

【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20年10月9日(2008.10.9)

【公表番号】特表2008-510771(P2008-510771A)

【公表日】平成20年4月10日(2008.4.10)

【年通号数】公開・登録公報2008-014

【出願番号】特願2007-528834(P2007-528834)

【国際特許分類】

C 07 D 475/00	(2006.01)
A 61 K 31/522	(2006.01)
A 61 K 31/551	(2006.01)
C 07 D 519/00	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 31/04	(2006.01)
A 61 P 31/12	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 P 37/00	(2006.01)
A 61 P 17/14	(2006.01)
A 61 P 17/02	(2006.01)
A 61 P 9/00	(2006.01)
A 61 P 13/12	(2006.01)
A 61 P 25/00	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 31/18	(2006.01)
A 61 P 1/04	(2006.01)
A 61 P 19/02	(2006.01)
A 61 P 25/28	(2006.01)
A 61 P 31/10	(2006.01)
A 61 P 33/00	(2006.01)
A 61 P 35/02	(2006.01)
A 61 P 17/06	(2006.01)
A 61 P 19/08	(2006.01)
A 61 P 9/10	(2006.01)
A 61 P 9/04	(2006.01)

【F I】

C 07 D 475/00	C S P
A 61 K 31/522	
A 61 K 31/551	
C 07 D 519/00	3 1 1
A 61 K 31/5377	
A 61 P 35/00	
A 61 P 31/04	
A 61 P 31/12	
A 61 P 29/00	
A 61 P 37/00	
A 61 P 17/14	
A 61 P 17/02	
A 61 P 9/00	

A 6 1 P 13/12
A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 43/00 1 1 1
A 6 1 P 31/18
A 6 1 P 1/04
A 6 1 P 19/02
A 6 1 P 25/28
A 6 1 P 31/10
A 6 1 P 33/00
A 6 1 P 35/02
A 6 1 P 17/06
A 6 1 P 19/08
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 9/04

【手続補正書】

【提出日】平成20年8月19日(2008.8.19)

【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

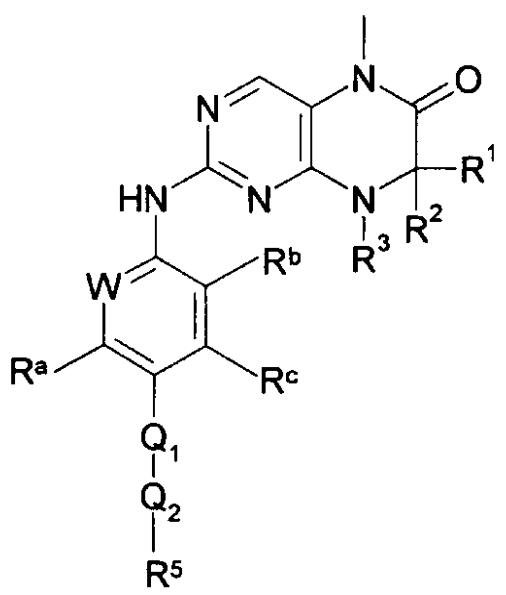
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

下記一般式(1)の化合物

【化1】



(式中、

Wは、NまたはC-R⁴を表し、R¹、R²は、それぞれ互いに独立に、水素または一置換もしくは多置換されていてよいC₁₋₆アルキル、C₁₋₆アルケニル、C₁₋₆アルキニルを表し、あるいはR¹とR²は一緒になって、飽和もしくは部分的に不飽和の2~5員アルキル架橋(-CH₂-基はO、S、-NR⁸により置換されていてよい、または、-CH-基はNにより置換されていてよい)を形成し；R³は、水素または一置換もしくは多置換されていてよいC₁₋₁₂アルキル、C₂₋₁₂アルケ

