

【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3月21日(2008.3.21)

【公表番号】特表2007-520536(P2007-520536A)

【公表日】平成19年7月26日(2007.7.26)

【年通号数】公開・登録公報2007-028

【出願番号】特願2006-551903(P2006-551903)

【国際特許分類】

C 0 7 D 495/04 (2006.01)

C 0 7 D 513/04 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 495/04 1 0 5 Z

C 0 7 D 495/04 C S P

C 0 7 D 513/04 3 5 1

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 19/02

A 6 1 K 31/519

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 9/10 1 0 1

A 6 1 P 9/10

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 17/02

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 35/02

【手続補正書】

【提出日】平成20年2月1日(2008.2.1)

【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

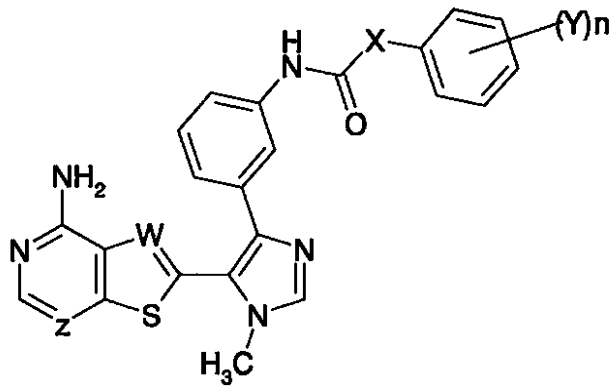
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

【化 1】



式 I

[ 式中 :

Z は、N 及び C H より選択され ;

W は、N 及び C H より選択され ;

X は、NH 及び C H<sub>2</sub> より選択され ;

Y は、F、C l、B r、及び I より選択され ; そして

n は、1、2 又は 3 である ] の化合物とその塩又は溶媒和物。

【請求項 2】

Z が N である、請求項 1 に記載の式 I の化合物とその塩又は溶媒和物。

【請求項 3】

Y が F 及び / 又は C l より選択される、請求項 1 又は請求項 2 に記載の式 I の化合物とその塩又は溶媒和物。

【請求項 4】

以下 :

N - { 3 - [ 5 - ( 4 - アミノチエノ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ] フェニル } - N ' - ( 3 - フルオロフェニル ) 尿素 ;

N - { 3 - [ 5 - ( 4 - アミノチエノ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ] フェニル } - N ' - ( 2 - フルオロフェニル ) 尿素 ;

N - { 3 - [ 5 - ( 4 - アミノチエノ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ] フェニル } - N ' - ( 3 - クロロフェニル ) 尿素 ;

N - { 3 - [ 5 - ( 4 - アミノチエノ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ] フェニル } - N ' - ( 2 - クロロフェニル ) 尿素 ;

N - { 3 - [ 5 - ( 4 - アミノチエノ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ] フェニル } - 2 - ( 3 - フルオロフェニル ) アセトアミド ;

N - { 3 - [ 5 - ( 4 - アミノチエノ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ] フェニル } - 2 - ( 2 - フルオロフェニル ) アセ

トアミド；

N - { 3 - [ 5 - ( 4 - アミノチエノ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ] フェニル } - 2 - ( 3 - クロロフェニル ) アセトアミド；

N - { 3 - [ 5 - ( 4 - アミノチエノ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ] フェニル } - 2 ' - ( 2 - クロロフェニル ) アセトアミド；

N - { 3 - [ 5 - ( 4 - アミノチアゾロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ] フェニル } - N ' - ( 3 - フルオロフェニル ) 尿素；

N - { 3 - [ 5 - ( 4 - アミノチアゾロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ] フェニル } - N ' - ( 2 - フルオロフェニル ) 尿素；

N - { 3 - [ 5 - ( 4 - アミノチアゾロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ] フェニル } - N ' - ( 3 - クロロフェニル ) 尿素；

N - { 3 - [ 5 - ( 4 - アミノチアゾロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ] フェニル } - N ' - ( 2 - クロロフェニル ) 尿素；

