

【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22年6月3日(2010.6.3)

【公表番号】特表2009-534457(P2009-534457A)

【公表日】平成21年9月24日(2009.9.24)

【年通号数】公開・登録公報2009-038

【出願番号】特願2009-507165(P2009-507165)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 31/4545 (2006.01)

A 6 1 K 31/541 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/04 1 0 5 C

C 0 7 D 471/04 C S P

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 31/444

A 6 1 K 31/4545

A 6 1 K 31/541

A 6 1 K 31/437

【手続補正書】

【提出日】平成22年4月19日(2010.4.19)

【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】

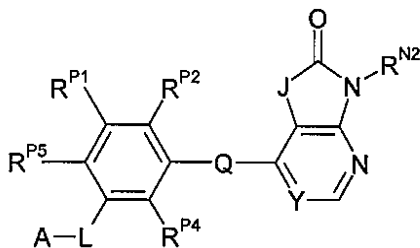
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

次式の化合物、ならびにその製薬上許容される塩および溶媒和物から選択される化合物

：

【化 1】



式中、

J は独立して - N R^{N 1} - ；

R^{N 1} は独立して - H または - M e ；

R^{N 2} は独立して - H または - M e ；

Y は独立して - C H = ；

Q は独立して - O - ；

R^{P 1}、R^{P 2}、R^{P 5} および R^{P 4} はそれぞれ独立して - H、- M e、- C F₃、-

F または - Cl ;

基 A - L - は独立して A - NH - C (= O) - NH - 、 A - C (= O) - NH - 、 または A - NH - C (= O) - ;

A は独立してフェニルまたはピラゾリル、

かつ、独立して非置換または以下から選択される一つ以上の基で置換される :

- (C = O) NH₂、 - (C = O) NMe₂、 - (C = O) NEt₂、 - (C = O) N (i Pr)₂、 - (C = O) N (CH₂CH₂OH)₂、 - (C = O) - モルフォリノ、
 - (C = O) NHPh、 - (C = O) NHCH₂Ph、 - F、 - Cl、 - Br、 - I、 - CN、 - OH、 - OMe、 - OEt、 - O (i Pr)、 - O (t Bu)、 - OPh、 - OCH₂Ph、
 - OCF₃、 - OCH₂CF₃、 - OCF₂CF₂H、 - OCH₂CH₂OH、 - OCH₂CH₂OMe、
 - OCH₂CH₂OEt、 - OCH₂CH₂NH₂、 - OCH₂CH₂NMe₂、 - OCH₂CH₂N (i Pr)₂、 - OCH₂CH₂ - モルフォリノ、
 - OCH₂CH₂ - ピペラジノ、 - OCH₂CH₂ - ピロリジノ、 - OPh - Me、
 - OPh - OH、 - OPh - OMe、 - OPh - F、 - OPh - Cl、 - OPh - Br、
 - OPh - I、 - NH₂、 - NHMe、 - NEt、 - NH (i Pr)、 - NMe₂、
 - NEt₂、 - N (i Pr)₂、 - N (CH₂CH₂OH)₂、 - NHPh、 - NHCH₂Ph、
 ピペリジノ、ピペラジノ、モルフォリノ、 - NH (C = O) Me、 - NH (C = O) Et、
 - NH (C = O) n Pr、 - NH (C = O) Ph、 - NHC (= O) CH₂Ph、
 - NMe (C = O) Me、 - NMe (C = O) Et、 - NMe (C = O) Ph、 - NMeC (= O) CH₂Ph、
 - SO₂Me、 - SO₂CF₃、 - SO₂Et、 - SO₂Ph、 - SO₂PhMe、
 - SO₂CH₂Ph、 - SO₂NH₂、 - SO₂NHMe、 - SO₂NHEt、
 - SO₂NMe₂、 - SO₂NEt₂、 - SO₂ - モルフォリノ、 - SO₂NHPh、
 - SO₂NHCH₂Ph、 - CH₂Ph、 - CH₂Ph - Me、 - CH₂Ph - OH、
 - CH₂Ph - F、 - CH₂Ph - Cl、 - Ph、 - Ph - Me、 - Ph - OH、
 - Ph - OMe、 - Ph - NH₂、 - Ph - F、 - Ph - Cl、 - Ph - Br、 - Ph - I、
 ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、フラニル、チオフェニル、
 ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、チアジアゾリル、
 ピロリジニル、イミダゾリジニル、ピラゾリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、アゼ
 ピニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、モルフォリニル、アゼチジニル、
 - Me、 - Et、 - n Pr、 - i Pr、 - n Bu、 - i Bu、 - s Bu、 - t Bu、 - n Pe、
 - i Pe、 - ter - Pe、 - neo - Pe、 - c Pr、 - c Hex、 - CH = CH₂、
 - CH₂ - CH = CH₂、 - CF₃、 - CHF₂、 - CH₂F、 - CCl₃、 - CBr₃、
 - CH₂CH₂F、 - CH₂CHF₂、および - CH₂CF₃、 - CH₂OH、 - CH₂OMe、
 - CH₂OEt、 - CH₂NH₂、 - CH₂NMe₂、 - CH₂CH₂OH、 - CH₂CH₂OMe、
 - CH₂CH₂OEt、 - CH₂CH₂CH₂NH₂、 - CH₂CH₂NMe₂、 - CH₂CH₂ - モルフォリノ、
 - CH₂CH₂ - ピペラジノ、 - CH₂CH₂ - ピロリジノ、および = O。

