11</sup>、-N(R<sup>10</sup>)C(=O)R<sup>11</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>10</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>10</sup>)SO<sub>2</sub>R<sup>11</sup>および-SO<sub>2</sub>R<sup>11</sup>からなる群よりそれぞれ選択される1~5つの置換基であり、

各R<sup>7</sup>は、H、C<sub>1-9</sub>アルキル、ハロゲン化物、アミノ、-OCF<sub>3</sub>、-CF<sub>3</sub>、-CN、-XR<sup>10</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>カルボシクリルR<sup>9</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロシクリルR<sup>9</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>アリールR<sup>9</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロアリールR<sup>9</sup>、-C(=O)R<sup>11</sup>、-N(R<sup>10</sup>)C(=O)R<sup>11</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>10</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>10</sup>)SO<sub>2</sub>R<sup>11</sup>および-SO<sub>2</sub>R<sup>11</sup>からなる群よりそれぞれ選択される1~5つの置換基であり、

各R<sup>8</sup>は、H、C<sub>1-3</sub>アルキル、ハロゲン化物、アミノ、OCF<sub>3</sub>、-CF<sub>3</sub>、CN、-XR<sup>12</sup>、-C(=O)R<sup>13</sup>、-N(R<sup>12</sup>)C(=O)R<sup>13</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>12</sup>)SO<sub>2</sub>R<sup>13</sup>および-SO<sub>2</sub>R<sup>13</sup>からなる群よりそれぞれ選択される1~5つの置換基であり、

各R<sup>9</sup>は、H、C<sub>1-3</sub>アルキル、ハロゲン化物、アミノ、-OCF<sub>3</sub>、-CF<sub>3</sub>、CN、-XR<sup>12</sup>、-C(=O)R<sup>13</sup>、-N(R<sup>12</sup>)C(=O)R<sup>13</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>12</sup>)SO<sub>2</sub>R<sup>13</sup>および-SO<sub>2</sub>R<sup>13</sup>からなる群よりそれぞれ選択される1~5つの置換基であり、

各R<sup>10</sup>は、H、C<sub>1-9</sub>アルキル、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>カルボシクリルR<sup>8</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロシクリルR<sup>8</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>アリールR<sup>8</sup>および-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロアリールR<sup>8</sup>からなる群より独立して選択され、

各R<sup>11</sup>は、C<sub>1-9</sub>アルキル、-N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>カルボシクリルR<sup>8</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロシクリルR<sup>8</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>アリールR<sup>8</sup>および-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロアリールR<sup>8</sup>からなる群より独立して選択され、

各R<sup>12</sup>は、H、C<sub>1-9</sub>アルキル、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>カルボシクリル、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロシクリル、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>アリールおよび-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロアリールからなる群より独立して選択され、

各R<sup>13</sup>は、C<sub>1-9</sub>アルキル、-N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>カルボシクリル、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロシクリル、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>アリールおよび-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロアリールからなる群より独立して選択され、

各R<sup>14</sup>は、H、C<sub>1-3</sub>アルキル、カルボシクリルおよびアリールからなる群より独立して選択され、

各Xは、結合、-O-および-S-からなる群より選択され、

各nは0または1である、

前記薬学的組成物。

【請求項2】

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>およびR<sup>4</sup>がHである、請求項1記載の薬学的組成物。

【請求項3】

R<sup>3</sup>が3-ピリジルR<sup>6</sup>である、請求項1～2のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項4】

R<sup>6</sup>が1つの置換基であり、かつ-(CH<sub>2</sub>)ヘテロシクリルR<sup>8</sup>である、請求項1～3のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項5】

前記R<sup>6</sup>ヘテロシクリルが、アゼチジニルR<sup>8</sup>、ピロリジニルR<sup>8</sup>、ピペリジニルR<sup>8</sup>、ピペラジニルR<sup>8</sup>およびモルホリニルR<sup>8</sup>からなる群より独立して選択される、請求項1～4のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項6】

R<sup>5</sup>が3-ピリジルR<sup>7</sup>である、請求項1～5のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項7】

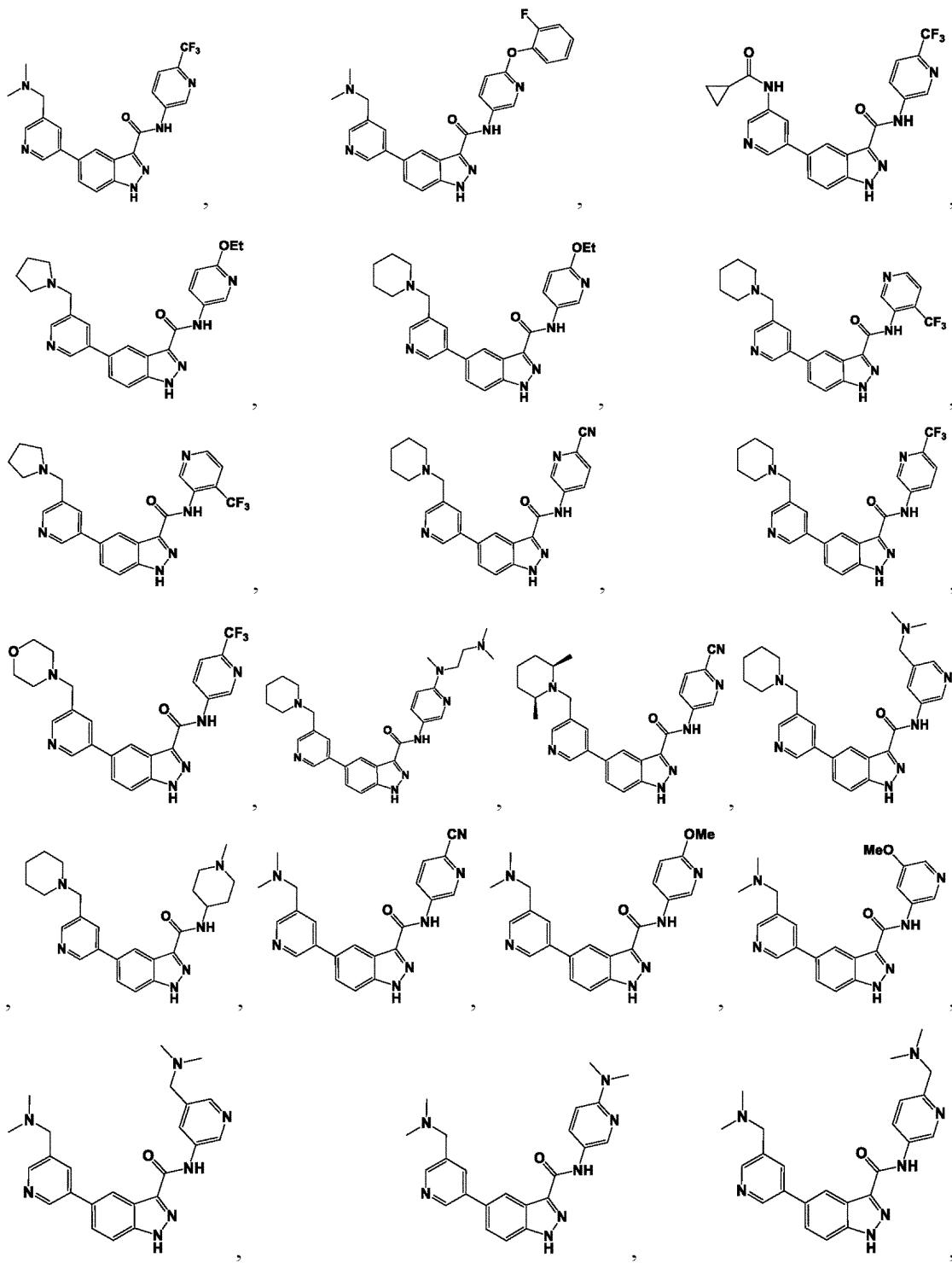
R<sup>7</sup>が1つの置換基であり、かつハロゲン化物、-OCF<sub>3</sub>、-CF<sub>3</sub>、-(C<sub>1～9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>10</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1～9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>10</sup>)SO<sub>2</sub>R<sup>11</sup>および-N(R<sup>10</sup>)C(=O)R<sup>11</sup>からなる群より選択される、請求項1～6のいずれか一項記載の薬学的組成物。

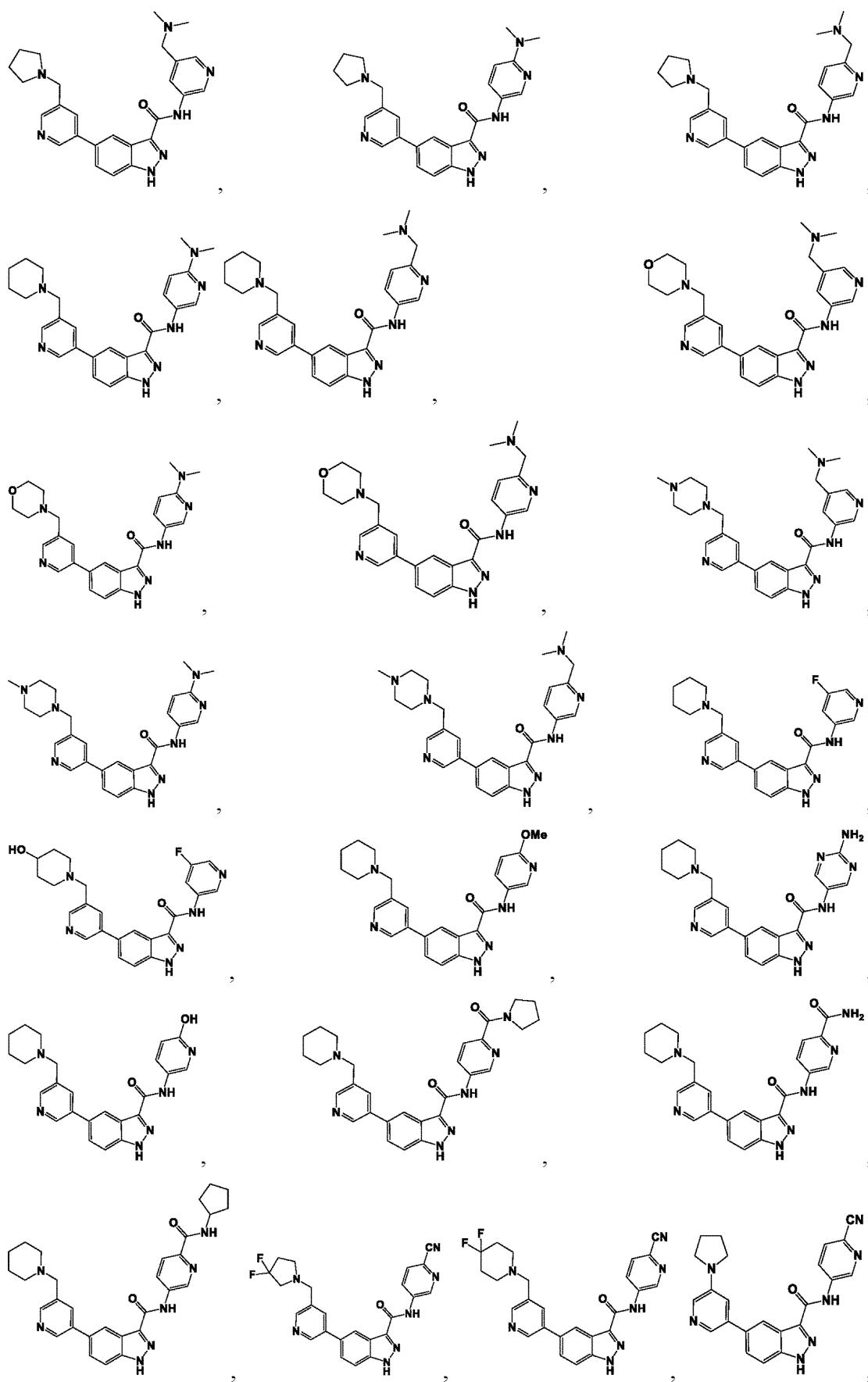
【請求項8】

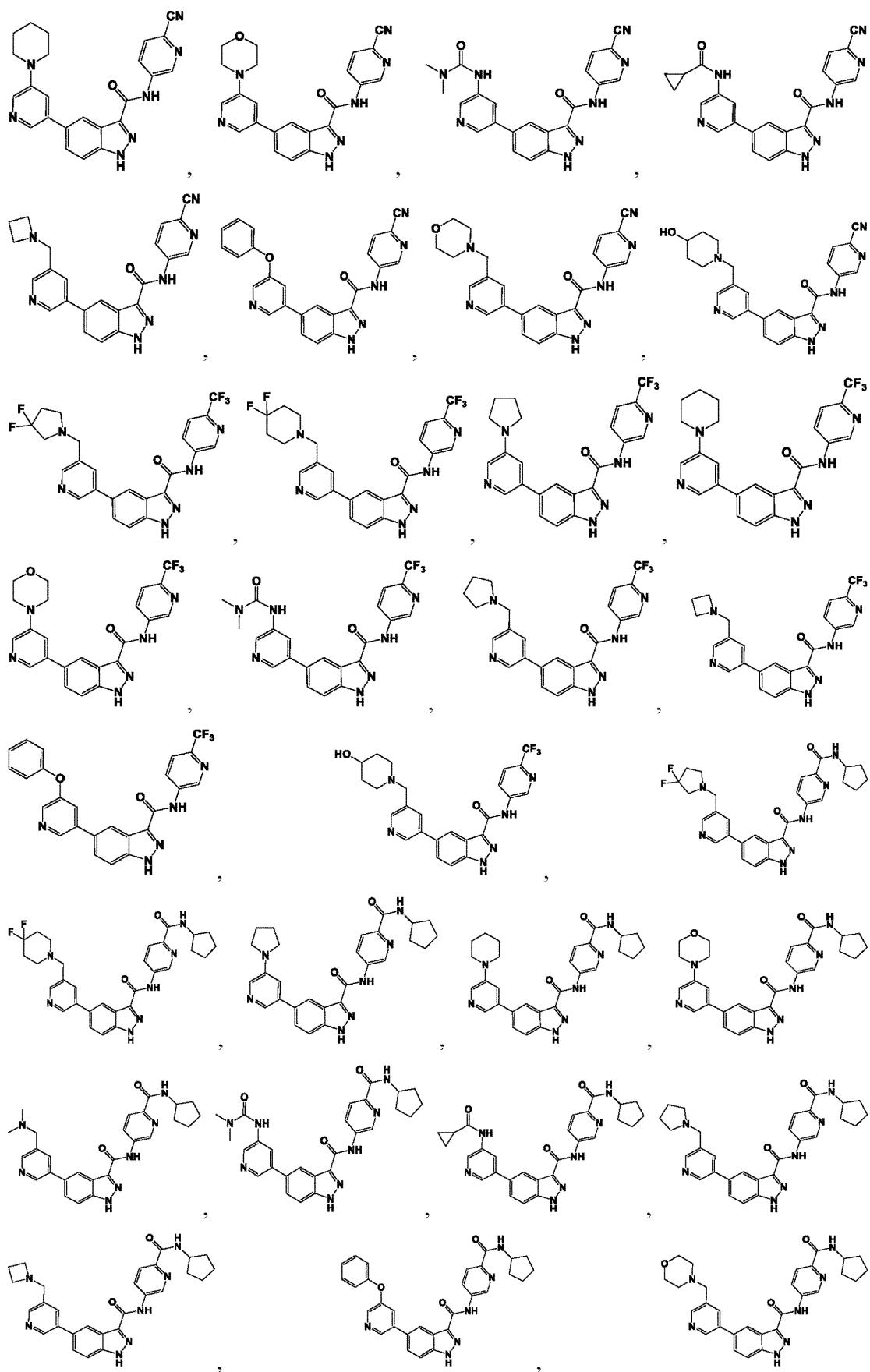
R<sup>7</sup>が1つの置換基であり、かつ-OR<sup>10</sup>および-C(=O)R<sup>11</sup>からなる群より選択され、式中、R<sup>11</sup>は-N(R<sup>10</sup>)<sub>2</sub>であり、各R<sup>10</sup>は、H、メチルおよび-(C<sub>1～9</sub>アルキル)<sub>n</sub>カルボシクリルR<sup>8</sup>からなる群より独立して選択され、式中、nは0であり、各R<sup>8</sup>は、Hまたはハロゲン化物から独立して選択される1～2つの置換基である、請求項1～7のいずれか一項記載の薬学的組成物。