ニル、 C_{2-12} -アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロアリールおよびヘテロシクリルより選択される基（置換基は、同一でも異なっていてもよく、ハロゲン、-NO₂、-OR⁸、-C(=O)R⁸、-C(=O)OR⁸、-C(=O)NR⁸R⁹、-NR⁸R⁹、-NR⁸C(=O)R⁹、-NR⁸C(=O)OR⁹、-NR⁸C(=O)NR⁹R¹⁰、-NR⁸C(=O)ONR⁹R¹⁰、-NR⁸SO₂R⁹、-N=CR⁸R⁹、-SR⁸、-SOR⁸、-SO₂R⁸、-SO₂NR⁸R⁹、-NR⁸SO₂NR⁹R¹⁰、-OSO₂NR⁸R⁹および擬ハロゲンより選択される）を表し；

あるいはR¹とR³またはR²とR³は、一緒になって飽和もしくは部分的に不飽和の2~5-員アルキル架橋(-CH₂-基はO、S、-NR⁸により置換されていてもよい、または、-CH-基はNにより置換されていてもよい)を形成し；

R⁴は、水素、-CN、ヒドロキシ、ハロゲン、-OR⁸および-NR⁶R⁷より選択される基、または、一置換もしくは多置換されていてもよいC₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₁₋₅アルキルオキシ、C₂₋₅アルケニルオキシ、C₂₋₅アルキニルオキシ、C₁₋₆アルキルチオ、C₁₋₆アルキルスルホキソおよびC₁₋₆アルキルスルホニルより選択される基（置換基は、同一でも異なっていてもよく、ハロゲン、-NO₂、-OR⁸、-C(=O)R⁸、-C(=O)OR⁸、-C(=O)NR⁸R⁹、-NR⁸C(=O)R⁹、-NR⁸C(=O)OR⁹、-NR⁸C(=O)NR⁹R¹⁰、-NR⁸C(=O)ONR⁹R¹⁰、-NR⁸SO₂R⁹、-N=CR⁸R⁹、-SR⁸、-SOR⁸、-SO₂R⁸、-SO₂NR⁸R⁹、-NR⁸SO₂NR⁹R¹⁰、-OSO₂NR⁸R⁹および擬ハロゲンより選択される）を表し；

Q₁は、一置換もしくは多置換されていてもよいピペリジニル、ピペラジニル、ホモピペラジニル、ピロリジニル、トロペニル、アザシクロヘプチルおよび-N(R⁸)-(CH₂)n-より選択される基（置換基は、同一でも異なっていてもよく、ハロゲン、-NO₂、R⁸、-OR⁸、-C(=O)R⁸、-C(=O)OR⁸、-C(=O)NR⁸R⁹、-NR⁸R⁹、-NR⁸C(=O)R⁹、-NR⁸C(=O)OR⁹、-NR⁸C(=O)NR⁹R¹⁰、-NR⁸C(=O)ONR⁹R¹⁰、-NR⁸SO₂R⁹、-N=CR⁸R⁹、-SR⁸、-SOR⁸、-SO₂R⁸、-SO₂NR⁸R⁹、-NR⁸SO₂NR⁹R¹⁰、-OSO₂NR⁸R⁹および擬ハロゲンより選択される）を表し；

Q₂は、存在しないか、または、一置換もしくは多置換されていてもよいC₁₋₁₆アルキレン、C₂₋₁₆アルケニレン、C₂₋₁₆アルキニレン、シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールより選択される基（置換基は、同一でも異なっていてもよく、ハロゲン、-NO₂、R⁸、-OR⁸、-C(=O)R⁸、-C(=O)OR⁸、-C(=O)NR⁸R⁹、-NR⁸R⁹、-NR⁸C(=O)R⁹、-NR⁸C(=O)OR⁹、-NR⁸C(=O)NR⁹R¹⁰、-NR⁸C(=O)ONR⁹R¹⁰、-NR⁸SO₂R⁹、-N=CR⁸R⁹、-SR⁸、-SOR⁸、-SO₂R⁸、-SO₂NR⁸R⁹、-NR⁸SO₂NR⁹R¹⁰、-OSO₂NR⁸R⁹および擬ハロゲンより選択される）を表し；