【請求項 2】

R^{N 1} が独立して - Me である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

R^{N 1} が独立して - H である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^{N 2} が独立して - Me である、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 5】

R^{N 2} が独立して - H である、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 6】

R^{P 1} および R^{P 2} がそれぞれ独立して - H 以外であって、R^{P 5} および R^{P 4} がそれぞれ独立して - H である、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 7】

R^{P 1}、R^{P 2}、R^{P 5}、および R^{P 4} がそれぞれ独立して - H である、請求項 1 ~ 5

のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 8】

基 A - L - が独立して A - NH - C (= O) - NH - である、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 9】

基 A - L - が独立して A - C (= O) - NH - である、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 10】

基 A - L - が独立して A - NH - C (= O) - である、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 11】

A が独立してフェニルであり、かつ独立して非置換または置換である、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物。

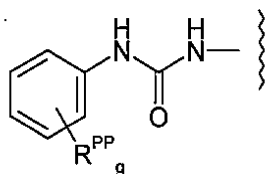
【請求項 12】

A が任意に置換されたフェニルであり、かつフェニル基上の置換基が独立して以下から選択される、請求項 1 ~ 10 のいずれか 1 項に記載の化合物： - F、- Cl、- Br、- I、- OH、- OMe、- OEt、- O (i Pr)、- O (t Bu)、- OPh、- OCH₂Ph、- OCF₃、- OCH₂CF₃、- OCH₂CH₂OH、- OCH₂CH₂OMe、- OCH₂CH₂OEt、- OCH₂CH₂NH₂、- OCH₂CH₂NMe₂、- NH₂、- NHMe、- NHEt、- NH (i Pr)、- NMe₂、- NEt₂、- N (i Pr)₂、- N (CH₂CH₂OH)₂、- NHPh、- NHCH₂Ph、ピペリジノ、ピペラジノ、モルフォリノ、- Ph、- Ph - Me、- Ph - OMe、- Ph - F、- Ph - Cl、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、フラニル、チオフェニル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、チアジアゾリル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、アゼピニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、モルフォリニル、アゼチジニル、- Me、- Et、- nPr、- iPr、- nBu、- iBu、- sBu、- tBu、- nPe、- cPr、- cHex、- CH = CH₂、- CH₂ - CH = CH₂、- CF₃、- CHF₂、- CH₂F、- CH₂CH₂F、- CH₂CHF₂、および - CH₂CF₃、- CH₂OMe、- CH₂OEt、- CH₂NH₂、- CH₂NMe₂、- CH₂CH₂OH、- CH₂CH₂OMe、- CH₂CH₂OEt、- CH₂CH₂CH₂NH₂、および - CH₂CH₂NMe₂；

