

【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24年8月30日 (2012.8.30)

【公表番号】特表2011-528030(P2011-528030A)

【公表日】平成23年11月10日 (2011.11.10)

【年通号数】公開・登録公報2011-045

【出願番号】特願2011-518009(P2011-518009)

【国際特許分類】

C 0 7 D 239/47 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 11/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 11/16 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 239/47 Z

C 0 7 D 403/12 C S P

A 6 1 K 31/506

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 405/12

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 11/02

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 11/16

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 17/06

【手続補正書】

【提出日】平成24年7月10日 (2012.7.10)

【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

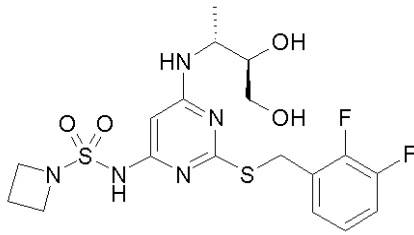
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式(1)

【化 1】



(1)

の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 2】

式(1)で示される、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

ケモカイン介在疾患または状態の処置に使用するための、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 4】

喘息、アレルギー性鼻炎、COPD、炎症性腸疾患、骨関節症、骨粗鬆症、リウマチ性関節炎、または乾癬の処置用医薬として使用するための、請求項 3 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【請求項 5】

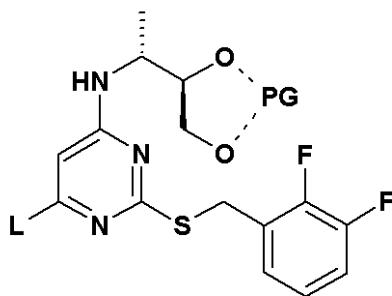
請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩を薬学的に許容される希釈剤または担体と共に含む、医薬組成物。

【請求項 6】

請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩の製造方法であって：

(a) 式(2a)

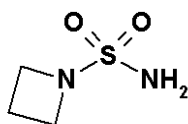
【化 2】



(2a)

〔式中、PGは保護基または2個の別々の水素原子であり、そしてLは脱離基である。〕
の化合物を、式(2c)

【化 3】



(2c)

のスルホンアミドで、適当な塩基、触媒および溶媒の存在下で処理し、その後、場合により(i)および/または(ii)を任意の順番で行うことを含む：

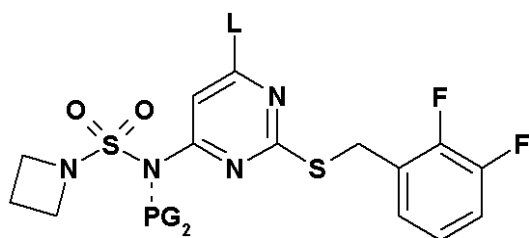
i) 何らかの保護基の除去；

ii) 塩の形成；

あるいは

(b) 式(2b)

【化4】

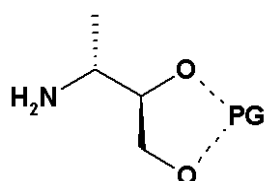


(2b)

〔式中、PG₂は保護基であり、そしてLは脱離基である。〕

の化合物を、式(2d)

【化5】



(2d)

〔式中、PGは保護基または2個の別々の水素原子である。〕

のアミンで、適当な塩基、および溶媒の存在下で処理し、その後、場合により(i)および/または(ii)を任意の順番で行うことを含む：

i) 何らかの保護基の除去、

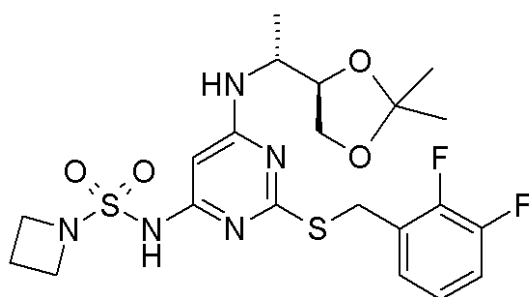
ii) 塩の形成

ことを含む、方法。

【請求項7】

式(1a)

【化6】



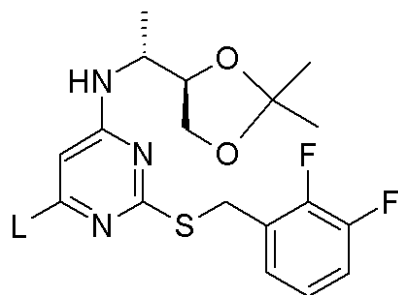
(1a)

の化合物、およびその薬学的に許容される塩。

【請求項8】

式(2a)

【化 7】



(2a)

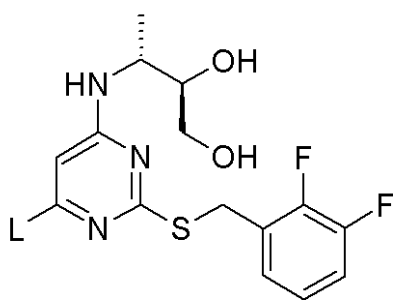
〔式中、L はハロゲンである。〕

の化合物。

【請求項 9】

式(2e)

【化 8】



(2e)