R⁵は、水素または一置換もしくは多置換されていてもよいC₁₋₁₆アルキル、C₂₋₁₆アルケニル、C₂₋₁₆アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールより選択される基（置換基は、同一でも異なっていてもよく、ハロゲン、-NO₂、R⁸、-OR⁸、-C(=O)R⁸、-C(=O)OR⁸、-C(=O)NR⁸R⁹、-NR⁸R⁹、-NR⁸COR⁹、-NR⁸C(=O)OR⁹、-NR⁸C(=O)NR⁹R¹⁰、-NR⁸C(=O)ONR⁹R¹⁰、-NR⁸SO₂R⁹、-N=CR⁸R⁹、-SR⁸、-SOR⁸、-SO₂R⁸、-SO₂NR⁸R⁹、-NR⁸SO₂NR⁹R¹⁰、-OSO₂NR⁸R⁹および擬ハロゲンより選択される）を表し；

R^a、R^b、R^cは、それぞれ互いに独立に、水素、ハロゲン、-NO₂、-OR⁸、-C(=O)R⁸、-C(=O)OR⁸、-C(=O)NR⁸R⁹、-NR⁸R⁹、-NR⁸C(=O)R⁹、-NR⁸C(=O)OR⁹、-NR⁸C(=O)NR⁹R¹⁰、-NR⁸SO₂R⁹、-N=CR⁸R⁹、-SR⁸、-SOR⁸、-SO₂R⁸、-SO₂NR⁸R⁹、-NR⁸SO₂NR⁹R¹⁰、-OSO₂NR⁸R⁹および擬ハロゲンより選択される基；

または、一置換もしくは多置換されていてもよいC₁₋₆アルキル、C₂₋₆アルケニル、C₂₋₆アルキニル、C₃₋₆シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールより選択される基（置換基は、同一でも異なっていてもよく、ハロゲン、-NO₂、-OR⁸、-C(=O)R⁸、-C(=O)OR⁸、-C(=O)NR⁸R⁹、-NR⁸R⁹、-NR⁸COR⁹、-NR⁸C(=O)OR⁹、-NR⁸C(=O)NR⁹R¹⁰、-NR⁸C(=O)ONR⁹R¹⁰、-NR⁸SO₂R⁹、-N=CR⁸R⁹、-SR⁸、-SOR⁸、-SO₂R⁸、-SO₂NR⁸R⁹、-NR⁸SO₂NR⁹R¹⁰、-OSO₂NR⁸R⁹および擬ハロゲンより選択される）を表し；

R⁶、R⁷は、それぞれ互いに独立に、水素または一置換もしくは多置換されていてもよいC₁₋₁₆アルキル、C₂₋₁₆アルケニル、C₂₋₁₆アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールより選択される基（置換基は、同一でも異なっていてもよく、ハロゲン、-NO₂、-OR⁸、-C(=O)R⁸、-C(=O)OR⁸、-C(=O)NR⁸R⁹、-NR⁸R⁹、-NR⁸C(=O)R⁹、-NR⁸C(=O)OR⁹、-NR⁸C(=O)NR⁹R¹⁰、-NR⁸C(=O)ONR⁹R¹⁰、-NR⁸SO₂R⁹、-N=CR⁸R⁹、-SR⁸、-

SOR^8 、 $-\text{SO}_2\text{R}^8$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{NR}^8\text{SO}_2\text{NR}^9\text{R}^{10}$ 、 $-\text{OSO}_2\text{NR}^8\text{R}^9$ および擬ハロゲンより選択される)を表し;

R^8 、 R^9 および R^{10} は、それぞれ互いに独立に、水素または置換されていてもよい C_{1-8} アルキル、 C_{2-8} アルケニル、 C_{2-8} アルキニル、シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールより選択される基(置換基は、同一でも異なっていてもよく、ハロゲン、メチル、エチル、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、 $-\text{OH}$ および擬ハロゲンより選択される)を表し;

n は、0、1、2 または 3 を表す)

の化合物であって、その互変異性体、ラセミ化合物、エナンチオマー、ジアステレオマーおよびその混合物の形体にあってもよく、また、その薬理学的に許容される酸付加塩の形体にあってもよい前記化合物。

【請求項 2】

式中、W は $\text{C}-\text{R}^4$ を表す、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

式中、 R^b は水素、 $-\text{F}$ 、 $-\text{Cl}$ 、メチルおよびエチルより選択される基を表す、請求項 1 または 2 記載の化合物。

