

【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29年8月3日(2017.8.3)

【公表番号】特表2015-503521(P2015-503521A)

【公表日】平成27年2月2日(2015.2.2)

【年通号数】公開・登録公報2015-007

【出願番号】特願2014-549176(P2014-549176)

【国際特許分類】

C 0 7 D 215/48 (2006.01)

C 0 7 D 403/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 239/74 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/47 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

C 0 7 D 403/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/18 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 13/08 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 215/48

C 0 7 D 403/12 C S P

A 6 1 K 31/517

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 239/74

C 0 7 D 403/04

A 6 1 K 31/47

A 6 1 K 31/4709

C 0 7 D 403/14

A 6 1 K 31/496

C 0 7 D 401/04

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 1/18

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 13/08

A 6 1 P 9/00  
 A 6 1 P 17/06  
 A 6 1 P 3/10  
 A 6 1 P 9/10  
 A 6 1 P 27/02  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

## 【誤訳訂正書】

【提出日】平成29年6月26日(2017.6.26)

## 【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

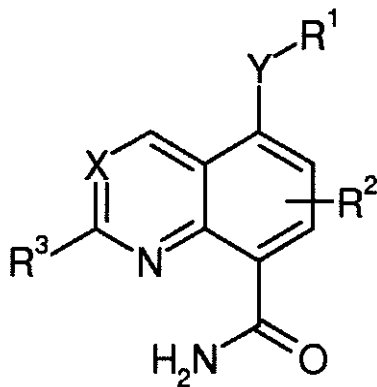
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(1)：

【化1】



(I)

[式中、

Xは、Nであり；

Yは、N-R<sup>5</sup>またはOであるか、存在せず；R<sup>1</sup>は、L<sup>1</sup>-R<sup>6</sup>またはL<sup>1</sup>-R<sup>6</sup>-L<sup>2</sup>-R<sup>7</sup>であり；R<sup>2</sup>は、H、Hal、OH、OA、CN、NH<sub>2</sub>、NHAのいずれかであり；R<sup>3</sup>は、H、CH<sub>3</sub>、C(Hal)<sub>3</sub>のいずれかであり；

R<sup>5</sup>は、HまたはLAであるか、あるいは3、4、5、6、又は7員環の炭素環を持ち、1個または2個のCH<sub>2</sub>基それぞれが-NH-基で置換されていてもよい単環アルキルである、あるいは

R<sup>5</sup>とR<sup>1</sup>が合わさって、3、4、5、6、又は7員環の炭素環を持ち、1個または2個のCH<sub>2</sub>基それぞれ自体が、O原子および/または-NH-基、-NA-基、-N(L<sup>1</sup>-R<sup>6</sup>)-基、-CHA-基、-CA<sub>2</sub>-基、CH(L<sup>1</sup>-R<sup>6</sup>)-基、-CO-基のいずれかで置換されていてもよい単環アルキル(その単環のアルキルの水素原子はNH<sub>2</sub>で置換されていてもよい)を形成し；

L<sup>1</sup>とL<sup>2</sup>は、独立に、単結合であるか、1、2、3、4、5個いずれかのC原子を有する分岐していないか分岐したアルキルであり、当該アルキルの水素原子は、置換されていないか、Hal、OH、NH<sub>2</sub>、NH(LA)、N(LA)<sub>2</sub>のいずれかで1置換または2置換されていてもよく、1個ま

たは2個のCH<sub>2</sub>基それ自体が、O原子で置換されるか、-CO-基、-NH-基、-N(LA)-基、-CONH-基、-N(LA)COO-基、-NHCO-基のいずれかで置換されていてもよく；

R<sup>6</sup>は、Arであるか、3、4、5、6、又は7員環の炭素環を持ち、1個または2個のCH<sub>2</sub>基それ自体が、O原子および/または-NH-基、-NA-基、-CHA-基、-CO-基、-CONHA-基のいずれかで置換されていてもよい単環アルキルであり；

R<sup>7</sup>は、置換されていないフェニルであるか、フェニルの水素原子が独立にHal、C(Hal)<sub>3</sub>、CH<sub>3</sub>、CH<sub>3</sub>O、C(Hal)<sub>3</sub>Oで1置換、または2置換、または3置換されたフェニルであり；

