

【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8月14日(2008.8.14)

【公開番号】特開2005-320351(P2005-320351A)

【公開日】平成17年11月17日(2005.11.17)

【年通号数】公開・登録公報2005-045

【出願番号】特願2005-211959(P2005-211959)

【国際特許分類】

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 5/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 19/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 403/14 (2006.01)

C 0 7 D 453/02 (2006.01)

A 6 1 K 31/439 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/541 (2006.01)

A 6 1 K 31/551 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 403/12

A 6 1 P 3/00

A 6 1 P 5/00

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 13/08

A 6 1 P 19/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 43/00

A 6 1 P 43/00

1 1 1

C 0 7 D 403/14

C 0 7 D 453/02

A 6 1 K 31/439
 A 6 1 K 31/506
 A 6 1 K 31/5377
 A 6 1 K 31/541
 A 6 1 K 31/551

【手続補正書】

【提出日】平成20年7月2日(2008.7.2)

【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

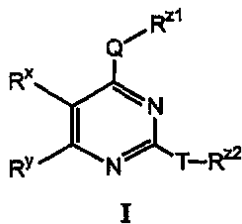
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式Iの化合物：

【化1】



を調製する方法であって、ここで：

QおよびTは、それぞれ別個に、酸素、イオウまたはN(R)から選択される；

各Rは、別個に、水素または必要に応じて置換したC₁ - 6脂肪族基から選択され、ここで：

同じ窒素原子に結合した2個のRは、必要に応じて、窒素と一緒に、必要に応じて置換した3員～7員の単環式または8員～10員の二環式の飽和、部分不飽和または完全不飽和環を形成し、該環は、それに結合した窒素に加えて、0個～3個のヘテロ原子を有し、該ヘテロ原子は、別個に、窒素、酸素またはイオウから選択される；

R^xは、U-R⁵である；R⁵は、ハロゲン、NO₂、CN、RまたはArから選択される；各Uは、別個に、原子価結合またはC₁ - 4アルキリデン鎖から選択され、ここで：Uの2個までのメチレン単位は、必要に応じて、別個に、-O-、-S-、-SO-、-SO₂-、-N(R)SO₂-、-SO₂N(R)-、-N(R)-、-C(O)-、-CO₂-、-N(R)C(O)-、-N(R)C(O)O-、-N(R)CON(R)-、-N(R)SO₂N(R)-、-N(R)N(R)-、-C(O)N(R)-、-OC(O)N(R)-、-C(R)=NN(R)-または-C(R)=N-O-で置き換えられる；

各Arは、別個に、必要に応じて置換した環から選択され、該環は、3員～7員の単環式または8員～10員の二環式の飽和、部分不飽和または完全不飽和環から選択され、該環は、0個～4個のヘテロ原子を有し、該ヘテロ原子は、別個に、窒素、酸素またはイオウから選択される；

R^yは、-N(R¹)₂、-OR¹または-SR¹である；各R¹は、別個に、R、または3員～8員の単環式、8員～10員の二環式または10員～12員の三環式の飽和、部分不飽和または完全不飽和環から選択され、該環は、0個～4個のヘテロ原子を有し、該ヘテロ原子は、別個に、窒素、酸素またはイオウから選択され、ここで；

各 R^1 は、必要に応じて、別個に、4個までの置換基で置換されており、該置換基は、別個に、 R^2 から選択される；

各 R^2 は、別個に、 $-R^3$ 、 $-OR^3$ 、 $-SR^3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、オキソ、ハロゲン、 $-N(R^3)_2$ 、 $-C(O)R^3$ 、 $-OC(O)R^3$ 、 $-CO_2R^3$ 、 $-SO_2R^3$ 、 $-SO_2N(R^3)_2$ 、 $-N(R^3)SO_2R^3$ 、 $-C(O)NR(R^3)$ 、 $-C(O)N(R^3)_2$ 、 $-OC(O)NR(R^3)$ 、 $-OC(O)N(R^3)_2$ 、 $-NR^3C(O)R^3$ 、 $-NR^3C(O)N(R^3)_2$ または $-NR^3CO_2(R^3)$ から選択される；

各 R^3 は、別個に、 R または Ar から選択される；

R^{z1} は、 C_{1-6} 脂肪族基または3員～8員の単環式、8員～10員の二環式または10員～12員の三環式の飽和、部分不飽和または完全不飽和環から選択され、該環は、0個～4個のヘテロ原子を有し、該ヘテロ原子は、別個に、酸素、窒素またはイオウから選択され、ここで：

R^{z1} は、0個～4個の別個に選択された R^2 基で置換されている；

R^{z2} は、 C_{1-6} 脂肪族基または3員～8員の単環式または8員～10員の二環式の飽和、部分不飽和または完全不飽和環であり、該環は、0個～4個のヘテロ原子を有し、該ヘテロ原子は、別個に、窒素、酸素またはイオウから選択され、ここで：

R^{z2} は、0個～4個の置換基で置換されており、該置換基は、別個に、オキソまたは $U-R^5$ から選択される；

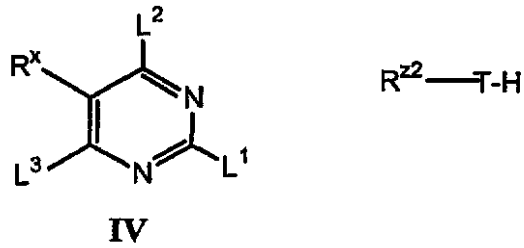
該方法は、以下：

式 IV の化合物と式 $R^{z2}-T-H$ の化合物とを第1の適切な媒体中で組み合わせて、式 III の化合物を得る、第1の工程、

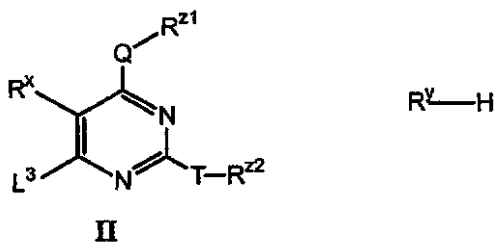
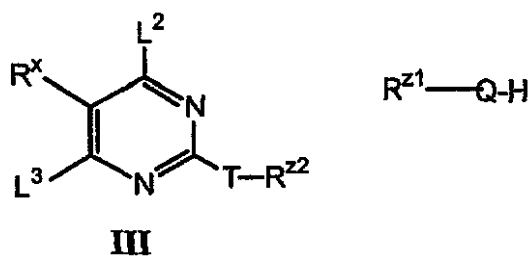
該第1の工程に続いて、式 III の化合物と式 $R^{z1}-Q-H$ の化合物とを第2の適切な媒体中で組み合わせて、式 II の化合物を得る、第2の工程、