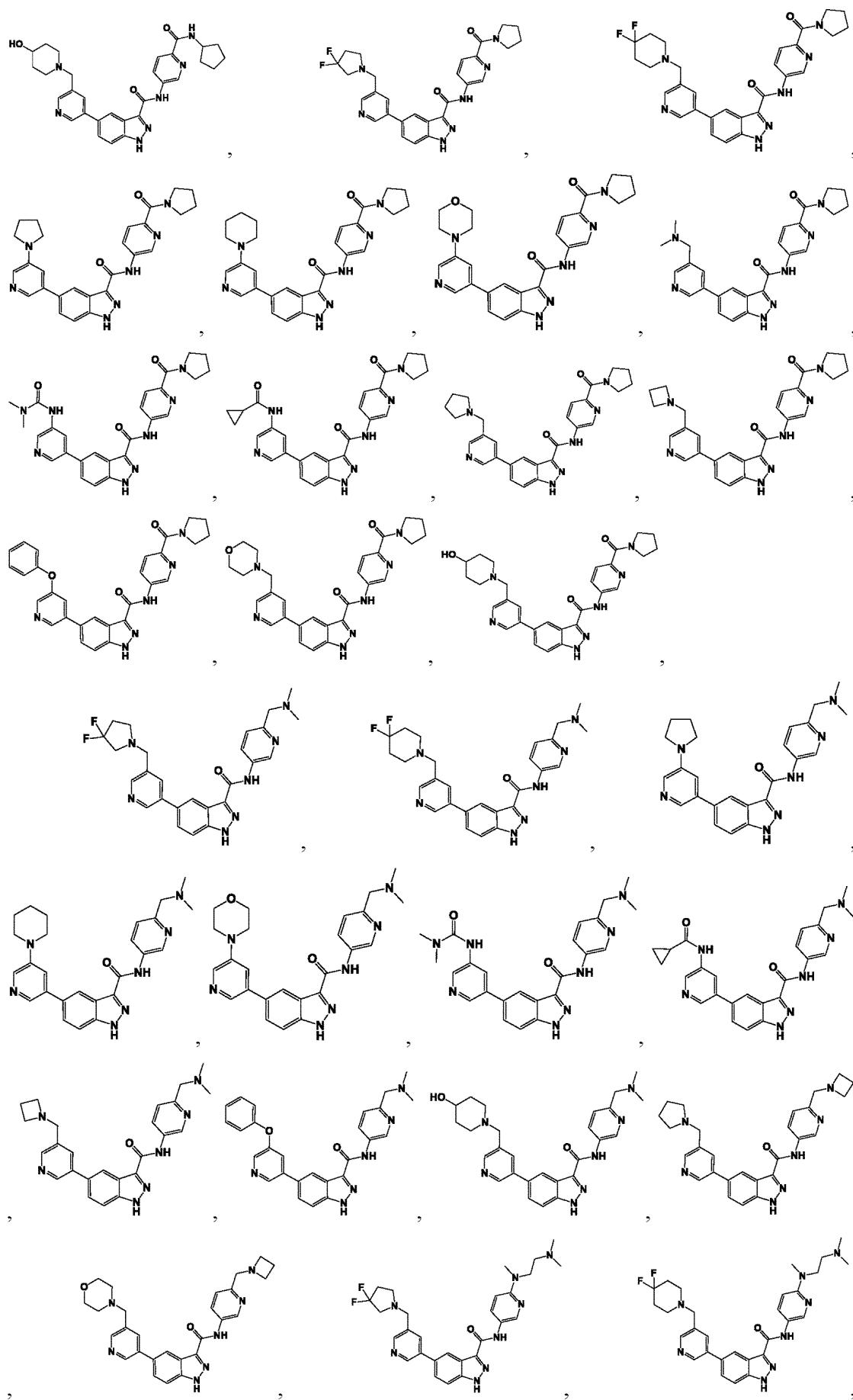
【請求項9】

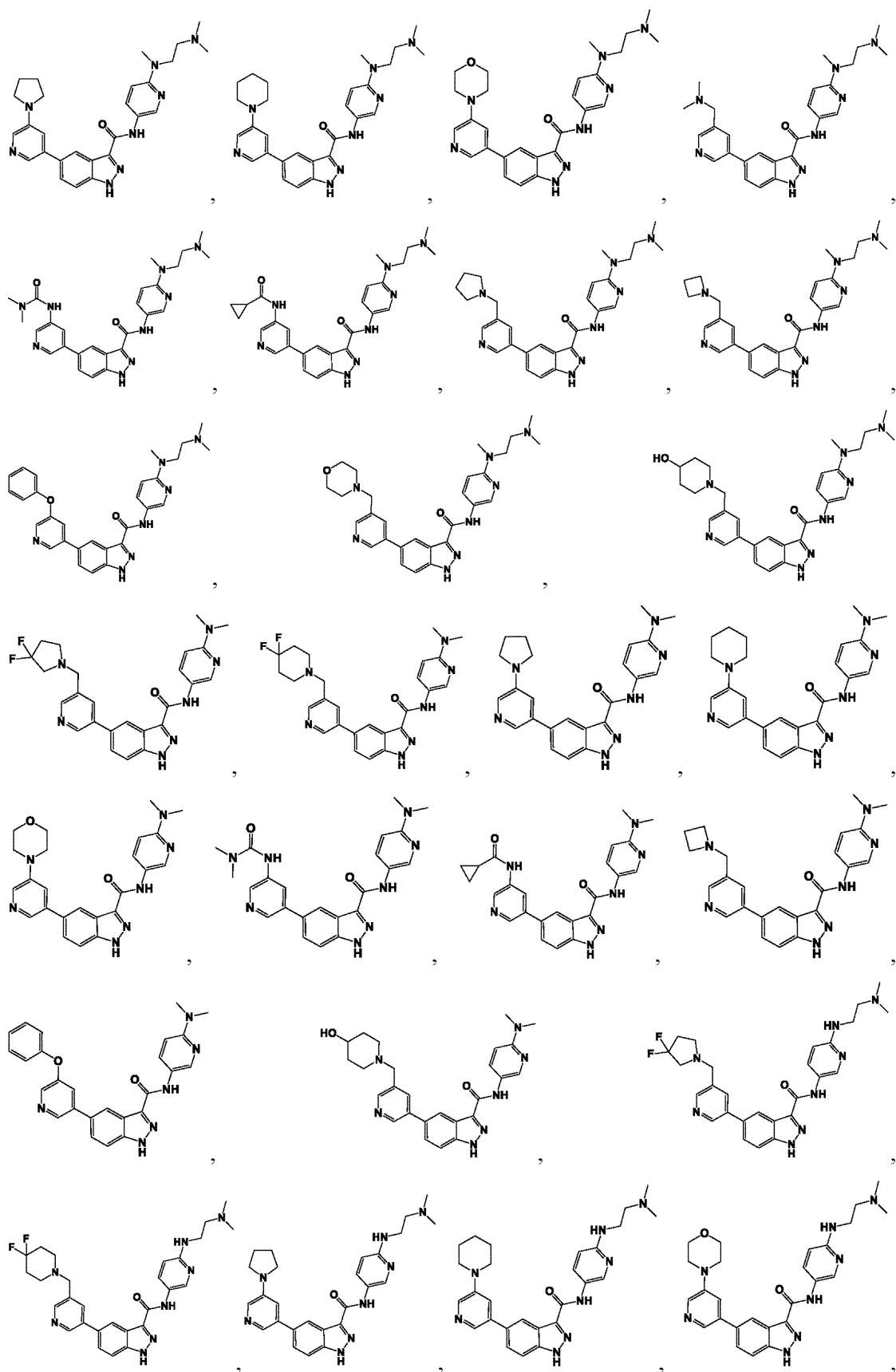
前記化合物が、

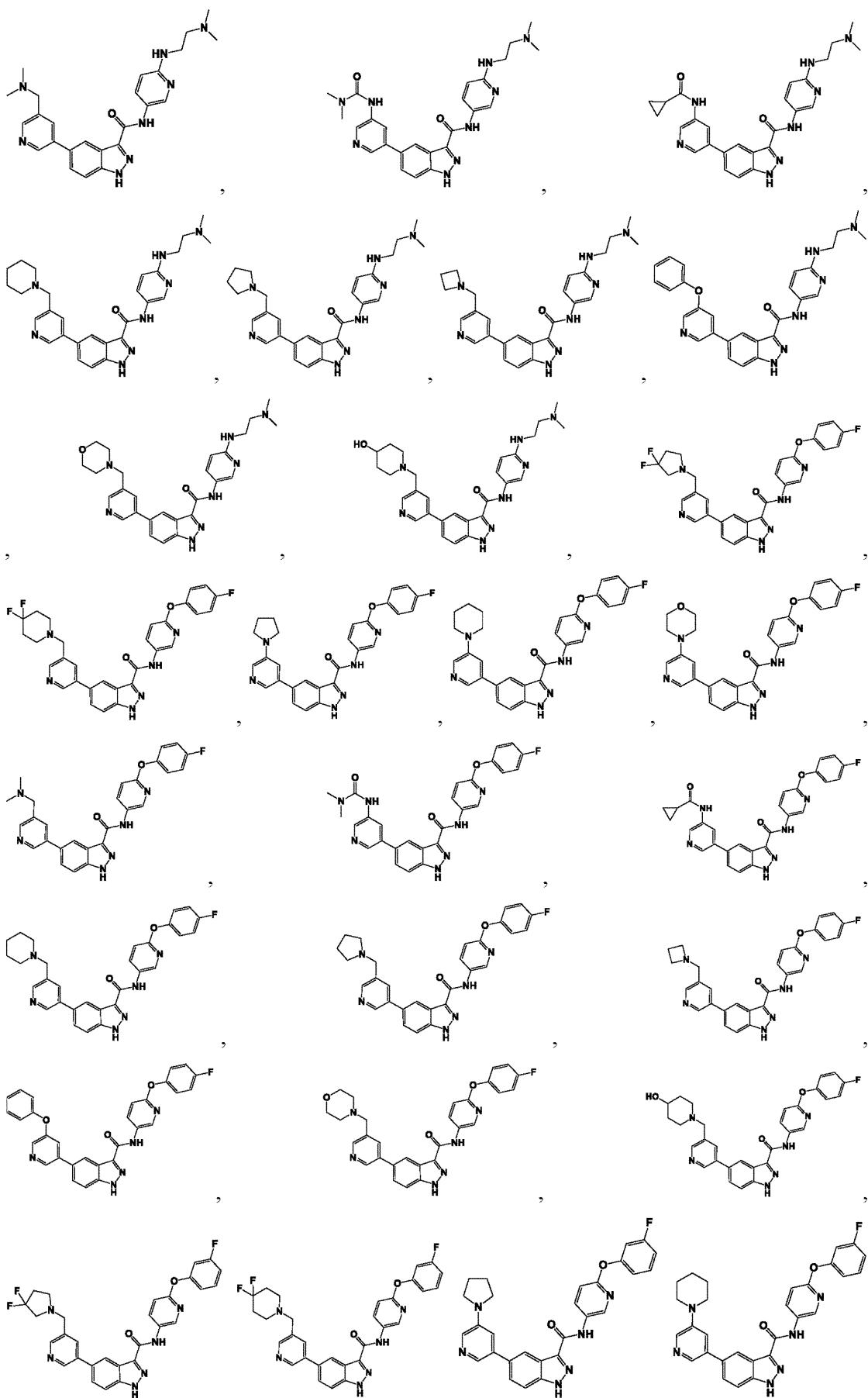


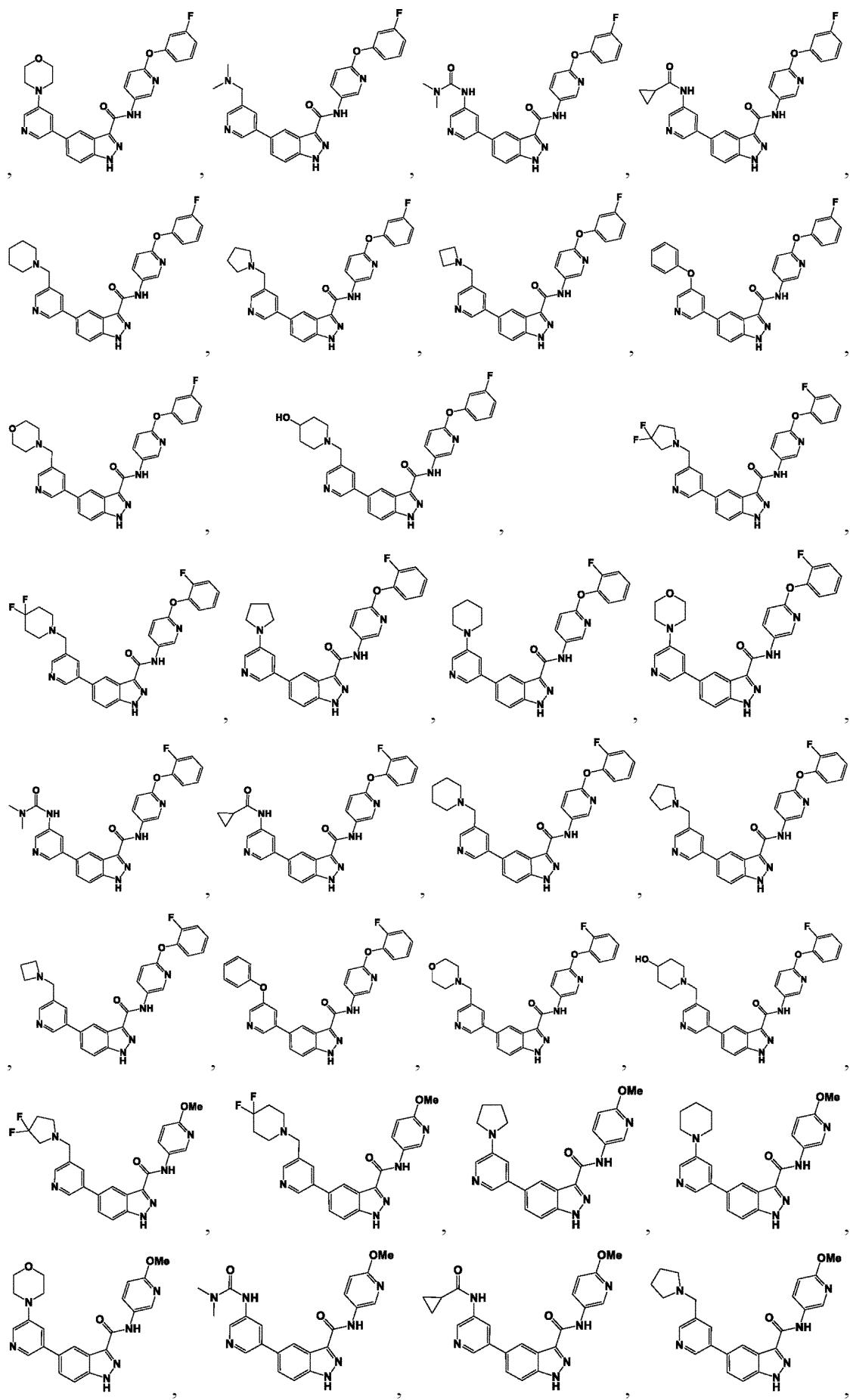


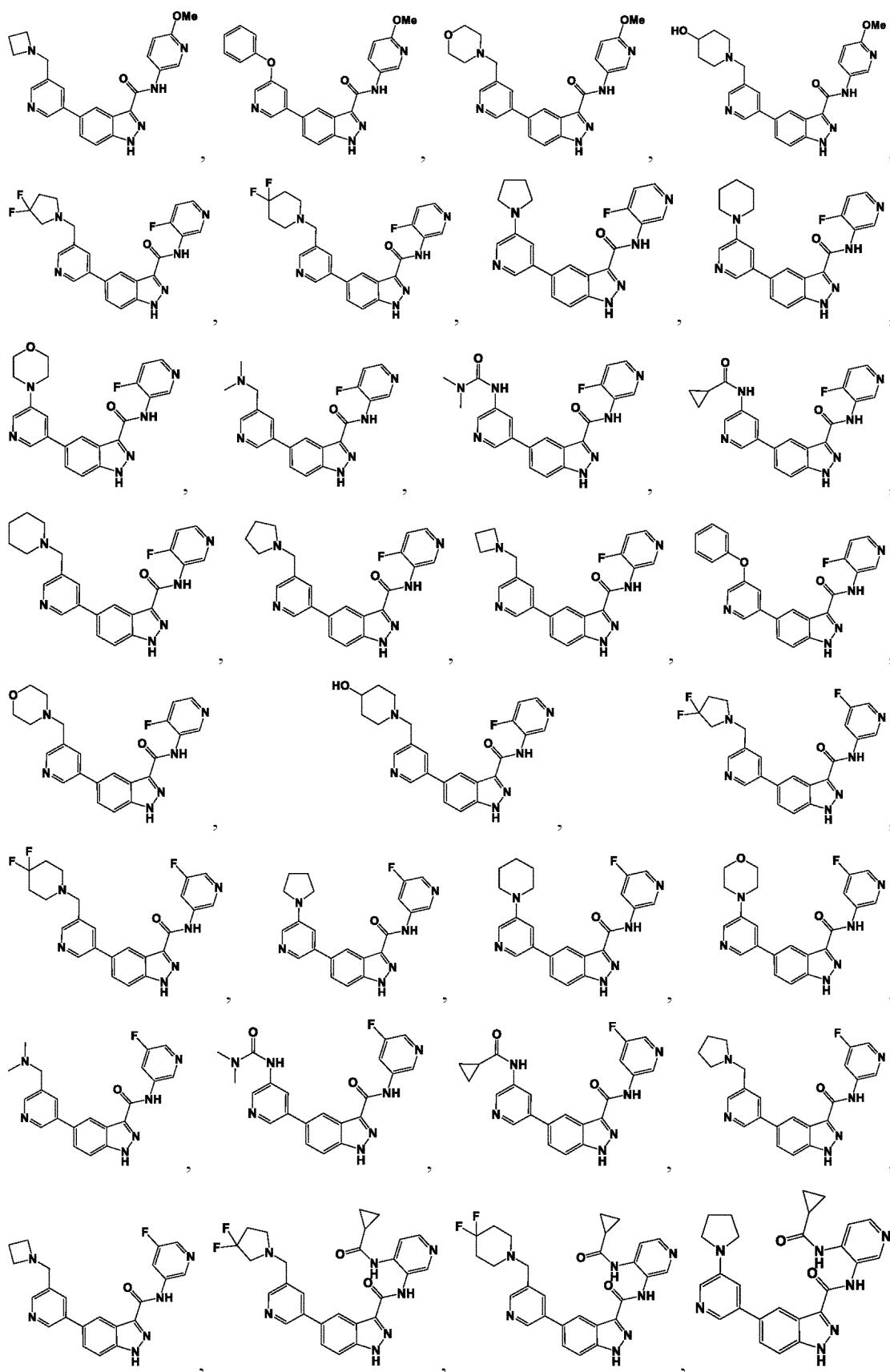


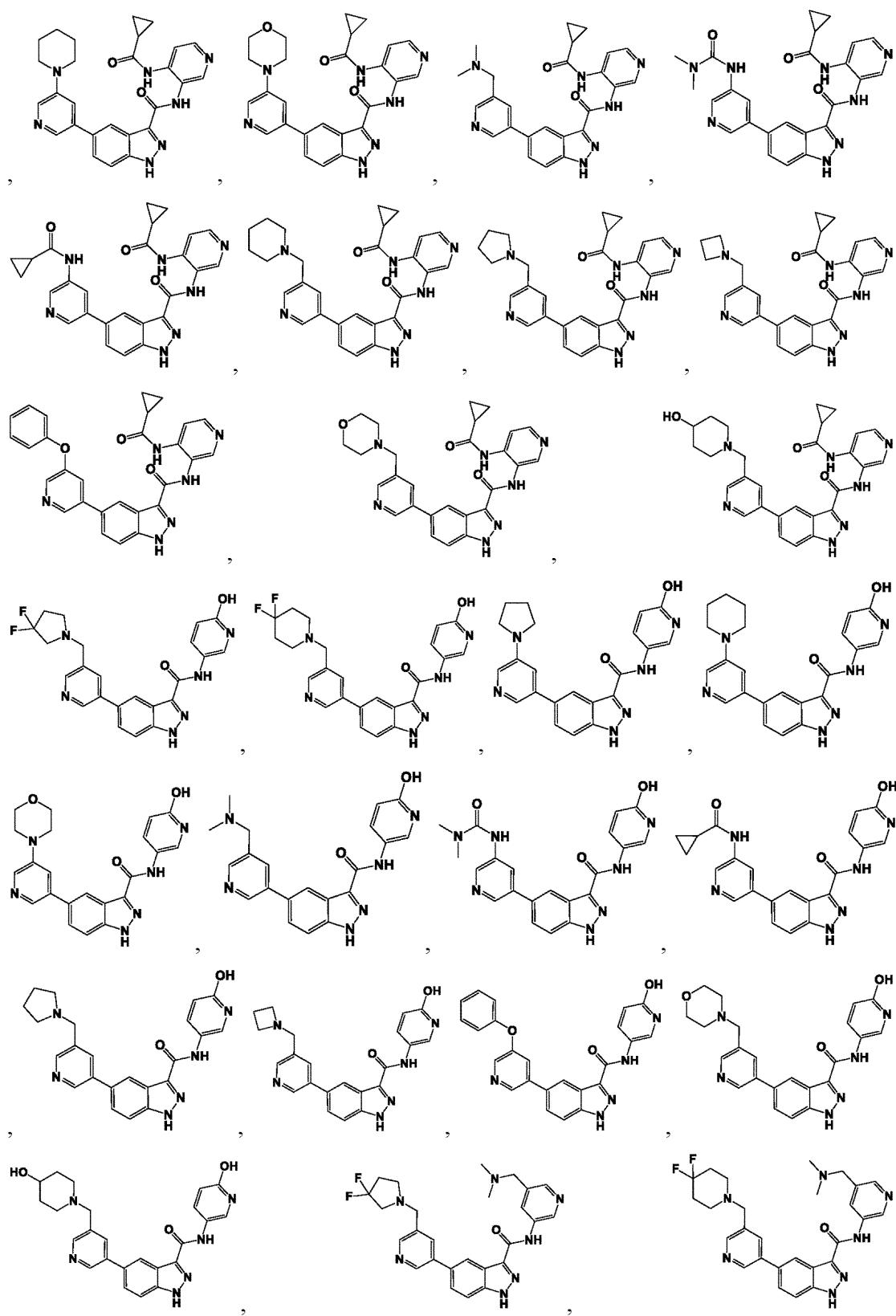


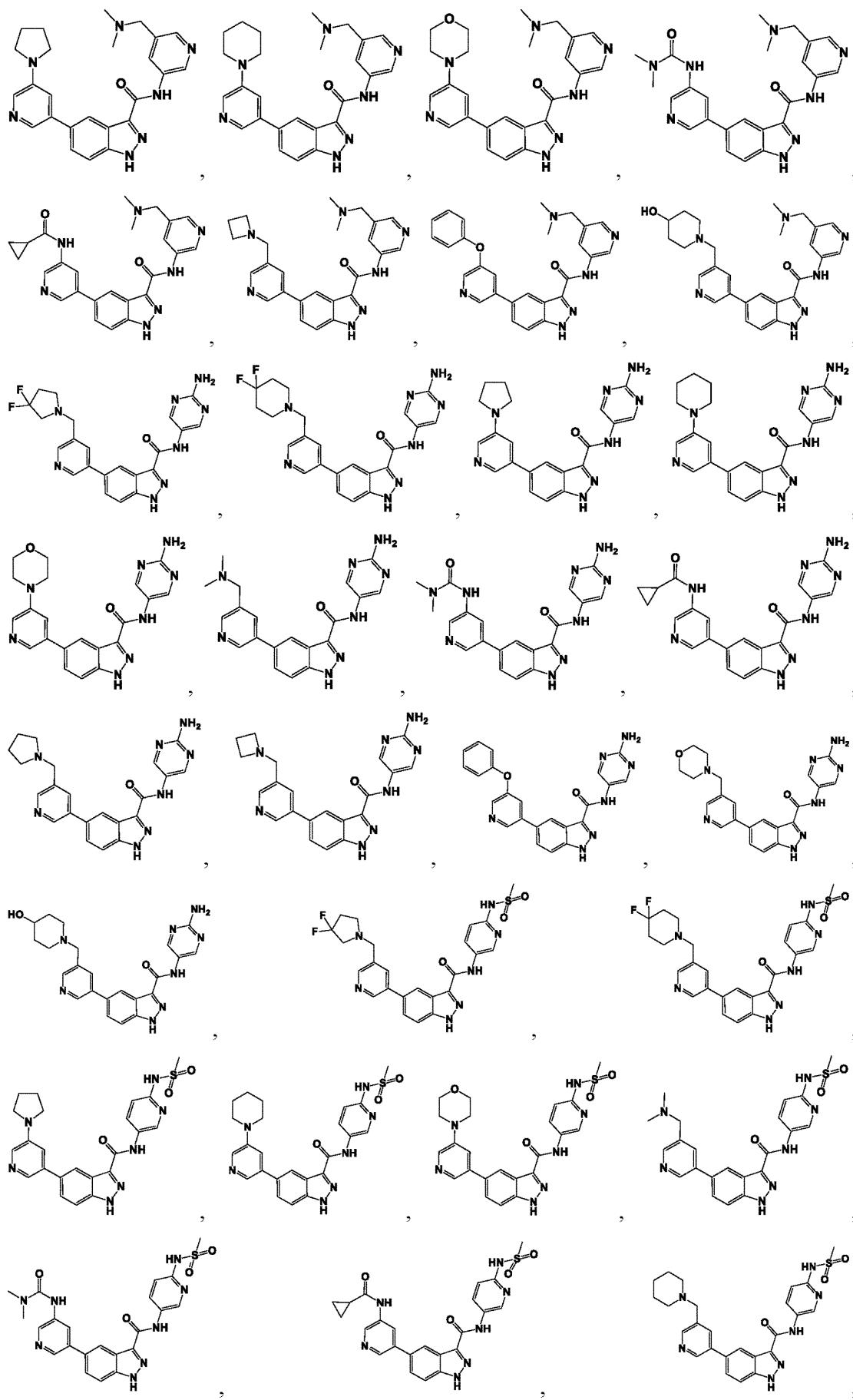


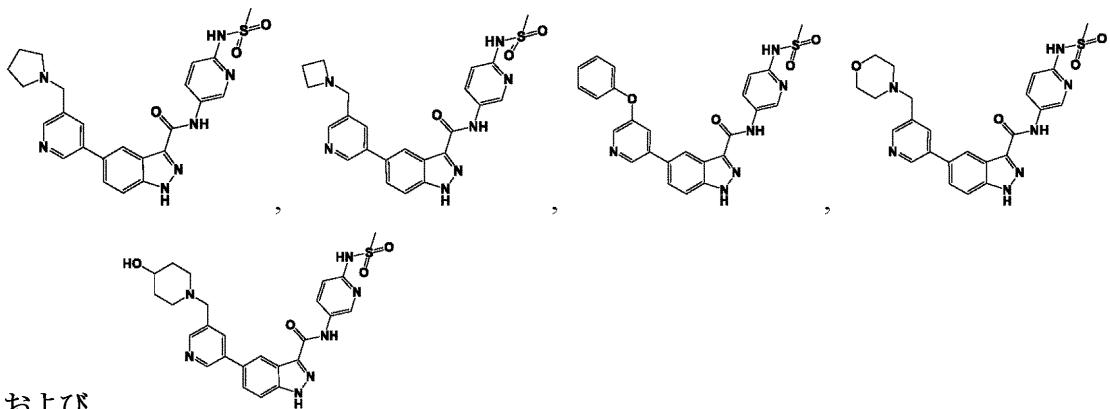










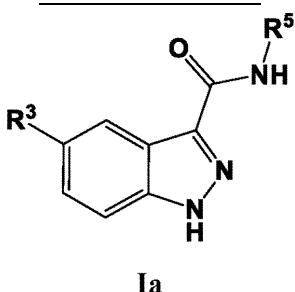


および

からなる群より選択される構造またはその薬学的に許容される塩を有する、請求項1記載の薬学的組成物。

**【請求項 10】**

対象における疾患または状態を治療するための薬学的組成物であって、式Ia:



Ia

の構造を有する化合物またはその薬学的に許容される塩を含み、該疾患または状態が、腱障害、皮膚炎、乾癬、モルフェア、魚鱗癬、レイノー症候群、およびダリエー病より選択され、

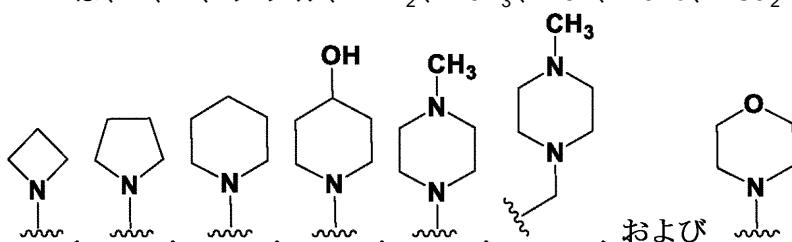
式中、

R<sup>3</sup>は3-ピリジルR<sup>6</sup>であり、

R<sup>5</sup>は、ピリジルR<sup>7</sup>、-ピリミジニルR<sup>7</sup>および-ピリダジニルR<sup>7</sup>からなる群より選択され、

R<sup>6</sup>は-CH<sub>2</sub>ヘテロシクリルR<sup>8</sup>であり、

R<sup>7</sup>は、H、F、メチル、-NH<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、-CN、-OMe、-SO<sub>2</sub>Me、



からなる群よりそれぞれ独立して選択される1~2つの置換基であり、

R<sup>8</sup>は、Hおよびハロゲン化物からなる群よりそれぞれ独立して選択される1~2つの置換基である、

前記薬学的組成物。

**【請求項 11】**

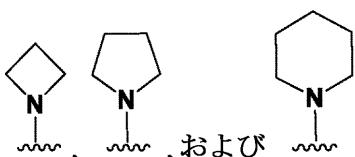
前記R<sup>6</sup>ヘテロシクリルが、アゼチジニルR<sup>8</sup>、ピロリジニルR<sup>8</sup>、ピペリジニルR<sup>8</sup>、ピペラジニルR<sup>8</sup>およびモルホリニルR<sup>8</sup>からなる群より選択される、請求項10記載の薬学的組成物。

**【請求項 12】**

R<sup>6</sup>が-CH<sub>2</sub>-ピペリジニルR<sup>8</sup>である、請求項10~11のいずれか一項記載の薬学的組成物。

**【請求項 13】**

R<sup>7</sup>が、H、-CF<sub>3</sub>、-OMe、-CN、



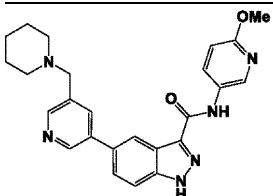
からなる群より選択される、請求項10～12のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項14】

R<sup>8</sup>がHである、請求項10～13のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項15】

対象における選択される疾患または状態を治療するための薬学的組成物であって、該疾患または状態が、腱障害、皮膚炎、乾癬、モルフェア、魚鱗癬、レイノー症候群、およびダリエー病より選択され、



の構造を有する化合物またはその薬学的に許容される塩を含む、前記薬学的組成物。

【請求項16】

前記疾患または状態が腱障害である、請求項1～15のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項17】

前記腱障害が腱症である、請求項16記載の薬学的組成物。

【請求項18】

前記腱障害が腱炎である、請求項16記載の薬学的組成物。

【請求項19】

前記腱障害が腱鞘炎である、請求項16記載の薬学的組成物。

【請求項20】

前記疾患または状態が皮膚炎である、請求項1～15のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【請求項21】

前記皮膚炎が接触性皮膚炎である、請求項20記載の薬学的組成物。

【請求項22】

前記皮膚炎がアトピー性皮膚炎である、請求項20記載の薬学的組成物。

【請求項23】

前記疾患または状態が乾癬である、請求項1～15のいずれか一項記載の薬学的組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0018

【補正方法】変更

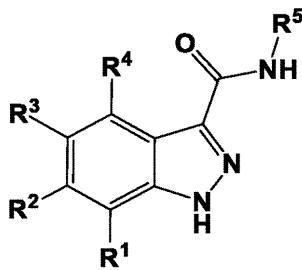
【補正の内容】

【0018】

[本発明1001]

腱障害、皮膚炎、乾癬、モルフェア、魚鱗癬、レイノー症候群およびダリエー病からなる群より独立して選択される1つまたは複数の疾患または状態の治療方法であって、

前記方法が、式1：



の構造を有する化合物またはその薬学的に許容される塩を対象（例えば、前記方法を必要とする対象）に投与する工程を含み、

式中、

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>およびR<sup>4</sup>は、H、C<sub>1-9</sub>アルキル、ハロゲン化物、-N(R<sup>10</sup>)<sub>2</sub>、-XR<sup>10</sup>、CN、-OCF<sub>3</sub>および-CF<sub>3</sub>からなる群より独立して選択され、

R<sup>3</sup>は、カルボシクリルR<sup>6</sup>、ヘテロシクリルR<sup>6</sup>、アリールR<sup>6</sup>およびヘテロアリールR<sup>6</sup>からなる群より選択され、

R<sup>5</sup>は、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>カルボシクリルR<sup>7</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロシクリルR<sup>7</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>アリールR<sup>7</sup>および-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロアリールR<sup>7</sup>からなる群より選択され、

各R<sup>6</sup>は、H、C<sub>1-9</sub>アルキル、ハロゲン化物、アミノ、-OCF<sub>3</sub>、-CF<sub>3</sub>、-CN、-XR<sup>10</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>カルボシクリルR<sup>8</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロシクリルR<sup>8</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>アリールR<sup>8</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロアリールR<sup>8</sup>、-C(=O)R<sup>11</sup>、-N(R<sup>10</sup>)C(=O)R<sup>11</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>10</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>10</sup>)SO<sub>2</sub>R<sup>11</sup>および-SO<sub>2</sub>R<sup>11</sup>からなる群よりそれぞれ選択される1~5つの置換基であり、

各R<sup>7</sup>は、H、C<sub>1-9</sub>アルキル、ハロゲン化物、アミノ、-OCF<sub>3</sub>、-CF<sub>3</sub>、-CN、-XR<sup>10</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>カルボシクリルR<sup>9</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロシクリルR<sup>9</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>アリールR<sup>9</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロアリールR<sup>9</sup>、-C(=O)R<sup>11</sup>、-N(R<sup>10</sup>)C(=O)R<sup>11</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>10</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>10</sup>)SO<sub>2</sub>R<sup>11</sup>および-SO<sub>2</sub>R<sup>11</sup>からなる群よりそれぞれ選択される1~5つの置換基であり、

