

【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

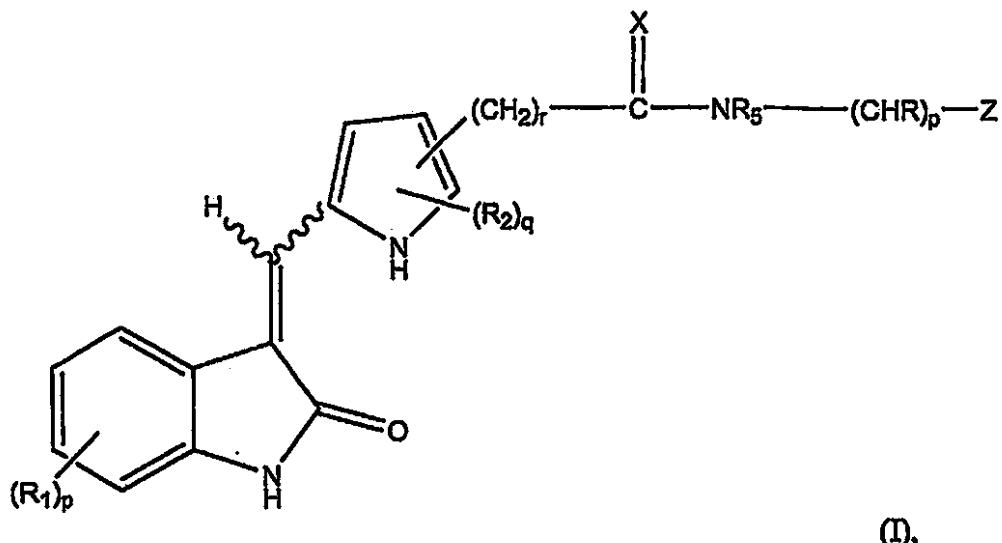
【補正の内容】

【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】



(I),

[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<sub>8</sub>、-NR<sub>9</sub>R<sub>10</sub>、-NR<sub>9</sub>C(O)-R<sub>12</sub>及び-C(O)NR<sub>9</sub>R<sub>10</sub>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<sub>8</sub>及びSO<sub>2</sub>R" (R"は、アルキル、アリール、ヘテロアリール、NR<sub>9</sub>、N<sub>10</sub>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<sub>8</sub>及び(CHR)<sub>r</sub>R<sub>11</sub>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<sub>8</sub>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；

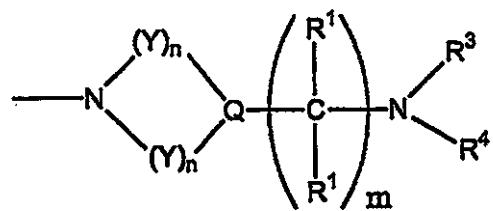
R<sub>9</sub>及びR<sub>10</sub>は、独立に、H、アルキル、アリール、アミノアルキル、ヘテロアリール、シクロアルキル及び複素環からなる群より選択されるか、あるいは、R<sub>9</sub>及びR<sub>10</sub>は、Nと一緒にになって、環原子がC、N、O及びSからなる群より選択される環を形成してもよく；

R<sub>11</sub>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<sub>12</sub>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<sub>3</sub>R<sub>4</sub>、ここでR<sub>3</sub>及びR<sub>4</sub>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<sub>3</sub>及びR<sub>4</sub>は、Nと結合して、環原子がCH<sub>2</sub>、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、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】

の化合物またはその塩を含む、上記医薬組成物。

【請求項2】

R<sub>1</sub>がハロ、かつpが1である、請求項1に記載の医薬組成物。

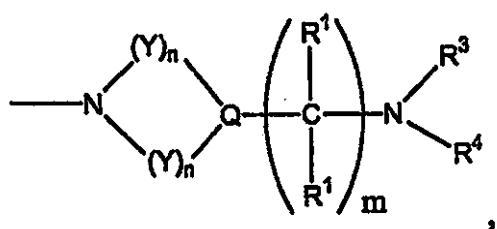
【請求項3】

Zが-NR<sub>3</sub>R<sub>4</sub>であって、ここでR<sub>3</sub>及びR<sub>4</sub>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CH<sub>2</sub>、各nは2、mは0、そしてR<sub>3</sub>及びR<sub>4</sub>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。