N - { 3 - [ 5 - ( 4 - アミノチアゾロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ] フェニル } - 2 - ( 3 - フルオロフェニル ) アセトアミド；

N - { 3 - [ 5 - ( 4 - アミノチアゾロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ] フェニル } - 2 - ( 2 - フルオロフェニル ) アセトアミド；

N - { 3 - [ 5 - ( 4 - アミノチアゾロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ] フェニル } - 2 - ( 3 - クロロフェニル ) アセトアミド；

N - { 3 - [ 5 - ( 4 - アミノチアゾロ [ 2 , 3 - d ] ピリミジン - 6 - イル ) - 1 - メチル - 1 H - イミダゾール - 4 - イル ] フェニル } - 2 - ( 2 - クロロフェニル ) アセトアミドの 1 以上より選択される、請求項 1 に記載の式 I の化合物とその塩又は溶媒和物。

#### 【請求項 5】

請求項 1 ～ 4 のいずれか 1 項に定義される、式 I の化合物又はその医薬的に許容される塩を医薬的に許容される希釈剤又は担体とともに含んでなる医薬組成物。

#### 【請求項 6】

医薬品として使用の、請求項 1 ～ 4 のいずれか 1 項に定義される、式 I の化合物又はその医薬的に許容される塩。

#### 【請求項 7】

請求項 1 ～ 4 のいずれか 1 項に定義される、式 I の化合物又はその医薬的に許容される塩の、ヒトのような温血動物における T i e 2 受容体チロシンキナーゼ阻害剤として使用の医薬品の製造における使用。

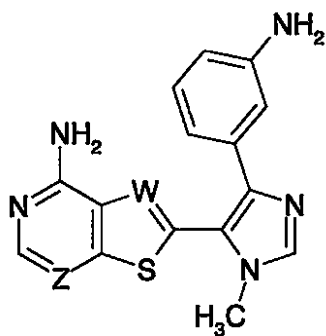
#### 【請求項 8】

請求項 1 ～ 4 のいずれか 1 項に定義される、式 I の化合物又はその医薬的に許容される塩の、ヒトのような温血動物における抗血管新生効果の産生に使用の医薬品の製造における使用。

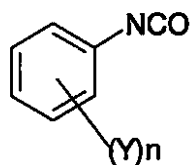
#### 【請求項 9】

式 I の化合物又はその塩又は溶媒和物（ここで、X は NH であり、Z、W、Y、及び n は、式 I に定義される通りである）を製造するための方法であって、式 I I のアミンを式 I I I のイソシアネートと反応させること；

【化 2】



式II



式III

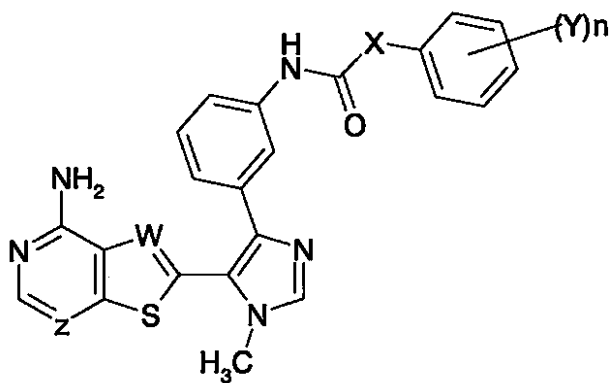
そしてその後必要ならば：

- i) 式(I)の化合物を式(I)の別の化合物へ変換すること；
- ii) 塩又は溶媒和物を生成することを含む、前記方法。

【請求項10】

式I：

【化 3】



式I

[ 式中：

Zは、N及びCHより選択され；

Wは、N及びCHより選択され；

Xは、NH及びCH<sub>2</sub>より選択され；

Yは、F、Cl、Br、及びIより選択され；そして

nは、1、2又は3である]の化合物又はその塩若しくは溶媒和物をヒトのような温血動物に投与することを特徴とする、ヒトのような温血動物の体内で血管新生と関連した疾患状態の治療方法。