〔式中、L はハロゲンである。〕

の化合物。

【請求項 10】

請求項 1 に記載の式(1)の化合物またはその薬学的に許容される塩、または式(1)の化合物を含む医薬組成物または製剤を、他の治療および/または他の治療剤と同時にまたは連続的に投与することを含む、組合せ治療。

【請求項 11】

喘息、アレルギー性鼻炎、COPD、炎症性腸疾患、過敏性腸症候群、骨関節症、骨粗鬆症、リウマチ性関節炎、または乾癬の処置のための、請求項 10 に記載の組合せ治療。

【請求項 12】

式(1)の化合物またはその薬学的に許容される塩を、他の薬剤と共に含む、医薬組成物。

【請求項 13】

喘息、アレルギー性鼻炎、COPD、炎症性腸疾患、過敏性腸症候群、骨関節症、骨粗鬆症、リウマチ性関節炎、または乾癬の処置のための、請求項 12 に記載の医薬組成物。

【請求項 14】

癌の処置のための、請求項 12 に記載の医薬組成物。

【請求項 15】

次の結晶形態のいずれかである、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩：

(a) 表 3 に示す X 線粉末回折(XRPD)パターンにより特徴付けられる(修飾 A と命名)；

(b) 表 4 に示す X 線粉末回折(XRPD)パターンにより特徴付けられる(修飾 B と命名)；

(c) 表 5 に示す X 線粉末回折 (XRPD) パターンにより特徴付けられる (修飾 C と命名) ;
 (d) 表 6 に示す X 線粉末回折 (XRPD) パターンにより特徴付けられる (修飾 D と命名) ;
 (e) 表 7 に示す X 線粉末回折 (XRPD) パターンにより特徴付けられる (修飾 E と命名) ;
 または
 (f) 表 8 に示す X 線粉末回折 (XRPD) パターンにより特徴付けられる (修飾 F と命名)。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0120

【補正方法】変更

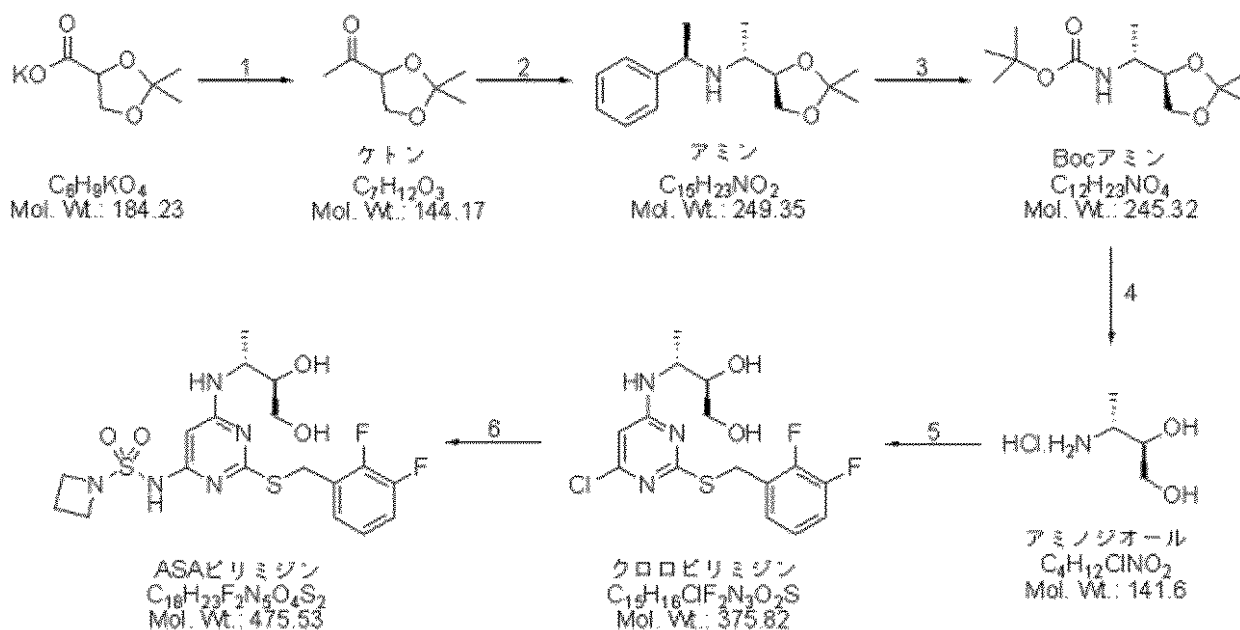
【補正の内容】

【0120】

実施例 3

スキーム 1 (以下に示す) に略記する経路を使用した、大規模で繰り返した実施例 1 の化合物の製造

【化 19】



- 1: (i) クエン酸, H_2O , EtOAc; (ii) MeMgBr, Et_2O
- 2: (R)-(+)-1-フェニルエチルアミン, $NaBH(CH_3CO_2)_3$, MeCN
- 3: Boc_2O , 20% $Pd(OH)_2$ 炭素, H_2 , IMS
- 4: 4M HCl のジオキサン溶液, MeOH
- 5: 4,6-ジクロロ-2-[(2,3-ジフルオロベンジル)チオ]ピリミジン, $NaHCO_3$, MeCN
- 6: アゼチジン-1-スルホンアミド, $Pd_2(dba)_3$, X-Phos, Cs_2CO_3 , 1,4-ジオキサン

スキーム 1