各R<sup>8</sup>は、H、C<sub>1-3</sub>アルキル、ハロゲン化物、アミノ、OCF<sub>3</sub>、-CF<sub>3</sub>-CN、-XR<sup>12</sup>、-C(=O)R<sup>13</sup>、-N(R<sup>12</sup>)C(=O)R<sup>13</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>12</sup>)SO<sub>2</sub>R<sup>13</sup>および-SO<sub>2</sub>R<sup>13</sup>からなる群よりそれぞれ選択される1~5つの置換基であり、

各R<sup>9</sup>は、H、C<sub>1-3</sub>アルキル、ハロゲン化物、アミノ、-OCF<sub>3</sub>、-CF<sub>3</sub>-CN、-XR<sup>12</sup>、-C(=O)R<sup>13</sup>、-N(R<sup>12</sup>)C(=O)R<sup>13</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>12</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>12</sup>)SO<sub>2</sub>R<sup>13</sup>および-SO<sub>2</sub>R<sup>13</sup>からなる群よりそれぞれ選択される1~5つの置換基であり、

各R<sup>10</sup>は、H、C<sub>1-9</sub>アルキル、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>カルボシクリルR<sup>8</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロシクリルR<sup>8</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>アリールR<sup>8</sup>および-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロアリールR<sup>8</sup>からなる群より独立して選択され、

各R<sup>11</sup>は、C<sub>1-9</sub>アルキル、-N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>カルボシクリルR<sup>8</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロシクリルR<sup>8</sup>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>アリールR<sup>8</sup>および-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロアリールR<sup>8</sup>からなる群より独立して選択され、

各R<sup>12</sup>は、H、C<sub>1-9</sub>アルキル、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>カルボシクリル、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロシクリル、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>アリールおよび-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロアリールからなる群より独立して選択され、

各R<sup>13</sup>は、C<sub>1-9</sub>アルキル、-N(R<sup>14</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>カルボシクリル、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロシクリル、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>アリールおよび-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>ヘテロアリールからなる群より独立して選択され、

各R<sup>14</sup>は、H、C<sub>1-3</sub>アルキル、カルボシクリルおよびアリールからなる群より独立して選択され、

各Xは、結合手、-O-および-S-からなる群より選択され、

各nは0または1である、

前記治療方法。

[本発明1002]

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>およびR<sup>4</sup>がHである、本発明1001の方法。

[本発明1003]

R<sup>3</sup>が3-ピリジルR<sup>6</sup>である、本発明1002の方法。

[本発明1004]

R<sup>3</sup>が5-ピリミジニルR<sup>6</sup>である、本発明1002の方法。

[本発明1005]

R<sup>3</sup>が4-ピリダジニルR<sup>6</sup>である、本発明1002の方法。

[本発明1006]

R<sup>6</sup>が1つの置換基であり、かつ-N(R<sup>9</sup>)C(=O)R<sup>10</sup>である、本発明1003の方法。

[本発明1007]

R<sup>6</sup>が1つの置換基であり、かつ-(CH<sub>2</sub>)ヘテロシクリルR<sup>8</sup>である、本発明1003の方法。

[本発明1008]

前記R<sup>6</sup>ヘテロシクリルが、アゼチジニルR<sup>8</sup>、ピロリジニルR<sup>8</sup>、ピペリジニルR<sup>8</sup>、ピペラジニルR<sup>8</sup>およびモルホリニルR<sup>8</sup>からなる群より独立して選択される、本発明1007の方法。

[本発明1009]

R<sup>5</sup>が3-ピリジルR<sup>7</sup>である、本発明1002の方法。

[本発明1010]

R<sup>5</sup>が3-ピリジルR<sup>7</sup>である、本発明1003の方法。

[本発明1011]

R<sup>5</sup>が5-ピリミジニルR<sup>7</sup>である、本発明1002の方法。

[本発明1012]

R<sup>5</sup>が4-ピリダジニルR<sup>7</sup>である、本発明1002の方法。

[本発明1013]

R<sup>7</sup>が1つの置換基であり、かつハロゲン化物、-OCF<sub>3</sub>、-CF<sub>3</sub>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>10</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>10</sup>)SO<sub>2</sub>R<sup>11</sup>および-N(R<sup>10</sup>)C(=O)R<sup>11</sup>からなる群より選択される、本発明1009の方法。

[本発明1014]

R<sup>7</sup>が1つの置換基であり、かつハロゲン化物、-OCF<sub>3</sub>、-CF<sub>3</sub>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>10</sup>)<sub>2</sub>、-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>N(R<sup>10</sup>)SO<sub>2</sub>R<sup>11</sup>および-N(R<sup>10</sup>)C(=O)R<sup>11</sup>からなる群より選択される、本発明1010の方法。

[本発明1015]

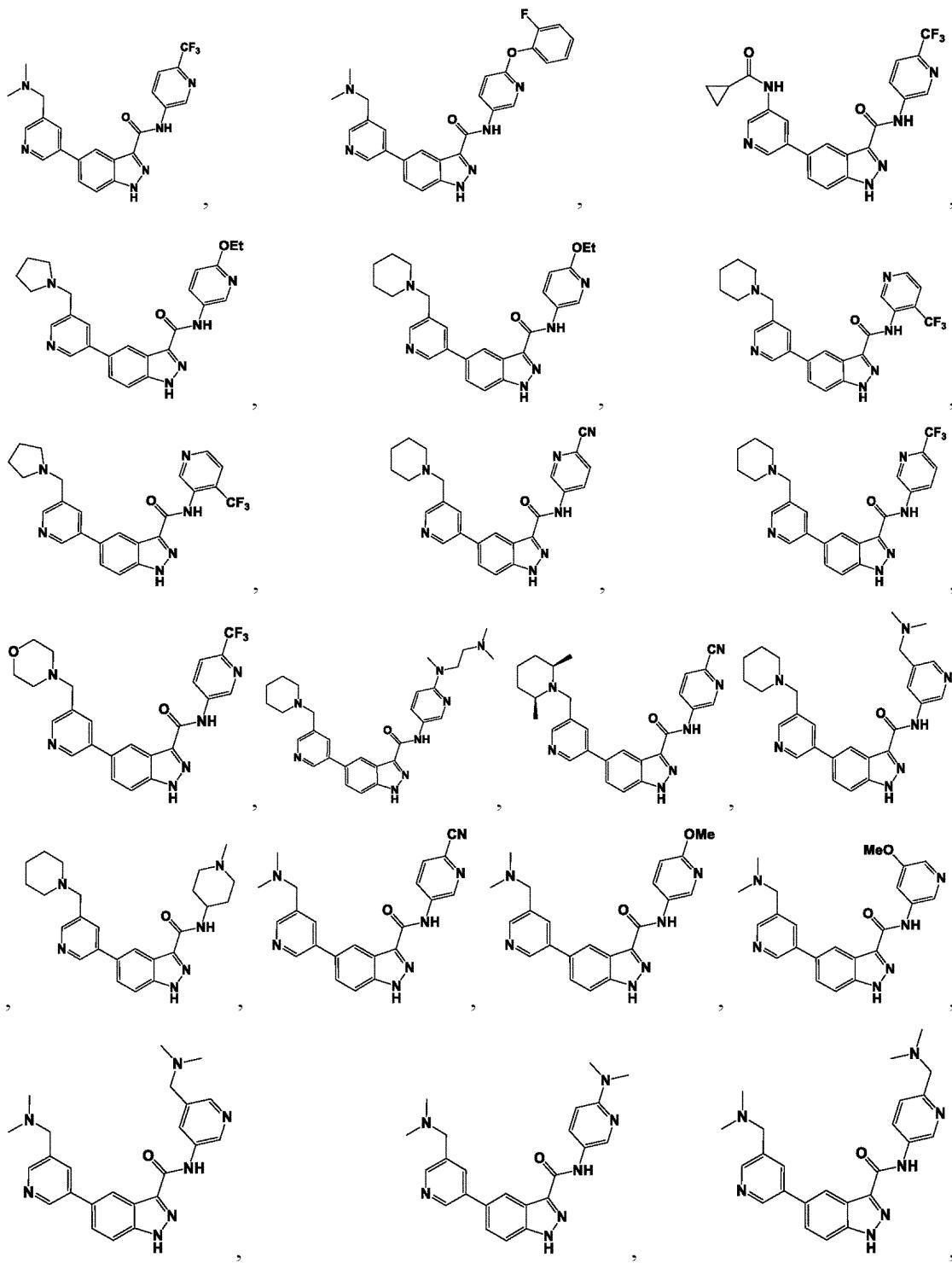
R<sup>7</sup>が1つの置換基であり、かつ-OR<sup>10</sup>および-C(=O)R<sup>11</sup>からなる群より選択され、式中、R<sup>11</sup>は-N(R<sup>10</sup>)<sub>2</sub>であり、各R<sup>10</sup>は、H、メチルおよび-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>カルボシクリルR<sup>8</sup>からなる群より独立して選択され、式中、nは0であり、各R<sup>8</sup>は、Hまたはハロゲン化物から独立して選択される1~2つの置換基である、本発明1009の方法。

