

【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4日 (2016.11.4)

【公表番号】特表2015-533810(P2015-533810A)

【公表日】平成27年11月26日 (2015.11.26)

【年通号数】公開・登録公報2015-074

【出願番号】特願2015-533142(P2015-533142)

【国際特許分類】

C 0 7 C 321/20 (2006.01)

C 0 7 C 319/14 (2006.01)

C 0 7 C 317/10 (2006.01)

C 0 7 C 315/02 (2006.01)

C 0 7 C 317/28 (2006.01)

C 0 7 C 317/18 (2006.01)

C 0 7 C 317/44 (2006.01)

C 0 7 C 235/38 (2006.01)

C 0 7 C 231/12 (2006.01)

C 0 7 C 311/23 (2006.01)

C 0 7 C 235/48 (2006.01)

C 0 7 D 207/337 (2006.01)

A 6 1 K 31/40 (2006.01)

A 6 1 K 31/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/136 (2006.01)

A 6 1 K 31/197 (2006.01)

A 6 1 K 31/192 (2006.01)

A 6 1 K 31/167 (2006.01)

A 6 1 K 31/223 (2006.01)

A 6 1 K 31/198 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

C 0 7 B 61/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 321/20

C 0 7 C 319/14

C 0 7 C 317/10

C 0 7 C 315/02

C 0 7 C 317/28

C 0 7 C 317/18

C 0 7 C 317/44

C 0 7 C 235/38

C 0 7 C 231/12

C 0 7 C 311/23

C 0 7 C 235/48

C 0 7 D 207/337

A 6 1 K 31/40

A 6 1 K 31/10

A 6 1 K 31/136

A 6 1 K 31/197

A 6 1 K 31/192  
 A 6 1 K 31/167  
 A 6 1 K 31/223  
 A 6 1 K 31/198  
 A 6 1 P 43/00 1 0 5  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 35/02  
 C 0 7 B 61/00 3 0 0

## 【手続補正書】

【提出日】平成28年9月9日(2016.9.9)

## 【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

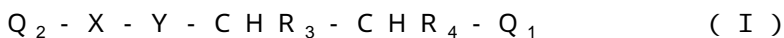
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I の化合物又はその塩：



[ここで、

$Q_1$ は置換アリール及び置換ヘテロアリールより成る群から選択され、これらは、フルオロ；クロロ；ブロモ；ニトロ； $-NR_{10}R_{11}$ ；アロイルアミノ；シアノ；カルボキサミド；トリフルオロメチル； $-O-R_{10}$ ； $[-N(-R_1)-(CH_2)_m-C(-R_5)(-R_6)-(CH_2)_n-COOR_7]_z$ ；及び $C_1-C_{10}$ 飽和又は不飽和、直鎖状又は分岐鎖状、環状又は非環状、キラル又はアキラルのヒドロカルビル基（このヒドロカルビル基の少なくとも1個の炭素原子は随意に $-N(-R_1)-$ 、 $-O-$ 又は $-S-$ で置き換えられていてよい）：より成る群から選択される5個までの置換基を有し；

$Q_2$ は置換アリール及び置換ヘテロアリールより成る群から選択され、これらは、フルオロ；クロロ；ニトロ； $-NR_{10}R_{11}$ ；アロイルアミノ；シアノ；カルボキシ；カルボキサミド；トリフルオロメチル； $-O-SO_2-OH$ ； $-O-P(=O)(OR_8)_2$ ； $-O-R_{10}$ ； $[-N(-R_9)-(CH_2)_m-C(-R_5)(-R_6)-(CH_2)_n-COOR_7]_z$ ；及び $C_1-C_{10}$ 飽和又は不飽和、直鎖状又は分岐鎖状、環状又は非環状、キラル又はアキラルのヒドロカルビル基（このヒドロカルビル基の少なくとも1個の炭素原子は随意に $-N(-R_1)-$ 、 $-O-$ 又は $-S-$ で置き換えられていてよい）：より成る群から選択される5個までの置換基を有し；

ここで、 $Q_1$ 及び $Q_2$ の内の少なくとも1つは非置換フェニル以外の置換基で置換されているものとし；

$X$ は $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 、 $-S(=O)_2-$ 、 $-CH(R_2)-$ 及び $-N(-R_1)-$ より成る群から選択され；

