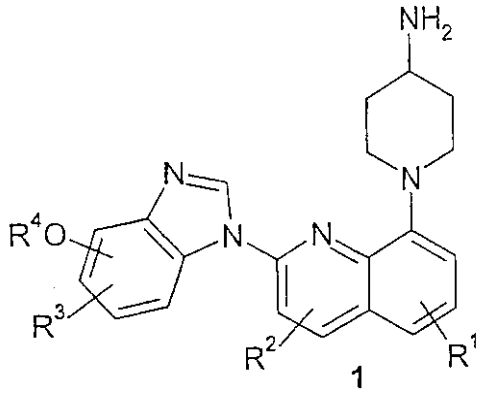
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成18年3月23日(2006.3.23)

【公表番号】特表2006-501309(P2006-501309A)
【公表日】平成18年1月12日(2006.1.12)
【年通号数】公開・登録公報2006-002
【出願番号】特願2004-569727(P2004-569727)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 401/14 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/4709 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/5377 (2006.01)
Ａ６１Ｋ 45/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00 (2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00 (2006.01)
Ｃ０７Ｄ 405/14 (2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 401/14 ＣＳＰ
Ａ６１Ｋ 31/4709
Ａ６１Ｋ 31/5377
Ａ６１Ｋ 45/00
Ａ６１Ｐ 35/00
Ａ６１Ｐ 43/00 １２１
Ｃ０７Ｄ 405/14

【手続補正書】
【提出日】平成18年2月1日(2006.2.1)
【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】
以下の式1：

【化１】



1

｛上式、R^1、R^2、およびR^3がそれぞれ独立にH、C_1～C_6アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、ハロ、シアノ、CF_3、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、OC_1～C_6アルキル、OC_3～C_6シクロアルキル、およびNR^7R^8から選択され、

R^4が－$(CR^5R^6)_n$Hまたは－$(CR^5R^6)_m$（4～10員ヘテロ環）であり、式中nが1～5の範囲の整数、mが0～5の範囲の整数であり、前記4～10員ヘテロ環が芳香族の場合、任意選択で1～3 個のR^1置換基で置換され、前記4～10員ヘテロ環が非芳香族の場合、任意選択で任意の位置で1～3個のR^7置換基で置換、また任意選択でヘテロ原子に隣接または直接結合しない任意の位置で1～3個のR^9置換基で置換され、

R^5およびR^6がそれぞれ独立にHまたはC_1～C_6アルキルから選択され、

R^7およびR^8がそれぞれ独立にH、C_1～C_6アルキル、およびC_3～C_6シクロアルキルから選択され、そして

R^9がそれぞれ独立にハロ、シアノ、CF_3、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、OC_1～C_6アルキル、OC_3～C_6シクロアルキル、およびNR^7R^8から選択される。｝で表される化合物、あるいはその薬学的に許容できる塩、プロドラッグ、水和物、または溶媒和化合物。

【請求項２】

R^4が－$(CR^5R^6)_n$Hである、請求項1に記載の化合物。

【請求項３】

R^4が－$(CR^5R^6)_m$（4～10員ヘテロ環）であり、mが0～5の範囲の整数であり、前記4～10員ヘテロ環基が任意選択で任意の位置で1～3個のR^7置換基で置換、また任意選択でヘテロ原子に隣接または直接結合しない任意の位置で1～3個のR^9置換基で置換される、請求項1に記載の化合物。

【請求項４】

前記4～10員ヘテロ環が、ピロリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、モルホリノ、およびオキセタニルからなる群から選択される、請求項3に記載の化合物。

【請求項５】

R^4の前記ヘテロ環基が1個のO原子を含有する、請求項3に記載の化合物。

【請求項６】

R^4が－$(CR^5R^6)_m$（4員非芳香族ヘテロ環）であり、mが0～1の範囲の整数であり、また前記4員非芳香族ヘテロ環基が任意選択で任意の位置で1～3個のR^7置換基で置換、また任意選択でヘテロ原子に隣接または直接結合しない任意の位置で1～3個のR^9置換基で置換される、請求項3に記載の化合物。

【請求項７】

前記4～10員ヘテロ環が、アゼチジニル、チアゾリル、キノリニル、ピロリジニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロチエニル、テトラヒドロピラニル、テトラヒドロチオピラニル、ピペリジノ、モルホリノ、チオモルホリノ、ピペラジニル、ホモピペラジニル、オキセタニル、ホモピペリジニル、インドリニル、ジオキサニル、3－アザビシクロ[3．1．0]ヘキサニル、3－アザビシクロ[4．1．0]ヘプタニル、アザビシクロ[2．2．2]ヘキサニル、および3H－インドリルからなる群から選択される、請求項6に記載の化合物。