該第2の工程に続いて、式 II の化合物と式 R^y-H の化合物とを第3の適切な媒体中で組み合わせる、第3の工程、
を包含し、

【化 2】



3



ここで、該第 1 の適切な媒体、該第 2 の適切な媒体、および該第 3 の適切な媒体のそれぞれが、独立して、以下：

i) 適切な溶媒；および

ii) 必要に応じて、適切な塩基；

を含み、ここで、 L^1 、 L^2 、および L^3 のそれぞれが、独立して、適切な脱離基を含む、方法。

【請求項 2】

L^3 が、ハロゲン、必要に応じて置換したアリールスルホニルまたは必要に応じて置換したアルキルスルホニルから選択される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3】

L^3 が、フルオロ、クロロ、プロモ、ヨード、パラトルエンスルホニル、メタンスルホニル、パラニトロフェニルスルホニル、パラプロモフェニルスルホニルまたはトリフルオロメタンスルホネートである、請求項 2 に記載の方法。

【請求項 4】

L^3 が、クロロまたはヨードである、請求項 3 に記載の方法。

【請求項 5】

L^2 が、ハロゲン、必要に応じて置換したアリールスルホニルまたは必要に応じて置換したアルキルスルホニルである、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 6】

L^2 が、フルオロ、クロロ、プロモ、ヨード、パラトルエンシルホネート、メタンシルホネート、パラニトロフェニルシルホニル、パラプロモフェニルシルホニルまたはトリフルオロメタンシルホネートである、請求項 5 に記載の方法。

【請求項 7】

L^2 が、クロロまたはヨードである、請求項 6 に記載の方法。

【請求項 8】

L^1 が、ハロゲン、必要に応じて置換したアリアルシルホニルまたは必要に応じて置換したアルキルシルホニルである、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 9】

L^1 が、必要に応じて置換したアルキルシルホニルである、請求項 8 に記載の方法。

【請求項 10】

L^1 が、メタンシルホニルである、請求項 9 に記載の方法。

【請求項 11】

Q が、N(R) である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 12】

T が、酸素またはイオウである、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 13】

T が、イオウである、請求項 12 に記載の方法。

【請求項 14】

R^y が、 $-OR^1$ または $-N(R^1)_2$ である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 15】

R^y が、 $-N(R^1)_2$ である、請求項 14 に記載の方法であって、ここで：

R^1 は、R、または 3 員～7 員の単環式または 8 員～10 員の二環式の飽和、部分不飽和または完全不飽和環から選択され、該環は、0 個～4 個のヘテロ原子を有し、該ヘテロ原子は、別個に、窒素、酸素またはイオウから選択される；または

各 R^1 は、同じ窒素原子上の 2 個の R が一緒になって必要に応じて置換した 4 員～7 員飽和環を形成するような R であり、該環は、2 個までの追加ヘテロ原子を有し、該ヘテロ原子は、窒素、酸素またはイオウから選択され、ここで：

各 R^1 は、必要に応じて、別個に、4 個までの置換基で置換されており、該置換基は、
 $-R^3$ 、 $-OR^3$ 、 $-SR^3$ 、 $-CN$ 、 $-NO_2$ 、オキソ、ハロゲン、 $-N(R^3)_2$ 、
 $-C(O)R^3$ 、 $-OC(O)R^3$ 、 $-CO_2R^3$ 、 $-SO_2R^3$ 、 $-SO_2N(R^3)$
 $_2$ 、 $-N(R^3)SO_2R^3$ 、 $-C(O)NR(R^3)$ 、 $-C(O)N(R^3)_2$ 、 $-OC(O)NR(R^3)$ 、
 $-OC(O)N(R^3)_2$ 、 $-NR^3C(O)R^3$ 、 $-NR^3C(O)N(R^3)_2$ または $-NR^3CO_2(R^3)$ から選択される、
 方法。

【請求項 16】

R^y が、 $N(R^1)_2$ であり、ここで：各 R^1 が、別個に、R から選択され、ここで、R が、水素または必要に応じて置換した C_{1-4} 脂肪族基である、請求項 15 に記載の方法。

【請求項 17】

R^y が、 $N(R^1)_2$ であり、ここで：各 R^1 が、2 個の R 基が一緒になって必要に応じて置換した 4 員～7 員飽和環を形成するような R であり、該環が、2 個までの追加ヘテロ原子を有し、該ヘテロ原子が、別個に、窒素、酸素またはイオウから選択される、請求項 15 に記載の方法。

【請求項 18】

R^y が、ピロリジン - 1 - イル、ピペリジン - 1 - イル、モルホリン - 4 - イル、チオモルホリン - 4 - イル、ピペラジン - 1 - イル、ジアゼパニルまたはテトラヒドロイソキノリニルから選択され、ここで、各環が、必要に応じて、1 個または 2 個の基で置換されており、該基が、別個に、メチル、エチル、メチルシルホニル、 $(CH_2)_2SO_2CH_3$

、シクロプロピル、 CH_2 シクロプロピル、 $(\text{CH}_2)_2\text{OH}$ 、 CO_2 *t*-ブチル、 CH_2 フェニル、フェニル、 NH_2 、 $\text{NH}(\text{CH}_3)$ 、 $\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $(\text{CH}_2)_2\text{NH}_2$ 、 $(\text{CH}_2)_2$ モルホリン-4-イル、 $(\text{CH}_2)_2\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、イソプロピル、プロピル、*t*-ブチル、 $(\text{CH}_2)_2\text{CN}$ または $(\text{CH}_2)_2\text{C}(\text{O})$ モルホリン-4-イルから選択される、請求項17に記載の方法。

【請求項19】

R^{21} が、3員～7員の単環式または8員～10員の二環式の飽和、部分不飽和または完全不飽和環であり、該環が、0個～4個のヘテロ原子を有し、該ヘテロ原子が、別個に、酸素、窒素またはイオウから選択され、ここで、該環が、必要に応じて、別個に、3個までの置換基で置換されており、該置換基が、 $-\text{R}^3$ 、 $-\text{OR}^3$ 、 $-\text{SR}^3$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、オキソ、ハロゲン、 $-\text{N}(\text{R}^3)_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^3$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^3$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^3$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^3$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^3)_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^3)\text{SO}_2\text{R}^3$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}(\text{R}^3)$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^3)_2$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{NR}(\text{R}^3)$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^3)_2$ 、 $-\text{NR}^3\text{C}(\text{O})\text{R}^3$ 、 $-\text{NR}^3\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^3)_2$ または $-\text{NR}^3\text{CO}_2\text{R}^3$ から選択される、請求項1に記載の方法。