Arは、0、1、2、3、4個いずれかのN原子および/またはO原子および/またはS原子と、5、6、8、9、10個いずれかの骨格原子を有する単環または二環の芳香族同素環または複素環であり、当該芳香族同素環または複素環の水素原子は、置換されていないか、互いに独立に、Hal、A、OA、OH、NH<sub>2</sub>、NHAのいずれかで1置換または2置換または3置換されていてもよく；

Aは、1、2、3、4、5、6個のいずれかの炭素原子を持ち、1個または2個のCH<sub>2</sub>基それ自体が、O原子および/または-NH-基、-NHCOAr基、-CONHAr基のいずれかで置換されていてもよく、1~3個のH原子がHalで置換されていてもよく、1個または2個のCH<sub>3</sub>基それ自体が、NH<sub>2</sub>基、OH基、NH(LA)基、N(LA)<sub>2</sub>基のいずれかで置換されていてもよい、分岐していないか分岐した直鎖アルキルまたは環式アルキル

LAは、1、2、3、4個いずれかの炭素原子を持ち、1、2、3個いずれかのH原子がHalで置換されていてもよい、分岐していないか分岐した直鎖アルキルであり；

Halは、F、Cl、Br、Iのいずれかである。]

で表される化合物、またはその立体異性体もしくは互変異性体、またはその医薬として許容される塩、あるいはあらゆる割合でのそれらの混合物。

#### 【請求項2】

下位式1において、

YはN-R<sup>5</sup>であり；

R<sup>5</sup>は請求項1で定義したとおりであり；

下位式2において、

XはNであり、

YはN-R<sup>5</sup>であり、

R<sup>5</sup>とR<sup>1</sup>が合わさって、3、4、5、6、又は7員環の炭素環を持ち、1個または2個のCH<sub>2</sub>基それ自体が、-NH-基、-NA-基、-N(L<sup>1</sup>-R<sup>6</sup>)-基、-CHA-基、-CA<sub>2</sub>-基、CH(L<sup>1</sup>-R<sup>6</sup>)-基、-CO-基のいずれかで置換されていてもよい単環アルキル（その単環のアルキルの水素原子はNH<sub>2</sub>で置換されていてもよい）を形成し；

L<sup>1</sup>およびR<sup>6</sup>は請求項1で定義したとおりであり；

下位式3において、

YはN-R<sup>5</sup>であり、

R<sup>5</sup>とR<sup>1</sup>が合わさって、4、5、又は6員環の炭素環を持ち、1個のCH<sub>2</sub>基それ自体が-N(L<sup>1</sup>-R<sup>6</sup>)-基で置換された単環アルキル（その単環のアルキルの水素原子はNH<sub>2</sub>で置換されていてもよい）を形成し；

L<sup>1</sup>およびR<sup>6</sup>は請求項1で定義したとおりであり；

下位式4において、

YはN-R<sup>5</sup>であり、

R<sup>5</sup>とR<sup>1</sup>が合わさって、4、5、又は6員環の炭素環を持ち、1個のCH<sub>2</sub>基それ自体が-N(L<sup>1</sup>-R<sup>6</sup>)-基で置換された単環アルキル（その単環のアルキルの水素原子はNH<sub>2</sub>で置換されていてもよい）を形成し、

L<sup>1</sup>は、結合、-CONH-、-NHCO-、-CONHCH<sub>2</sub>-、CH<sub>2</sub>CONH-であり；

R<sup>1</sup>およびR<sup>6</sup>は請求項1で定義したとおりであり；

下位式5において、

YはN-R<sup>5</sup>であり、

R<sup>5</sup>とR<sup>1</sup>が合わさって、4、5、又は6員環の炭素環を持ち、1個のCH<sub>2</sub>基それ自体が-N(L<sup>1</sup>-R

<sup>6</sup>)-基で置換された単環アルキル（その単環のアルキルの水素原子はNH<sub>2</sub>で置換されていてもよい）を形成し、

R<sup>6</sup>は、置換されていないフェニルであるか、フェニルの水素原子が独立にHal、C(Hal)<sub>3</sub>、CH<sub>3</sub>、C(Hal)<sub>3</sub>Oで1置換、または2置換、または3置換されたフェニルであり；