【請求項８】

前記4～10員ヘテロ環が、テトラヒドロフラニル、モルホリノ、オキセタニル、および4H－ピラニルからなる群から選択される、請求項7に記載の化合物。

【請求項９】

1－｛2－[5－（3－モルホリン－4－イル－プロポキシ）－ベンゾイミダゾール－1－イル]－キノリン－8－イル｝－ピペリジン－4－イルアミン、

（±）－1－｛2－[5－（テトラヒドロ－フラン－3－イルオキシ）－ベンゾイミダゾール－1－イル]－キノリン－8－イル｝－ピペリジン－4－イルアミン、

（＋）－1－｛2－[5－（テトラヒドロ－フラン－3－イルオキシ）－ベンゾイミダゾール－1－イル]－キノリン－8－イル｝－ピペリジン－4－イルアミン、

（－）－1－｛2－[5－（テトラヒドロ－フラン－3－イルオキシ）－ベンゾイミダゾール－1－イル]－キノリン－8－イル｝－ピペリジン－4－イルアミン、

1－｛2－[5－（3－メチル－オキセタン－3－イルメトキシ）－ベンゾイミダゾール－1－イル]－キノリン－8－イル｝－ピペリジン－4－イルアミン、

1－[2－（5－イソブトキシ－ベンゾイミダゾール－1－イル）－キノリン－8－イル]－ピペリジン－4－イルアミン、

1－｛2－[5－（テトラヒドロ－ピラン－4－イルオキシ）－ベンゾイミダゾール－1－イル]－キノリン－8－イル｝－ピペリジン－4－イルアミン、および上記これら化合物の薬学的に許容できる塩、プロドラッグ、水和物、および溶媒和化合物からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項１０】

1－｛2－[5－（3－モルホリン－4－イル－プロポキシ）－ベンゾイミダゾール－1－イル]－キノリン－8－イル｝－ピペリジン－4－イルアミン、1－｛2－[5－（3－メチル－オキセタン－3－イルメトキシ）－ベンゾイミダゾール－1－イル]－キノリン－8－イル｝－ピペリジン－4－イルアミン、および上記これら化合物の薬学的に許容できる塩、プロドラッグ、水和物、および溶媒和化合物からなる群から選択される、請求項9に記載の化合物。

【請求項１１】

前記塩がベンゼンスルホン酸塩である、請求項10に記載の化合物。

【請求項１２】

異常細胞増殖の治療に効果のある請求項1の化合物の有効量を含む、前記哺乳類の異常細胞増殖の治療用医薬組成物。

【請求項１３】

有糸分裂阻害剤、アルキル化剤、代謝拮抗物質、挿入性抗生物質、成長因子阻害剤、細胞周期阻害剤、酵素、トポイソメラーゼ阻害剤、生体応答調整物質、抗ホルモン、血管形成阻害剤、および抗アンドロゲンからなる群から選択される抗腫瘍剤と併用して請求項1に記載の式1の化合物、あるいはその薬学的に許容できる塩、プロドラッグ、または水和物の治療上有効な量を含む、前記哺乳類の過剰増殖障害の治療用医薬組成物。

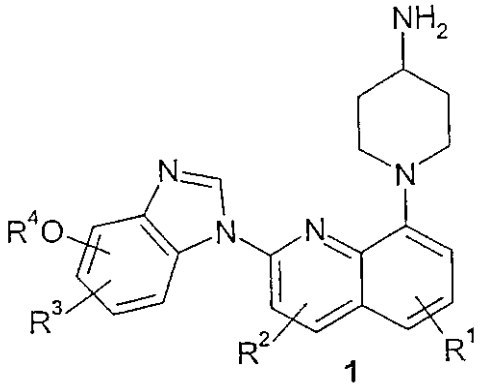
【請求項１４】

異常細胞増殖の治療に効果のある請求項1の化合物の量、および薬学的に許容できる担体を含む哺乳類の異常細胞増殖の治療用医薬組成物。

【請求項１５】

以下の式1：

【化２】



1

{式1中、R^1、R^2、およびR^3がそれぞれ独立にH、C_1～C_6アルキル、C_3～C_6シクロアルキル、ハロ、シアノ、CF_3、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、OC_1～C_6アルキル、OC_3～C_6シクロアルキル、およびNR^7R^8から選択され、

R^4が－$(CR^5R^6)_n$Hまたは－$(CR^5R^6)_m$（4～10員ヘテロ環）であり、式中nが1～5の範囲の整数、mが0～5の範囲の整数であり、前記4～10員ヘテロ環が芳香族の場合、任意選択で1～3 個のR^1置換基で置換され、前記4～10員ヘテロ環が非芳香族の場合、任意選択で任意の位置で1～3個のR^7置換基で置換、また任意選択でヘテロ原子に隣接または直接結合しない任意の位置で1～3個のR^9置換基で置換され、

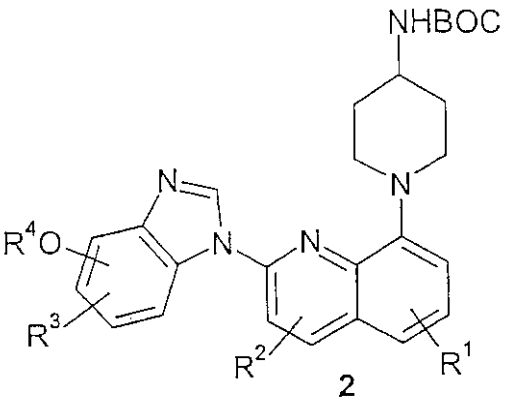
R^5およびR^6がそれぞれ独立にHまたはC_1～C_6アルキルから選択され、

R^7およびR^8がそれぞれ独立にH、C_1～C_6アルキル、およびC_3～C_6シクロアルキルから選択され、そして

R^9がそれぞれ独立にハロ、シアノ、CF_3、ジフルオロメトキシ、トリフルオロメトキシ、OC_1～C_6アルキル、OC_3～C_6シクロアルキル、およびNR^7R^8から選択される。}

で表される化合物、あるいはその薬学的に許容できる塩、プロドラッグ、水和物、または溶媒和化合物の製造方法であって、以下の式2：

【化３】



2

{式中、でR^1、R^2、R^3、およびR^4は上記で式1の化合物について定義したとおりである。}

で表される化合物を酸で処理して式1の化合物を得るステップを含む、前記方法。