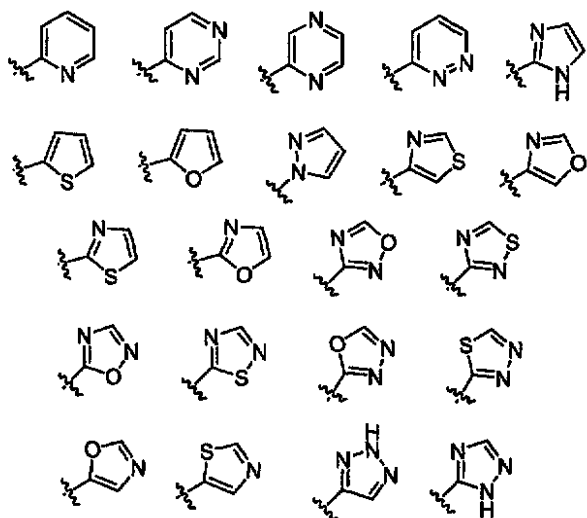
【請求項20】

R^{21} が、5員～6員の完全不飽和環であり、該環が、1個～3個のヘテロ原子を有し、該ヘテロ原子が、別個に、窒素、酸素またはイオウから選択され、ここで、該環が、必要に応じて、別個に、3個までの置換基で置換されており、該置換基が、 $-\text{R}^3$ 、 $-\text{OR}^3$ 、 $-\text{SR}^3$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{NO}_2$ 、オキソ、ハロゲン、 $-\text{N}(\text{R}^3)_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{R}^3$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{R}^3$ 、 $-\text{CO}_2\text{R}^3$ 、 $-\text{SO}_2\text{R}^3$ 、 $-\text{SO}_2\text{N}(\text{R}^3)_2$ 、 $-\text{N}(\text{R}^3)\text{SO}_2\text{R}^3$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NR}(\text{R}^3)$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^3)_2$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{NR}(\text{R}^3)$ 、 $-\text{OC}(\text{O})\text{N}(\text{R}^3)_2$ 、 $-\text{NR}^3\text{C}(\text{O})\text{R}^3$ 、 $-\text{NR}^3\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{R}^3)_2$ または $-\text{NR}^3\text{CO}_2\text{R}^3$ から選択される、請求項19に記載の方法。

【請求項21】

R^{21} が、必要に応じて置換した環であり、該環が、ピラゾールまたは以下の5員～6員環：

【化3】



のいずれか1種から選択される、請求項20に記載の方法。

【請求項22】

R^{21} が、ピラゾール環であり、該環が、2個までの置換基を有し、該置換基が、別個に、 $-\text{N}(\text{R}^3)_2$ 、 $-\text{OR}^3$ または $\text{C}_1\sim\text{C}_4$ 脂肪族基から選択される、請求項21に記載の方法。

【請求項23】

R^{21} が、ピラゾールであり、該ピラゾールが、必要に応じて、1個の置換基で置換されており、該置換基が、メチル、エチル、プロピル、イソプロピル、*t*-ブチル、シクロブ

ロピルまたはフェニルから選択される、請求項 2 2 に記載の方法。

【請求項 2 4】

R^{2 2} が、必要に応じて置換した環であり、該環が、5員～6員の単環式または8員～10員の二環式の飽和、部分不飽和または完全不飽和環から選択され、該環が、0個～4個のヘテロ原子を有し、該ヘテロ原子が、別個に、窒素、酸素またはイオウから選択され、ここで、該環が、必要に応じて、3個までの置換基で置換されており、該置換基が、別個に、ハロゲン、-CN、-NO₂、-C(O)R³、-CO₂R³、-C(O)NR(R³)、-NR³C(O)R³、-N(R³)₂、-N(R³)SO₂R³、-NR³C(O)N(R³)₂または-NR³CO₂R³から選択される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 2 5】

R^{2 2} が、フェニル、イミダゾリル、ピラゾリル、ピリジル、ピリダジニル、ピラジニル、ナフチル、テトラヒドロナフチル、ベンゾイミダゾリル、ベンズチアゾリル、キノリニル、キナゾリニル、ベンゾジオキシニル、イソベンゾフラン、インダニル、インドリル、インドリニル、インダゾリルまたはイソキノリニルから選択され、ここで：

R^{2 2} が、必要に応じて、3個までの置換基で置換されており、該置換基が、別個に、-Cl、-Br、-F、-CN、-CF₃、-COOH、-CONHMe、-CONHEt、-NH₂、-NHAc、-NHCO₂Me、-NHCO₂Et、-NHCO₂(n-プロピル)、-NHCO₂(イソプロピル)、-NHCOEt、-NHCOCH₂NHCH₃、-NHCOCH₂N(CO₂t-Bu)CH₃、-NHCOCH₂N(CH₃)₂、-NHCOCH₂CH₂N(CH₃)₂、-NHCOCH₂CH₂CH₂N(CH₃)₂、-NHCO(シクロプロピル)、-NHCO(イソプロピル)、-NHCO(イソブチル)、-NHCOCH₂(モルホリン-4-イル)、-NHCOCH₂CH₂(モルホリン-4-イル)、-NHCOCH₂CH₂CH₂(モルホリン-4-イル)、-NHCO₂(t-ブチル)、-NH(シクロヘキシル)、-MMe、-NMe₂、-OH、-OMe、メチル、エチル、シクロプロピル、イソプロピルまたはt-ブチルから選択される、請求項 2 4 に記載の方法。

【請求項 2 6】

R^{2 2} が、1個の置換基を有し、該置換基が、-NR³C(O)R³から選択され、ここで：

各R³が、別個に、RまたはArから選択され、ここで：

Rが、水素または必要に応じて置換したC₁～₄脂肪族基である、請求項 2 5 に記載の方法。

【請求項 2 7】

前記適切な溶媒が、プロトン性溶媒、ハロゲン化炭化水素、エーテル、芳香族炭化水素、極性または非極性の非プロトン性溶媒、またはそれらの任意の混合物である、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 2 8】

前記溶媒が、C₁～₅直鎖または分枝アルキルアルコール、エーテル、または極性または非極性の非プロトン性溶媒である、請求項 2 7 に記載の方法。

【請求項 2 9】

前記適切な塩基が、有機アミン、アルカリ土類金属炭酸塩、アルカリ土類金属水素化物またはアルカリ土類金属水酸化物から選択される、請求項 1 に記載の方法。

【請求項 3 0】

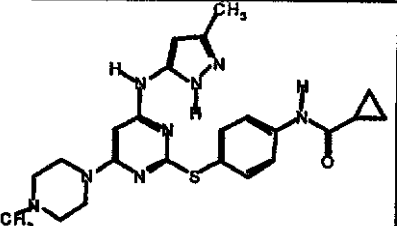
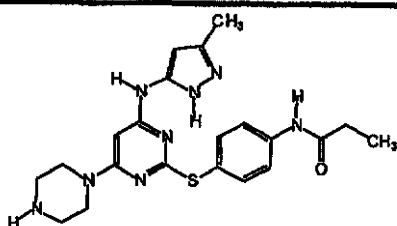
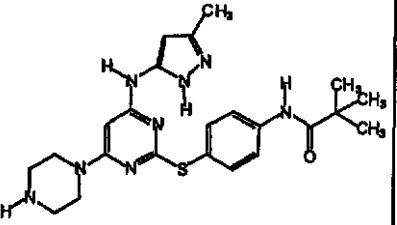
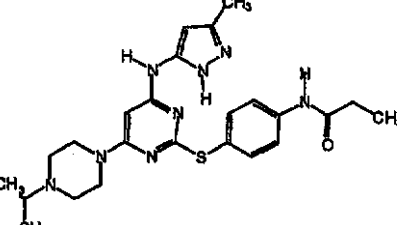
前記適切な塩基が、トリアルキルアミン、炭酸ナトリウム、炭酸カリウム、水素化ナトリウム、水素化カリウム、水酸化ナトリウムまたは水酸化カリウムから選択される、請求項 2 9 に記載の方法。

【請求項 3 1】

前記方法が、以下の表 1 および表 2 の化合物：

【化 4】

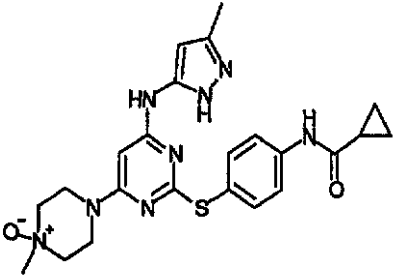
表 1.