【請求項 13】

A - L - が下記式である、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物：

【化 2】



式中：

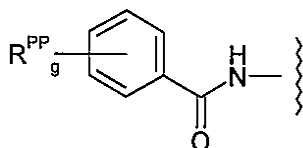
g は独立して 0、1、または 2；ならびに

R^{PP} はそれぞれ独立して - F、- Cl、- Br、- I、- OMe、- OCF₃、- Me、または - CF₃。

【請求項 14】

A - L - が下記式である、請求項 1 ~ 7 のいずれか 1 項に記載の化合物：

【化 3】



式中：

g は独立して 0、1、または 2；ならびに

R^{PP} はそれぞれ独立して -F、-Cl、-Br、-I、-OMe、-OCF₃、-Me、または -CF₃。

【請求項 15】

A が独立してピラゾリルであり、かつ独立して非置換または置換である、請求項 1～10 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 16】

A が任意に置換されたピラゾリルであり、かつ次式で表される、請求項 1～10 のいずれか 1 項に記載の化合物：

【化 4】



式中：

R^{A4} は H；

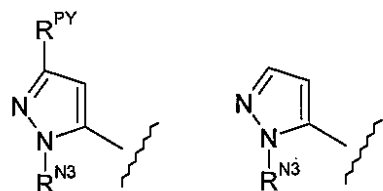
R^{A3} は -F、-Cl、-Br、-I、-Ph、-Me、-Et、-nPr、-iPr、-nBu、-iBu、-sBu、-tBu、-nPe、-cPr、-cHex、-CF₃、-CHF₂、-CH₂F、-CH₂CH₂F、-CH₂CHF₂、および -CH₂CF₃ から独立して選択される；

R^{A1} は -Ph、-Ph-Me、-Ph-OH、-Ph-OMe、-Ph-NH₂、-Ph-F、-Ph-Cl、-Ph-Br、-Ph-I、ピリジル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル；フラニル、チオフェニル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、チアゾリル、チアジアゾリル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペラジニル、アゼピニル、テトラヒドロフラニル、テトラヒドロピラニル、モルフォリニル、アゼチジニル、-Me、-Et、-nPr、-iPr、-nBu、-iBu、-sBu、-tBu、-nPe、-cPr、-cHex；-CH=CH₂、-CH₂-CH=CH₂、-CF₃、-CHF₂、-CH₂F、-CH₂CH₂F、-CH₂CHF₂、および -CH₂CF₃、-CH₂OMe、-CH₂OEt、-CH₂NH₂、-CH₂NMe₂、-CH₂CH₂OH、-CH₂CH₂OMe、-CH₂CH₂OEt、-CH₂CH₂CH₂NH₂、および -CH₂CH₂NMe₂ から独立してから選択される。

