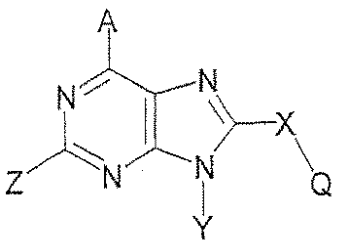
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】平成18年1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2005-511565(P2005-511565A)
【公表日】平成17年4月28日(2005.4.28)
【年通号数】公開・登録公報2005-017
【出願番号】特願2003-540142(P2003-540142)
【国際特許分類】
Ｃ０７Ｄ 473/34　(2006.01)
Ａ６１Ｋ 31/52　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 9/10　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 29/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 31/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 35/00　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 37/06　(2006.01)
Ａ６１Ｐ 43/00　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 473/16　(2006.01)
Ｃ０７Ｄ 473/40　(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ 473/34　３２１
Ａ６１Ｋ 31/52
Ａ６１Ｐ 9/10
Ａ６１Ｐ 29/00
Ａ６１Ｐ 31/00
Ａ６１Ｐ 35/00
Ａ６１Ｐ 37/06
Ａ６１Ｐ 43/00
Ｃ０７Ｄ 473/16　ＣＳＰ
Ｃ０７Ｄ 473/40

【手続補正書】
【提出日】平成17年10月26日(2005.10.26)
【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：
【化１】



で示される化合物または互変異性体もしくはその医薬的に許容される塩またはエステル

［式中、Aは、H、ハロゲン、CN、N_3、$NR^1{}_2$、$NR^1S(O)_2R^2$、OR^3、SR^3、低級アルキル、$C(O)N(R^4)_2$、グアニジン、アミジン、$R^1NR^1{}_2$、NR^1OR^4、およびパーハロアルキルからなる群から選ばれる；

Qは、C_1-C_6アルキル、C_3-C_{10}シクロアルキル、アリールアルキル、アリール、ヘテロアリール、およびC_2-C_8ヘテロサイクリック(すべて所望により置換されている)からなる群から選ばれる；

Xは、Sまたは$S(O)_2$である；

Yは、$C(O)R^2$、$S(O)_2R^2$、$C(O)NR^4{}_2$、および$C(O)OR^2$、所望により置換されたC_2-C_8アルキル、所望により置換されたC_2-C_8アルケニル、所望により置換されたC_2-C_8アルキニル、所望により置換されたアリール、所望により置換されたアリサイクリック、所望により置換されたアラルキル、所望により置換されたアリールオキシアルキル、所望により置換されたアルコキシアルキル、所望により置換されたジオキソラン、アルキルアミノアルキル、所望により置換されたアルキルカルボニルアミノアルキル、$(-(CH_2)_n-C(O)-NR^4-(CH_2)N)$、所望により置換されたアルキルカルボニルオキシルアルキル$(-(CH_2)_n-C(O)-O-(CH_2)_n)$、$C_1$-$C_6$ヒドロキシルアルキル、$C_1$-$C_6$ハロアルキル、および$C_1$-$C_6$パーハロアルキルからなる群から選ばれる；

Zは、H、ハロゲン、CN、OR^3、SR^3、C_1-C_6パーハロアルキル、所望により置換されたC_1-C_6アルキル、所望により置換されたC_2-C_6アルケニル、所望により置換されたC_2-C_6アルキニル、所望により置換されたアリール、所望により置換されたアリサイクリック、所望により置換されたアラルキル、所望により置換されたアリールオキシアルキル、所望により置換されたアルコキシアルキル、所望により置換されたヘテロサイクリック、$C(O)R^2$、$-S(O)_2R^2-$、グアニジン、アミジン、および$C(O)NR^4{}_2$からなる群から選ばれる；

R^1は、独立してH、所望により置換されたC_1-C_6アルキル、所望により置換されたC_3-C_6シクロアルキル、所望により置換されたC_1-C_6ヘテロアルキル、所望により置換されたアリール、所望により置換されたヘテロサイクリック、$C(O)R^2$、$-C(O)OR^2$、$C(O)NR^4{}_2$、$C(S)OR^2$、$C(S)NR^4{}_2$、PO_3R_4、およびSO_2R^2からなる群から選ばれる；