$Y$ は $-N(-R_1)-$ 、 $-C(=O)-$ 、 $-S-$ 及び $-S(=O)_2-$ より成る群から選択され；

$R_1$ 及び $R_2$ はそれぞれ独立してH及び $C_1-C_{10}$ 飽和又は不飽和、直鎖状又は分岐鎖状、環状又は非環状、キラル又はアキラルのヒドロカルビル基（このヒドロカルビル基の少なくとも1個の炭素原子は随意に $-N(-R_1)-$ 、 $-O-$ 又は $-S-$ で置き換えられていてよい）より成る群から選択され；

$R_3$ 及び $R_4$ はそれぞれ独立してH； $C_1-C_{10}$ 飽和又は不飽和、直鎖状又は分岐鎖状、非環状、キラル又はアキラルのヒドロカルビル基（このヒドロカルビル基の少なくとも1個の炭素原子は随意に $-N(-R_1)-$ 、 $-O-$ 又は $-S-$ で置き換えられていてよい）；及び $C_1-C_{10}$ 飽和又は不飽和、直鎖状又は分岐鎖状、環状、キラル又はアキラルのヒド

ロカルビル基：より成る群から選択され；

また、 $R_3$ と $R_4$ とが一緒になって3～4個の炭素原子を有する飽和又は不飽和炭素環式環を形成することもでき（ここで、1個以上の炭素原子は随意に $-N(-R_1)-$ 又は $-S-$ で置き換えられてヘテロ環を形成してもよい）、また、 $R_3$ と $R_4$ とが一緒になって5～6個の炭素原子を有する飽和又は不飽和炭素環式環を形成することもでき（ここで、1個以上の炭素原子は随意に $-N(-R_1)-$ 、 $-O-$ 又は $-S-$ で置き換えられていてもよい）；

また、 $R_4$ と $Q_2$ とが一緒になって炭素環式環を形成することもでき；

$R_5$ 及び $R_6$ はそれぞれ独立してH；ハロ；及び $C_1 - C_{10}$ 飽和又は不飽和、直鎖状又は分岐鎖状、環状又は非環状、キラル又はアキラルのヒドロカルビル基（このヒドロカルビル基は1個以上のハロゲン、 $C_1 - C_4$ アルキル、 $C_1 - C_4$ アルコキシ、ヒドロキシ、カルボキシ、カルボキサミド、アミノ、( $C_1 - C_6$ )アルキル、( $C_1 - C_6$ )ジアルキルアミノ又はアシルアミノで随意に置換されていてもよい）より成る群から選択され；

また、 $R_5$ と $R_6$ とが一緒になって3～6個の炭素原子を有する飽和又は不飽和炭素環式環を形成することもでき（ここで、1個以上の炭素原子は随意に $-N(-R_1)-$ 、 $-O-$ 又は $-S-$ で置き換えられていてもよい）；

$R_7$ はH；及び $C_1 - C_{10}$ 飽和又は不飽和、直鎖状又は分岐鎖状、環状又は非環状、キラル又はアキラルのヒドロカルビル基；及び無機カチオン又は有機カチオン（塩を形成）：より成る群から選択され；

$R_8$ はH及び( $C_1 - C_7$ )ヒドロカルビルより成る群から選択され；

$R_9$ はH及び $-(CH_2)_m - C(-R_5)(-R_6) - (CH_2)_n - COOR_7$ より成る群から選択され；

$R_{10}$ はH、分岐鎖状又は非分岐鎖状( $C_1 - C_6$ )アルキル及び( $C_2 - C_8$ )アシルより成る群から選択され；

$R_{11}$ はH、分岐鎖状又は非分岐鎖状( $C_1 - C_6$ )アルキル及び( $C_2 - C_8$ )アシルより成る群から選択され；

$m$ 及び $n$ はそれぞれ独立して0～2であり；

$z$ は1～2であり；

但し、Xが $-S-$ 、 $-S(=O)-$ 又は $-S(=O)_2-$ である場合にはYは $-N(-R_1)-$ である。]

【請求項2】

Xが $-N(-R_1)-$ 又は $-CH(R_2)-$ であり且つYが $-S(=O)_2-$ である、請求項1に記載の化合物又はその塩。

【請求項3】

Xが $-N(-R_1)-$ であり且つYは $-C(=O)-$ である、請求項1に記載の化合物又はその塩。

【請求項4】

$R_3$ がHであり且つ $R_4$ がHである請求項2又は3に記載の化合物又はその塩。

【請求項5】

$Q_1$ が $-O-R_{10}$ 及びフルオロより成る群から選択される少なくとも1つの置換基を有する、請求項4に記載の化合物又はその塩。

【請求項6】

$Q_2$ がクロロ； $-O-R_{10}$ ； $-NR_{10}R_{11}$ ；及び $[-N(-R_9) - (CH_2)_m - C(-R_5)(-R_6) - (CH_2)_n - COOR_7]_z$ より成る群から選択される少なくとも1つの置換基を有する、請求項4に記載の化合物又はその塩。