【請求項 17】

A が次式で表される基から選択されるピラゾリル基である、請求項 1～10 のいずれか 1 項に記載の化合物：

【化 5】



式中：

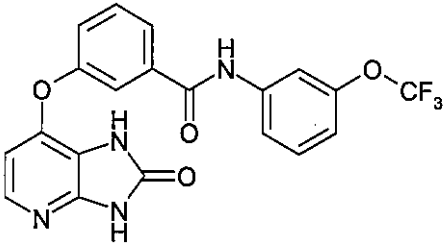
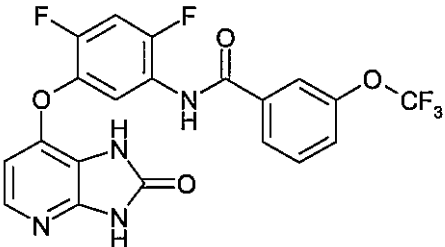
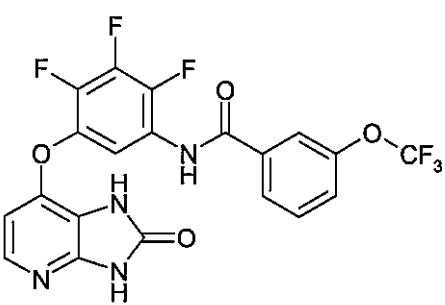
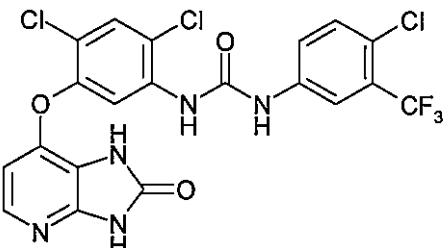
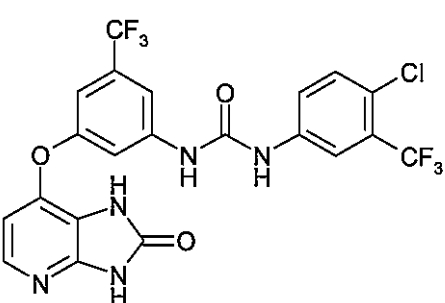
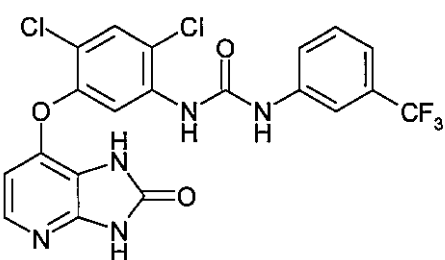
R^{PY} は独立して飽和 C_{1-7} アルキル；ならびに

R^{N3} は独立してフェニルであり、かつ独立して非置換または - F、- Cl、- Br、
- I、- OMe、- OCF₃、- Me、および - CF₃ から選択される一つ以上の置換基
で置換される。

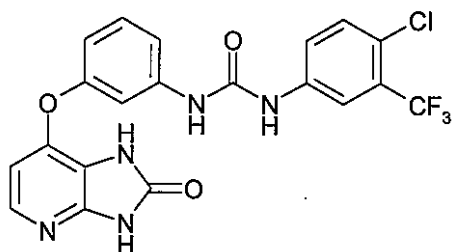
【請求項 18】

下記化合物、ならびにその製薬上許容される塩および溶媒和物から選択される、請求項
1 に記載の化合物：

【表 1】

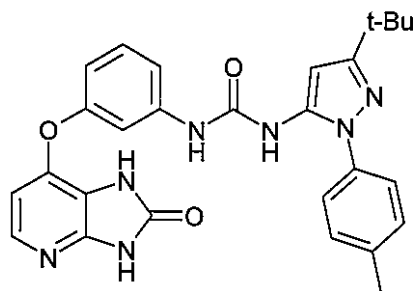
1		CJS 3256
2		CJS 3440
3		CJS 3441
4		CJS 3513
5		CJS 3517
6		CJS 3518