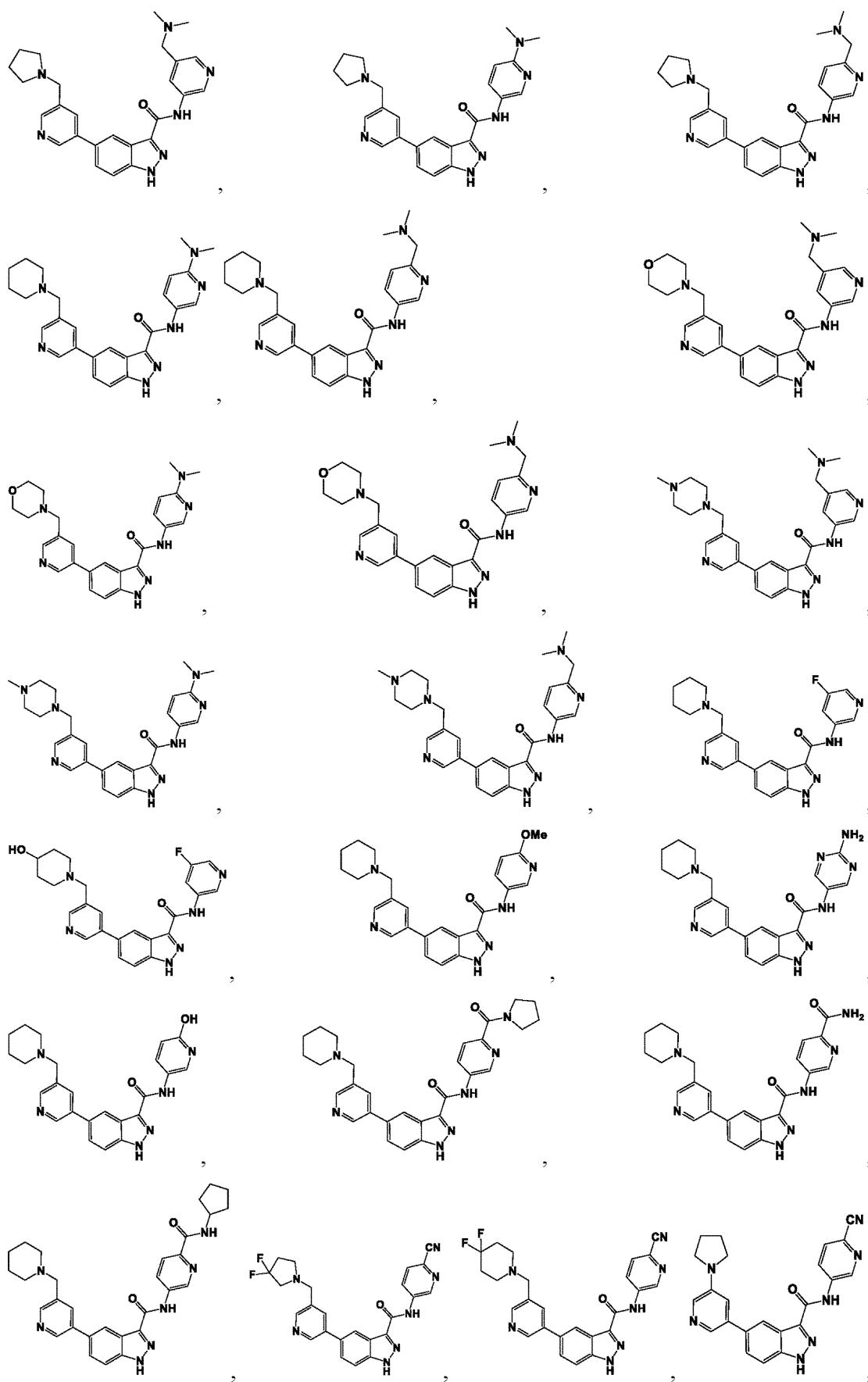
[本発明1016]

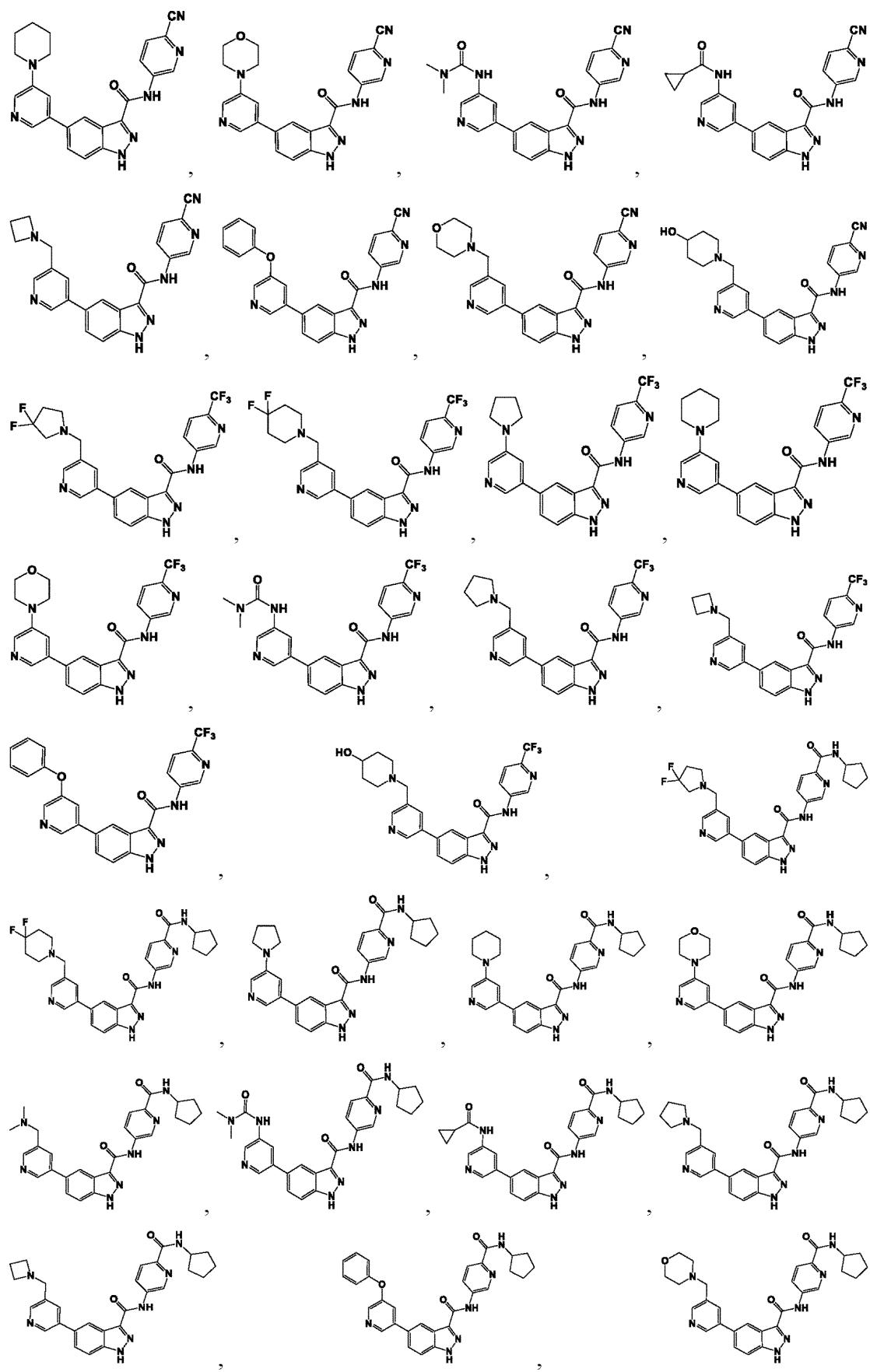
R<sup>7</sup>が1つの置換基であり、かつ-OR<sup>10</sup>および-C(=O)R<sup>11</sup>からなる群より選択され、式中、R<sup>11</sup>は-N(R<sup>10</sup>)<sub>2</sub>であり、各R<sup>10</sup>は、H、メチルおよび-(C<sub>1-9</sub>アルキル)<sub>n</sub>カルボシクリルR<sup>8</sup>からなる群より独立して選択され、式中、nは0であり、各R<sup>8</sup>は、Hまたはハロゲン化物から独立して選択される1~2つの置換基である、本発明1010の方法。

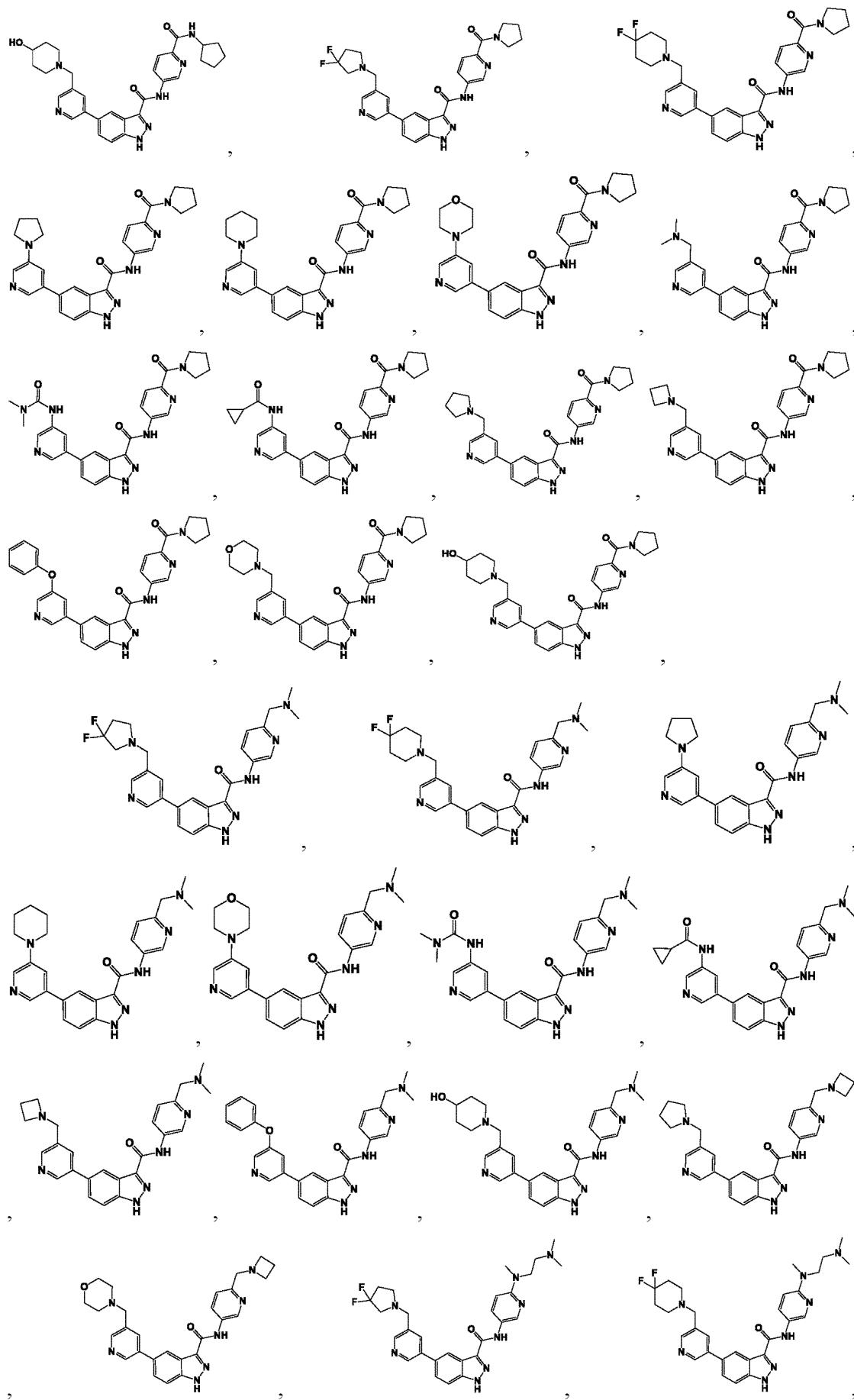
[本発明1017]

