

【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26年4月10日 (2014.4.10)

【公表番号】特表2013-525438(P2013-525438A)

【公表日】平成25年6月20日 (2013.6.20)

【年通号数】公開・登録公報2013-032

【出願番号】特願2013-508139(P2013-508139)

【国際特許分類】

C 0 7 D 209/08 (2006.01)

C 0 7 D 209/34 (2006.01)

C 0 7 D 215/36 (2006.01)

A 6 1 K 31/404 (2006.01)

A 6 1 K 31/4704 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 K 31/538 (2006.01)

C 0 7 D 265/36 (2006.01)

C 0 7 D 235/26 (2006.01)

A 6 1 K 31/4184 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

C 0 7 D 215/38 (2006.01)

C 0 7 D 215/16 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 215/48 (2006.01)

C 0 7 D 223/16 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 209/08

C 0 7 D 209/34

C 0 7 D 215/36

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 31/4704

A 6 1 K 31/55

A 6 1 K 31/538

C 0 7 D 265/36

C 0 7 D 235/26 B

A 6 1 K 31/4184

C 0 7 D 401/04

A 6 1 K 31/4709

C 0 7 D 215/38

C 0 7 D 215/16

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 405/12

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

C 0 7 D 215/48

C 0 7 D 223/16

A

【手続補正書】

【提出日】平成26年2月21日(2014.2.21)

【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

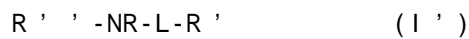
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式(I'):



[式中、

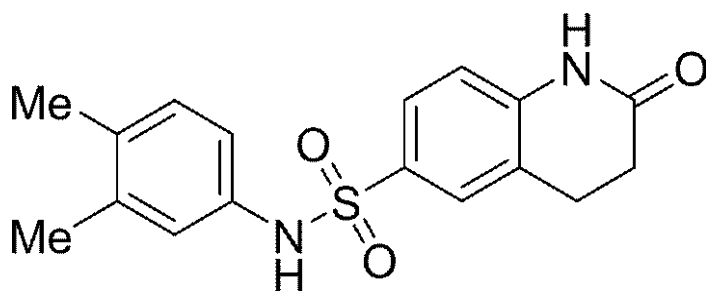
RはH又はC₁-C₄アルキルであり；LはSO₂又はCOであり；

R'は縮合二環であり、二環の一方の環は、フェニルであり、窒素原子で、又はLがSO₂の場合に硫黄原子で若しくはLがCOの場合に炭素原子でNR-L部位と結合し、二環の他方の環はアリール、ヘテロアリール、シクリル又はヘテロシクリルであり、R'はアリール、ヘテロアリール、シクリル、アルキル、アルコキシル、ハロゲン、NH₂、NH-(C₁-C₄)アルキル、N-(C₁-C₄)アルキル-(C₁-C₄)アルキル、(C₁-C₄)アルキル-CO-及びヘテロシクリルからなる群(ハロゲン及びNH₂以外はそれぞれさらにNH₂、OH、NH-(C₁-C₄)アルキル及びN-(C₁-C₄)アルキル-(C₁-C₄)アルキルからなる群から選ばれる1個以上の置換基で置換されていてもよい)から選ばれる1個以上の置換基で一方又は両方の環が置換されていてもよく；及び

R'は、ハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄アルコキシル、シアノ、アルキレンジオキシ、アリール、ヘテロアリール、ベンジル、B(OH)₂及び1個以上のハロゲンで置換されたC₁-C₄アルキルからなる群から選ばれる1個以上の置換基で置換されていてもよいフェニル、ベンジル若しくはヘテロアリール、又はハロゲン、C₁-C₄アルキル、C₁-C₄アルコキシル、アルキレンジオキシ、アリール、ヘテロアリール、ベンジル及び1個以上のハロゲンで置換されたC₁-C₄アルキルからなる群から選ばれる1個以上の置換基でそれぞれ置換されていてもよいアリール、ヘテロアリール、シクリル若しくはヘテロシクリルで縮合されていてもよいフェニルである。]

で表される化合物(ただし、式：

【化1】



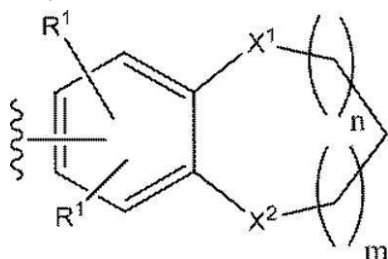
で表される化合物を除く)

