

【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28年11月10日 (2016.11.10)

【公表番号】特表2016-500649(P2016-500649A)

【公表日】平成28年1月14日 (2016.1.14)

【年通号数】公開・登録公報2016-003

【出願番号】特願2015-533430(P2015-533430)

【国際特許分類】

C 0 7 D 311/12 (2006.01)

C 0 7 D 311/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/352 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 49/00 (2006.01)

A 6 1 K 9/127 (2006.01)

A 6 1 K 9/14 (2006.01)

C 0 7 C 237/06 (2006.01)

C 0 7 D 311/16 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 311/12 C S P

C 0 7 D 311/14

A 6 1 K 31/352

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 9/00

A 6 1 P 37/02

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 49/00 A

A 6 1 K 9/127

A 6 1 K 9/14

C 0 7 C 237/06

C 0 7 D 311/16

【手続補正書】

【提出日】平成28年9月23日 (2016.9.23)

【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

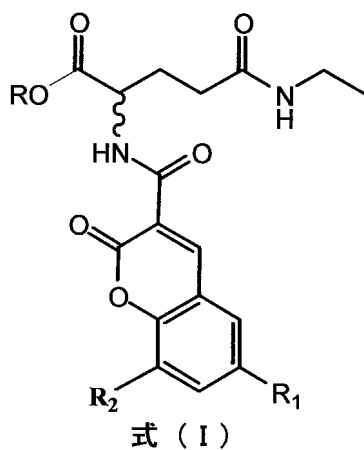
【補正方法】変更

【補正の内容】

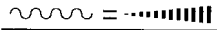
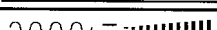
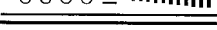
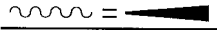
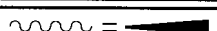

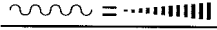
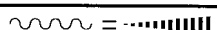

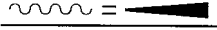
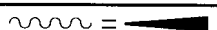
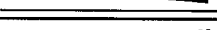

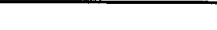




【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I)
【化 1】

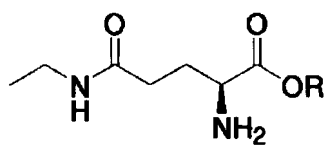


(式中、
【表 1】

(Ia)	R= CH ₃	R ₁ =H	R ₂ =H	 = 
(Ib)	R= CH ₂ CH ₃	R ₁ =H	R ₂ =H	 = 
(Ic)	R= CH ₂ CH ₃	R ₁ =Cl	R ₂ =H	 = 
(Id)	R= CH ₂ CH ₃	R ₁ =Br	R ₂ =H	 = 
(Ie)	R= CH ₂ CH ₃	R ₁ =F	R ₂ =H	 = 
(If)	R= CH ₂ CH ₃	R ₁ =NO ₂	R ₂ =H	 = 
(Ig)	R= CH ₂ CH ₃	R ₁ =Cl	R ₂ =Cl	 = 
(Ih)	R= CH ₂ CH ₃	R ₁ =Br	R ₂ =Br	 = 
(Ii)	R= CH ₂ CH ₃	R ₁ =NH ₂	R ₂ =H	 = 

)
により表される、化合物。

【請求項 2】
式 (I I)
【化 2】



(式中、

【表 2】

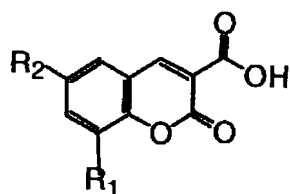
(IIb)	R= CH ₂ CH ₃
-------	------------------------------------

)
により表される、化合物。

【請求項 3】

式 (I I I)

【化 3】



式 (I I I)

(式中、

【表 3】

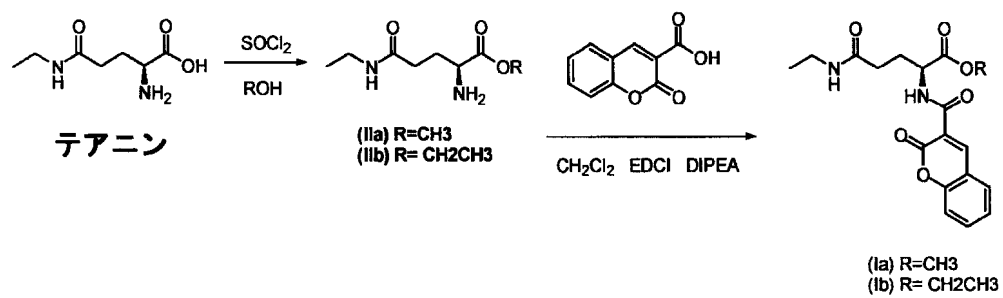
(IIIc)	R ₁ = <u>H</u>	R ₂ = <u>Cl</u>
(IIId)	R ₁ = <u>H</u>	R ₂ = <u>Br</u>
(IIIe)	R ₁ = <u>H</u>	R ₂ = <u>F</u>
(IIIf)	R ₁ = <u>H</u>	R ₂ = <u>NO₂</u>
(IIIg)	R ₁ = <u>Cl</u>	R ₂ = <u>Cl</u>
(IIIh)	R ₁ = <u>Br</u>	R ₂ = <u>Br</u>