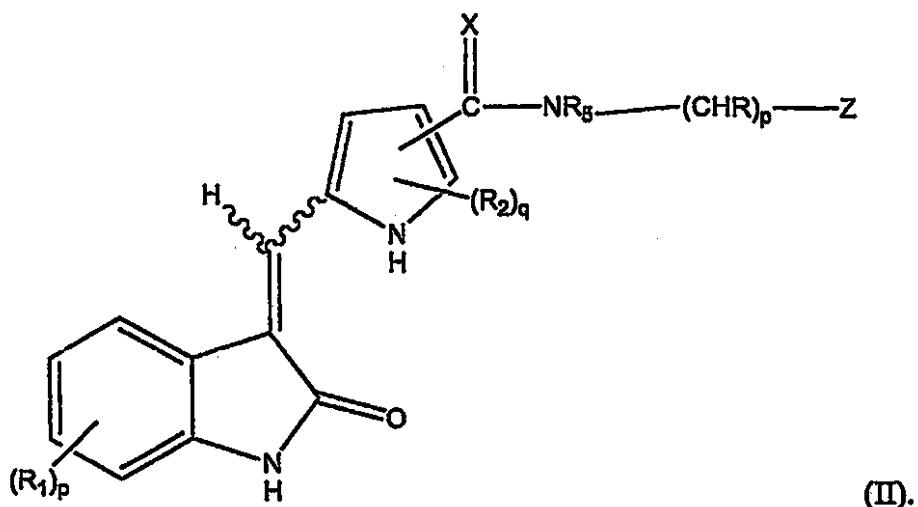
【請求項5】

R<sub>2</sub>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】



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。

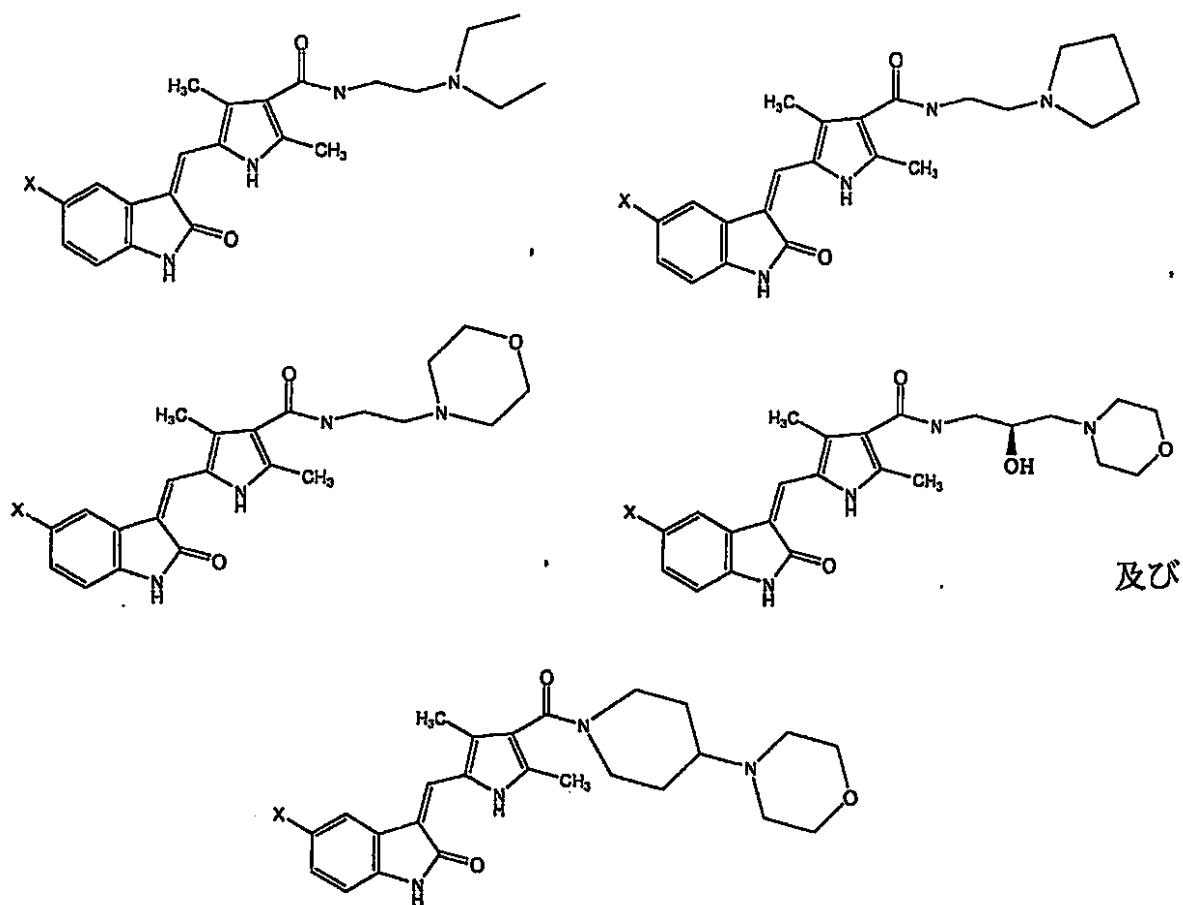
【請求項 12】

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：

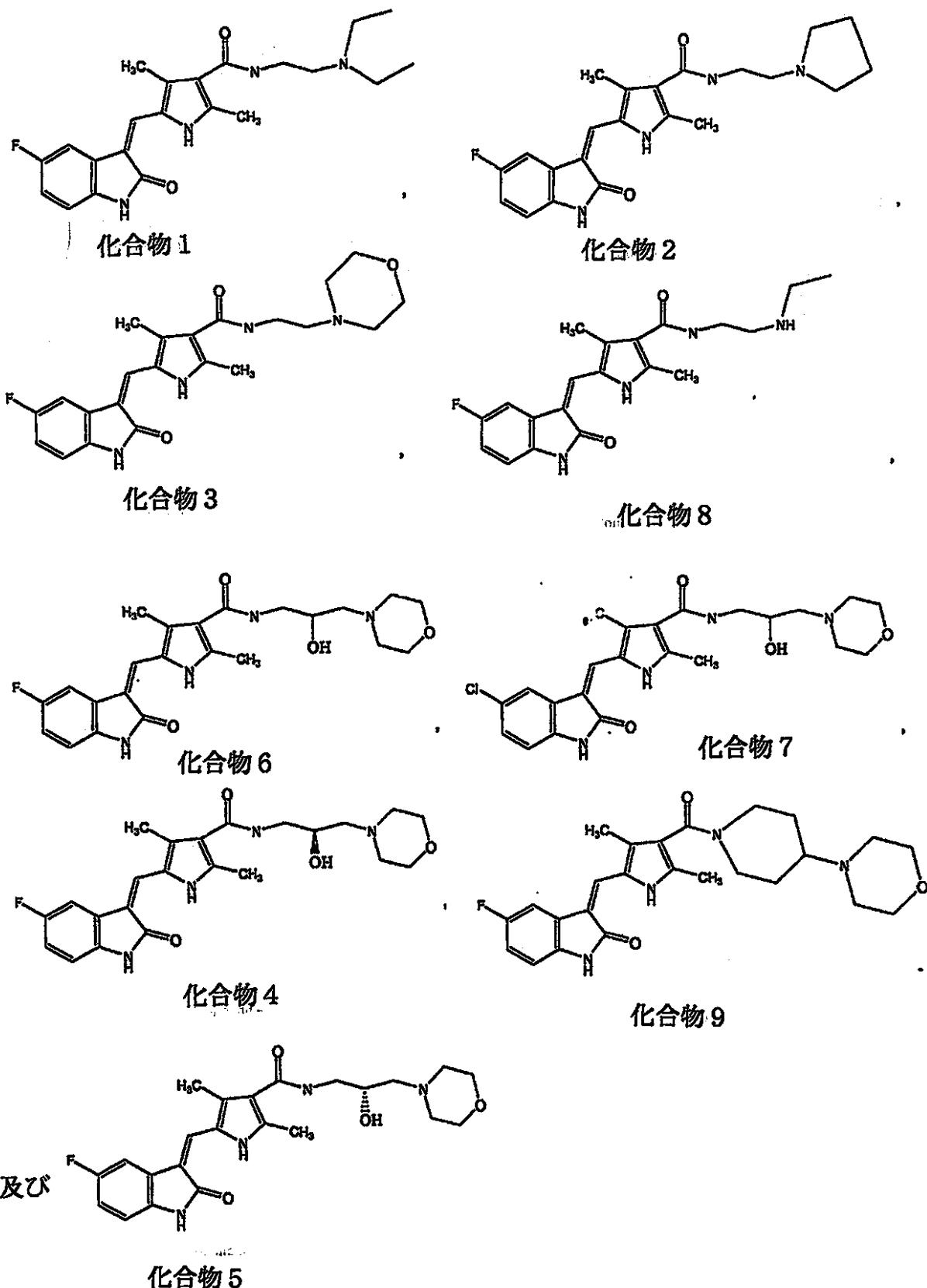
【化 5】



【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：

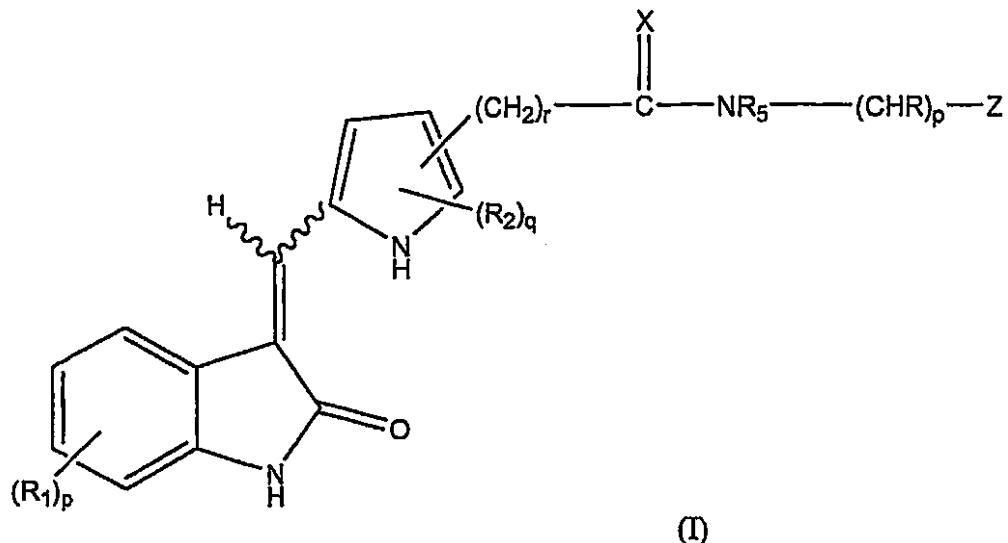
【化6】



【請求項 1 5】

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<sub>1</sub>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