

【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19年2月15日(2007.2.15)

【公表番号】特表2006-518756(P2006-518756A)

【公表日】平成18年8月17日(2006.8.17)

【年通号数】公開・登録公報2006-032

【出願番号】特願2006-503797(P2006-503797)

【国際特許分類】

**A 6 1 K 31/404 (2006.01)**

**A 6 1 K 31/5377 (2006.01)**

**A 6 1 P 19/08 (2006.01)**

**A 6 1 P 19/10 (2006.01)**

**A 6 1 P 43/00 (2006.01)**

**A 6 1 P 35/04 (2006.01)**

C 0 7 D 403/06 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 P 19/08

A 6 1 P 19/10

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 35/04

C 0 7 D 403/06

C 0 7 D 401/14

【手続補正書】

【提出日】平成18年12月19日(2006.12.19)

【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

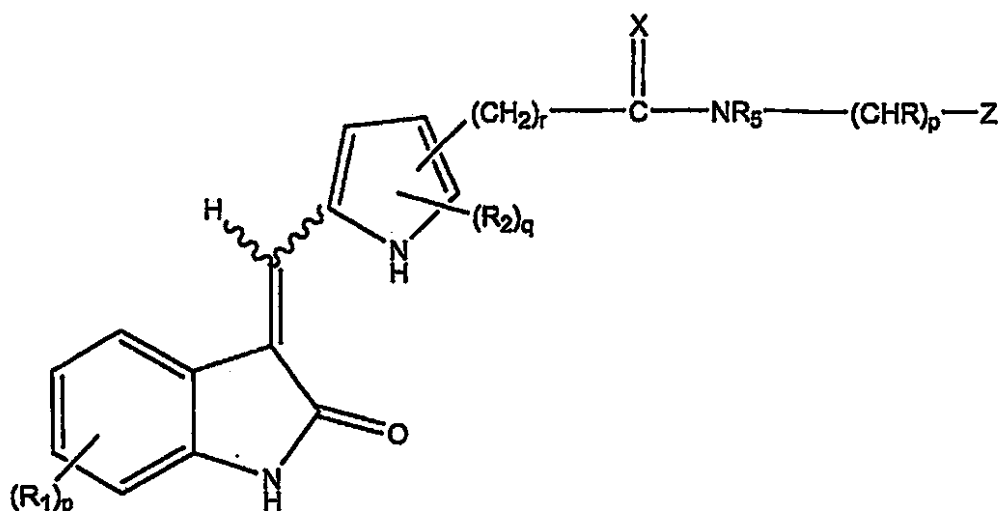
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

患者における過度の骨溶解を治療するための医薬組成物であって、化学式I：

## 【化 1】



[ 式中、R は、独立に、H、OH、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、アルコキシ、複素環及びアミノであり；

各  $R_1$  は、アルキル、ハロ、アリール、アルコキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、シクロアルキル、ヘテロアリール、複素環、ヒドロキシ、 $-C(O)-R_8$ 、 $-NR_9R_{10}$ 、 $-NR_9C(O)-R_{12}$  及び  $-C(O)NR_9R_{10}$  からなる群より独立に選択され；

各  $R_2$  は、アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-C(O)-R_8$  及び  $SO_2R''$  ( $R''$  は、アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $NR_9N_{10}$  またはアルコキシである) からなる群より独立に選択され；

各  $R_5$  は、水素、アルキル、アリール、ハロアルキル、シクロアルキル、ヘテロアリール、複素環、ヒドロキシ、 $-C(O)-R_8$  及び  $(CHR)_rR_{11}$  からなる群より独立に選択され；

X は、O または S であり；

p は、0 ~ 3 であり；

q は、0 ~ 2 であり；

r は、0 ~ 3 であり；

$R_8$  は、 $-OH$ 、アルキル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、シクロアルキル及び複素環からなる群より選択され；

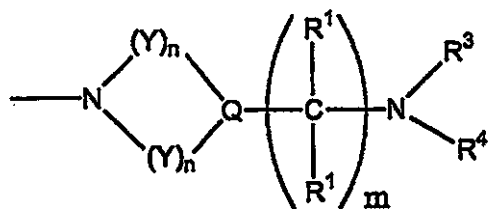
$R_9$  及び  $R_{10}$  は、独立に、H、アルキル、アリール、アミノアルキル、ヘテロアリール、シクロアルキル及び複素環からなる群より選択されるか、あるいは、 $R_9$  及び  $R_{10}$  は、N と一緒になって、環原子が C、N、O 及び S からなる群より選択される環を形成してもよく；