No. V-	構造	No. V-	構造
1		2	
3		4	

【化5】

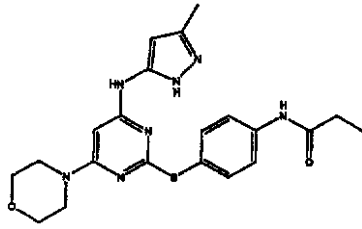
No. V-	構造	No. V-	構造
5		6	
7		8	
9		10	
11		12	
13		14	
15		16	
17		18	

【化 6】

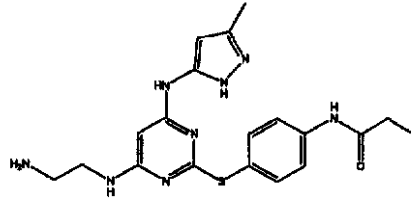
No. V-	構造	No. V-	構造
19		20	

【化 7】

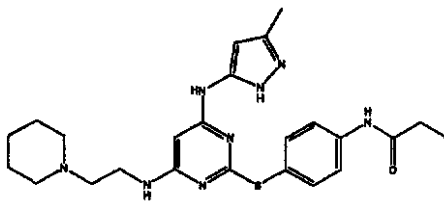
表 2.



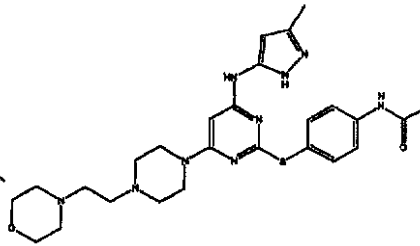
I-1



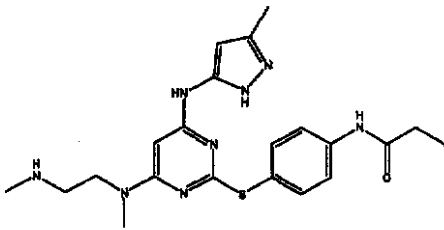
I-2



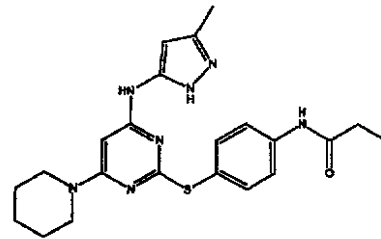
I-3



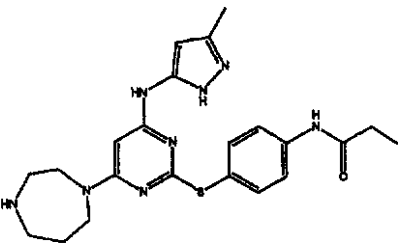
I-4



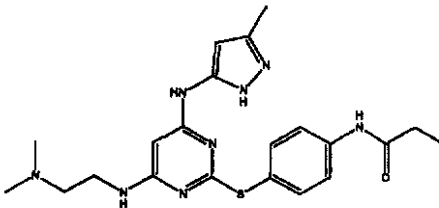
I-5



I-6

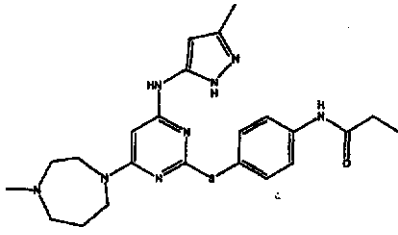


I-7

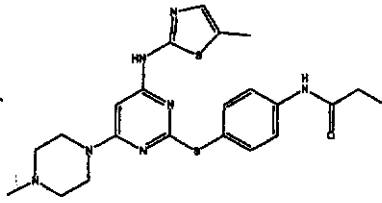


I-8

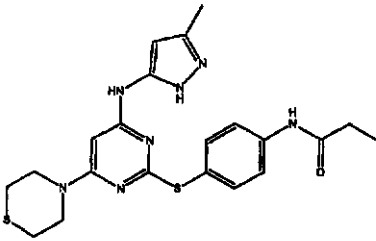
【化 8】



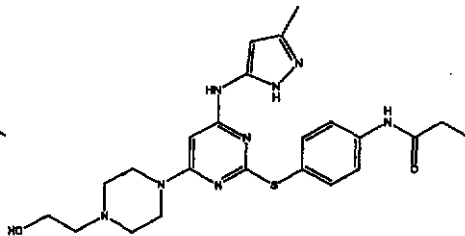
I-9



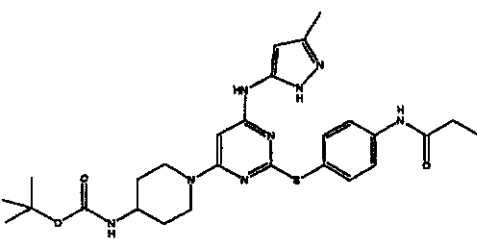
I-10



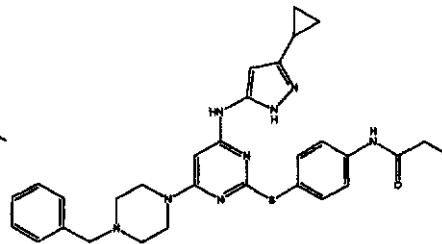
I-11



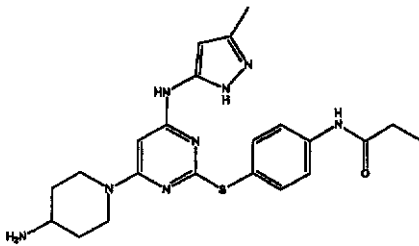
I-12



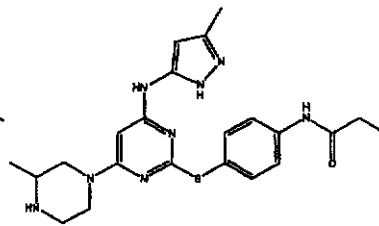
I-13



I-14

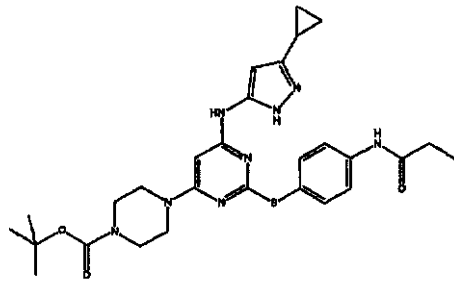


I-15

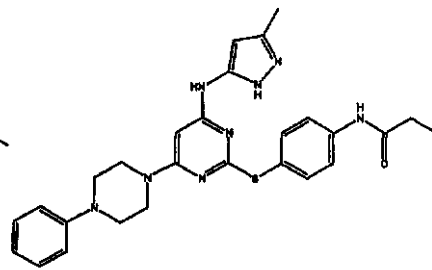


I-16

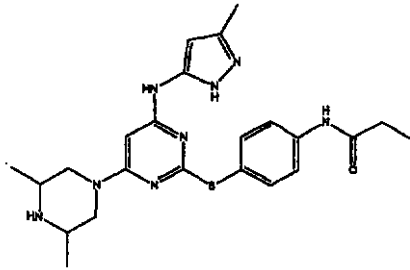
【化 9】



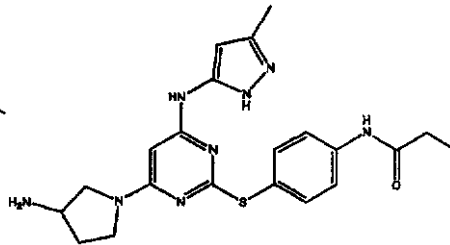
I-17



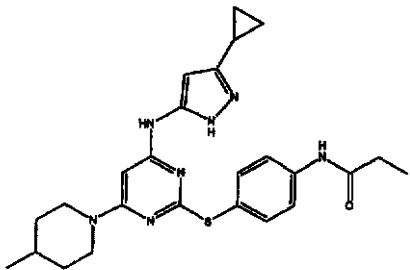