【請求項 4】

式中、 R^a と R^c は、それぞれ互いに独立に、水素またはフッ素;
あるいは、一置換もしくは多置換されていてもよい C_{1-2} アルキル、 C_2 アルケニル、 C_2 アルキニル、 C_{3-6} シクロアルキル、アリール、ヘテロシクリルおよびヘテロアリールより選択される基(置換基は、同一でも異なっていてもよく、水素、ハロゲン、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{OR}^8$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{R}^8$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{OR}^8$ 、 $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{NR}^8\text{C}(=\text{O})\text{R}^9$ 、 $-\text{NR}^8\text{C}(=\text{O})\text{OR}^9$ 、 $-\text{NR}^8\text{C}(=\text{O})\text{NR}^9\text{R}^{10}$ 、 $-\text{NR}^8\text{C}(=\text{O})\text{ONR}^9\text{R}^{10}$ 、 $-\text{NR}^8\text{SO}_2\text{R}^9$ 、 $-\text{N}=\text{CR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{SR}^8$ 、 $-\text{SOR}^8$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^8$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^8\text{R}^9$ 、 $-\text{NR}^8\text{S}\text{O}_2\text{NR}^9\text{R}^{10}$ 、 $-\text{OSO}_2\text{NR}^8\text{R}^9$ および擬ハロゲンより選択される)を表す、請求項 1 から 3 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 5】

式中、 R^a 、 R^c は、それぞれ互いに独立に、水素またはフッ素を表す、請求項 1 から 4 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 6】

式中、 R^1 と R^2 は、それぞれ互いに独立に、水素または置換されていてもよい C_{1-3} アルキル、 C_{2-3} アルケニル、 C_{2-3} -アルキニルを表し、

あるいは R^1 と R^2 は、一緒になって飽和もしくは部分的に不飽和の 2-5-員アルキル架橋($-\text{CH}_2-$ 基は O、S、 $-\text{NR}^8$ により置換されていてもよい、または、 $-\text{CH}-$ 基は N により置換されていてもよい)を形成する、請求項 1 から 5 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 7】

式中、 R^5 は、水素、メチル、エチル、ヒドロキシ、メトキシ、エトキシ、アミノ、メチルアミノ、ジメチルアミノ、F、Cl、Br、O-プロパルギル、CN、メチルチオ、 CONH_2 、エチニル、プロピニル、ブチニルまたはアリルを表す、請求項 1 から 6 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 8】

式中、 Q_1 はピペラジニルまたはホモピペラジニルを表す、請求項 1 から 7 のいずれか 1 項記載の化合物。

【請求項 9】

請求項 1 から 8 のいずれか 1 項記載の式(1)の化合物を含む医薬組成物。

【請求項 10】

請求項 1 から 8 のいずれか 1 項記載の式(1)の化合物を含む、抗増殖活性を有する医薬組成物。

【請求項 11】

癌、細菌およびウィルス感染症、炎症性および自己免疫性疾患、化学療法による脱毛症および粘膜炎、心臓血管疾患、腎臓疾患、並びに慢性および急性の神経変性疾患より選択

される疾患の治療および/または予防のための医薬組成物を調製するための、請求項1から8のいずれか1項記載の式(1)の化合物の使用。

【請求項12】

キナーゼを阻害するための医薬組成物を調製するための、請求項1から8のいずれか1項記載の式(1)の化合物の使用。

【請求項13】

ポロ様キナーゼがPLK1である、請求項11記載の使用。

【請求項14】

ポロ様キナーゼの過剰発現に基づく腫瘍性疾患の治療および/または予防のための医薬組成物を調製するための、式(1)の化合物の使用。

【請求項15】

請求項1から8のいずれか1項記載の式1の化合物を含む、癌、細菌およびウィルス感染症、炎症性および自己免疫性疾患、化学療法による脱毛症および粘膜炎、心臓血管疾患、腎臓疾患、並びに慢性および急性の神経変性疾患より選択される疾患の治療および/または予防のための医薬組成物。

【請求項16】

活性物質として1または2以上の一般式(I)の化合物を含む医薬製剤であって、従来型の賦形剤および/または担体と混合されていてもよい前記医薬製剤。