$R_{11}$  は、 $-OH$ 、アミノ、一置換アミノ、二置換アミノ、アルキル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、シクロアルキル及び複素環からなる群より選択され；

$R_{12}$  は、アルキル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、シクロアルキル及び複素環からなる群より選択され；

Z は、OH、O-アルキル、または  $-NR_3R_4$ 、ここで  $R_3$  及び  $R_4$  は、水素、アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及び複素環からなる群より独立に選択されるか、あるいは、 $R_3$  及び  $R_4$  は、N と結合して、環原子が  $CH_2$ 、N、O、S からなる群より選択される環を形成してもよく、または

## 【化 2】



(式中、Yは、独立に、 $\text{CH}_2$ 、O、NまたはSであり、

Qは、CまたはNであり；

nは、独立に、0～4であり；そして、

mは0～3である)である]

の化合物またはその塩を含む、上記医薬組成物。

## 【請求項 2】

$\text{R}_1$  がハロ、かつ p が 1 である、請求項 1 に記載の 医薬組成物。

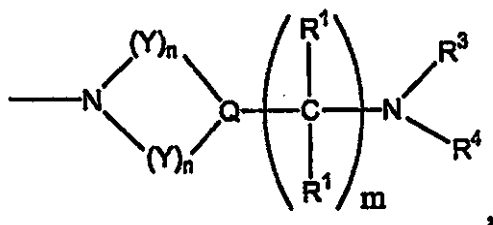
## 【請求項 3】

Z が  $-\text{NR}_3\text{R}_4$  であって、ここで  $\text{R}_3$  及び  $\text{R}_4$  はモルホリン環を形成する、請求項 2 に記載の 医薬組成物。

## 【請求項 4】

Z が以下：

## 【化 3】



であって、ここで各 Y は  $\text{CH}_2$ 、各 n は 2、m は 0、そして  $\text{R}_3$  及び  $\text{R}_4$  はモルホリン環を形成する、請求項 1 に記載の 医薬組成物。

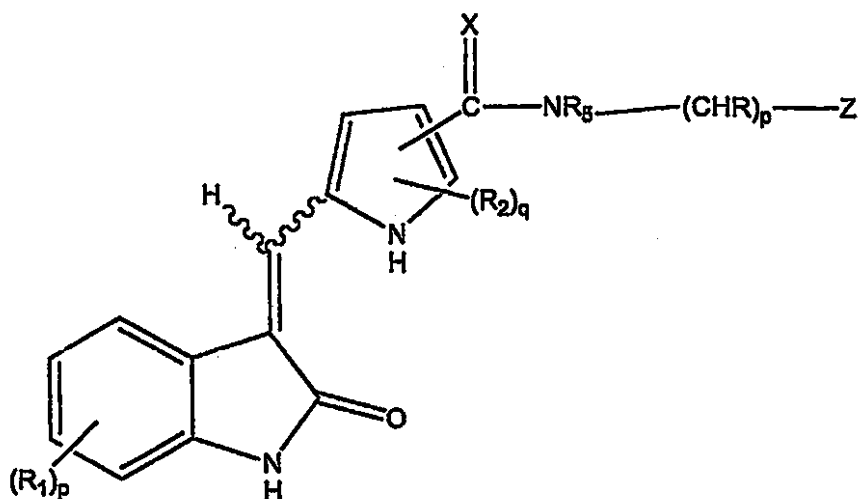
## 【請求項 5】

$\text{R}_2$  がメチル、かつ q が 2 であって、ここで該メチルは 3 位及び 5 位に結合する、請求項 1～3 のいずれかに記載の 医薬組成物。

## 【請求項 6】

化合物が化学式 II：

## 【化 4】



(II).