I-18



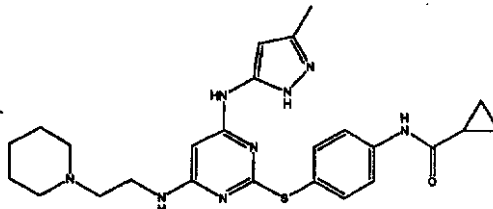
I-19



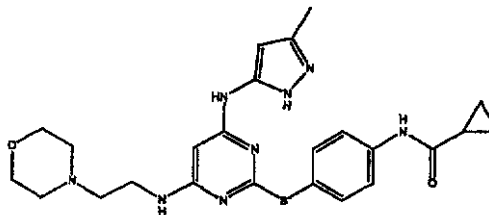
I-20



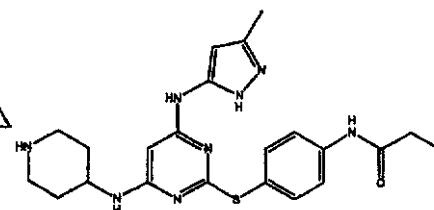
I-21



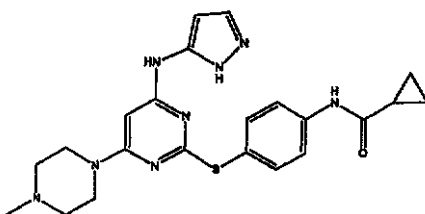
I-22



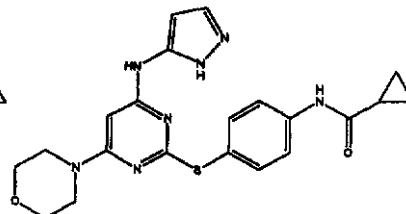
I-23



I-24

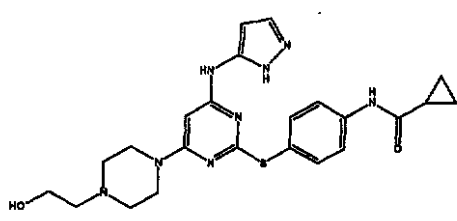


I-25

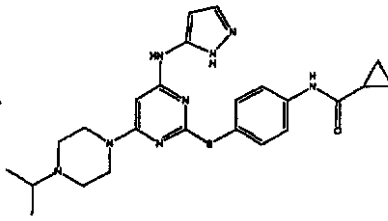


I-26

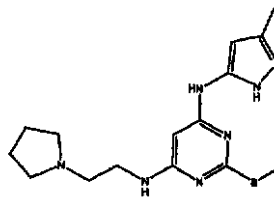
【化 10】



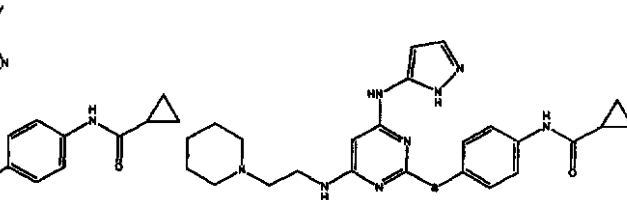
I-27



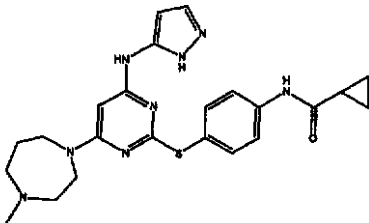
I-28



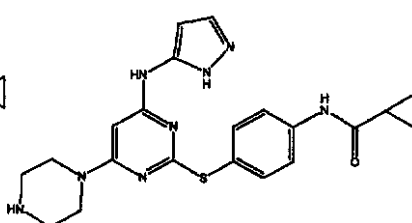
I-29



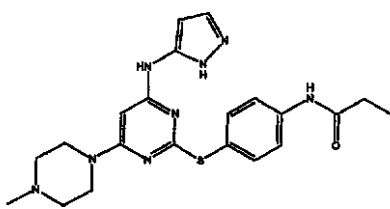
I-30



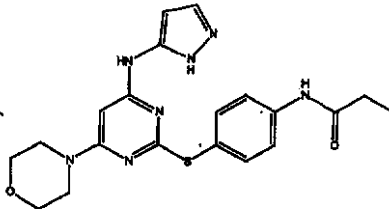
I-31



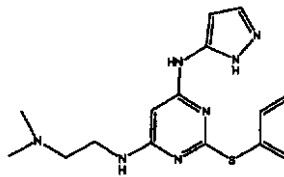
I-32



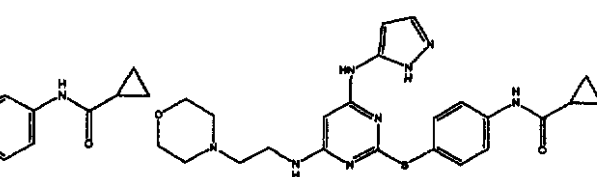
I-33



I-34

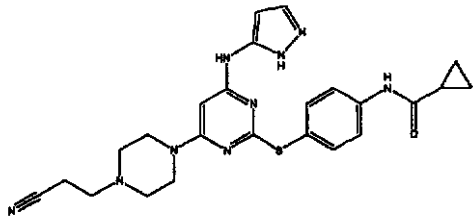


I-35

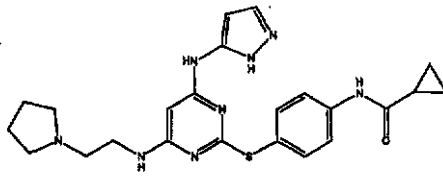


I-36

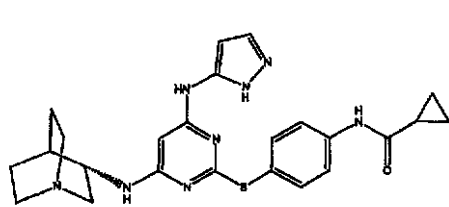
【化 1 1】



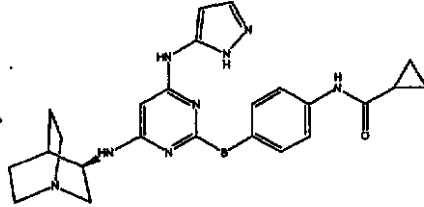
I-37



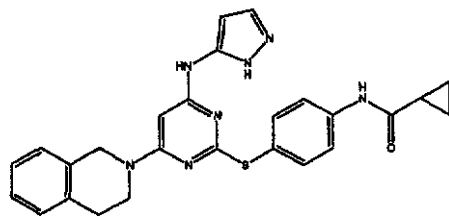
I-38



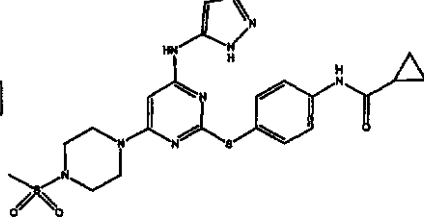
I-39



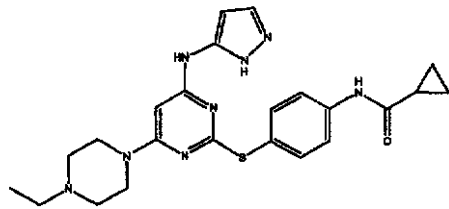
I-40



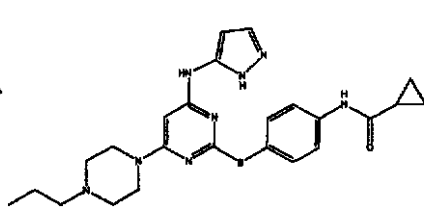
I-41



