

【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21年3月12日 (2009.3.12)

【公表番号】特表2008-528466(P2008-528466A)

【公表日】平成20年7月31日 (2008.7.31)

【年通号数】公開・登録公報2008-030

【出願番号】特願2007-551740(P2007-551740)

【国際特許分類】

C 07 D 401/12 (2006.01)

A 61 K 31/454 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 25/28 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

A 61 P 25/08 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 31/12 (2006.01)

A 61 P 37/00 (2006.01)

A 61 P 35/02 (2006.01)

A 61 P 13/12 (2006.01)

A 61 P 31/18 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 17/06 (2006.01)

A 61 P 1/04 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 25/16 (2006.01)

A 61 P 21/00 (2006.01)

A 61 P 9/06 (2006.01)

A 61 P 25/32 (2006.01)

A 61 P 7/06 (2006.01)

A 61 P 19/00 (2006.01)

A 61 P 19/10 (2006.01)

A 61 P 11/02 (2006.01)

A 61 P 25/04 (2006.01)

C 07 D 231/14 (2006.01)

【F I】

C 07 D 401/12 C S P

A 61 K 31/454

A 61 P 3/10

A 61 P 25/28

A 61 P 9/00

A 61 P 25/08

A 61 P 25/00

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 35/00

A 61 P 31/12

A 61 P 37/00

A 6 1 P 35/02  
 A 6 1 P 13/12  
 A 6 1 P 31/18  
 A 6 1 P 29/00  
 A 6 1 P 19/02  
 A 6 1 P 17/06  
 A 6 1 P 1/04  
 A 6 1 P 9/10 1 0 1  
 A 6 1 P 25/16  
 A 6 1 P 21/00  
 A 6 1 P 9/10  
 A 6 1 P 9/06  
 A 6 1 P 25/32  
 A 6 1 P 7/06  
 A 6 1 P 19/00  
 A 6 1 P 19/10  
 A 6 1 P 11/02  
 A 6 1 P 25/04  
 C 0 7 D 231/14

## 【手続補正書】

【提出日】平成21年1月20日(2009.1.20)

## 【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

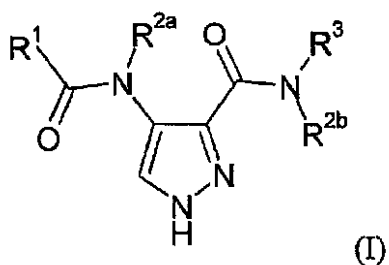
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



[ 式中 :

 $R^1$  は、2, 6 - ジクロロフェニルであり ; $R^{2a}$  および  $R^{2b}$  は、いずれも水素であり ;そして、 $R^3$  は、基 :

【化 2】

( 式中、 $R^4$  は、 $C_{1-4}$  アルキルである ) である ]

の化合物またはその塩、互変異性体、溶媒和物および N - オキシド。

## 【請求項 2】

R<sup>4</sup> が、C<sub>1</sub> - <sub>3</sub> アルキルである請求項 1 記載の化合物。

## 【請求項 3】

R<sup>4</sup> が、メチルである請求項 2 記載の化合物。

## 【請求項 4】

R<sup>4</sup> が、エチル、n - プロピルおよびイソプロピルから選択される請求項 2 記載の化合物。

## 【請求項 5】

4 - ( 2 , 6 - ジクロロベンゾイルアミノ ) - 1 H - ピラゾール - 3 - カルボン酸 ( 1 - メタンスルホニル - ピペリジン - 4 - イル ) - アミドである請求項 1 記載の化合物。

## 【請求項 6】

サイクリン依存性キナーゼまたはグリコーゲン合成酵素キナーゼ - 3 によって介在される疾患症状または状態の予防または処置のための薬剤の製造のための請求項 1 ~ 5 のいずれか一つに記載の化合物の使用。

## 【請求項 7】

哺乳類の異常細胞増殖を包含するか、または哺乳類の異常細胞増殖から生じる疾患または状態を予防または処置するための薬剤の製造のための請求項 1 ~ 5 のいずれか一つに記載の化合物の使用。

## 【請求項 8】

該疾患または状態が癌である請求項 7 に記載の使用。

## 【請求項 9】

該癌が膀胱、乳房、大腸、腎臓、表皮、肝臓、肺、食道、胆嚢、卵巣、膵臓、胃、子宮頸、甲状腺、前立腺または皮膚の癌；リンパ系の造血腫瘍；骨髄系の造血腫瘍；甲状腺小細胞癌；間充織起源腫瘍；中枢または末梢神経系腫瘍；黒色腫；精上皮腫；奇形癌；骨肉腫；色素性乾皮症；角化棘細胞腫；甲状腺小細胞癌またはカボジ肉腫である請求項 8 に記載の使用。

## 【請求項 10】

乳癌、卵巣癌、大腸癌、前立腺癌、食道癌、扁平上皮癌および非小細胞肺癌から選択される請求項 8 に記載の使用。

## 【請求項 11】

癌が白血病である請求項 9 に記載の使用。

## 【請求項 12】

癌が急性リンパ球白血病、慢性リンパ球白血病、B 細胞リンパ腫（びまん性大細胞型 B 細胞リンパ腫のような）、T 細胞リンパ腫、ホジキンリンパ腫、非ホジキンリンパ腫、有毛細胞リンパ腫またはパーケットリンパ腫から選択される請求項 9 に記載の使用。