)
により表される、化合物。

【請求項 4】

請求項 1 に記載の化合物 I a ~ I b 及び請求項 2 に記載の化合物 I I a ~ I I b を調製する方法。

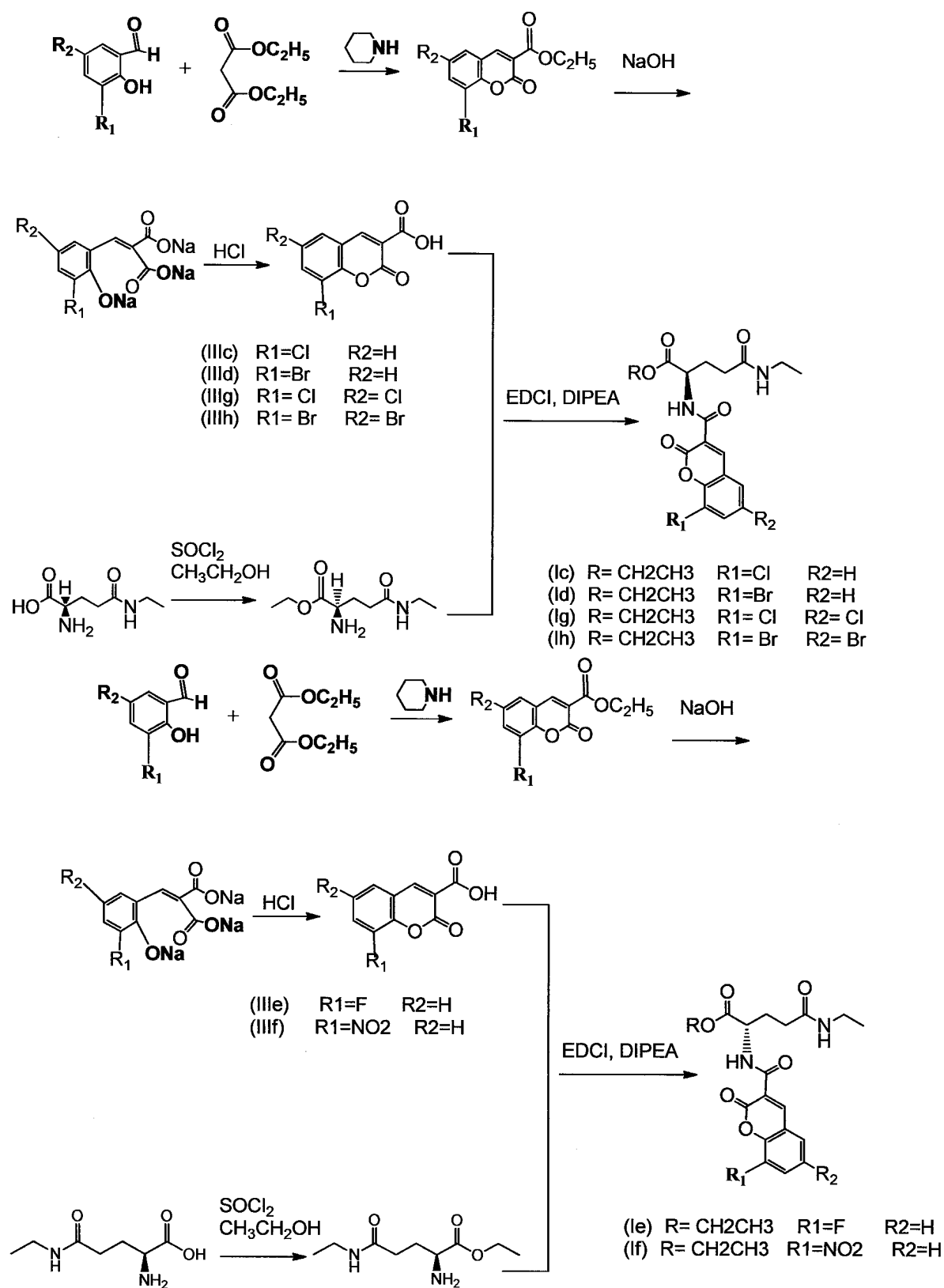
【表 4】



【請求項 5】

請求項 1 に記載の化合物 I c ~ I h 及び請求項 3 に記載の化合物 I I I c ~ I I I h を調製する方法。

【表 5】



【請求項 6】

請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物及び任意に薬剂的に許容できる賦形剤を含む、医薬組成物。