又は薬学的に許容されるその塩。

【請求項 2】

R'が、

【化 2】



[式中、

X^1 及び X^2 はそれぞれ独立して O、 NR^6 又は CR^7R^8 であり；

X^1 及び X^2 を含む環の何れの CH_2-CH_2 部位も、 $CH=CH$ 部位で置き換えてもよく；

X^1 及び X^2 を含む環の何れの $NH-CH_2$ 部位も、 $N=CH$ 部位で置き換えてもよく；

X^1 及び X^2 を含む環の何れのメチレンも、カルボニルで置き換えてもよく；

n 及び m は、それぞれ独立して 0、1 又は 2 であり、且つ $n+m$ が 0 ~ 2 であり；

各 R^1 は独立して H、ハロゲン、アルキル、アルコキシル、 NH_2 、 $NH-(C_1-C_4)$ アルキル、 $N-(C_1-C_4)$ アルキル、 (C_1-C_4) アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクリル又はヘテロシクリルであり、ハロゲン及び NH_2 以外は、それぞれ、さらに NH_2 、OH、 $NH-(C_1-C_4)$ アルキル及び $N-(C_1-C_4)$ アルキル、 (C_1-C_4) アルキルからなる群から選ばれる 1 個以上の置換基で置換されていてもよく；

R^6 は H、アルキル、アルキルカルボキシ、アリール、ヘテロアリール、シクリル又はヘテロシクリルであり、それぞれ、さらに NH_2 、OH、 $NH-(C_1-C_4)$ アルキル及び $N-(C_1-C_4)$ アルキル、 (C_1-C_4) アルキルからなる群から選ばれる 1 個以上の置換基で置換されていてもよく；及び

R^7 及び R^8 は、それぞれ独立して H、ハロゲン、アルキル、アルコキシル、 NH_2 、 $NH-(C_1-C_4)$ アルキル、 $N-(C_1-C_4)$ アルキル、 (C_1-C_4) アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクリル又はヘテロシクリルであり、ハロゲン及び NH_2 以外は、それぞれ、さらに NH_2 、OH、 $NH-(C_1-C_4)$ アルキル及び $N-(C_1-C_4)$ アルキル、 (C_1-C_4) アルキルからなる群から選ばれる 1 個以上の置換基で置換されていてもよい。] である、請求項 1 に記載の化合物又は塩。

【請求項 3】

R' が、3,4-ジヒドロキノリン-2(1H)-オンイル、インドリン-2-オンイル、4,5-ジヒドロ-1H-ベンゾ[b]アゼピン-2(3H)-オンイル、2H-ベンゾ[b][1,4]オキサジン-3(4H)-オンイル、4-メチル-2H-ベンゾ[b][1,4]オキサジン-3(4H)-オンイル、1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2(3H)-オンイル、1,3-ジメチル-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-2(3H)-オンイル、1-(インドリン-1-イル)エタノニル、1-メチル-1H-インドリル、1-アセチル-2-メチルインドリニル、6-クロロ-2-オキシインドリニル、3,3-ジクロロ-2-オキシインドリニル、7-((2-(ジメチルアミノ)エチル)(メチル)アミノ)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリニル、2-オキソ-7-(ピロリジン-1-イル)-1,2,3,4-テトラヒドロキノリニル、7-(3-(ジメチルアミノ)ピロリジン-1-イル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリニル、7-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルアミノ)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリニル、7-(イソプロピルアミノ)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリニル、7-(ジエチルアミノ)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリニル、7-(2-ヒドロキシエチルアミノ)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリニル、7-(1-ヒドロキシプロパン-2-イルアミノ)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリニル、(S)-7-(1-ヒドロキシプロパン-2-イルアミノ)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリニル又は(R)-7-(1-ヒドロキシプロパン-2-イルアミノ)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリニルである、請求項 1 に記載の化合物又は塩。

【請求項 4】

R'' が、

(II)

R¹はH、ハロゲン、アルキル、アルコキシル、NH₂、NH-(C₁-C₄)アルキル、N-(C₁-C₄)アルキル-(C₁-C₄)アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクリル又はヘテロシクリルであり、ハロゲン及びNH₂以外は、それぞれさらにNH₂、OH、NH-(C₁-C₄)アルキル及びN-(C₁-C₄)アルキル-(C₁-C₄)アルキルからなる群から選ばれる1個以上の置換基で置換されているもよく；