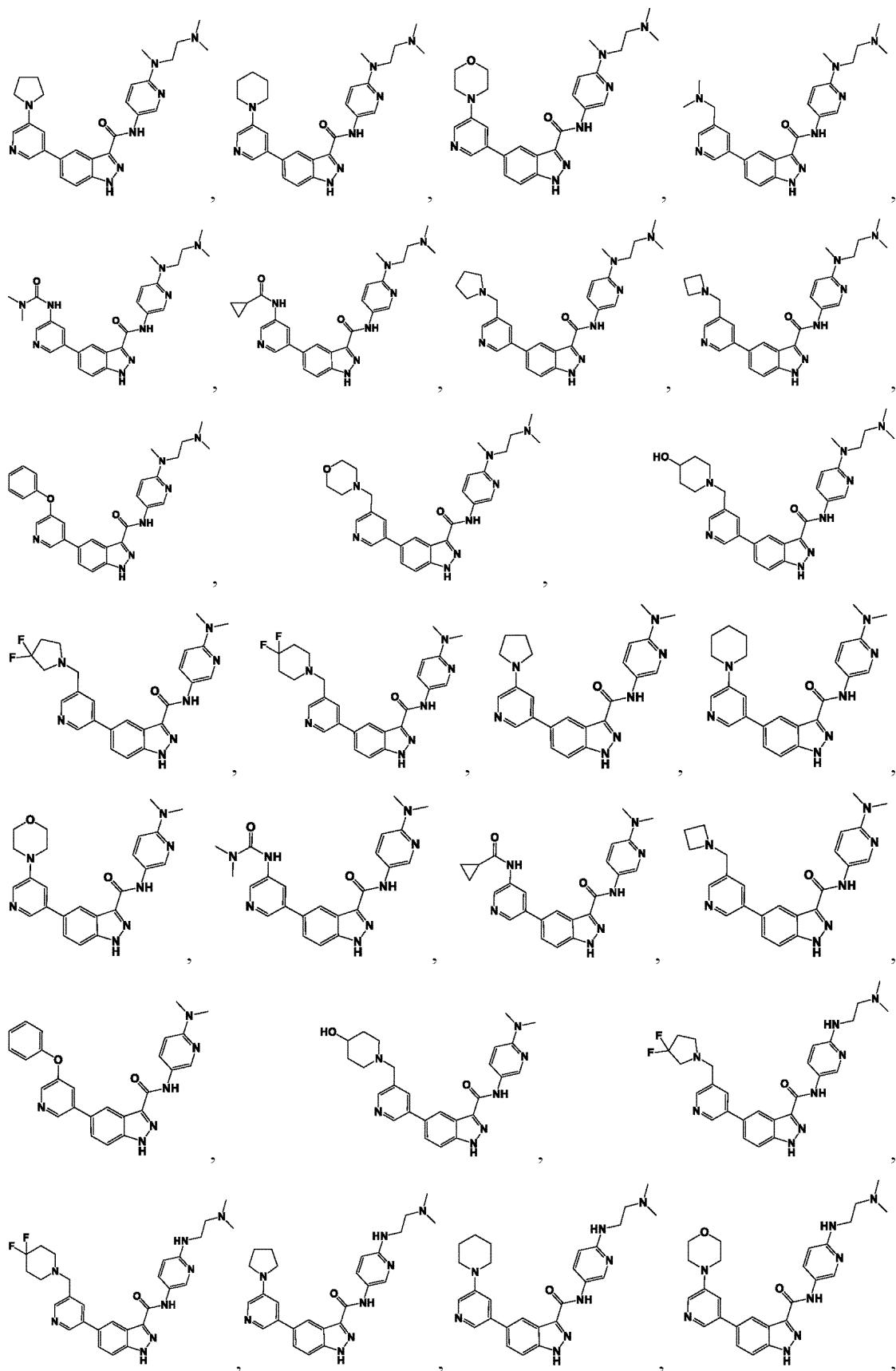
前記化合物が、

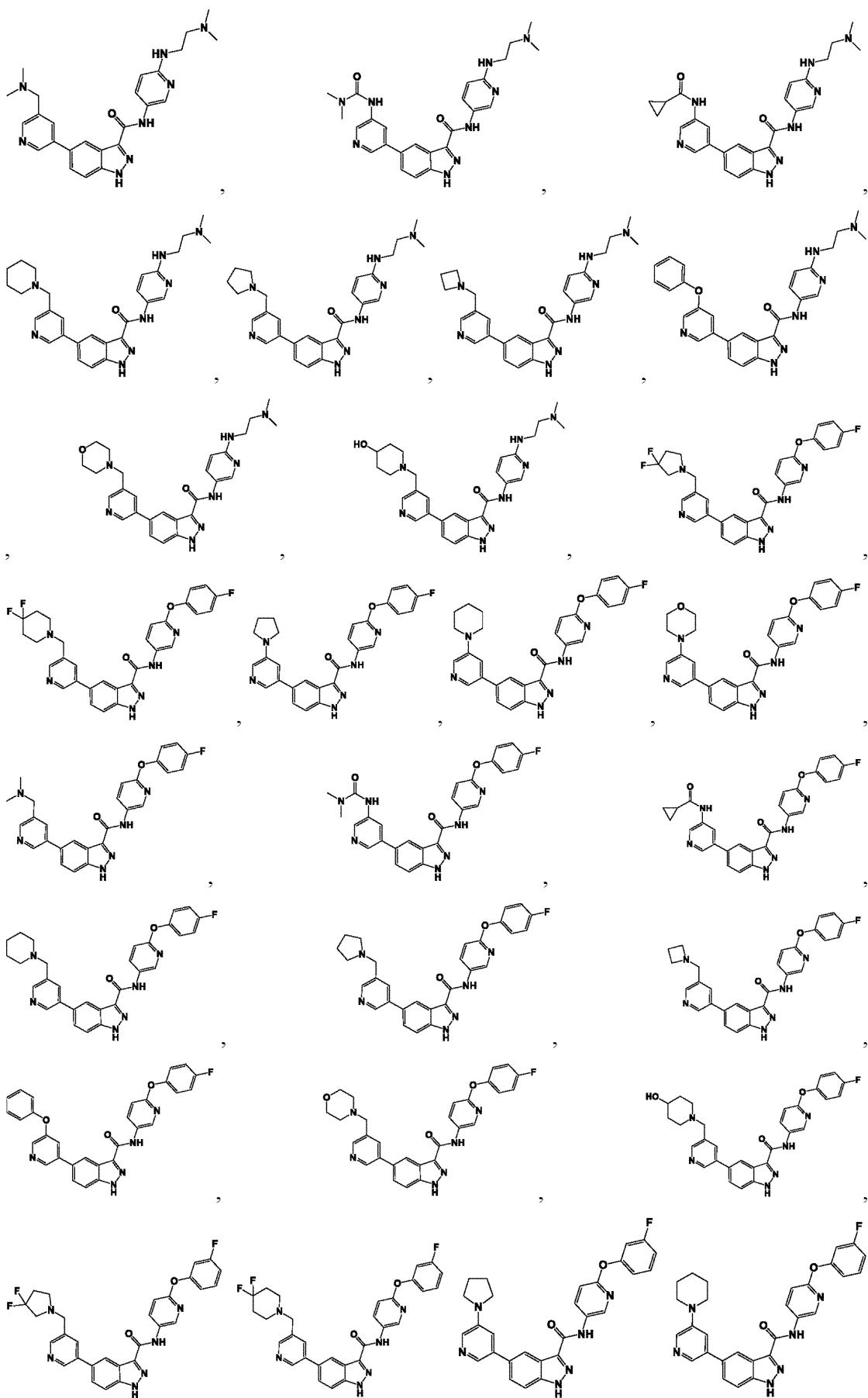


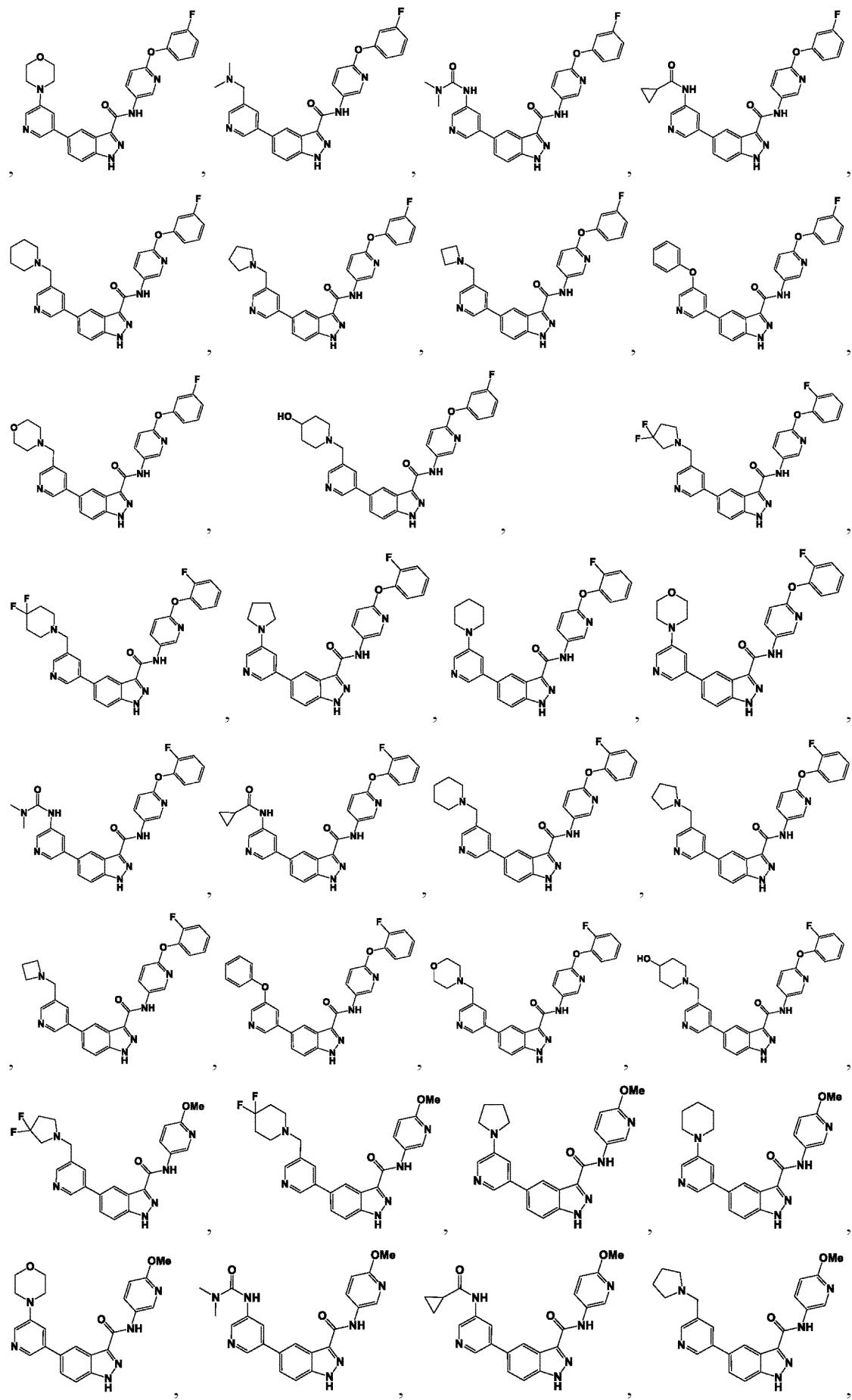


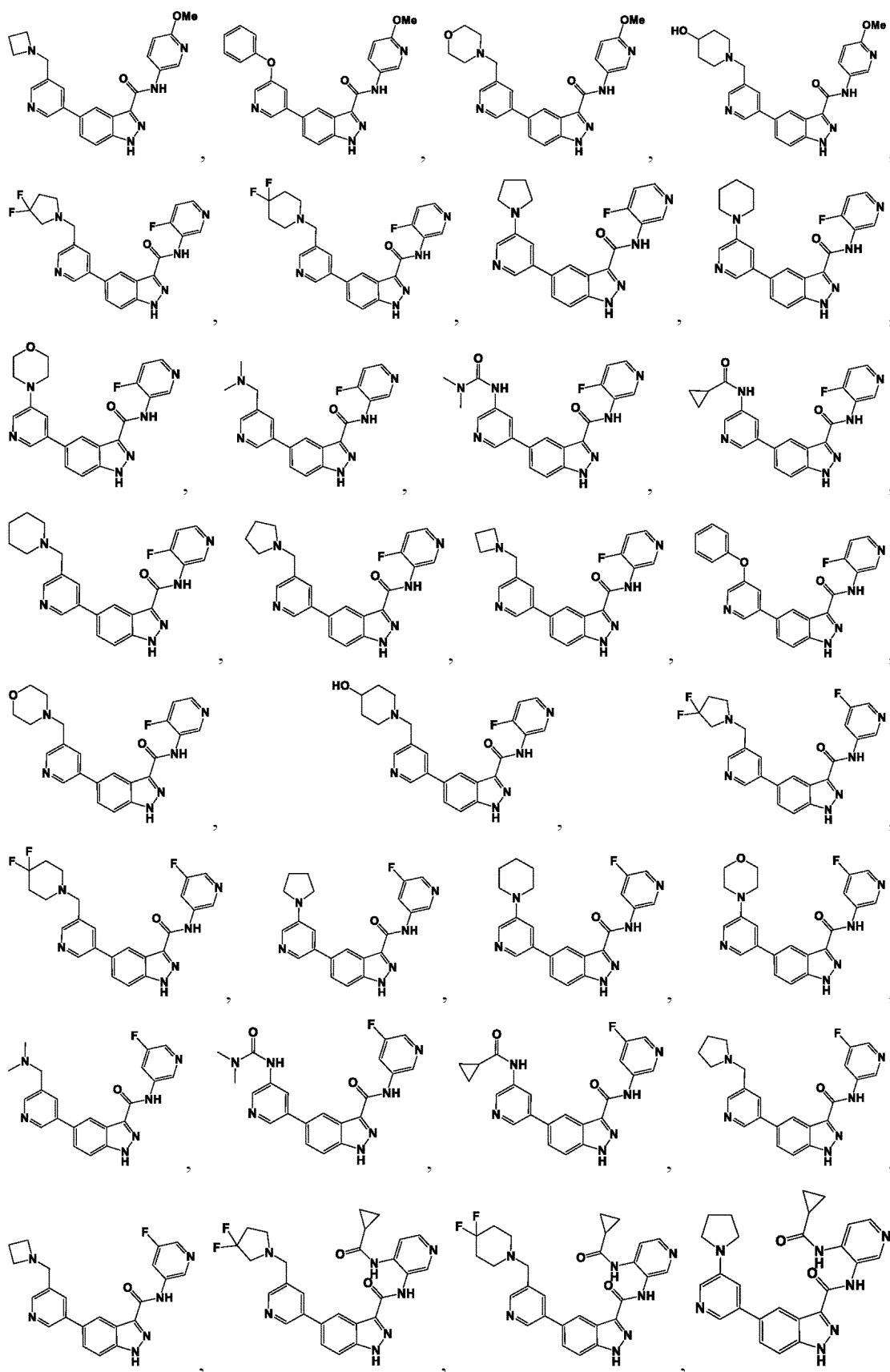


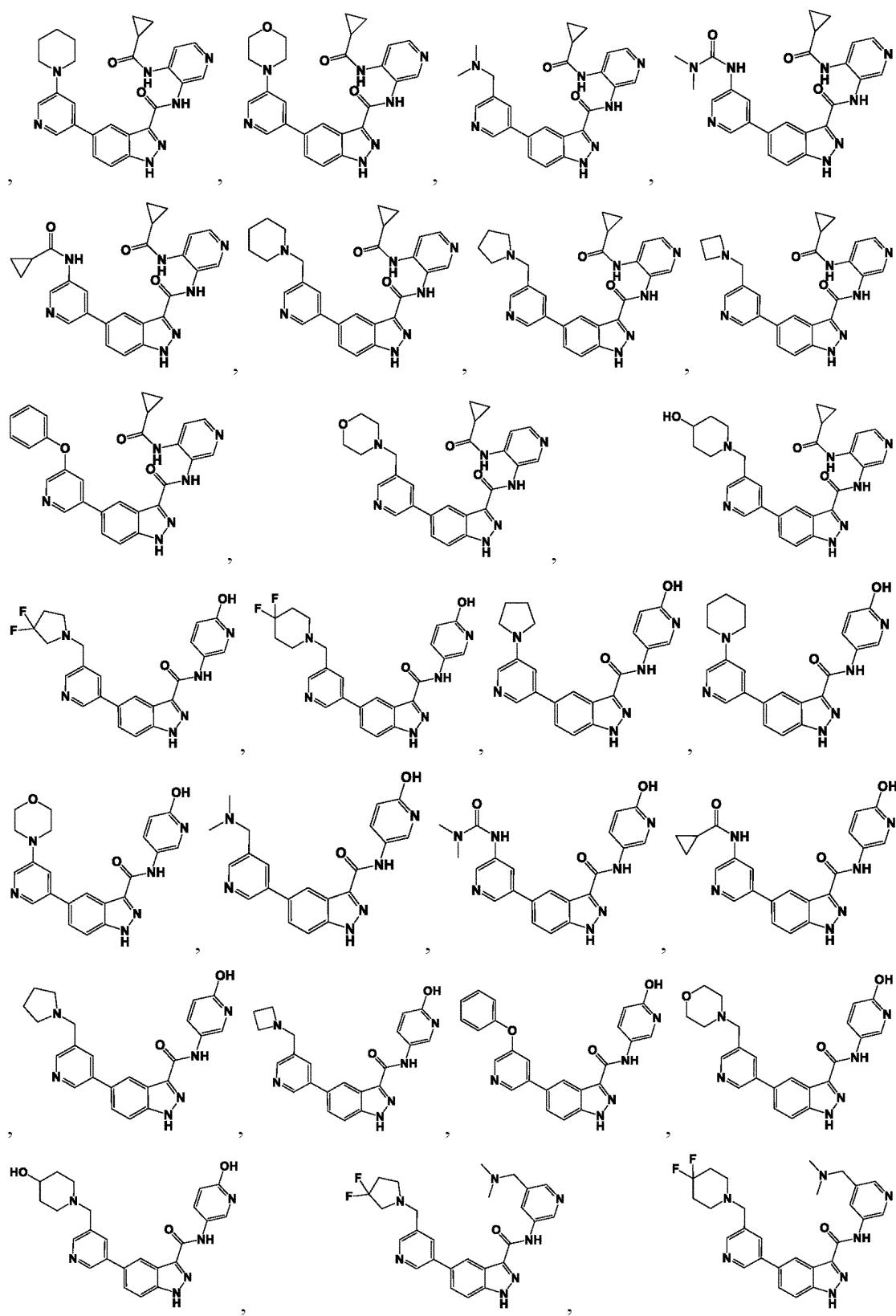


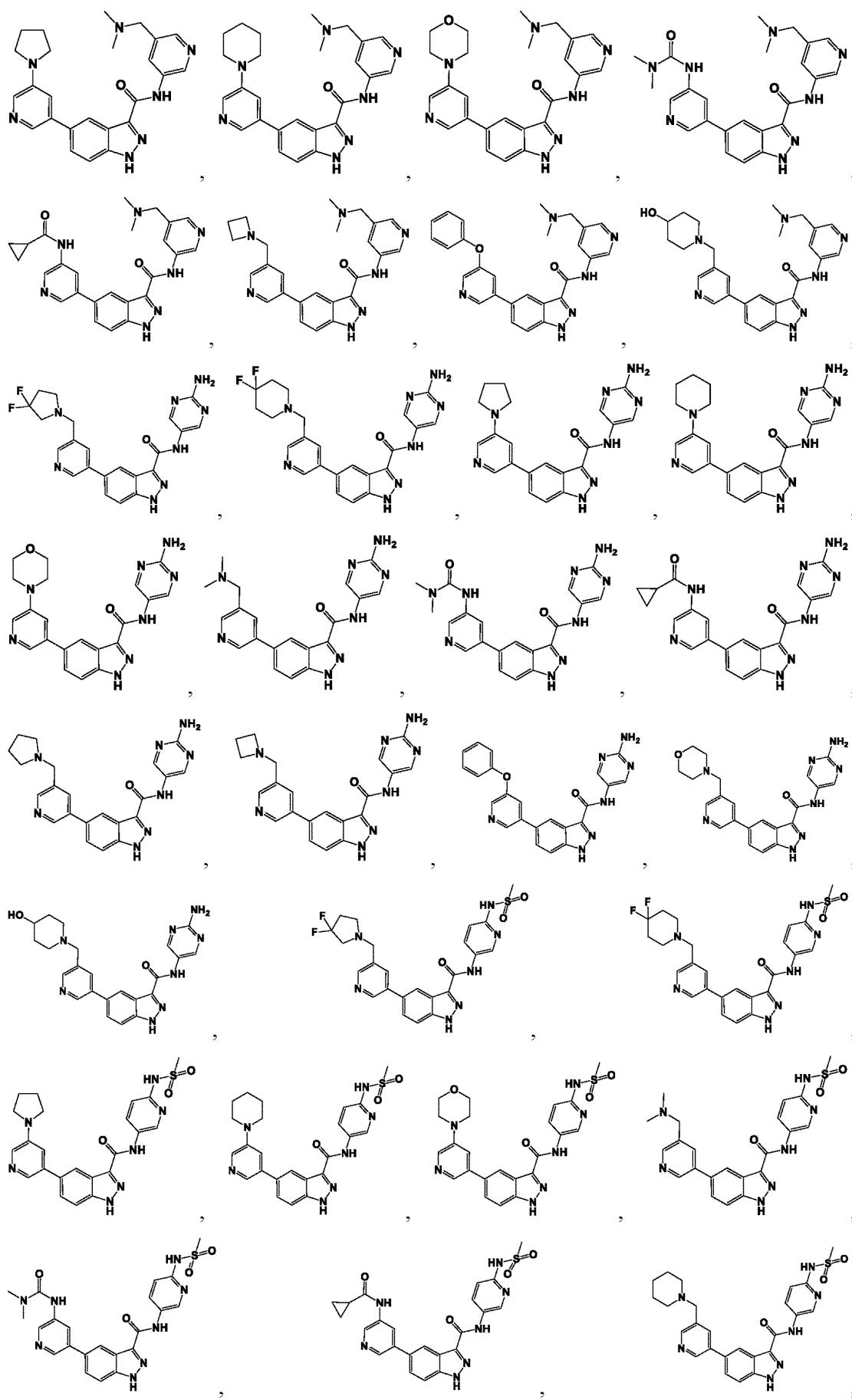


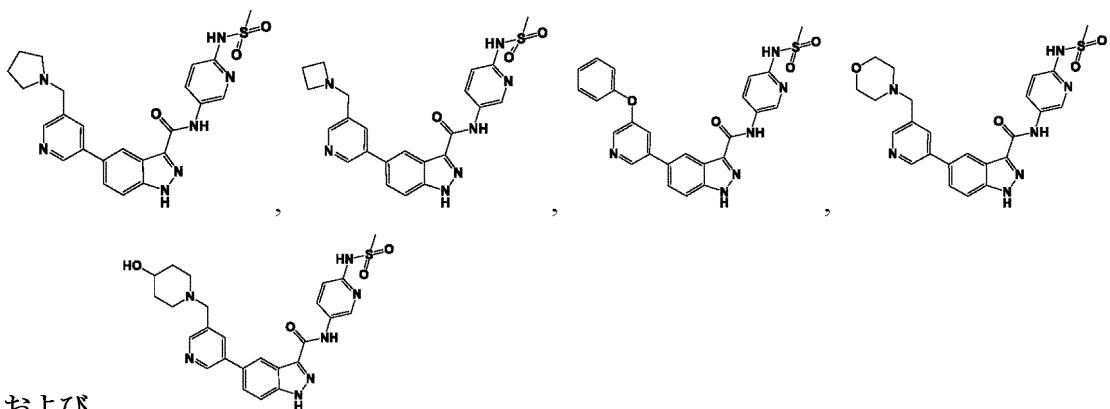










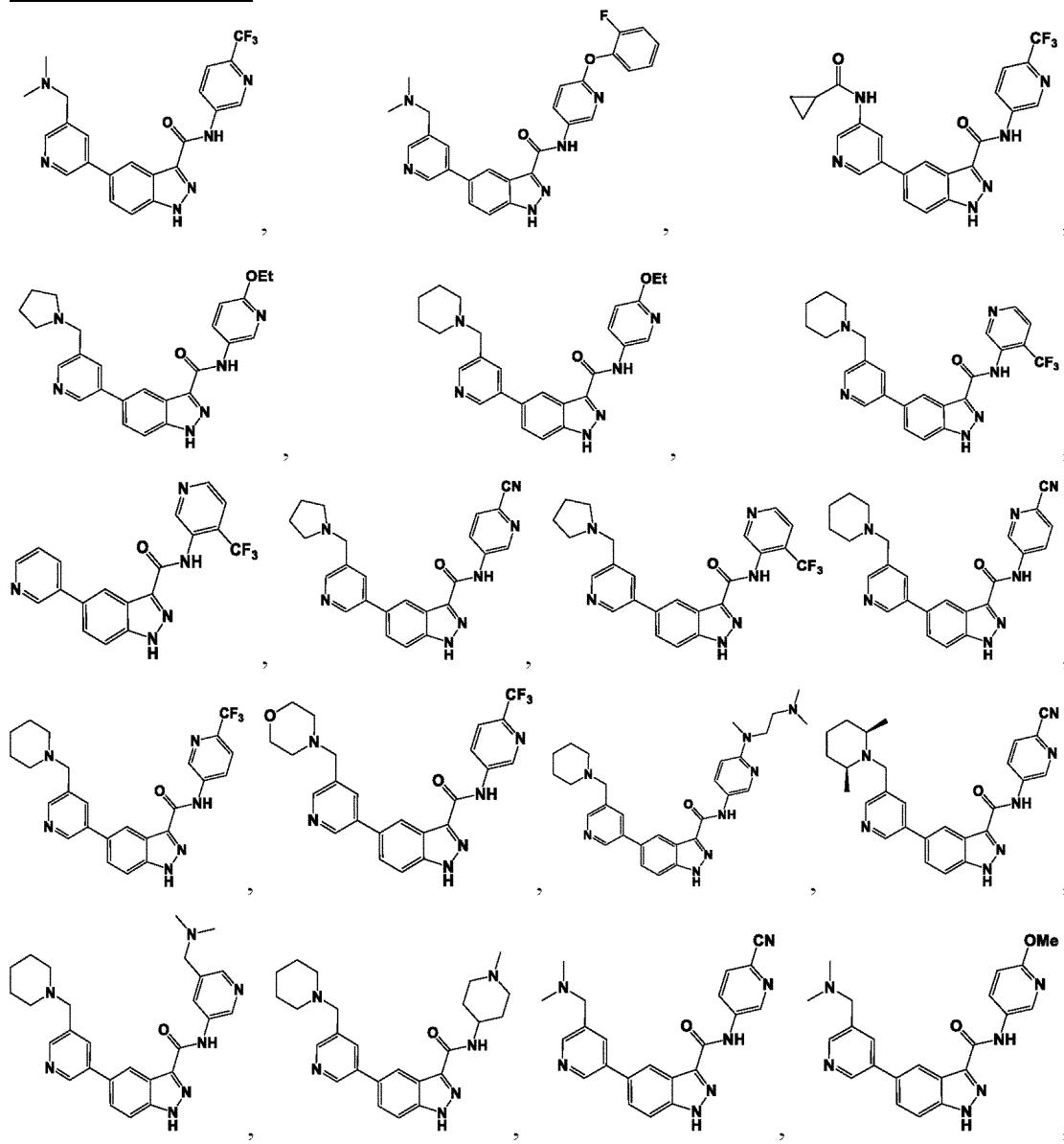


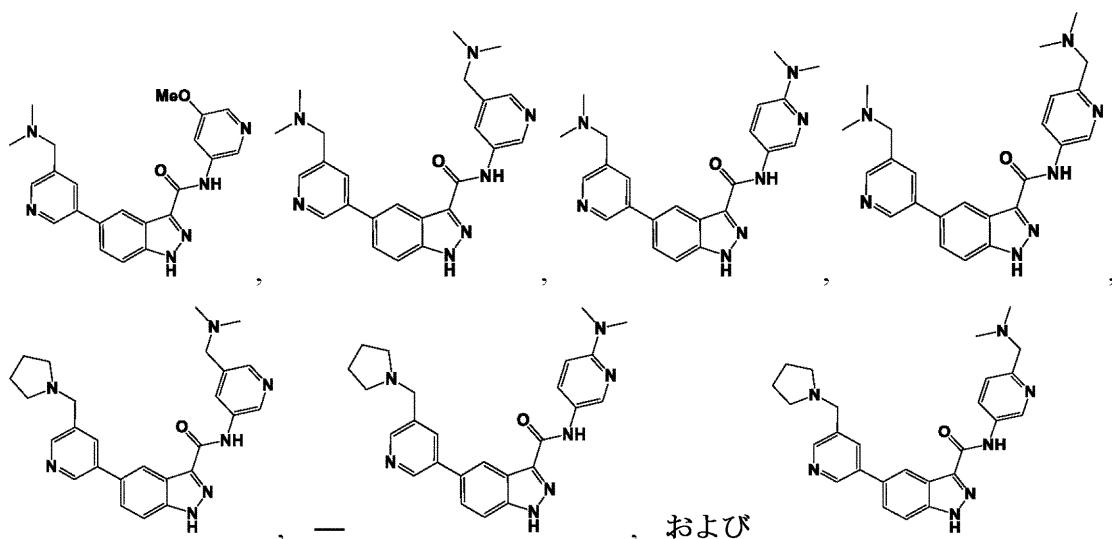