【請求項 7】

前記医薬組成物が、嚥下可能な錠剤、顆粒錠剤、トローチ剤、カプセル剤、エリキシル剤、懸濁剤、シロップ剤、ウェファ、注射液、塗り広げできるペースト、ゲル、軟膏、又はソープの形態で使用する、請求項 6 に記載の医薬組成物。

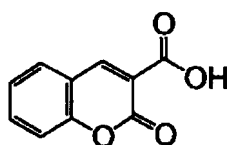
【請求項 8】

前記医薬組成物が種々の新しい医薬剤形であり、前記新しい医薬剤形が、乳化可能なりボソーム、ミクロスフィア、及びナノスフィアから選択される、請求項 6 に記載の医薬組成物。

【請求項 9】

ヒトの肺癌、乳癌、肝臓癌、直腸癌、結腸癌、前立腺癌、胃癌、食道癌、喉頭癌、白血病、リンパ腫、メラノーマ、子宮癌、子宮頸癌、卵巣癌、皮膚癌、気管支癌、細気管支癌、尿道癌、腎臓癌、口腔癌、膣癌、胆管癌、膵臓癌、膀胱癌、脳癌、神経腫、鼻咽頭癌、及び他のヒトの腫瘍の予防及び治療のための、請求項 1 ～ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、又は以下に示される式 I I I a

【化 4】



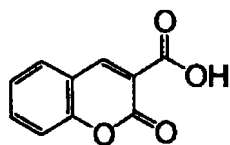
式 (I I I a)

により表される化合物、又は請求項 6 ～ 8 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物、又は式 (I I I a) により表される化合物及び任意に薬剤的に許容できる賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 10】

ヒストンメチルトランスフェラーゼ E Z H 2 の阻害における使用のための、又はヒストンデアセチラーゼの阻害における使用のための、又は、腫瘍、炎症、心血管疾患、免疫不全、及び他の疾患の促進と関連した因子である N F - B の阻害における使用のための、又は、腫瘍、炎症、心血管疾患、免疫不全、及び他の疾患の促進に関連する V E G F R、E G F R、c - M e t、K - R a s、H - R a s、A k t、サイクリン D 1、- カテニン、E R - 、M M P - 9、M M P - 2、D v 1 - 1、D v 1 - 2、D v 1 - 3、B c 1 - 2 などを含む因子のタンパク質レベルの低下における使用のための、又は、B a x、p 5 3、p 2 1、E - カドヘリン、カスパーゼ 3、及びチトクロム C のタンパク質レベルの増加における使用のための、請求項 1 ～ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、又は式 (I I I a)

【化 5】



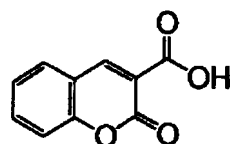
式 (I I I a)

により表される化合物、又は請求項 6 ～ 8 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物、又は式 (I I I a) により表される化合物及び任意に薬剤的に許容できる賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 1 1】

放射線療法と相乗作用する、又は、放射線療法、化学療法、外科治療、温熱療法、及び集学的治療と協同した腫瘍治療における使用のための、化学療法剤と一緒に使った、請求項 1 ～ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、又は式 (I I I a)

【化 6】



式 (I I I a)

により表される化合物、又は請求項 6 ～ 8 のいずれか 1 項に記載の医薬組成物、又は式 (I I I a) により表される化合物及び任意に薬剤的に許容できる賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項 1 2】

前記腫瘍が、ヒトの肺癌、乳癌、肝臓癌、直腸癌、結腸癌、前立腺癌、胃癌、食道癌、喉頭癌、白血病、リンパ腫、メラノーマ、子宮癌、子宮頸癌、卵巣癌、皮膚癌、気管支癌、細気管支癌、尿道癌、腎臓癌、口腔癌、膣癌、胆管癌、膵臓癌、膀胱癌、脳癌、神経腫、鼻咽頭癌、及び他のヒトの腫瘍を含む、請求項 1 0 又は 1 1 に記載の化合物又は医薬組成物。

【請求項 1 3】

ヒトの腫瘍、炎症、心血管疾患、免疫不全、及び他の疾患の予防及び治療における使用のための、又は、上述の疾患の臨床診断蛍光標識における使用のための、又は生活用品の蛍光標識の化合物の組み合わせにおける使用のための、請求項 1 ～ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 1 4】

請求項 1 ～ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物を修飾して形成され、インビトロ又はインビボで反応を受けて前記化合物を提供でき；好ましくは、前記修飾が、グルコシド結合、エステル結合、アミド結合などの形成をもたらし、及び／又は好ましくは前記反応が、加水分解、酸化などを含む、プロドラッグ。