R^2 及び R^3 はそれぞれ独立して H、ハロゲン、 C_1 - C_4 アルキル、 C_1 - C_4 アルコキシル、シアノ、 $B(OH)_2$ 、フェニル、1 個以上のハロゲンで置換されている C_1 - C_4 アルキルであるか、又は一緒になってアルキレンジオキシ又は X^3 を含む環の CH:CH 部位に縮合したフェニルを形成し；

R^6 は H、アルキル、アルキルカルボキシ、アリール、ヘテロアリール、シクリル又はヘテロシクリルであり、それぞれさらに NH_2 、OH、 NH -(C_1 - C_4) アルキル及び N -(C_1 - C_4) アルキル-(C_1 - C_4) アルキルからなる群から選ばれる 1 個以上の置換基で置換されていてもよく；及び

R^7 及び R^8 はそれぞれ独立して H、ハロゲン、アルキル、アルコキシル、 NH_2 、 NH -(C_1 - C_4) アルキル、 N -(C_1 - C_4) アルキル-(C_1 - C_4) アルキル、アリール、ヘテロアリール、シクリル又はヘテロシクリルであり、ハロゲン及び NH_2 以外は、それぞれさらに NH_2 、OH、 NH -(C_1 - C_4) アルキル及び N -(C_1 - C_4) アルキル-(C_1 - C_4) アルキルからなる群から選ばれる 1 個以上の置換基で置換されていてもよい。]

で表される化合物である、請求項 1 ~ 5 の何れか 1 項に記載の化合物又は塩。

【請求項 7】

化合物が、

N -(3,4-ジメチルフェニル)-2-オキソインドリン-5-スルホンアミド、

N -(3,4-ジメチルフェニル)-2-オキソ-2,3,4,5-テトラヒドロ-1H-ベンゾ[b]アゼピン-7-スルホンアミド、

N -(3,4-ジメチルフェニル)-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[b][1,4]オキサジン-6-スルホンアミド、

N -(3,4-ジメチルフェニル)-4-メチル-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[b][1,4]オキサジン-6-スルホンアミド、

N -(3,4-ジメチルフェニル)-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-スルホンアミド、

N -(3,4-ジメチルフェニル)-1,3-ジメチル-2-オキソ-2,3-ジヒドロ-1H-ベンゾ[d]イミダゾール-5-スルホンアミド、

1-アセチル- N -(3,4-ジメチルフェニル)インドリン-5-スルホンアミド、

N -(3,4-ジメチルフェニル)-1-メチル-1H-インドール-5-スルホンアミド、

N -(3-クロロフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、

2-オキソ- N -m-トリル-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、

N -(3-メトキシフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド

、

N -(3-フルオロフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド

、

2-オキソ- N -(3-(トリフルオロメチル)フェニル)-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、