L<sup>1</sup>は請求項1で定義したとおりであり；

下位式6において、

YはN-R<sup>5</sup>であり、

R<sup>5</sup>とR<sup>1</sup>が合わさって、4、5、又は6員環の炭素環を持ち、1個のCH<sub>2</sub>基それ自体が-N(L<sup>1</sup>-R<sup>6</sup>)-基で置換された単環アルキル（その単環のアルキルの水素原子はNH<sub>2</sub>で置換されていてもよい）を形成し、

L<sup>1</sup>は、結合、-CONH-、-NHCO-、-CONHCH<sub>2</sub>-、CH<sub>2</sub>CONH-であり、

R<sup>6</sup>は、置換されていないフェニルであるか、フェニルの水素原子が独立にHal、C(Hal)<sub>3</sub>、CH<sub>3</sub>、CH<sub>3</sub>O、C(Hal)<sub>3</sub>Oで1置換、または2置換、または3置換されたフェニルであり；

下位式7において、

YはNHであり、

R<sup>1</sup>はL<sup>1</sup>-R<sup>6</sup>-L<sup>2</sup>-R<sup>7</sup>であり、

L<sup>1</sup>とL<sup>2</sup>は結合であり、

R<sup>6</sup>は、4、5、又は6員環の炭素環を持ち、1個のCH<sub>2</sub>基それ自体が-NH-基で置換されている単環アルキルであり、

R<sup>7</sup>は、置換されていないフェニルであるか、フェニルの水素原子が独立にHal、C(Hal)<sub>3</sub>、CH<sub>3</sub>、CH<sub>3</sub>O、C(Hal)<sub>3</sub>Oで1置換、または2置換、または3置換されたフェニルであり；

下位式8において、

YはNHであり、

R<sup>1</sup>はL<sup>1</sup>-R<sup>6</sup>-L<sup>2</sup>-R<sup>7</sup>であり、

L<sup>1</sup>とL<sup>2</sup>は結合であり、

R<sup>6</sup>はピペリジルまたはピロリジニルであり、

R<sup>7</sup>は、フェニルの水素原子がHal、C(Hal)<sub>3</sub>、CH<sub>3</sub>、CH<sub>3</sub>O、C(Hal)<sub>3</sub>Oで1置換または2置換されたフェニルであり；

下位式9において、

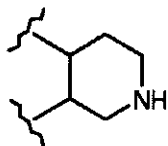
YはNHであり、

R<sup>1</sup>はL<sup>1</sup>-R<sup>6</sup>-L<sup>2</sup>-R<sup>7</sup>であり、

L<sup>1</sup>とL<sup>2</sup>は結合であり、

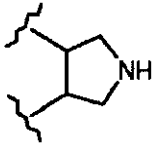
R<sup>6</sup>は、

【化2】



または

## 【化3】



であり、

$R^7$ は、フェニルの水素原子がHal、 $C(Hal)_3$ 、 $CH_3$ 、 $CH_3O$ 、 $C(Hal)_3O$ で1置換または2置換されたフェニルであり；

下位式10において、

YはNHであり、

$R^1$ は $L^1-R^6$ であり、

$R^6$ は、置換されていないフェニルであるか、フェニルの水素原子が独立にHal、 $C(Hal)_3$ 、 $CH_3$ 、 $CH_3O$ 、 $C(Hal)_3O$ で1置換、または2置換、または3置換されたフェニルであり、

$L^1$ は請求項1で定義したとおりである、

請求項1に記載の化合物、またはその立体異性体もしくは互変異性体、またはその医薬として許容される塩、あるいはあらゆる割合でのそれらの混合物。

## 【請求項3】

5-((4-(4-(トリフルオロメトキシ)フェニル)ピロリジン-3-イル)アミノ)キナゾリン-8-カルボキサミド(トランス、ラセミ)、

5-((4-フェニルピペリジン-3-イル)アミノ)キナゾリン-8-カルボキサミド(トランス、ラセミ)、

5-((4-(3-フルオロ-4-(トリフルオロメチル)フェニル)ピペリジン-3-イル)アミノ)キナゾリン-8-カルボキサミド(トランス、ラセミ)、

5-((4-(3-(トリフルオロメチル)フェニル)ピロリジン-3-イル)アミノ)キナゾリン-8-カルボキサミド、

5-((4-(4-クロロ-3-フルオロフェニル)ピペリジン-3-イル)アミノ)キナゾリン-8-カルボキサミド、

5-((4-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)ピペリジン-3-イル)アミノ)キナゾリン-8-カルボキサミド、