7



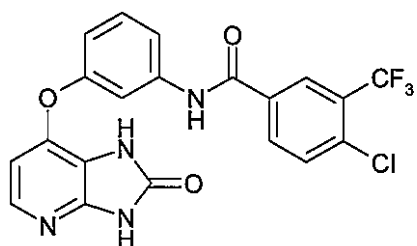
CJS 3678

8



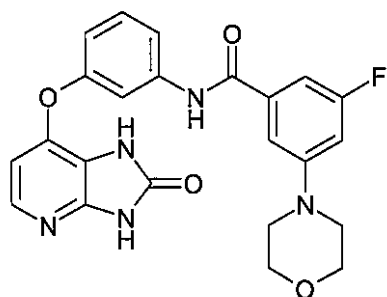
CJS 3683

10



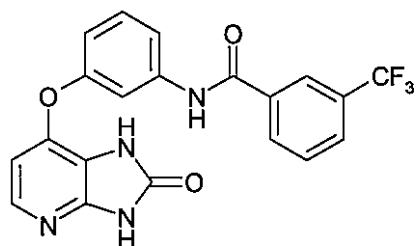
CJS 3685

11



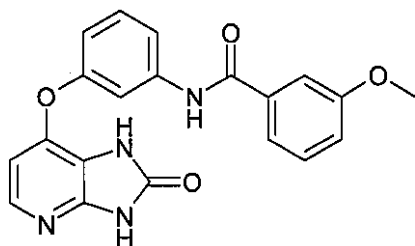
CJS 3686

12



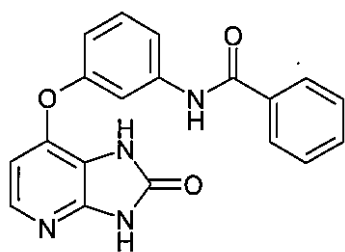
CJS 3687

13



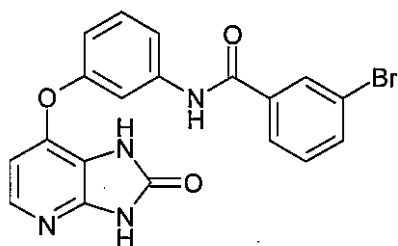
CJS 3688

14



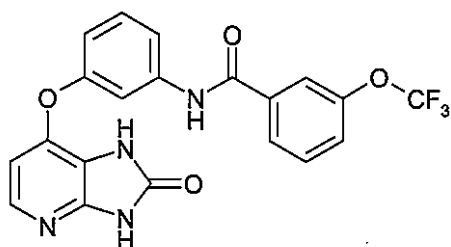
CJS 3689

15



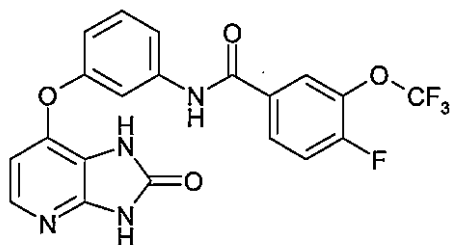
CJS 3690

20



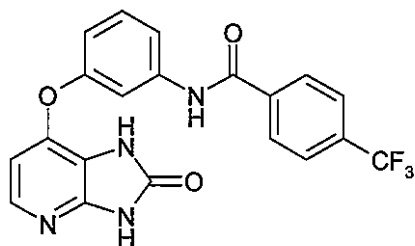
CJS 3695

21



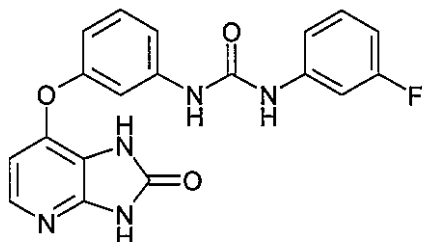
CJS 3696

22



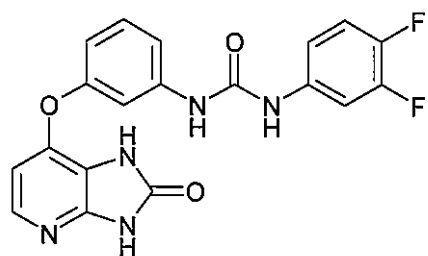
CJS 3697

23