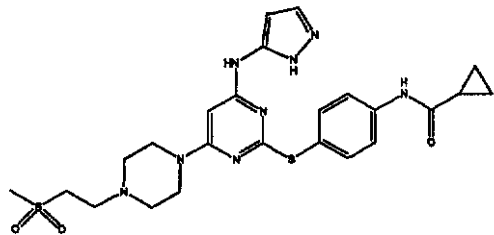
I-42



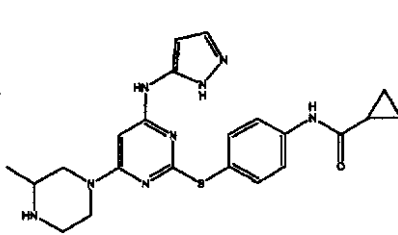
I-43



I-44

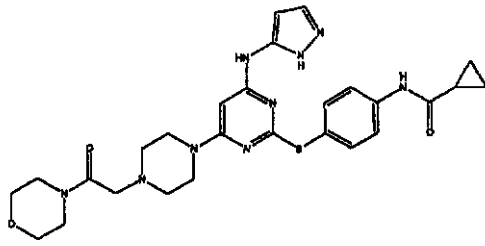


I-45

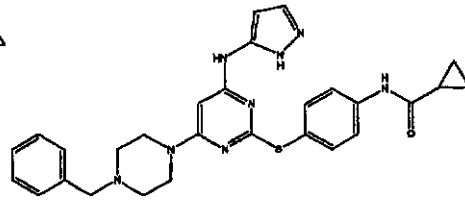


I-46

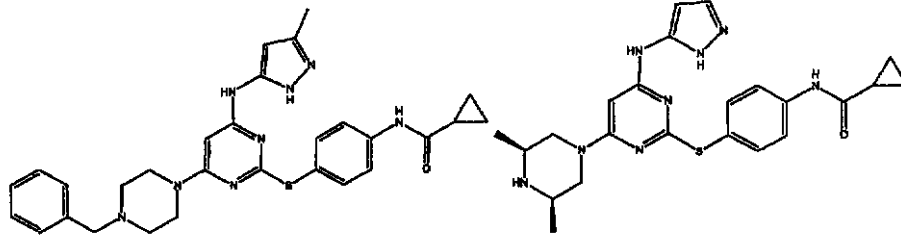
【化 1 2】



I-47

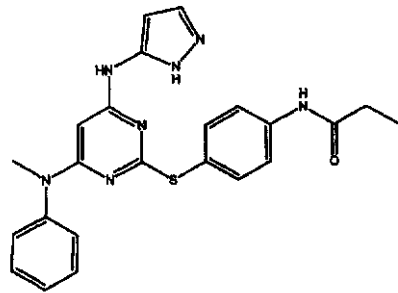


I-48

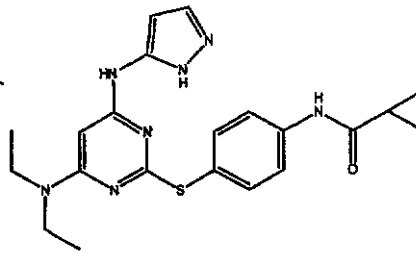


I-49

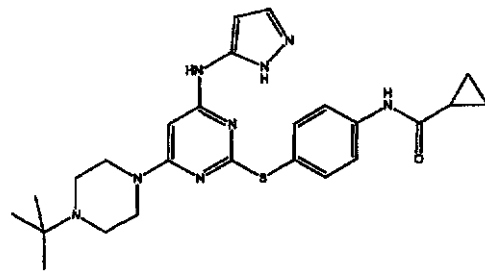
I-50



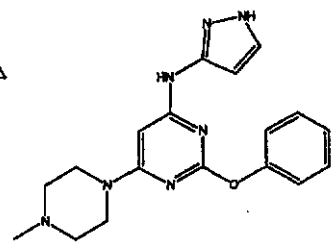
I-51



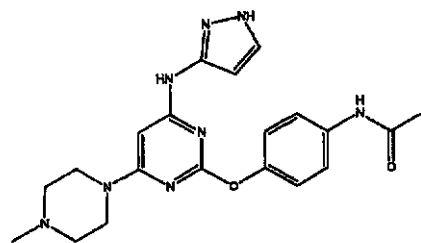
I-52



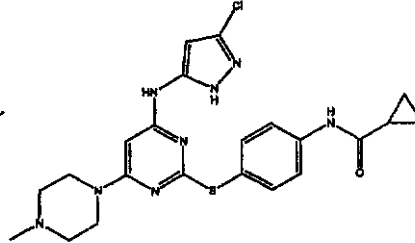
I-53



I-54

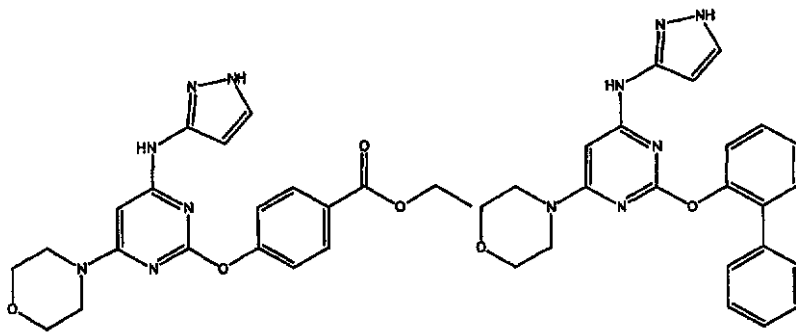


I-55



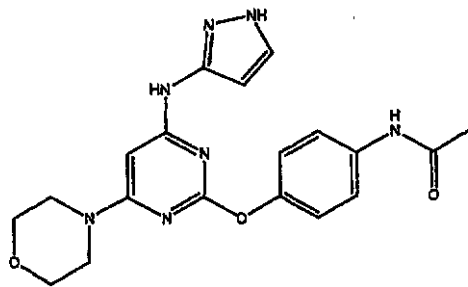
I-56

【化 1 3】

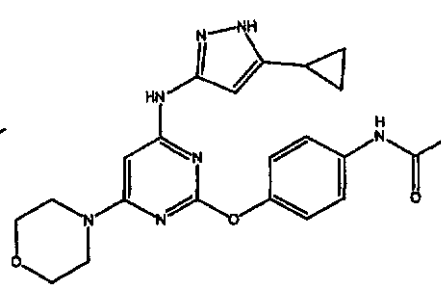


I-57

I-58

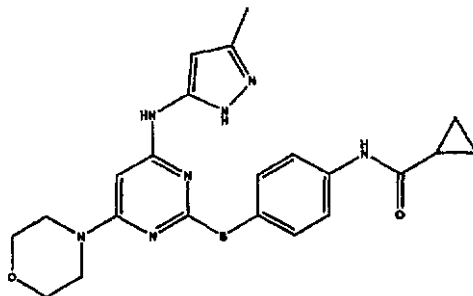


I-59



I-60

および



I-61.

から選択される化合物を調製するのに使用される、請求項 1 に記載の方法。

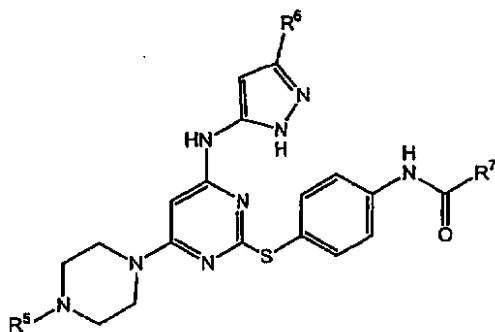
【請求項 3 2】

前記方法が、式 V - 1 の化合物を調製するために使用される、請求項 3 1 に記載の方法。

【請求項 3 3】

式 V の化合物またはそれらの薬学的に受容可能な誘導体または塩：

【化 1 4】



V

ここで：

R⁵は、水素またはC₁₋₄脂肪族から選択される；

R⁶は、C₁₋₃脂肪族から選択される；そして

R⁷は、シクロプロピルである、

化合物と、薬学的に受容可能な担体、補助剤またはビヒクルとを含有する、組成物。

【請求項34】

さらに、抗増殖薬または化学療法薬を含有する、請求項33に記載の組成物。

【請求項35】