および

からなる群より選択される構造またはその薬学的に許容される塩を有する、本発明1001の方法。

[本発明1018]

前記化合物が、

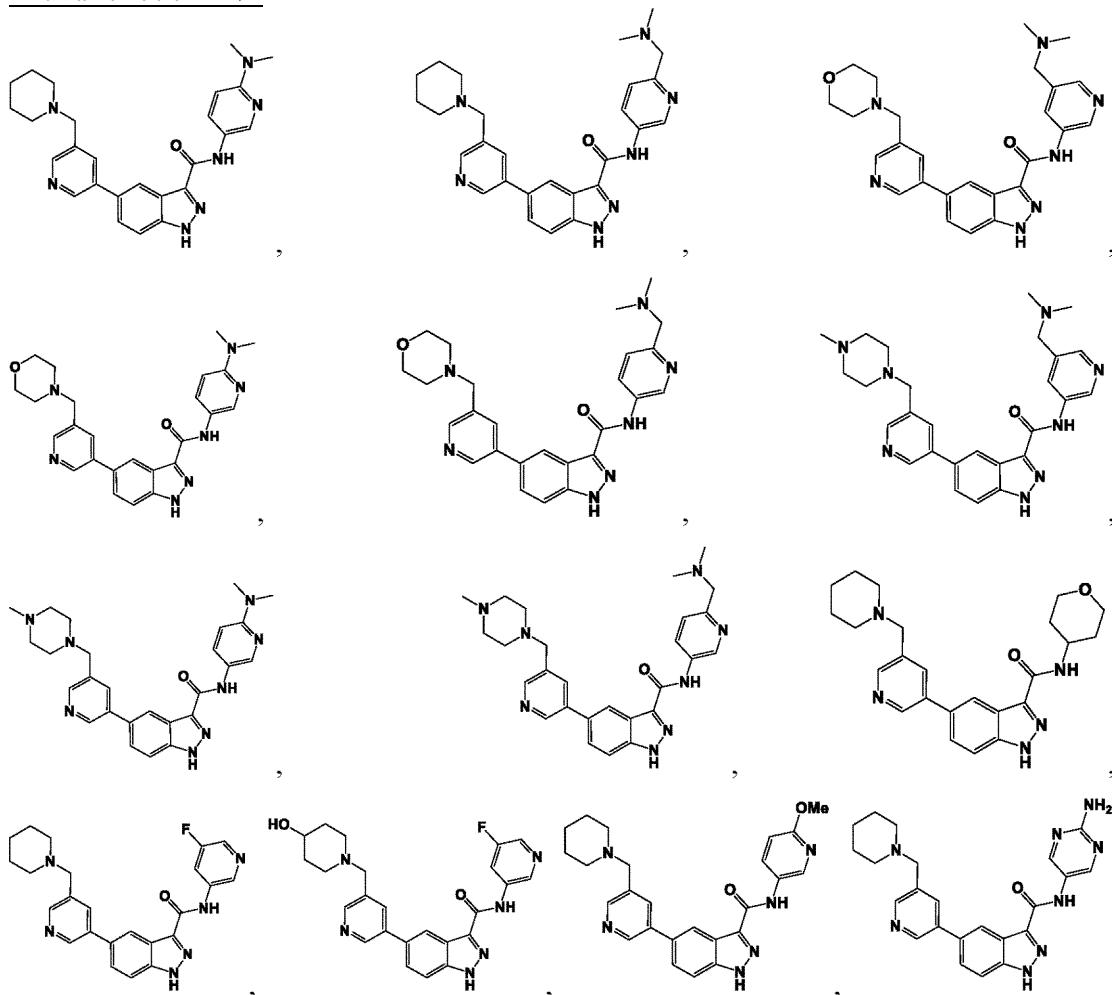


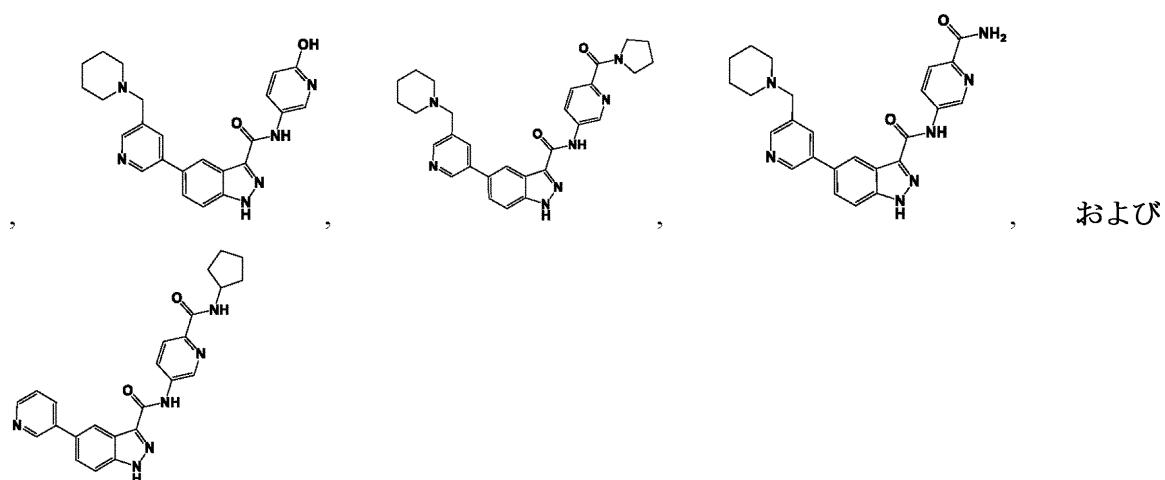


からなる群より選択される構造またはその薬学的に許容される塩を有する、本発明1017の方法。

[本発明1019]

前記化合物が、

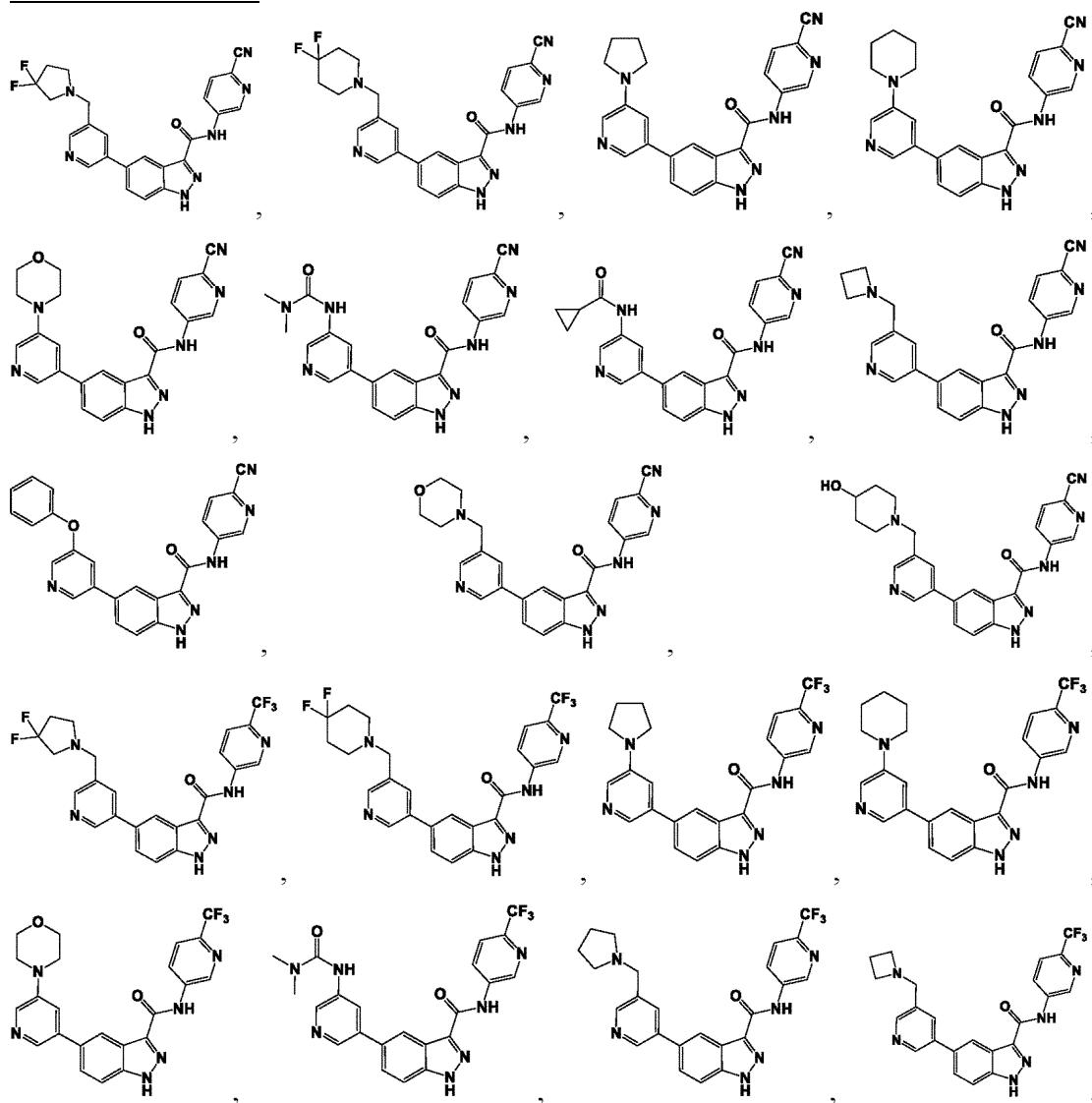


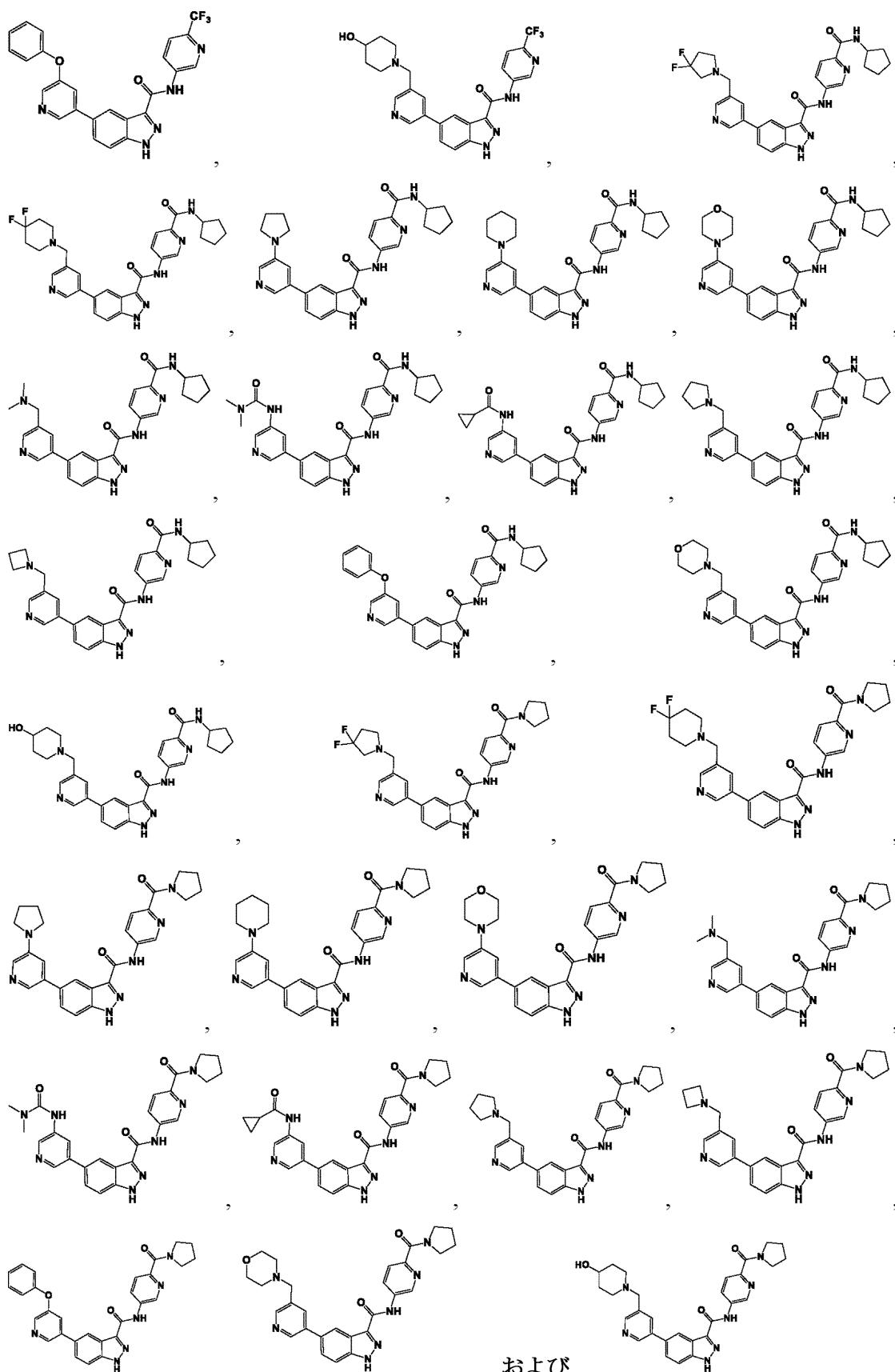


からなる群より選択される構造またはその薬学的に許容される塩を有する、本発明1017の方法。

[本発明1020]