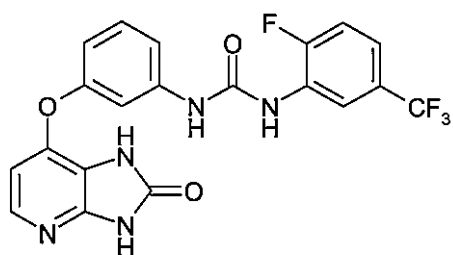
CJS 3717

24



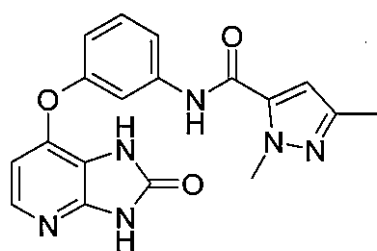
CJS 3720

25



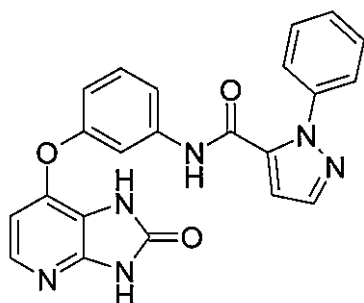
CJS 3721

27



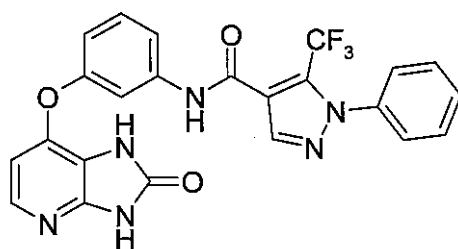
CJS 3724

28



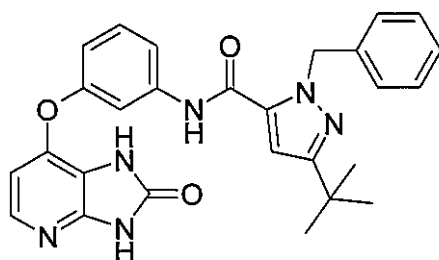
CJS 3725

29



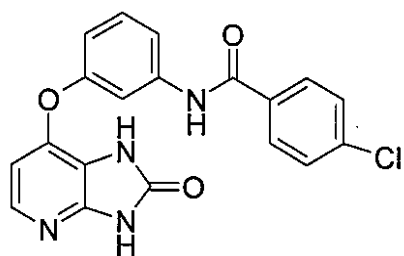
CJS 3726

30



CJS 3727

33



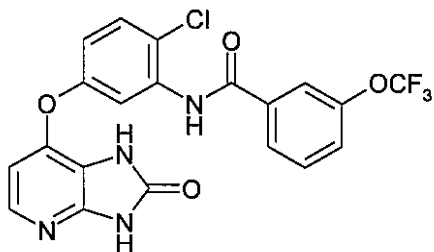
CJS 3730

【請求項 19】

下記化合物、ならびにその製薬上許容される塩および溶媒和物から選択される、請求項 1 に記載の化合物：

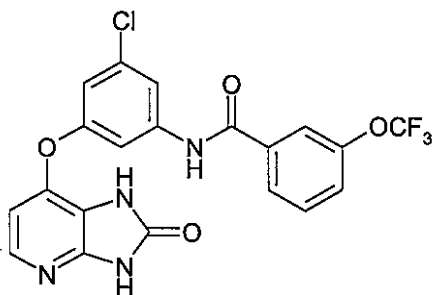
【表 2】

37



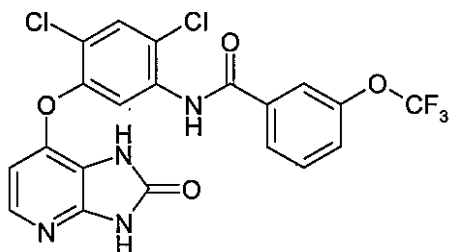
CJS 3442

38



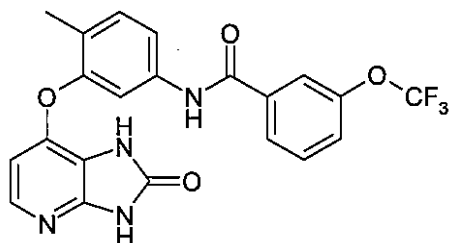
CJS 3443