R^2は、独立してC_1-C_6アルキル、ヘテロアルキル、C_3-C_{10}シクロアルキル、ヘテロサイクリック、ヘテロアリール、およびアリール(これらはすべて所望により置換されている)からなる群から選ばれる；

R^3は、独立してH、所望により置換されたC_1-C_6アルキル、所望により置換されたC_3-C_{10}シクロアルキル、所望により置換されたC_1-C_6ヘテロアルキル、所望により置換されたアリール、所望により置換されたヘテロサイクリック、および$C(O)NR^4{}_2$からなる群から選ばれ、

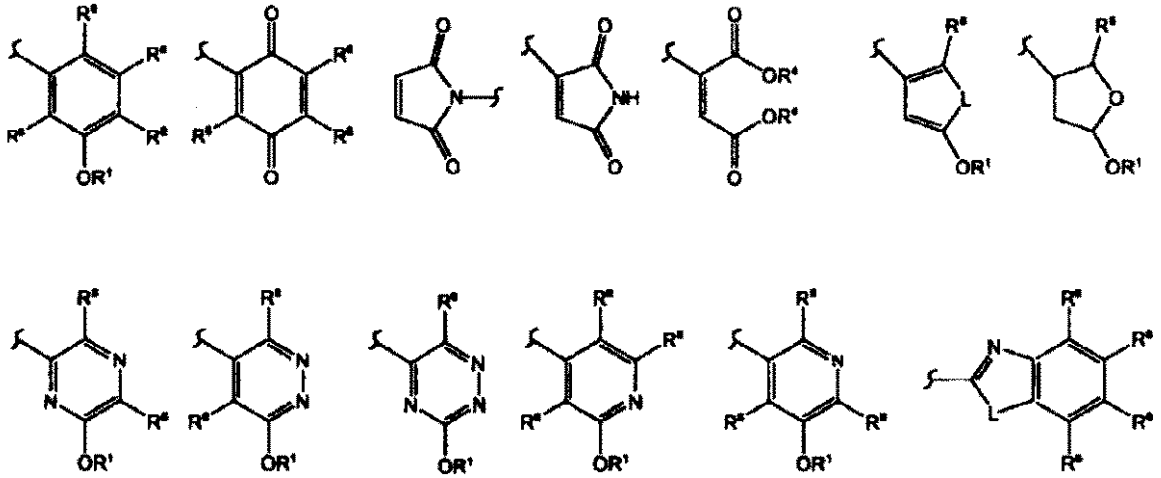
R^4は、独立してH、所望により置換されたC_1-C_6アルキル、所望により置換されたC_3-C_{10}シクロアルキル、所望により置換されたC_1-C_6ヘテロアルキル、所望により置換されたアリール、および所望により置換されたヘテロサイクリックからなる群から選ばれる；

nは1、2、または3である。］。

【請求項２】

Qが

【化２】



からなる群から選ばれるメンバーであり、

Lが O、S、または NR^1 であり、

R^5 が、H、OH、および所望により置換された C_1-C_6 アルキルからなる群から選ばれ；

R^6 が、独立して H、所望により置換された C_1-C_6 アルキル、OR^3、SR^3、NHR^3、$C(O)N(R^4)_2$、$(O)R^5$、NO_2、CN、ハロゲン、および $S(O)_2R^2$ からなる群から選ばれ；

nが 1、2、または 3である；

請求項1記載の化合物または互変異性体もしくはその医薬的に許容される塩またはエステル。

【請求項３】

Aが、H、ハロゲン、$NR^1{}_2$、OR^3、SR^3、所望により置換された C_1-C_6 アルキル、および $C(O)N(R^4)_2$ からなる群から選ばれる請求項1記載の化合物。

【請求項４】

Zが、H、ハロゲン、CN、OR^3、SR^3、所望により置換された C_1-C_6 パーハロアルキル、所望により置換された C_1-C_6 アルキル、所望により置換された C_2-C_6 アルケニル、所望により置換された C_2-C_6 アルキニル、および所望により置換されたアリールからなる群から選ばれる請求項1記載の化合物。

【請求項５】

Xが、Sおよび S(O)から選ばれる請求項1記載の化合物。

【請求項６】

Yが、所望により置換された C_2-C_6 アルキル、所望により置換された C_2-C_6 アルケニル、所望により置換された C_2-C_6 アルキニル、所望により置換されたアリール、および所望により置換された C_3-C_8 カルボサイクリックからなる群から選ばれる請求項1記載の化合物。