生体試料におけるAurora-1を阻害する方法であって、該方法は、該試料を、以下

：
請求項33に記載の組成物、
と接触させる工程を包含する、方法。

【請求項36】

生体試料におけるAurora-2を阻害する方法であって、該方法は、該試料を、以下

：
請求項33に記載の組成物、
と接触させる工程を包含する、方法。

【請求項37】

生体試料におけるAurora-3を阻害する方法であって、該方法は、該試料を、以下

：
請求項33に記載の組成物、
と接触させる工程を包含する、方法。

【請求項38】

生体試料におけるFLT-3を阻害する方法であって、該方法は、該試料を、以下：

請求項33に記載の組成物、
と接触させる工程を包含する、方法。

【請求項39】

患者におけるAurora-1を阻害するための医薬の調製における以下：

請求項33に記載の組成物、
の使用。

【請求項40】

患者におけるAurora-2を阻害するための医薬の調製における以下：

請求項33に記載の組成物、
の使用。

【請求項41】

患者におけるAurora-3を阻害するための医薬の調製における以下：

請求項33に記載の組成物、
の使用。

【請求項42】

患者におけるFLT-3を阻害するための医薬の調製における以下：

請求項33に記載の組成物、
の使用。

【請求項43】

患者におけるAurora-1、Aurora-2、Aurora-3およびFLT-3
を阻害するための医薬の調製における以下：

請求項33に記載の組成物、
の使用。

【請求項44】

患者における癌を治療する方法において用いるための医薬の調製における請求項33に記載
の組成物の使用。

【請求項 4 5】

前記癌を処置する方法が、前記患者に、追加化学療法薬または抗増殖薬を投与する工程を包含する、請求項 4 4 に記載の使用。

【請求項 4 6】

前記癌が、黒色腫、リンパ腫、神経芽細胞腫、白血病、もしくは大腸癌、乳房癌、肺癌、腎臓癌、卵巣癌、膵臓癌、腎臓癌、CNS 癌、頸部癌、前立腺癌から選択される癌、または消化器の癌から選択される、請求項 4 4 に記載の使用。

【請求項 4 7】

前記癌が、急性骨髄性白血病 (AML)、急性リンパ性白血病 (ALL)、肥満細胞症または胃腸間質性腫瘍 (GIST) から選択される、請求項 4 4 に記載の使用。

【請求項 4 8】

患者における癌を治療するかその重症度を減らす方法において用いるための医薬の調製における請求項 3 3 に記載の化合物の使用であって、該方法が Aurora タンパク質キナーゼを該医薬で阻害することにより、該癌細胞の有糸分裂を中断させる工程を包含する、使用。