N -(ピフェニル-3-イル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、

2-オキソ- N -(ピリジン-3-イル)-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、

N -(4-クロロフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、

2-オキソ- N -p-トリル-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、

N -(4-メトキシフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド

、

N -(4-フルオロフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド

、

2-オキソ- N -o-トリル-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、

N -(2-メトキシフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド

、

N -(2-フルオロフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド

、

N-(ナフタレン-2-イル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、
N-(ナフタレン-1-イル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、
N-(2,3-ジヒドロベンゾ[b][1,4]ジオキシン-6-イル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロ
キノリン-6-スルホンアミド、
N-ベンジル-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、
N-(3,4-ジメチルフェニル)-7-フルオロ-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-ス
ルホンアミド、
7-(ジメチルアミノ)-N-(3,4-ジメチルフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノ
リン-6-スルホンアミド、
N-(3,4-ジメチルフェニル)-7-(メチルアミノ)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノ
リン-6-スルホンアミド、
N-(3,4-ジメチルフェニル)-2-オキソ-7-(ピペリジン-1-イル)-1,2,3,4-テトラヒドロキノ
リン-6-スルホンアミド、
6-クロロ-N-(3,4-ジメチルフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-7-スル
ホンアミド、
6-(ジメチルアミノ)-N-(3,4-ジメチルフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノ
リン-7-スルホンアミド、
6-クロロ-N-(3,4-ジメチルフェニル)-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[b][1,4]オキ
サジン-7-スルホンアミド、
6-ブromo-N-(3,4-ジメチルフェニル)-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[b][1,4]オキ
サジン-7-スルホンアミド、
N-(3,4-ジメチルフェニル)-6-メチル-3-オキソ-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[b][1,4]オキ
サジン-7-スルホンアミド、
N-(3,4-ジメチルフェニル)-3-オキソ-6-フェニル-3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[b][1,4]オ
キサジン-7-スルホンアミド、
N-(3,4-ジメチルフェニル)-N-メチル-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スル
ホンアミド、
N-(3,4-ジメチルフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-カルボキサミ
ド、
N-(3-クロロ-4-メチルフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホン
アミド、
N-(3,4-ジクロロフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミ
ド、
6-クロロ-N-(5-クロロ-2-メチルフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-7
-スルホンアミド、
N-(3-シアノフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、
1-アセチル-N-(3,4-ジメチルフェニル)-2-メチルインドリン-5-スルホンアミド、
N-(5-クロロ-2-メチルフェニル)-7-フルオロ-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノ
リン-6-スルホンアミド、
6-クロロ-N-(3-クロロ-4-メチルフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-7
-スルホンアミド、
N-(3-クロロ-2-メチルフェニル)-7-フルオロ-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノ
リン-6-スルホンアミド、
N-(3-クロロ-4-メチルフェニル)-7-フルオロ-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノ
リン-6-スルホンアミド、
3-(2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド)フェニルボロン酸、
N-(4-フルオロ-3-メチルフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホ
ンアミド、
N-(3,4-ジクロロフェニル)-7-フルオロ-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-ス
ルホンアミド、

N-(3-フルオロ-4-メチルフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、

N-(4-クロロ-3-メチルフェニル)-7-フルオロ-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、

6-クロロ-N-(3,4-ジメチルフェニル)-2-オキソインドリン-5-スルホンアミド、

N-(4-クロロ-3-メチルフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、

6-クロロ-N-(3-クロロ-2-メチルフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-7-スルホンアミド、

3,3-ジクロロ-N-(3,4-ジメチルフェニル)-2-オキソインドリン-5-スルホンアミド、

7-((2-(ジメチルアミノ)エチル)(メチル)アミノ)-N-(3,4-ジメチルフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、

N-(3,4-ジメチルフェニル)-2-オキソ-7-(ピロリジン-1-イル)-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、

7-(3-(ジメチルアミノ)ピロリジン-1-イル)-N-(3,4-ジメチルフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、

N-(3,4-ジメチルフェニル)-7-(2-ヒドロキシ-2-メチルプロピルアミノ)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、

N-(3,4-ジメチルフェニル)-7-(イソプロピルアミノ)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、

7-(ジエチルアミノ)-N-(3,4-ジメチルフェニル)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、

N-(3,4-ジメチルフェニル)-7-(1-ヒドロキシプロパン-2-イルアミノ)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、

(S)-N-(3,4-ジメチルフェニル)-7-(1-ヒドロキシプロパン-2-イルアミノ)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、

(R)-N-(3,4-ジメチルフェニル)-7-(1-ヒドロキシプロパン-2-イルアミノ)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、

N-(3,4-ジメチルフェニル)-7-(2-ヒドロキシエチルアミノ)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、

(S)-N-(3-クロロ-4-メチルフェニル)-7-(1-ヒドロキシプロパン-2-イルアミノ)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、

(S)-N-(4-フルオロ-3-メチルフェニル)-7-(1-ヒドロキシプロパン-2-イルアミノ)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミド、又は

(S)-N-(3-クロロ-4-フルオロフェニル)-7-(1-ヒドロキシプロパン-2-イルアミノ)-2-オキソ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリン-6-スルホンアミドである、請求項 1、3、4 または 5 に記載の化合物又は塩。

【請求項 8】

請求項 1 ~ 7 の何れか 1 項に記載の化合物又は塩及び薬学的に許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 9】

1 ~ 7 の何れか 1 項に記載の化合物若しくは塩又は請求項 8 に記載の医薬組成物を含む癌の治療のための医薬製剤。