の化合物である、請求項 1 に記載の 医薬組成物。

【請求項 7】

$R_5$  が H である、請求項 6 に記載の 医薬組成物。

【請求項 8】

$R_2$  がメチル、 $q$  が 2 であって、ここで該メチルは 3 位及び 5 位に結合する、請求項 6 に記載の 医薬組成物。

【請求項 9】

患者が骨に転移している癌を有する、請求項 6 に記載の 医薬組成物。

【請求項 10】

患者が M - C S F を分泌する癌を有する、請求項 6 に記載の 医薬組成物。

【請求項 11】

患者が骨粗鬆症を有する、請求項 6 に記載の 医薬組成物。

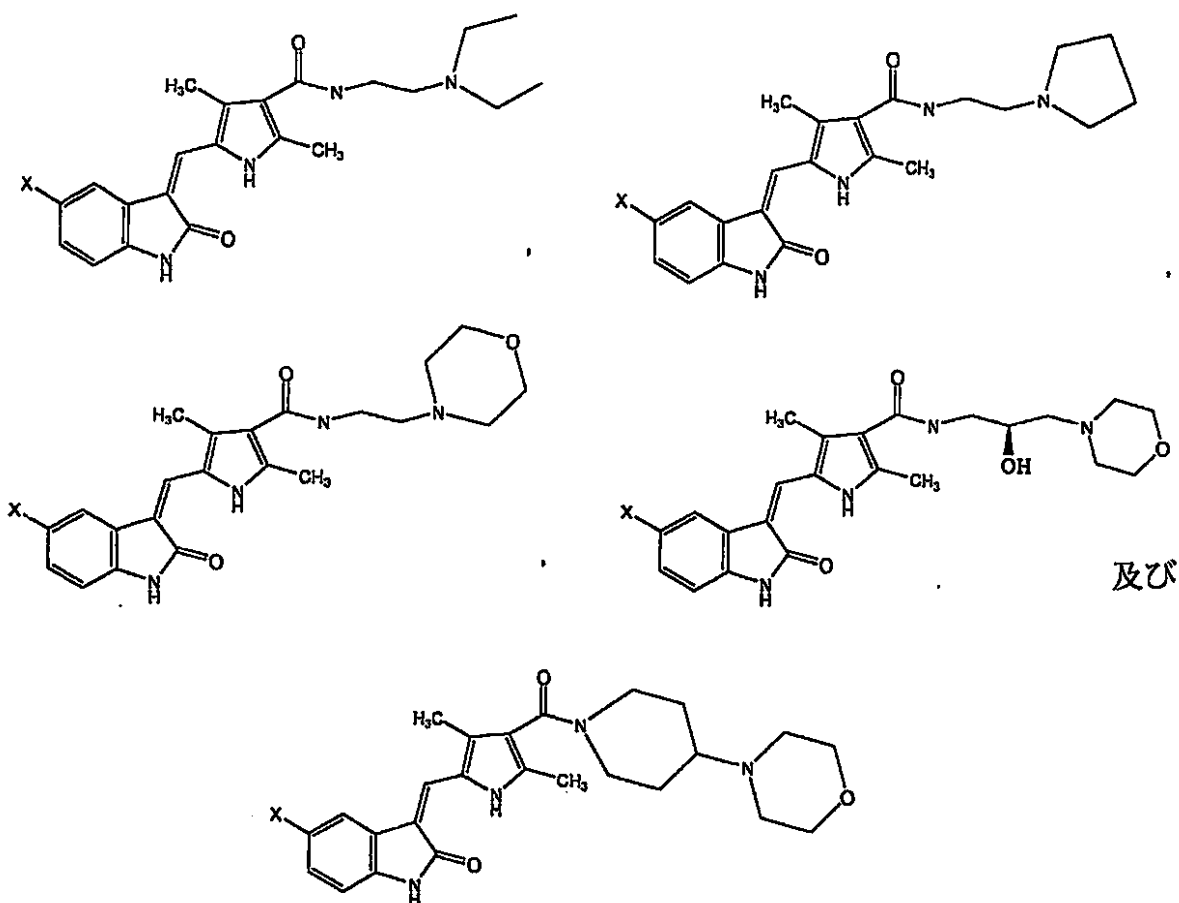
【請求項 12】

患者が閉経後である、請求項 6 に記載の 医薬組成物。

【請求項 13】

化合物が以下からなる群より選択される、請求項 1 に記載の 医薬組成物：

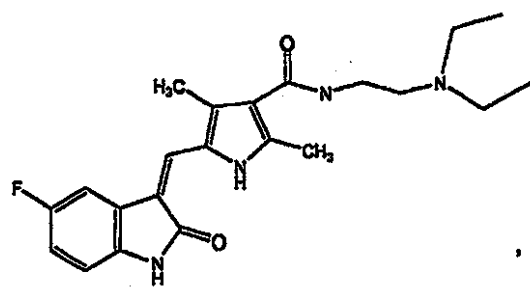
【化 5】



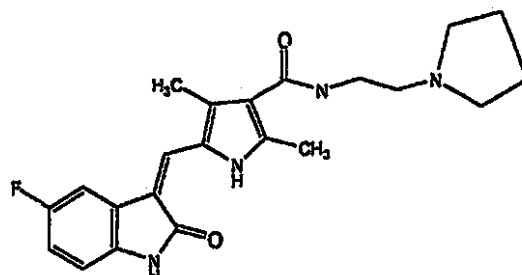
【請求項 14】

化学式 I の化合物が以下からなる群より選択される、請求項 1 に記載の 医薬組成物：

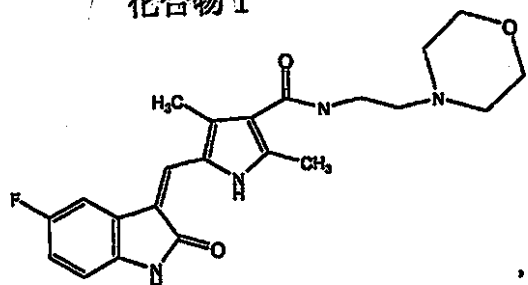
## 【化 6】



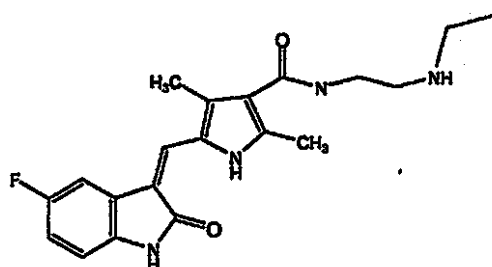
化合物 1



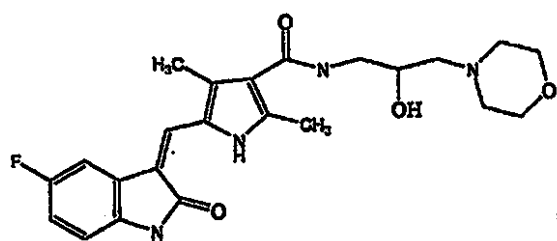
化合物 2



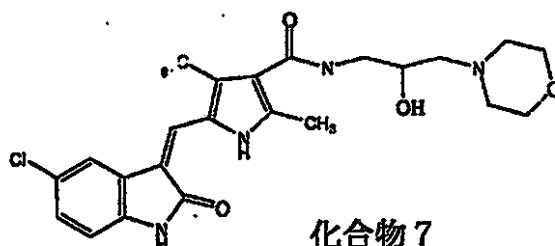
化合物 3



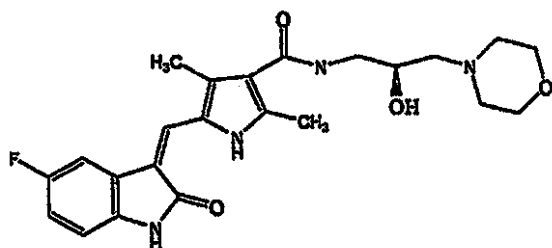
化合物 8