## 【請求項 13】

増殖性疾患、ウイルス感染症、自己免疫疾患および神経変性疾患から選択される疾患症状または状態の予防または処置のための薬剤の製造のための請求項 1 ~ 5 のいずれか一つに記載の化合物の使用。

## 【請求項 14】

請求項 1 ~ 5 のいずれか一つに記載の化合物と薬学的に許容される担体を含んでなる医薬組成物。

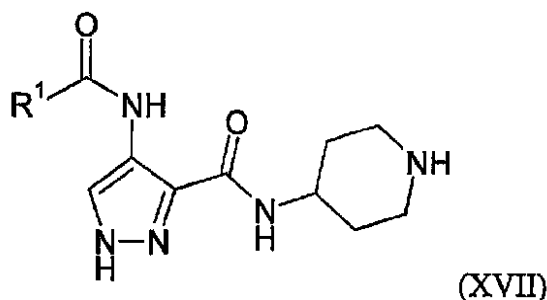
## 【請求項 15】

請求項 1 ~ 5 のいずれか一つに記載の化合物と経口投与に適当な形態の薬学的に許容される担体を含んでなる医薬組成物。

## 【請求項 16】

請求項 1 ~ 5 のいずれか一つに定義されている化合物の製造方法であって、式 ( X V I I ) :

## 【化 3】



の化合物を、基  $\text{SO}_2\text{R}^4$  を導入するのに適当なスルホニル化剤と反応させることを含んでなる方法。

## 【請求項 17】

スクリーニングされ、そしてサイクリン依存性キナーゼに対する活性を有している化合物での処置に感受性があるであろう疾患または状態に罹患しているか、または罹患するおそれがあると判定された患者の疾患の症状または状態を処置または予防する薬剤の製造のための請求項 1 ~ 5 のいずれか一つに記載の化合物の使用。

## 【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0109

【補正方法】変更

【補正の内容】

## 【0109】

阻害できる癌の例は、これらに限定されるものではないが、癌、例えば、膀胱、乳房、大腸の癌（例えば、大腸腺癌および大腸腺腫のような結腸直腸癌）、腎臓、表皮、肝臓、肺の癌（例えば、腺癌、小細胞肺癌および非小細胞肺癌）、食道、胆嚢、卵巣、膵臓の癌（例えば、外分泌性膵癌）、胃、子宮頸、甲状腺、前立腺または皮膚の癌（例えば、扁平上皮癌）を含む；リンパ系の造血腫瘍（例えば、白血病、急性リンパ球白血病、慢性リンパ球白血病、B細胞リンパ腫（例えば、びまん性大細胞型B細胞リンパ腫）、T細胞リンパ腫、ホジキンリンパ腫、非ホジキンリンパ腫、有毛細胞リンパ腫またはバーケットリンパ腫）；骨髄系の造血腫瘍（例えば、急性および慢性骨髄性白血病、骨髄形成異常症候群またはプロ骨髄性白血病）；甲状腺小胞癌；間充織起源腫瘍、例えば、線維肉腫または横紋筋肉腫(habdomyosarcoma)；中枢または末梢神経系腫瘍（例えば、星状細胞腫、神経芽細胞腫、神経膠腫または神経鞘腫）；黒色腫；精上皮腫；奇形癌；骨肉腫；色素性乾皮症；角化棘細胞腫(keratocanthoma)；甲状腺小胞癌；またはカボジ肉腫を含む。

## 【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0112

【補正方法】変更

【補正の内容】

## 【0112】

CDKは、また、アポトーシス、増殖、分化および転写において役割を果たすことで知られており、従ってCDK阻害剤は、また、癌以外の下記の疾患の処置に役立つであろう；ウイルス感染症、例えば、ヘルペスウイルス、ポックスウイルス、エプスタインバーウイルス、シンドビスウイルス、アデノウイルス、HIV、HPV、HCVおよびHCMV；HIV感染個体のエイズ進行の防止；慢性炎症性疾患、例えば、全身エリテマトーデス、自己免疫介在系球体腎炎、関節リウマチ、乾癬、炎症性腸疾患および自己免疫糖尿病；心臓血管疾患、例えば、心肥大、再狭窄、アテローム性動脈硬化症；神経変性疾患、例えば、アルツハイマー病、エイズ関連痴呆、パーキンソン病、筋萎縮性側索硬化症、色素性網膜炎、脊髄筋萎縮および小脳性退化；系球体腎炎；骨髄形成異常症候群、虚血性損傷に伴う心筋梗塞、卒中および再還流損傷、不整脈、アテローム性動脈硬化症、毒素誘発また

はアルコール関連肝疾患、血液病、例えば、慢性貧血症および無形成性貧血；筋骨格系の変性疾患、例えば、骨粗鬆症および関節炎、アスピリン過敏副鼻腔炎、嚢胞性線維症、多発性硬化症、腎臓病および癌疼痛。