【請求項７】

Qが、さらに所望により置換されたアリール、および所望により置換されたヘテロアリールから選ばれる請求項1記載の化合物。

【請求項８】

Xが Sであり、

Aが、Cl、NH_2、および CH_3 からなる群から選ばれ、

Zが、H、F、Cl、Br、および CF_3 からなる群から選ばれ、

Yが、所望により置換された C_3-C_8 アルキル、所望により置換された C_3-C_8 アルケニル、所望により置換された C_3-C_8 アルキニル、所望により置換された C_6-C_{10} アリール、および所望により置換された C_3-C_{10} アリサイクリックからなる群から選ばれる

請求項2記載の化合物。

【請求項９】

Aが NH_2 であり、

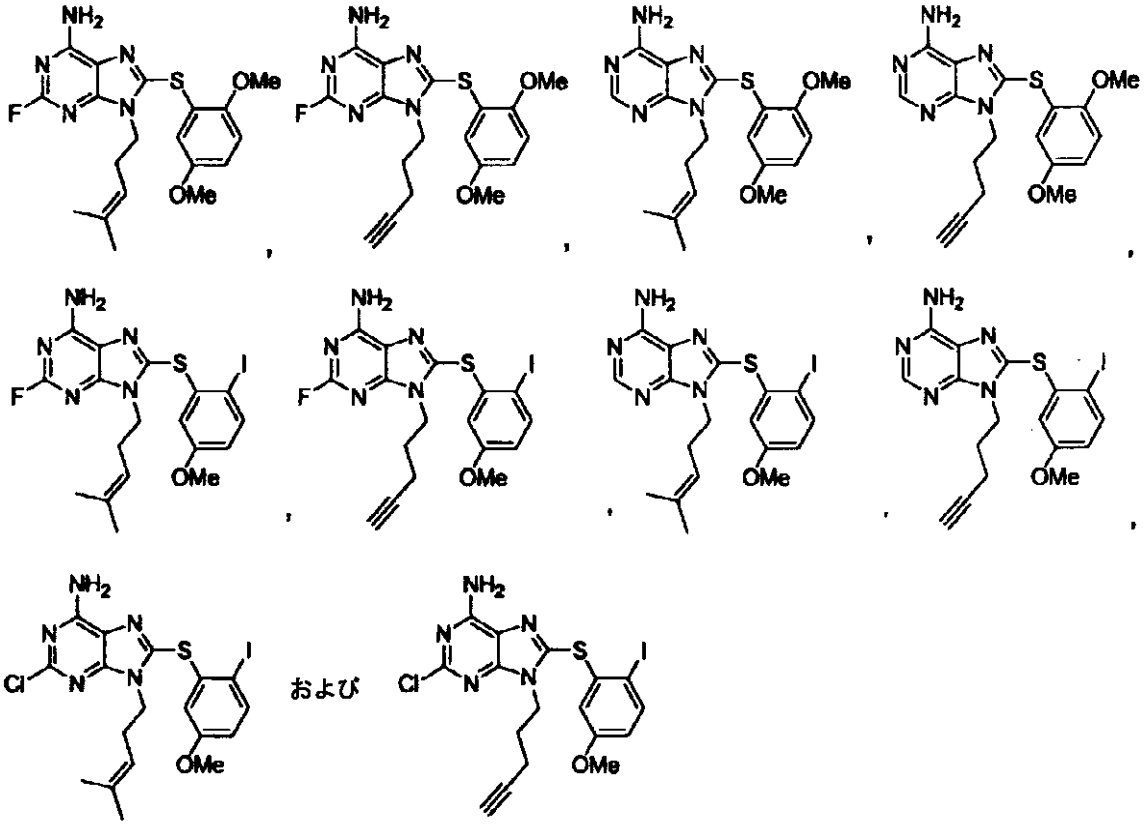
Zが、H、Cl、およびFからなる群から選ばれ、

Yが、$-(CH_2)_2CH=C(CH_3)_2$、$-(CH_2)_3CCH$、$-(CH_2)_4Br$、$-(CH_2)_4Cl$、$-(CH_2)_4OAc$、$-(CH_2)_4NHEt$、$-(CH_2)_4OH$、$-(CH_2)_5Br$、$-(CH_2)_5Cl$、$-(CH_2)_5OAc$、$-(CH_2)_2-O(CH)(CH_3)_2$、および$-(CH_2)_5OH$からなる群から選ばれ、