【請求項7】

$Q_2$ がクロロ； $-O-R_{10}$ ； $-NR_{10}R_{11}$ ；及び $[-N(-R_9) - (CH_2)_m - C(-R_5)(-R_6) - (CH_2)_n - COOR_7]_z$ より成る群から選択される少なくとも1つの置換基を有する、請求項5に記載の化合物又はその塩。

【請求項8】

$Q_1$ がその4位に置換基を有するフェニルであり且つ $Q_2$ がその4位に置換基を有するフェニルである、請求項7に記載の化合物又はその塩。

【請求項9】

$Q_1$ がその2位、4位及び6位において( $C_1 - C_3$ )アルコキシで置換されたフェニルであり、且つ $Q_2$ が少なくとも4位において $-O-R_{10}$ 又は $-NR_{10}R_{11}$ で置換されたフェニルである、請求項8に記載の化合物又はその塩。

【請求項10】

$Q_2$ が4位において $-O-R_{10}$ 又は $-NR_{10}R_{11}$ で置換され且つ3位において $-NR_{10}R_{11}$ 、 $-O-R_{10}$ 又は $-N(-R_9)-(CH_2)_m-C(-R_5)(-R_6)-(CH_2)_n-COOR_7$ で置換されたフェニルである、請求項9に記載の化合物又はその塩。

【請求項11】

以下のもの：

4 - クロロベンジル - 4 - フルオロフェネチルスルファン；  
 1 - クロロ - 4 - ( ( ( 4 - フルオロフェネチル ) スルホニル ) メチル ) ベンゼン；  
 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) アニリン；  
 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェノール；  
 N - ( 3 - アミノ - 4 - メトキシフェニル ) - 3 - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェニル ) プロパンアミド；  
 2 - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェニル ) アミノ ) 酢酸メチル；  
 2 , 2' - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェニル ) アザンジイル ) 二酢酸ジメチル；  
 2 - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェニル ) アミノ ) 酢酸；  
 2 - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェニル ) アミノ ) プロパン酸；  
 2 - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェニル ) アミノ ) - 2 - メチルプロパン酸；  
 2 - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェニル ) アミノ ) - 2 - フェニル酢酸；  
 2 - ( 4 - フルオロフェニル ) - 2 - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェニル ) アミノ ) 酢酸；  
 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェニル ) アミノ ) 酢酸；  
 2 - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェニル ) アミノ ) - 3 - フェニルプロパン酸；  
 2 - シクロプロピル - 2 - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェニル ) アミノ ) 酢酸；  
 2 - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェニル ) アミノ ) - 2 - ( 1H - ピロール - 3 - イル ) 酢酸；  
 N - ( 3 - アミノ - 4 - メトキシフェニル ) - 2 - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェニル ) エタンスルホンアミド；  
 1 , 3 , 5 - トリメトキシ - 2 - ( 2 - ( ( 4 - メトキシベンジル ) スルホニル ) エチル ) ベンゼン；

及びそれらの塩；

より成る群から選択される、請求項1に記載の化合物又はその塩。

【請求項12】

前記化合物が 2 - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル

）スルホニル）メチル）フェニル）アミノ）酢酸又はその塩である、請求項 1 1 に記載の化合物又はその塩。

【請求項 1 3】

以下のもの：

N - ( 4 - メトキシフェネチル ) - 4 - メチルベンゼンスルホンアミド；  
 4 - メトキシ - N - ( 4 - メトキシフェネチル ) - 3 - ニトロベンゼンスルホンアミド；  
 3 - アミノ - 4 - メトキシ - N - ( 4 - メトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド；  
 4 - メトキシ - 3 - ニトロ - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド；  
 3 - アミノ - 4 - メトキシ - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド；  
 4 - メトキシ - N - ( 4 - メトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド；  
 4 - メトキシ - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド；  
 4 - メチル - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド；  
 2 - ( 4 - メトキシフェニル ) - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェニル ) エタンスルホンアミド；  
 4 - ( ( ( 3 , 4 - ジメトキシフェネチル ) チオ ) メチル ) - 2 - メトキシフェノール；  
 4 - ( ( ( 3 , 4 - ジメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) - 2 - メトキシフェノール；