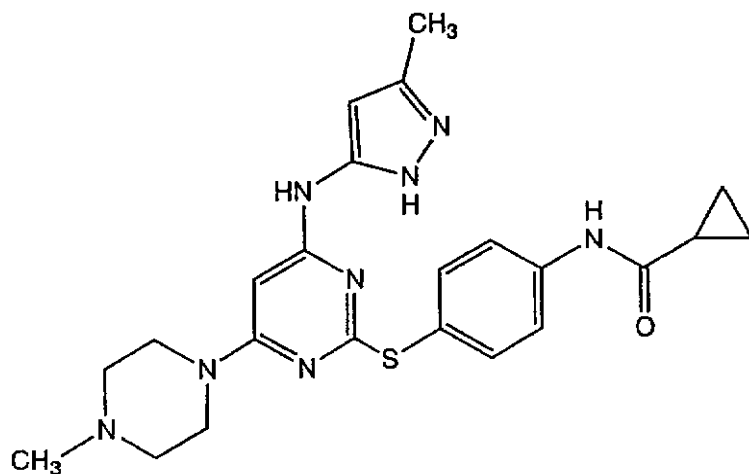
【請求項 4 9】

前記医薬がさらに薬学的に受容可能な担体、補助剤またはビヒクルを含む、請求項 4 8 に記載の使用。

【請求項 5 0】

癌を処置するための医薬の製造のための、式 V - 1 の化合物またはその薬学的に受容可能な塩：

【化 1 5】



V-1

の使用。

【請求項 5 1】

白血病を処置するための医薬の製造のための、請求項 5 0 に記載の化合物の使用。

【請求項 5 2】

癌を処置するための医薬の製造のための、Gleevec と組み合わせた請求項 5 0 に記載の化合物の使用。

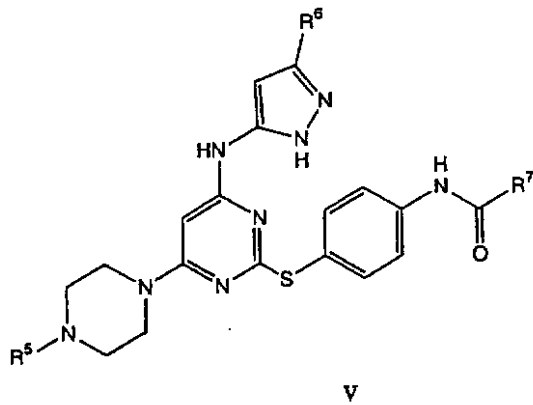
【請求項 5 3】

白血病を処置するための医薬の製造のための、Gleevec と組み合わせた請求項 5 0 に記載の化合物の使用。

【請求項 5 4】

式 V の化合物またはそれらの薬学的に受容可能な塩：

【化 16】



ここで：

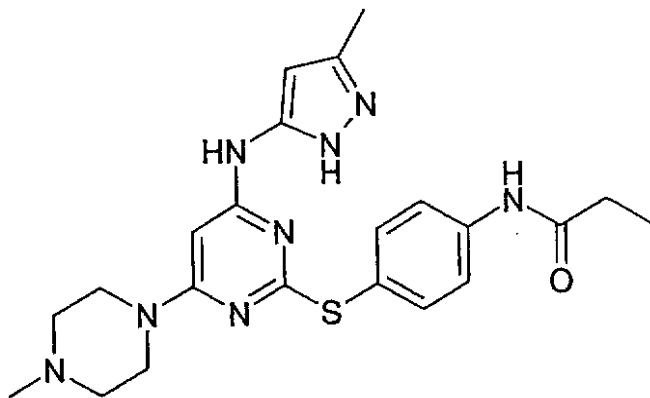
R⁵ は、H、Me、Et、ⁿPr、ⁱPr、^cPr、ⁱBu、または^tBuである；

R⁶ は、Me、Et、または^cPrである；そして

R⁷ は、Me、Et、^cPr、または^tBuであり、

但し、該化合物は、以下：

【化 17】



またはその塩ではない、

化合物と、薬学的に受容可能な担体、補助剤またはビヒクルとを含有する、組成物。

【請求項 55】

さらに、抗増殖薬または化学療法薬を含有する、請求項 54 に記載の組成物。

【請求項 56】

患者における Aurora - 1 を阻害するための請求 33 に記載の組成物。

【請求項 57】

患者における Aurora - 2 を阻害するための請求項 33 に記載の組成物。

【請求項 58】

患者における Aurora - 3 を阻害するための請求項 33 に記載の組成物。

【請求項 59】

患者における FLT - 3 を阻害するための請求項 33 に記載の組成物。

【請求項 60】

患者における Aurora - 1、Aurora - 2、Aurora - 3 および FLT - 3 を阻害するための請求項 33 に記載の組成物。

【請求項 61】

患者における癌を治療するための請求項 33 に記載の組成物。

【請求項 62】

追加化学療法薬または抗増殖薬とともに、前記患者に投与するのに適している、請求項 6 1 に記載の組成物。

【請求項 6 3】

前記癌が、黒色腫、リンパ腫、神経芽細胞腫、白血病、もしくは大腸癌、乳房癌、肺癌、腎臓癌、卵巣癌、膵臓癌、腎臓癌、CNS 癌、頸部癌、前立腺癌から選択される癌、または消化器の癌から選択される、請求項 6 1 に記載の組成物。

【請求項 6 4】

前記癌が、急性骨髄性白血病 (AML)、急性リンパ性白血病 (ALL)、肥満細胞症または胃腸間質性腫瘍 (GIST) から選択される、請求項 6 1 に記載の組成物。

【請求項 6 5】

Aurora タンパク質キナーゼを阻害することにより該癌細胞の有糸分裂を中断させることによって、患者における癌を治療するかその重症度を減らすための、請求項 3 3 に記載の化合物を含む、組成物。

【請求項 6 6】

さらに薬学的に受容可能な担体、補助剤またはビヒクルを含む、請求項 6 5 に記載の組成物。

【請求項 6 7】

請求項 5 0 に記載の化合物を含む、癌を処置するための組成物。

【請求項 6 8】

請求項 5 0 に記載の化合物を含む、白血病を処置するための組成物。

【請求項 6 9】

Gleevec と組み合わせて請求項 5 0 に記載の化合物を含む、癌を処置するための組成物。

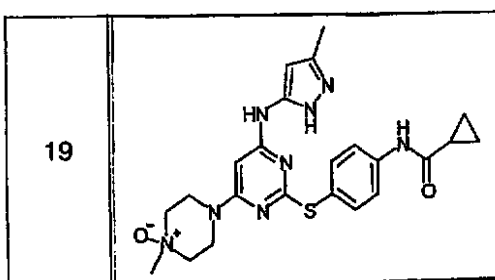
【請求項 7 0】

Gleevec と組み合わせて請求項 5 0 に記載の化合物を含む、白血病を処置するための組成物。

【請求項 7 1】

以下の表 1 の化合物：

【化 1 8】



から選択される、化合物。

【請求項 7 2】

本明細書中に記載の処置方法。