<sub>8</sub>、-NR<sub>9</sub>R<sub>10</sub>、-NR<sub>9</sub>C(O)-R<sub>12</sub>及び-C(O)NR<sub>9</sub>R<sub>10</sub>からなる群より独立に選択され；

各R<sub>2</sub>は、アルキル、アリール、ヘテロアリール、-C(O)-R<sub>8</sub>及びSO<sub>2</sub>R" (R"は、アルキル、アリール、ヘテロアリール、NR<sub>9</sub>N<sub>10</sub>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<sub>5</sub>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<sub>8</sub>及び(CHR)<sub>r</sub>R<sub>11</sub>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<sub>8</sub>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；

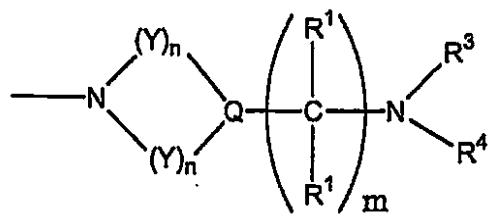
R<sub>9</sub>及びR<sub>10</sub>は、独立に、H、アルキル、アリール、アミノアルキル、ヘテロアリール、シクロアルキル及び複素環からなる群より選択されるか、あるいは、R<sub>9</sub>及びR<sub>10</sub>は、Nと一緒にになって、環原子がC、N、O及びSからなる群より選択される環を形成してもよく；

R<sub>11</sub>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<sub>12</sub>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<sub>3</sub>R<sub>4</sub>、ここでR<sub>3</sub>及びR<sub>4</sub>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<sub>3</sub>及びR<sub>4</sub>は、Nと結合して、環原子がCH<sub>2</sub>、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。