及びその塩：

より成る群から選択される、請求項 1 に記載の化合物又はその塩。

【請求項 1 4】

前記化合物が 3 - アミノ - 4 - メトキシ - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド 又はその塩である、請求項 1 3 に記載の化合物又はその塩。

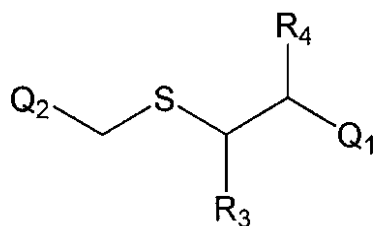
【請求項 1 5】

前記化合物が 3 - アミノ - 4 - メトキシ - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミドナトリウム 塩である、請求項 1 4 に記載の化合物又はその塩。

【請求項 1 6】

次式 I a：

【化 1】

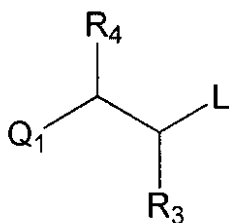


式 Ia

を有する請求項 1 に記載の式 I の化合物又はその塩の製造方法であって、

式 A A：

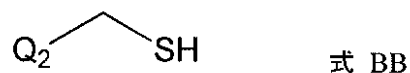
【化 2】



式 AA

の化合物と式 B B：

## 【化 3】



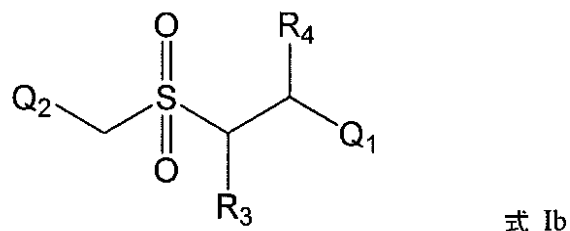
の化合物とを反応させて反応混合物中の式 I a の化合物又はその塩を製造し、随意に反応混合物から式 I a の化合物又はその塩を単離することを含む、前記方法。

(ここで、 $\text{Q}_1$ 、 $\text{Q}_2$ 、 $\text{R}_3$ 及び $\text{R}_4$ は請求項 1 で規定された通りであり、 $\text{L}$ は $\text{Cl}$ 、 $\text{Br}$ 及び $\text{I}$ より成る群から選択される脱離基である。)

## 【請求項 17】

次式 I b :

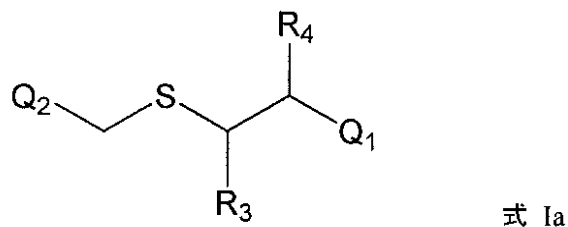
## 【化 4】



を有する請求項 1 に記載の式 I の化合物又はその塩の製造方法であって、

式 I a :

## 【化 5】



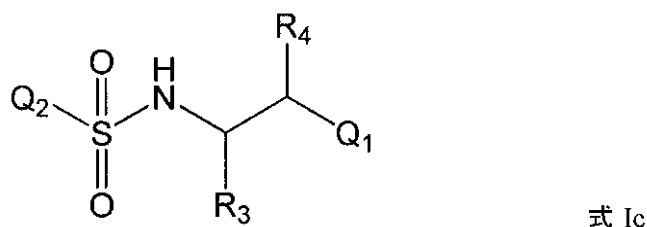
の化合物を酸化して反応混合物中の式 I b の化合物又はその塩を製造し、随意に反応混合物から式 I b の化合物又はその塩を単離することを含む、前記方法。

(ここで、 $\text{Q}_1$ 、 $\text{Q}_2$ 、 $\text{R}_3$ 及び $\text{R}_4$ は請求項 1 で規定された通りである。)

## 【請求項 18】

式 I c :