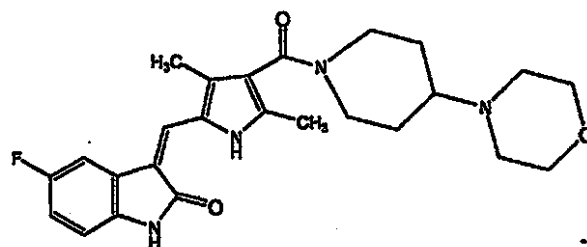
化合物 6



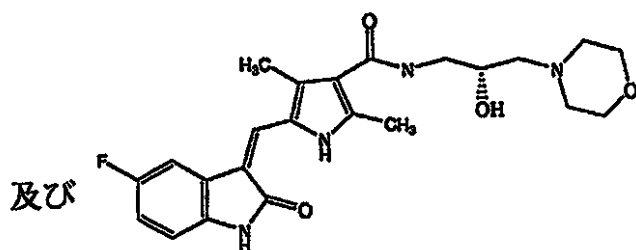
化合物 7



化合物 4



化合物 9

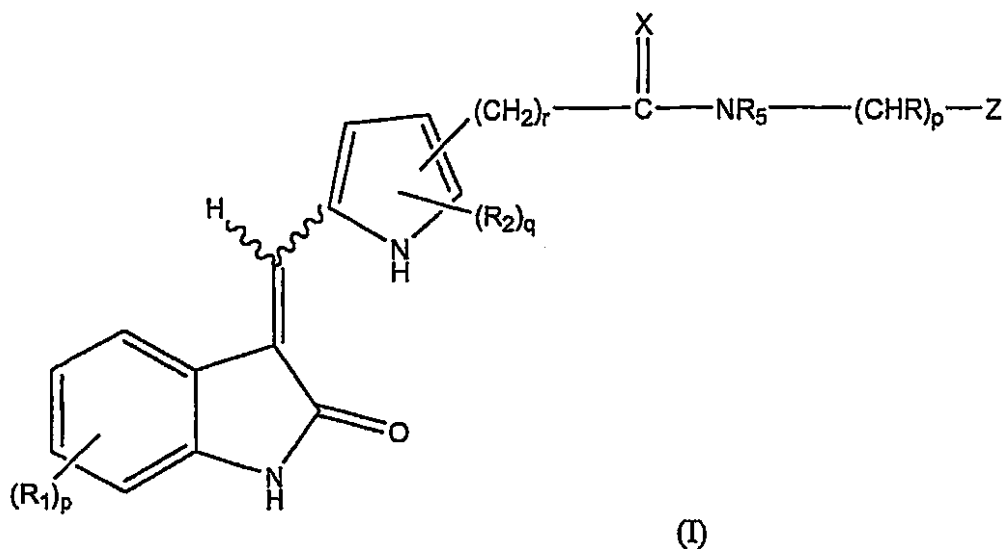


化合物 5

## 【請求項 15】

C S F 1 R のリン酸化の阻害を必要とする患者において、C S F 1 R のリン酸化を阻害するための医薬組成物であって、化学式 I :

## 【化 7】



[ 式中、R は、独立に、H、OH、アルキル、アリール、シクロアルキル、ヘテロアリール、アルコキシ、複素環及びアミノであり；

各  $R_1$  は、アルキル、ハロ、アリール、アルコキシ、ハロアルキル、ハロアルコキシ、シクロアルキル、ヘテロアリール、複素環、ヒドロキシ、 $-C(O)-R_8$ 、 $-NR_9R_{10}$ 、 $-NR_9C(O)-R_{12}$  及び  $-C(O)NR_9R_{10}$  からなる群より独立に選択され；

各  $R_2$  は、アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $-C(O)-R_8$  及び  $SO_2R''$  ( $R''$  は、アルキル、アリール、ヘテロアリール、 $NR_9$ 、 $N_{10}$  またはアルコキシである) からなる群より独立に選択され；

各  $R_5$  は、水素、アルキル、アリール、ハロアルキル、シクロアルキル、ヘテロアリール、複素環、ヒドロキシ、 $-C(O)-R_8$  及び  $(CHR)_rR_{11}$  からなる群より独立に選択され；

X は、O または S であり；

p は、0 ~ 3 であり；

q は、0 ~ 2 であり；

r は、0 ~ 3 であり；