前記化合物が、



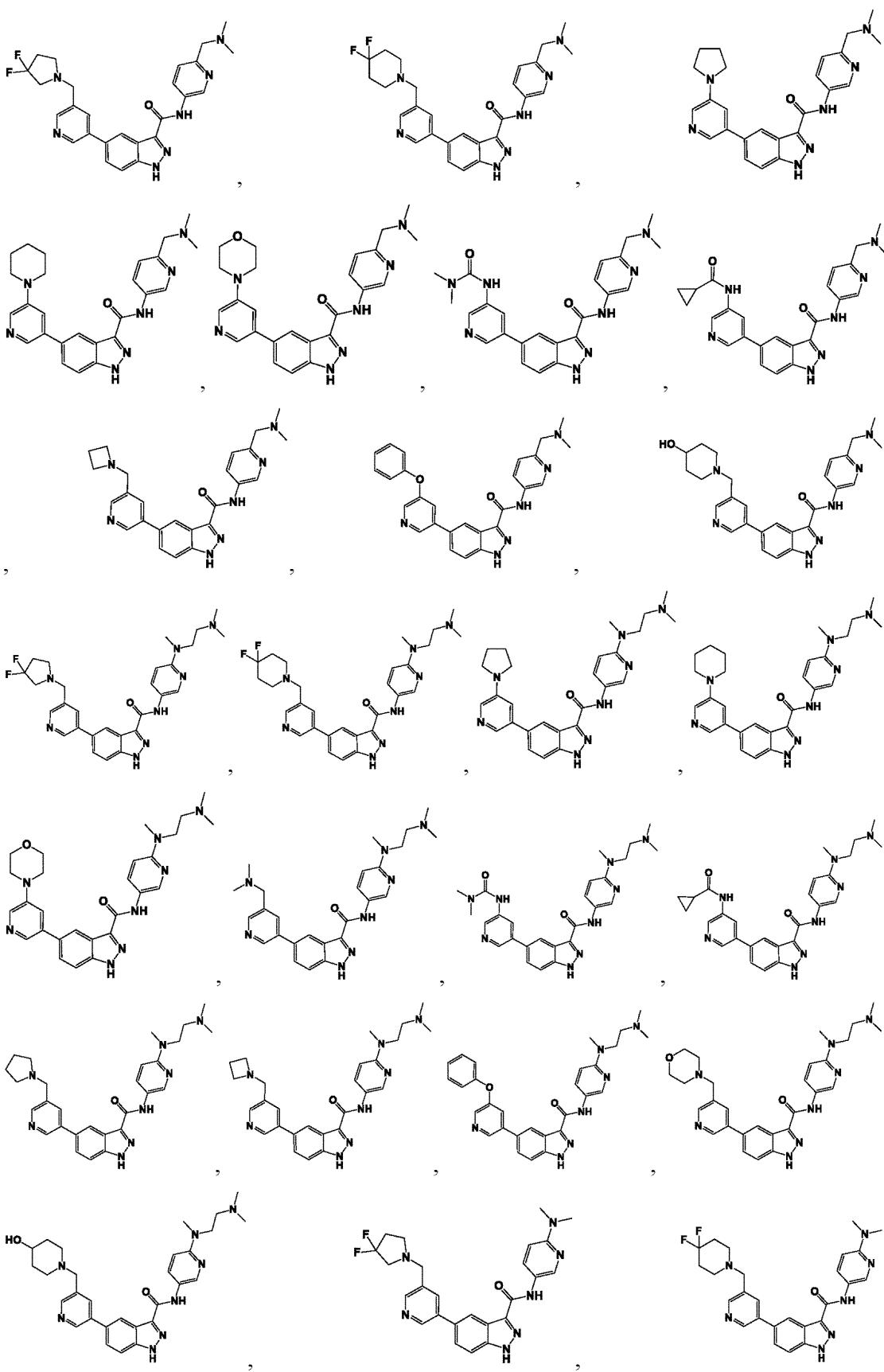


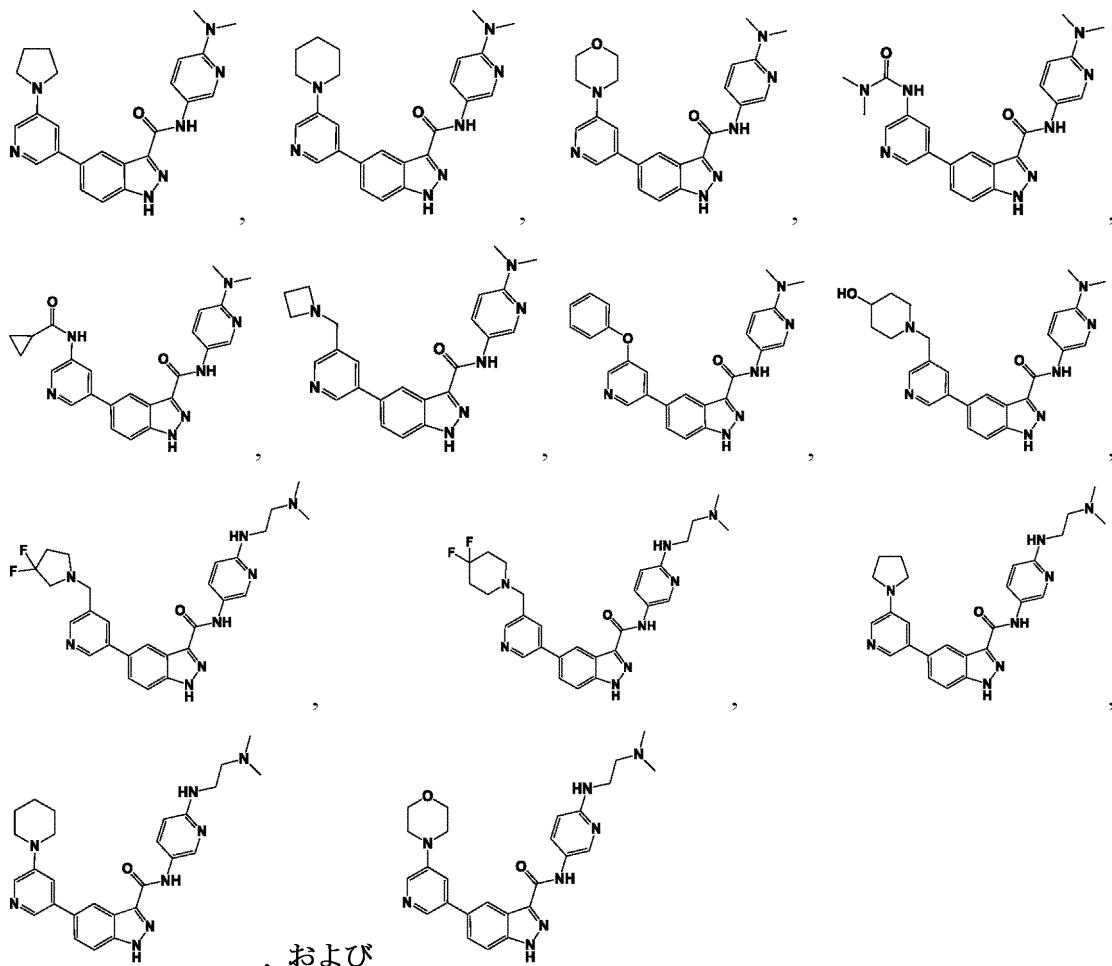
および

からなる群より選択される構造またはその薬学的に許容される塩を有する、本発明1017の方法。

[本発明1021]

前記化合物が、

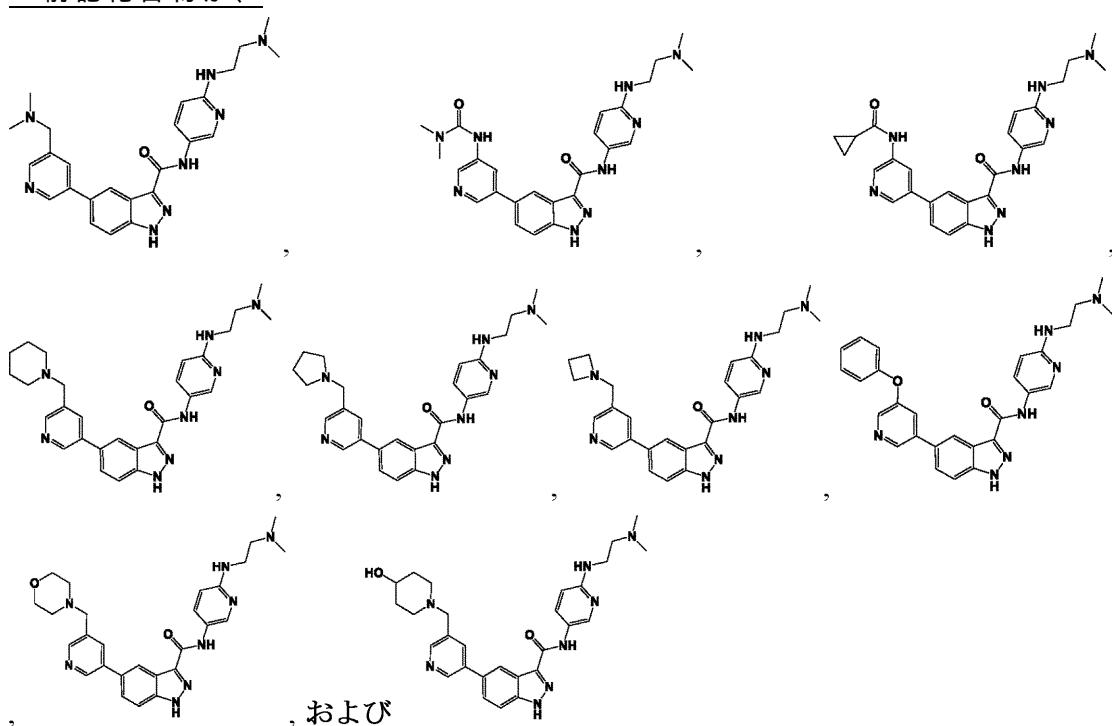




からなる群より選択される構造またはその薬学的に許容される塩を有する、本発明1017の方法。

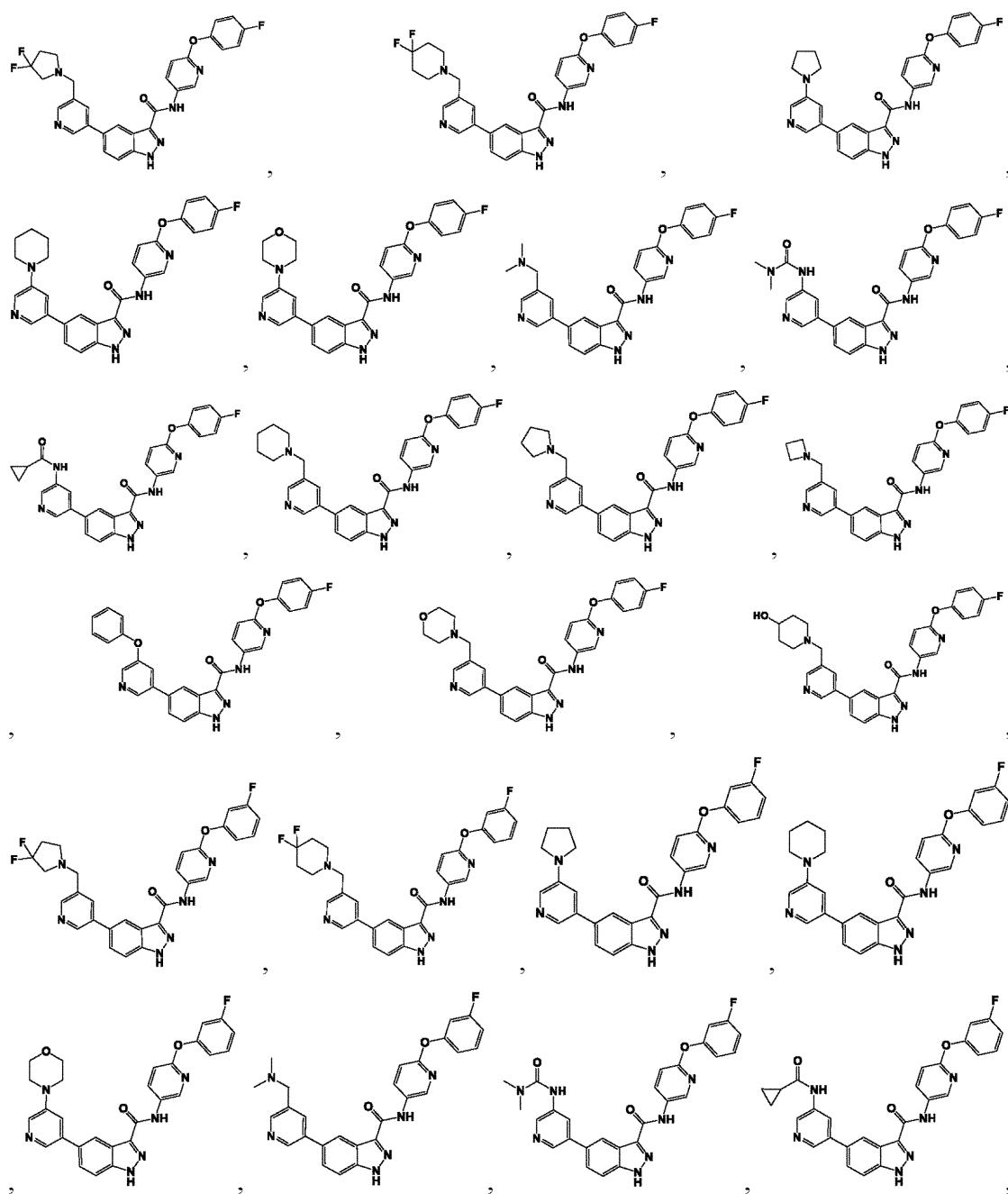
[本発明1022]