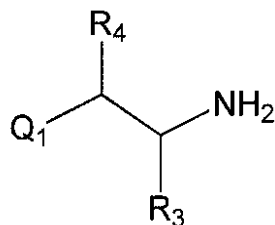
## 【化 6】



を有する請求項 1 に記載の式 I の化合物又はその塩の製造方法であって、

式 C C :

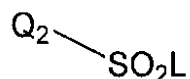
【化 7】



式 CC

の化合物と式 DD :

【化 8】



式 DD

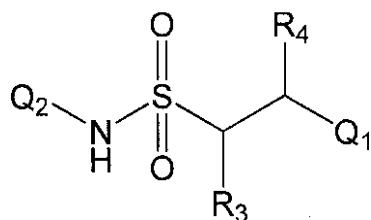
の化合物とを反応させて反応混合物中の式 I c の化合物又はその塩を製造し、随意に反応混合物から式 I c の化合物又はその塩を単離することを含む、前記方法。

(ここで、 $\text{Q}_1$ 、 $\text{Q}_2$ 、 $\text{R}_3$ 及び $\text{R}_4$ は請求項 1 で規定された通りであり、  
L は Cl、Br 及び I より成る群から選択される脱離基である。)

【請求項 19】

式 Id :

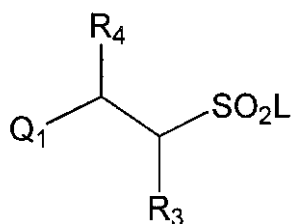
【化 9】



式 Id

を有する請求項 1 に記載の式 I の化合物又はその塩の製造方法であって、  
式 EE :

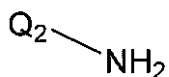
【化 10】



式 EE

の化合物と式 FF :

【化 11】



式 FF

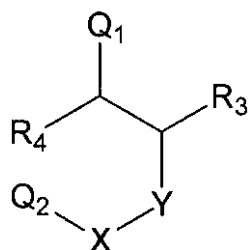
の化合物とを反応させて反応混合物中の式 Id の化合物又はその塩を製造し、随意に反応混合物から式 Id の化合物又はその塩を単離することを含む、前記方法。

(ここで、 $\text{Q}_1$ 、 $\text{Q}_2$ 、 $\text{R}_3$ 及び $\text{R}_4$ は請求項 1 で規定された通りであり、  
L は Cl、Br 及び I より成る群から選択される脱離基である。)

【請求項 20】

式 If :

## 【化 1 2】

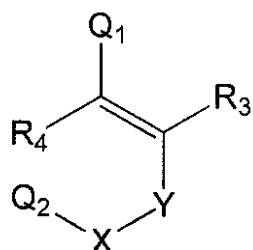


式 If

を有する請求項 1 に記載の式 I の化合物又はその塩の製造方法であって、

式 I e :

## 【化 1 3】



式 Ie

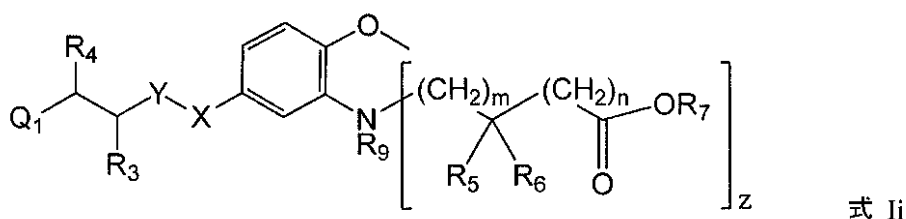
の化合物を反応させて反応混合物中の式 I f の化合物又はその塩を製造し、随意に反応混合物から式 I f の化合物又はその塩を単離することを含む、前記方法。

(ここで、X、Y、Q<sub>1</sub>、Q<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>及びR<sub>4</sub>は請求項 1 で規定された通りである。)

## 【請求項 2 1】

式 I i :

## 【化 1 4】

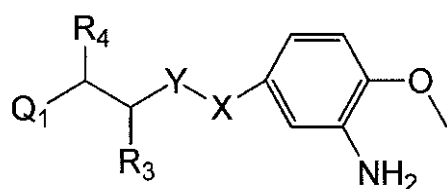


式 Ii

を有する請求項 1 に記載の式 I の化合物又はその塩の製造方法であって、

式 I h :

## 【化 1 5】



式 Ih

の化合物を反応させて反応混合物中の式 I i の化合物又はその塩を製造し、随意に反応混合物から式 I i の化合物又はその塩を単離することを含む、前記方法。

(ここで、X、Y、Q<sub>1</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、R<sub>9</sub>、m、n 及び z は請求項 1 で規定された通りである。)