$R_8$  は、 $-OH$ 、アルキル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、シクロアルキル及び複素環からなる群より選択され；

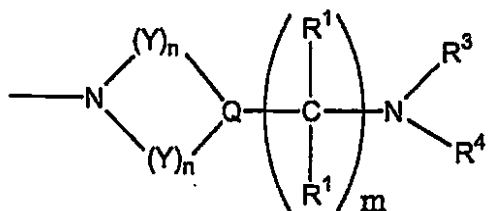
$R_9$  及び  $R_{10}$  は、独立に、H、アルキル、アリール、アミノアルキル、ヘテロアリール、シクロアルキル及び複素環からなる群より選択されるか、あるいは、 $R_9$  及び  $R_{10}$  は、N と一緒になって、環原子が C、N、O 及び S からなる群より選択される環を形成してもよく；

$R_{11}$  は、 $-OH$ 、アミノ、一置換アミノ、二置換アミノ、アルキル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、シクロアルキル及び複素環からなる群より選択され；

$R_{12}$  は、アルキル、アリール、ヘテロアリール、アルコキシ、シクロアルキル及び複素環からなる群より選択され；

Z は、OH、O-アルキル、または  $-NR_3R_4$ 、ここで  $R_3$  及び  $R_4$  は、水素、アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル及び複素環からなる群より独立に選択されるか、あるいは、 $R_3$  及び  $R_4$  は、N と結合して、環原子が  $CH_2$ 、N、O、S からなる群より選択される環を形成してもよく、または

## 【化 8】



( 式中、Y は、独立に、CH<sub>2</sub>、O、N または S であり、  
 Q は、C または N であり；  
 n は、独立に、0 ～ 4 であり；そして、  
 m は 0 ～ 3 である ) である ]  
 の化合物を含む、上記医薬組成物。