Qが2,5-ジメトキシフェニル、2-ヨード-5-メトキシフェニル、4-ヨード-5-メトキシフェニル、2-ヨード-4-フルオロ-5-メトキシフェニル、2-ブロモ-5-メトキシフェニル、2-クロロ-5-メトキシフェニル、2,4-ジヨード-5-メトキシフェニル、2-ヨード-4-ブロモ-5-メトキシフェニル、2-ヨード-4-クロロ-5-メトキシフェニル、および2-クロロ-3,4,5-トリメトキシフェニルからなる群から選ばれる請求項7記載の化合物。

【請求項１０】

【化３】



からなる群から選ばれる請求項1記載の化合物。

【請求項１１】

請求項1、5、8、9、および10のいずれかに記載の化合物および医薬的に許容される担体または賦形剤を含む医薬組成物。

【請求項１２】

HSP90を有する細胞を請求項8に記載の化合物と接触させることを含むHSP90を阻害する方法。

【請求項１３】

該細胞が哺乳類細胞である請求項12記載の方法。

【請求項１４】

該哺乳類細胞がヒト由来である請求項12記載の方法。

【請求項１５】

化学療法を含む請求項12記載の方法。

【請求項１６】

該化学療法が乳癌細胞およびメラノーマ細胞に対するものである請求項15記載の方法。

【請求項１７】

癌を有する個体の治療方法であって、請求項1、5、8、9、および10のいずれかに記載の

化合物を含む医薬組成物を該個体に投与することを含む方法。
【請求項１８】
該投与が経口投与である請求項17記載の方法。
【請求項１９】
該投与が局所投与である請求項17記載の方法。
【請求項２０】
該投与が非経口投与である請求項17記載の方法。
【請求項２１】
炎症、感染性疾患、自己免疫疾患、虚血、繊維形成性疾患、および神経変性からなる群から選ばれる疾患または病状を有する個体の治療方法であって、請求項1、5、8、9、および10のいずれかに記載の化合物を含む医薬組成物を該個体に投与することを含む方法。
【請求項２２】
癌を有する個体の治療方法であって、請求項8記載の化合物および抗腫瘍薬を該個体に投与することを含む方法。
【請求項２３】
該腫瘍薬が、放射性同位元素、抗体、組換えタンパク質、ヘルセプチン、タキソール、タキサン、グリーバック、アルキル化剤、代謝拮抗薬、エピドフィロトキシン、抗腫瘍酵素、トポイソメラーゼ阻害剤、プロカルバジン、マイトキサントロン、プラチナ配位複合体、成長阻害剤、抗ホルモン治療剤、造血成長因子、アントラサイクリン薬、ビンカ薬、マイトマイシン、ブレオマイシン、細胞毒性ヌクレオシド、テポチロン、ジスコデルモリド、プテリジン薬、ジイネン、ポドフィロトキシン、カルミノマイシン、ダウノルビシン、アミノプテリン、メトトレキセート、メトプテリン、ジクロロメトトレキセート、マイトマイシンC、ポルフィロマシン、5-フルオロウラシル、6-メルカプトプリン、ゲムシタビン、シトシンアラビノシド、エトポシド、リン酸エトポシド、テニポシド、メルファラン、ビンブラスチン、ビンクリスチン、ラウロシジン、ビンデシン、ラウロシン、パクリタキセル、エストラムスチン、カルボプラチン、シクロホスファミド、ブレオマイシン、ゲムシチビン、イフォサミド、メルファラン、ヘキサメチルメラミン、チオテパ、シタラビン、イダトレキセート、トリメトレキセート、ダカルバジン、L-アスパラギナーゼ、カンプトテシン、CPT-11、トポテカン、アラ-C、ビカルタミド、フルタミド、ロイプロリド、ピリドベンゾインドール、インターフェロン、およびインターロイキンからなる群から選ばれる請求項22記載の方法。
【請求項２４】
該化合物の該投与が経口投与である請求項22記載の方法。
【請求項２５】
該化合物の該投与が局所投与である請求項22記載の方法。
【請求項２６】
該化合物の該投与が非経口投与である請求項22記載の方法。