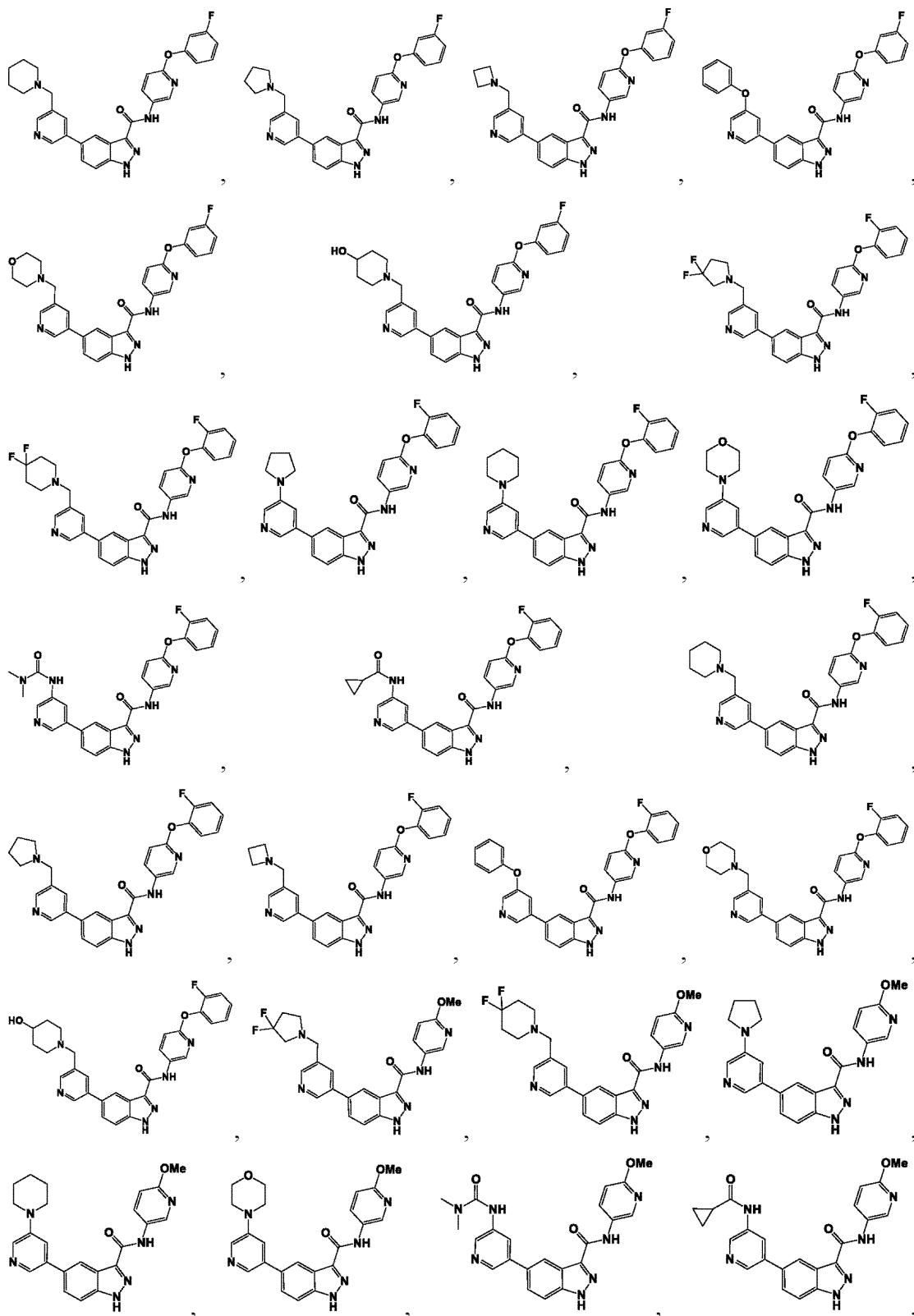
前記化合物が、

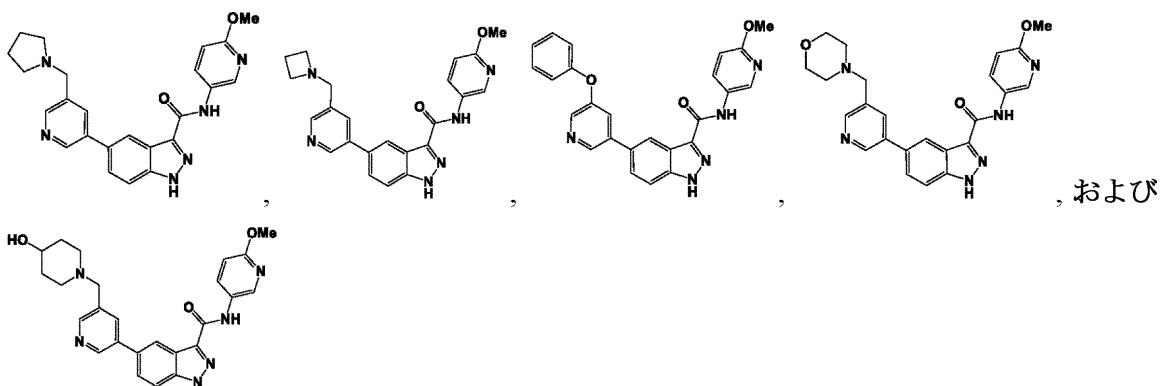


からなる群より選択される構造またはその薬学的に許容される塩を有する、本発明1017の方法。

[本発明1023]  
前記化合物が、





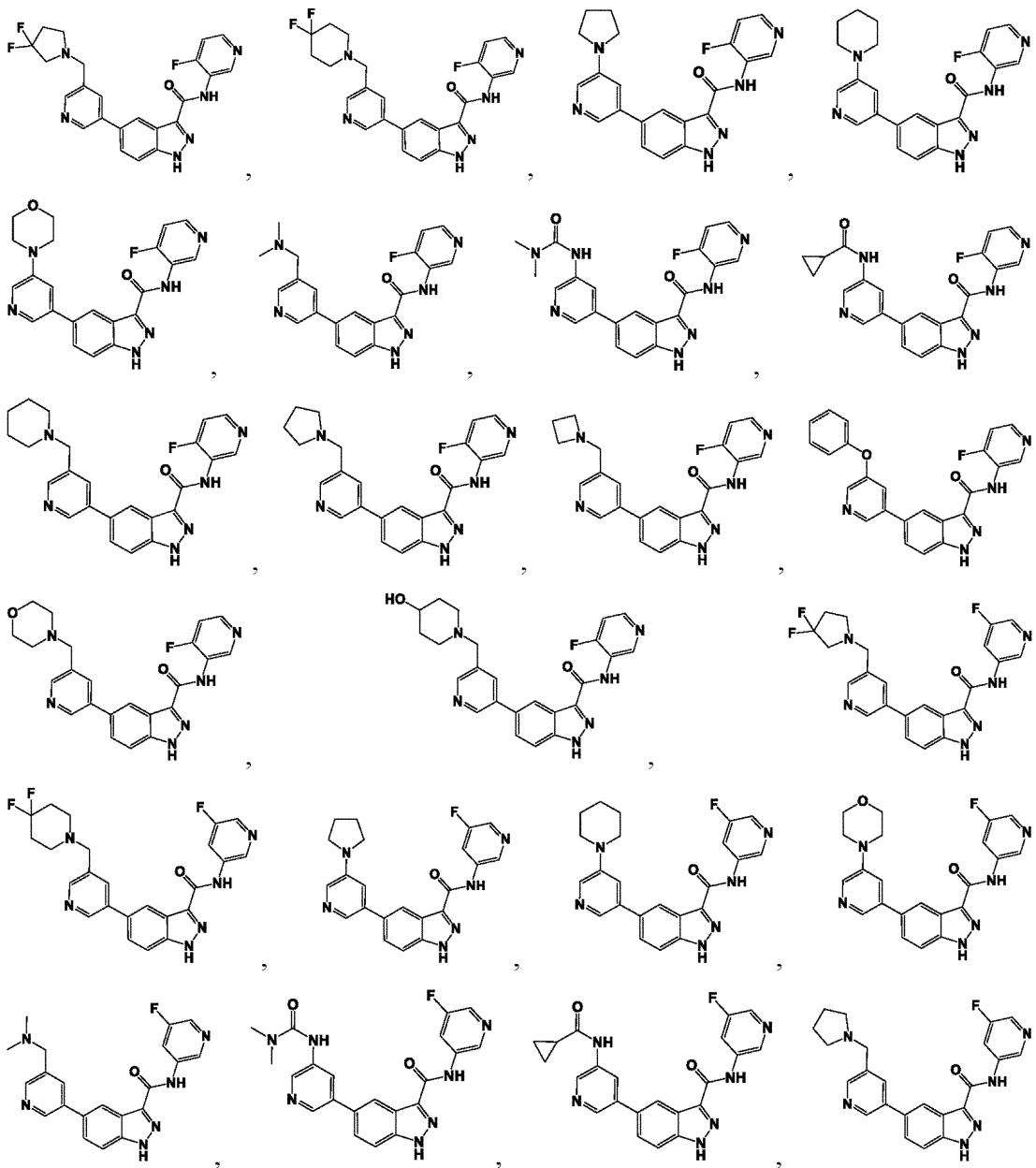


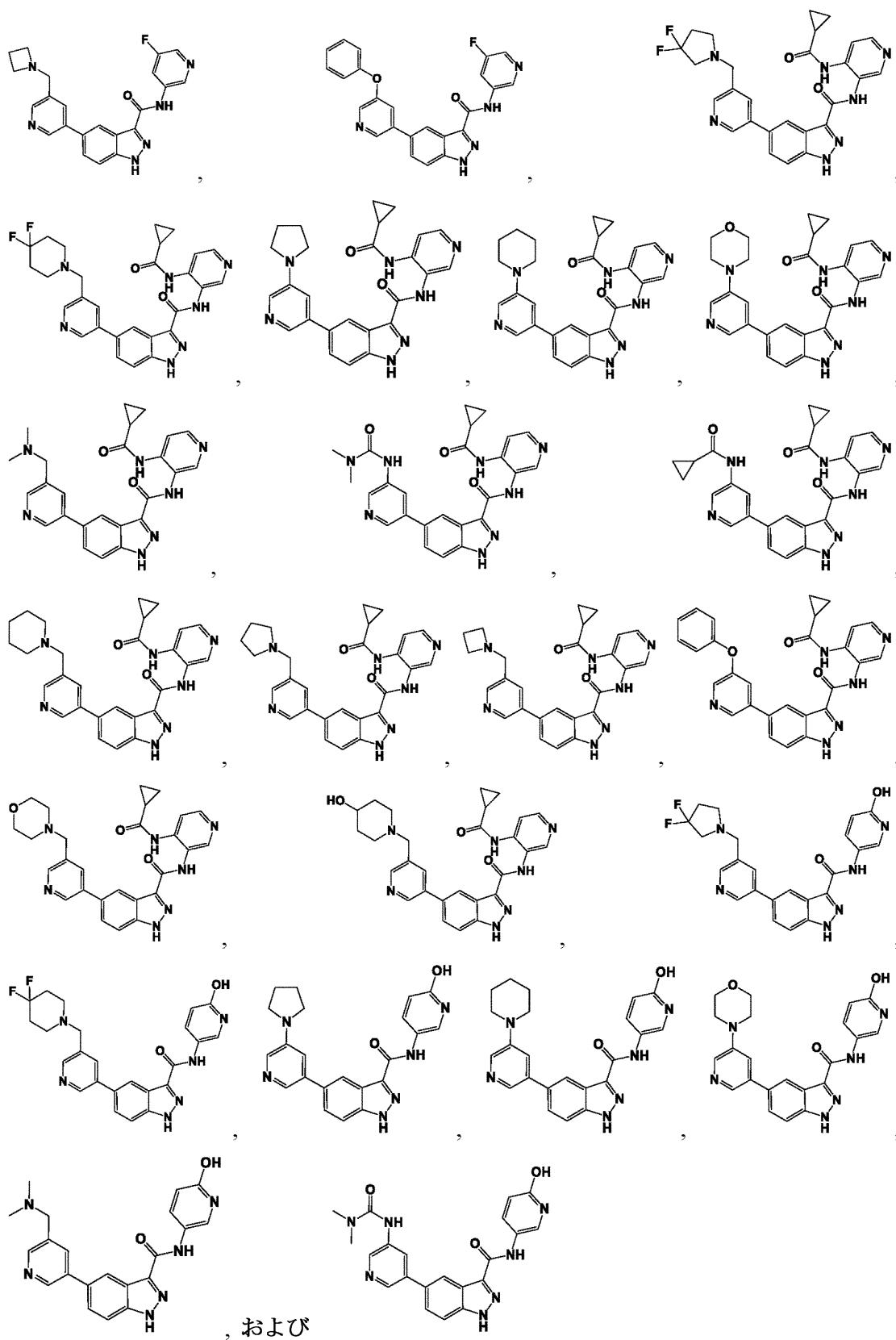
および

からなる群より選択される構造またはその薬学的に許容される塩を有する、本発明1017の方法。

[本発明1024]

前記化合物が、

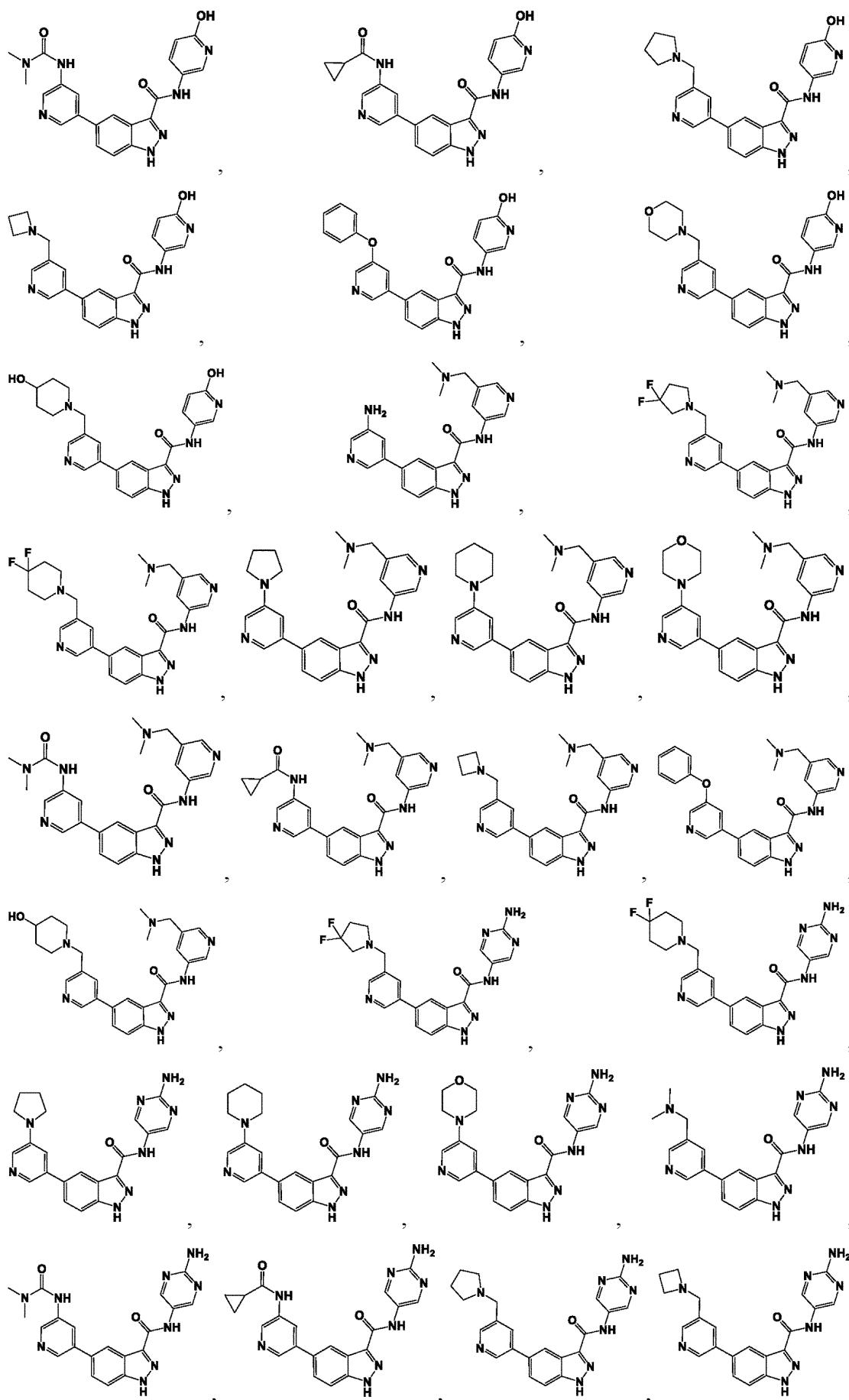


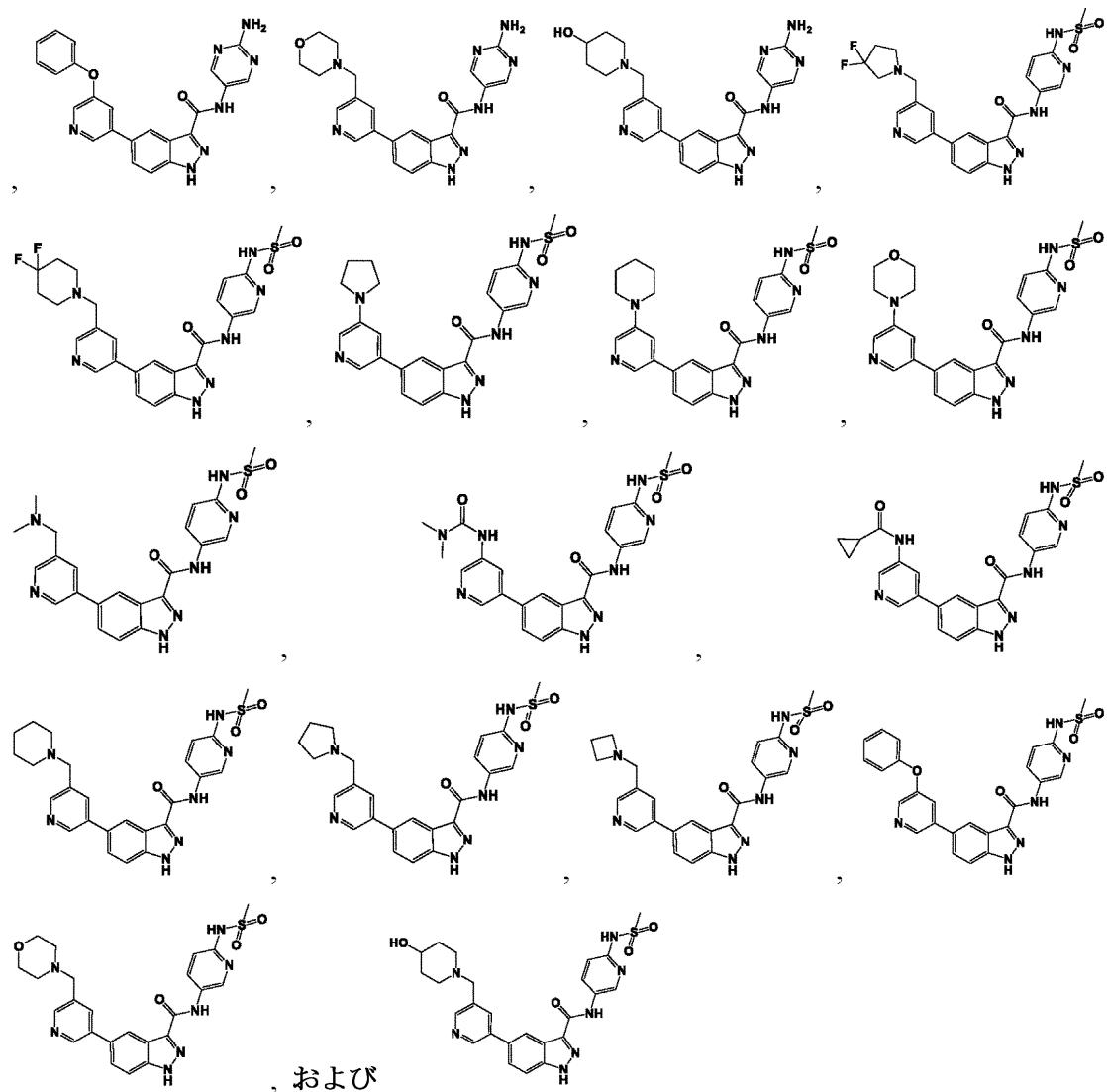


からなる群より選択される構造またはその薬学的に許容される塩を有する、本発明1017の方法。

[本発明1025]

前記化合物が、



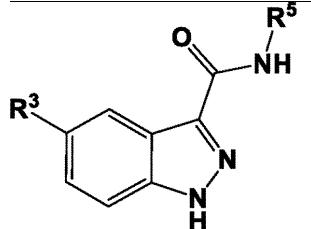


からなる群より選択される構造またはその薬学的に許容される塩を有する、本発明1017の方法。

#### [本発明1026]

健障害、皮膚炎、乾癬、モルフェア、魚鱗癬、レイノー症候群およびダリエー病からなる群より独立して選択される1つまたは複数の疾患または状態の治療方法であって、

前記方法が、式Ia:



Ia

の構造を有する化合物またはその薬学的に許容される塩の治療有効量を対象（例えば、前記方法を必要とする対象）に投与する工程を含み、

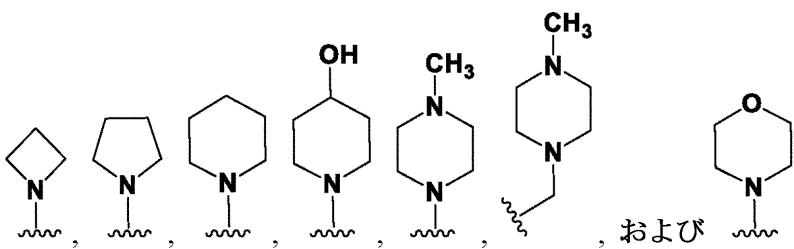
式中、

R<sup>3</sup>は3-ピリジルR<sup>6</sup>であり、

R<sup>5</sup>は、ピリジルR<sup>7</sup>、-ピリミジニルR<sup>7</sup>および-ピリダジニルR<sup>7</sup>からなる群より選択され、

R<sup>6</sup>は-CH<sub>2</sub>ヘテロシクリルR<sup>8</sup>であり、

R<sup>7</sup>は、H、F、メチル、-NH<sub>2</sub>、-CF<sub>3</sub>、-CN、-OMe、-SO<sub>2</sub>Me、



からなる群よりそれぞれ独立して選択される1~2つの置換基であり、

$R^8$ は、Hおよびハロゲン化物からなる群よりそれぞれ独立して選択される1~2つの置換基である、

前記治療方法。

[本発明1027]

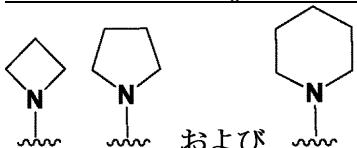
前記 $R^6$ ヘテロシクリルが、アゼチジニル $R^8$ 、ピロリジニル $R^8$ 、ピペリジニル $R^8$ 、ピペラジニル $R^8$ およびモルホリニル $R^8$ からなる群より選択される、本発明1026の方法。

[本発明1028]

$R^6$ が-CH<sub>2</sub>ピペリジニル $R^8$ である、本発明1026の方法。

[本発明1029]

$R^7$ が、H、-CF<sub>3</sub>、-OMe、-CN、



からなる群より選択される、本発明1026の方法。

[本発明1030]

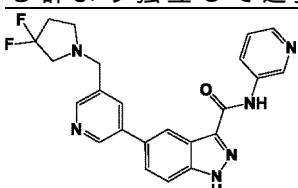
$R^8$ がHである、本発明1027の化合物。

[本発明1031]

$R^8$ がH.48である、本発明1028の化合物。

[本発明1032]

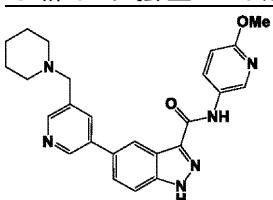
腱障害、皮膚炎、乾癬、モルフェア、魚鱗癬、レイノー症候群およびダリエー病からなる群より独立して選択される1つまたは複数の疾患または状態の治療方法であって、



の構造を有する化合物またはその薬学的に許容される塩の治療有効量を対象（例えば、前記方法を必要とする対象）に投与する工程を含む、前記治療方法。

[本発明1033]

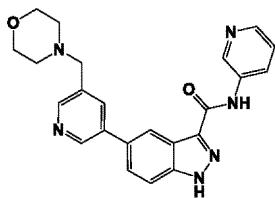
腱障害、皮膚炎、乾癬、モルフェア、魚鱗癬、レイノー症候群およびダリエー病からなる群より独立して選択される1つまたは複数の疾患または状態の治療方法であって、



の構造を有する化合物またはその薬学的に許容される塩の治療有効量を対象（例えば、前記方法を必要とする対象）に投与する工程を含む、前記治療方法。

[本発明1034]

腱障害、皮膚炎、乾癬、モルフェア、魚鱗癬、レイノー症候群およびダリエー病からなる群より独立して選択される1つまたは複数の疾患または状態の治療方法であって、



の構造を有する化合物またはその薬学的に許容される塩の治療有効量を対象（例えば、前記方法を必要とする対象）に投与する工程を含む治療方法。

[本発明1035]

前記1つまたは複数の疾患または状態が腱障害である、本発明1001～1034のいずれかの方法。

[本発明1036]

前記腱障害が腱症である、本発明1035の方法。

[本発明1037]

前記腱障害が腱炎である、本発明1035の方法。

[本発明1038]

前記腱障害が腱鞘炎である、本発明1035の方法。

[本発明1039]

前記1つまたは複数の疾患または状態が皮膚炎である、本発明1001～1034のいずれかの方法。

[本発明1040]

前記皮膚炎が接触性皮膚炎である、本発明1039の方法。

[本発明1041]

前記皮膚炎がアトピー性皮膚炎である、本発明1039の方法。

[本発明1042]

前記1つまたは複数の疾患または状態が乾癬である、本発明1001～1034のいずれかの方法。

前述の一般的な説明および以下の詳細な説明はともに例示的かつ説明的なものにすぎず、特許請求の範囲に記載の本発明を限定するものではないことを理解されたい。