## 【請求項 2 2】

製薬上許容できるキャリアーと、請求項 1 に記載の化合物又はその製薬上許容できる塩とを含む製薬組成物。

## 【請求項 2 3】

製薬上許容できるキャリアーと、請求項 1 1 に記載の化合物又はその製薬上許容できる塩とを含む製薬組成物。

【請求項 2 4】

製薬上許容できるキャリアーと、請求項 1 3 に記載の化合物又はその製薬上許容できる塩とを含む製薬組成物。

【請求項 2 5】

前記化合物が 3 - アミノ - 4 - メトキシ - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド 又はその製薬上許容できる塩である、請求項 2 4 に記載の製薬組成物。

【請求項 2 6】

請求項 1 に記載の少なくとも 1 種の化合物又はその製薬上許容できる 塩を含む、細胞増殖性疾患 治療用医薬。

【請求項 2 7】

前記化合物が 2 - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェニル ) アミノ ) 酢酸である、請求項 2 6 に記載の医薬。

【請求項 2 8】

前記化合物が

N - ( 4 - メトキシフェネチル ) - 4 - メチルベンゼンスルホンアミド ;  
4 - メトキシ - N - ( 4 - メトキシフェネチル ) - 3 - ニトロベンゼンスルホンアミド ;  
3 - アミノ - 4 - メトキシ - N - ( 4 - メトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド ;  
4 - メトキシ - 3 - ニトロ - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド ;  
3 - アミノ - 4 - メトキシ - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド ;  
4 - メトキシ - N - ( 4 - メトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド ;  
4 - メトキシ - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド ;  
4 - メチル - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド ;  
2 - ( 4 - メトキシフェニル ) - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェニル ) エタンスルホンアミド ;  
4 - ( ( ( 3 , 4 - ジメトキシフェネチル ) チオ ) メチル ) - 2 - メトキシフェノール ;  
4 - ( ( ( 3 , 4 - ジメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) - 2 - メトキシフェノール ;

及びそれらの製薬上許容できる塩 ;

より成る群から選択される、請求項 2 6 に記載の 医薬。

【請求項 2 9】

前記化合物が 3 - アミノ - 4 - メトキシ - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド 又はその製薬上許容できる塩である、請求項 2 6 に記載の 医薬。

【請求項 3 0】

前記細胞増殖性疾患が癌である、請求項 2 6 に記載の 医薬。

【請求項 3 1】

前記細胞増殖性疾患が卵巣癌 ; 子宮頸癌 ; 乳癌 ; 前立腺癌 ; 精巣癌 ; 肺癌 ; 腎臓癌 ; 結腸直腸癌 ; 皮膚癌 ; 脳腫瘍 ; 及び白血病より成る群から選択される癌である、請求項 3 0 に記載の 医薬。