5-(((3R,4R)-4-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)ピペリジン-3-イル)アミノ)キナゾリン-8-カルボキサミド、

5-((4-(4-フルオロフェニル)ピペリジン-3-イル)アミノ)キナゾリン-8-カルボキサミドからなる群から選択される請求項1に記載の化合物、またはその立体異性体もしくは互変異性体、またはその医薬として許容される塩、あるいはあらゆる割合でのそれらの混合物。

## 【請求項4】

医薬として許容される担体と共に、活性成分として、請求項1~3のいずれか1項に記載の化合物および/またはその立体異性体、互変異性体、またはその医薬として許容される塩、あるいはあらゆる割合でのそれらの混合物を含む、医薬組成物。

## 【請求項5】

医薬として使用するための、請求項1~3のいずれか1項に記載の化合物および/またはその立体異性体、互変異性体、またはその医薬として許容される塩、あるいはあらゆる割合でのそれらの混合物。

## 【請求項6】

過剰増殖性疾患を治療するための、請求項1~3のいずれか1項に記載の化合物および/

またはその立体異性体、互変異性体、またはその医薬として許容される塩、あるいはあらゆる割合でのそれらの混合物。

【請求項 7】

前記疾患が、がん、炎症、膵臓炎、腎臓疾患、痛み、皮膚の良性過形成、狭窄、前立腺、脈管新生または血管新生に関係する疾患、腫瘍血管新生、乾癬と湿疹と強皮症の中から選択した皮膚疾患、糖尿病、糖尿病性網膜炎、未成年の網膜症、加齢黄斑変性症、血管腫、グリオーマ、メラノーマ、およびカポジ肉腫からなる群から選択される、請求項6に記載の化合物および/またはその立体異性体、互変異性体、またはその医薬として許容される塩、あるいはあらゆる割合でのそれらの混合物。

【請求項 8】

過剰増殖性疾患を治療する医薬を製造するための、請求項1~3のいずれか1項に記載の化合物および/またはその立体異性体、互変異性体、またはその医薬として許容される塩、あるいはあらゆる割合でのそれらの混合物の使用。

【請求項 9】

前記疾患が、がん、炎症、膵臓炎、腎臓疾患、痛み、皮膚の良性過形成、狭窄、前立腺、脈管新生または血管新生に関係する疾患、腫瘍血管新生、乾癬と湿疹と強皮症の中から選択した皮膚疾患、糖尿病、糖尿病性網膜炎、未成年の網膜症、加齢黄斑変性症、血管腫、グリオーマ、メラノーマ、およびカポジ肉腫からなる群から選択される、請求項8に記載の使用。

【請求項 10】

請求項1~3のいずれか1項に記載の化合物、および/またはその立体異性体または互変異性体、またはその医薬として許容される塩、あるいはあらゆる割合でのそれらの混合物を含む、過剰増殖性疾患を治療するための医薬組成物であって、対象に投与される、医薬組成物。

【請求項 11】

前記疾患が、がん、炎症、膵臓炎または腎臓疾患、痛み、皮膚の良性過形成、狭窄、前立腺、脈管新生または血管新生に関係する疾患、腫瘍血管新生、乾せんと湿疹と強皮症の中から選択した皮膚疾患、糖尿病、糖尿病性網膜炎、未成年の網膜症、加齢黄斑変性症、血管腫、グリオーマ、メラノーマ、およびカポジ肉腫からなる群から選択される、請求項10に記載の医薬組成物。

【請求項 12】

請求項1~3のいずれか1項に記載の化合物、および/またはその立体異性体または互変異性体、またはその医薬として許容される塩、あるいはあらゆる割合でのそれらの混合物の有効量と、更なる医薬活性成分の有効量とが別個のパックからなるキット。