【請求項 3 2】

化合物 4 - ( 2 - ( ( 4 - クロロベンジル ) スルホニル ) エチル ) 安息香酸又はその製薬上許容できる塩。

【請求項 3 3】

製薬上許容できるキャリアーと、請求項 3 2 に記載の化合物又はその製薬上許容できる塩とを含む製薬組成物。

## 【請求項 3 4】

請求項 3 2 に記載の化合物又はその製薬上許容できる塩を含む、細胞増殖性疾患治療用医薬。

## 【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 5 4

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 5 4】

1 つの局面において、式 I の化合物は、以下のものである：

- 4 - クロロベンジル - 4 - フルオロフェネチルスルファン；
- 1 - クロロ - 4 - ( ( ( 4 - フルオロフェネチル ) スルホニル ) メチル ) ベンゼン；
- 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) アニリン；
- 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェノール；
- 4 - ( 2 - ( ( 4 - クロロベンジル ) スルホニル ) エチル ) 安息香酸；
- N - ( 3 - アミノ - 4 - メトキシフェニル ) - 3 - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェニル ) プロパンアミド；
- 2 - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェニル ) アミノ ) 酢酸メチル；
- 2 , 2' - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェニル ) アザンジイル ) 二酢酸ジメチル；
- 2 - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェニル ) アミノ ) 酢酸；
- 2 - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェニル ) アミノ ) プロパン酸；
- 2 - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェニル ) アミノ ) - 2 - メチルプロパン酸；
- 2 - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェニル ) アミノ ) - 2 - フェニル酢酸；
- 2 - ( 4 - フルオロフェニル ) - 2 - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェニル ) アミノ ) 酢酸；
- 2 - ( 4 - クロロフェニル ) - 2 - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェニル ) アミノ ) 酢酸；
- 2 - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェニル ) アミノ ) - 3 - フェニルプロパン酸；
- 2 - シクロプロピル - 2 - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェニル ) アミノ ) 酢酸；
- 2 - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) フェニル ) アミノ ) - 2 - ( 1 H - ピロール - 3 - イル ) 酢酸；
- N - ( 3 - アミノ - 4 - メトキシフェニル ) - 2 - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェニル ) エタンスルホンアミド；
- 1 , 3 , 5 - トリメトキシ - 2 - ( 2 - ( ( 4 - メトキシベンジル ) スルホニル ) エチル ) ベンゼン；
- N - ( 4 - メトキシフェネチル ) - 4 - メチルベンゼンスルホンアミド；
- 4 - メトキシ - N - ( 4 - メトキシフェネチル ) - 3 - ニトロベンゼンスルホンアミド；
- 3 - アミノ - 4 - メトキシ - N - ( 4 - メトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド；
- 4 - メトキシ - 3 - ニトロ - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド；

3 - アミノ - 4 - メトキシ - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド ;  
 4 - メトキシ - N - ( 4 - メトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド ;  
 4 - メトキシ - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド ;  
 4 - メチル - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド ;  
 4 - メトキシ - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンズアミド ;  
 4 - メトキシ - N - ( 4 - メトキシフェネチル ) ベンズアミド ;  
 4 - メトキシ - N - ( 4 - メトキシフェネチル ) - 3 - ニトロベンズアミド ;  
 3 - アミノ - 4 - メトキシ - N - ( 4 - メトキシフェネチル ) ベンズアミド ;  
 4 - メトキシ - 3 - ニトロ - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンズアミド ;  
 ;  
 3 - アミノ - 4 - メトキシ - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンズアミド ;  
 ;  
 2 - ( 4 - メトキシフェニル ) - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェニル ) エタンスルホンアミド ;  
 4 - ( ( ( 3 , 4 - ジメトキシフェネチル ) チオ ) メチル ) - 2 - メトキシフェノール ;  
 4 - ( ( ( 3 , 4 - ジメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) - 2 - メトキシフェノール ;  
 N - ( 4 - メトキシフェネチル ) - 4 - メチルベンゼンスルホンアミド ;  
 4 - メトキシ - N - ( 4 - メトキシフェネチル ) - 3 - ニトロベンゼンスルホンアミド ;  
 3 - アミノ - 4 - メトキシ - N - ( 4 - メトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド ;  
 4 - メトキシ - 3 - ニトロ - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド ;  
 3 - アミノ - 4 - メトキシ - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド ;  
 4 - メトキシ - N - ( 4 - メトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド ;  
 4 - メトキシ - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド ;  
 4 - メチル - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンゼンスルホンアミド ;  
 4 - メトキシ - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンズアミド ;  
 4 - メトキシ - N - ( 4 - メトキシフェネチル ) ベンズアミド ;  
 4 - メトキシ - N - ( 4 - メトキシフェネチル ) - 3 - ニトロベンズアミド ;  
 3 - アミノ - 4 - メトキシ - N - ( 4 - メトキシフェネチル ) ベンズアミド ;  
 4 - メトキシ - 3 - ニトロ - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンズアミド ;  
 ;  
 3 - アミノ - 4 - メトキシ - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) ベンズアミド ;  
 ;  
 2 - ( 4 - メトキシフェニル ) - N - ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェニル ) エタンスルホンアミド ;  
 4 - ( ( ( 3 , 4 - ジメトキシフェネチル ) チオ ) メチル ) - 2 - メトキシフェノール ;  
 4 - ( ( ( 3 , 4 - ジメトキシフェネチル ) スルホニル ) メチル ) - 2 - メトキシフェノール ;

又はそれらの塩。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0371

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0371】

2 - ( ( 2 - メトキシ - 5 - ( ( ( 2 , 4 , 6 - トリメトキシフェネチル ) スルホニル )  
 メチル ) フェニル ) アミノ ) 酢酸

COc1cc(OC)c(CSCCNC(=O)O)c(Cc2ccc(OC)cc2)c1