39



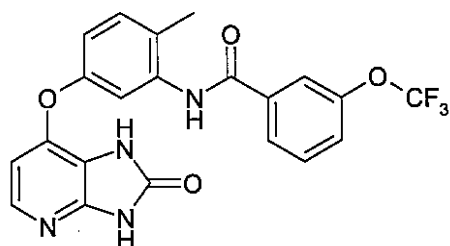
CJS 3521

41



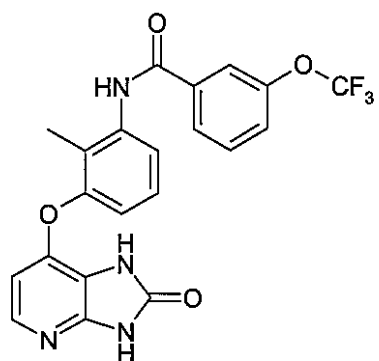
CJS 3523

42



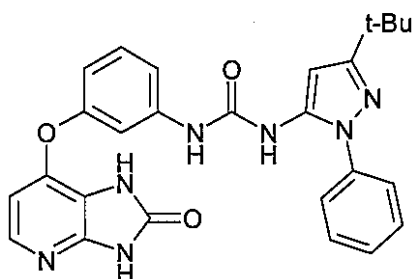
CJS 3524

44



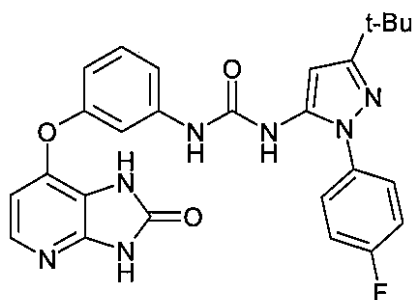
CJS 3526

47



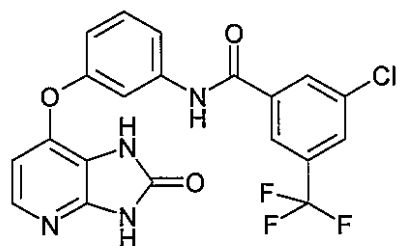
CJS 3741

48



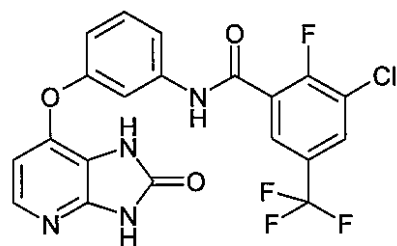
CJS 3742

49



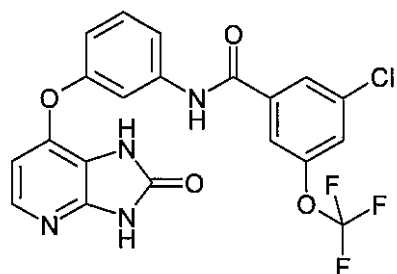
CJS 3743

50



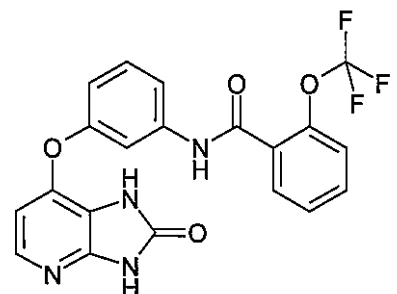
CJS 3744

51



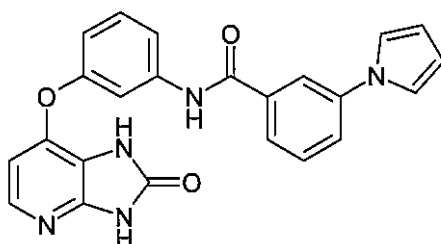
CJS 3745

55



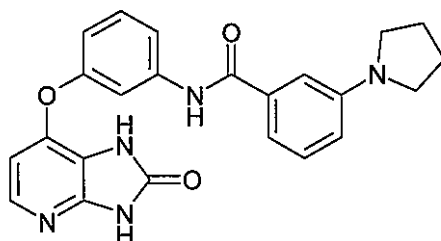
CJS 3751

56



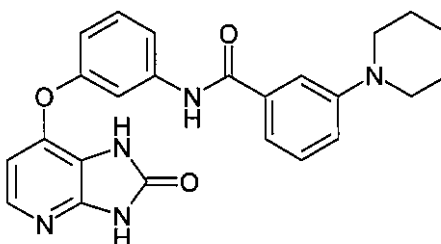
CJS 3752

57



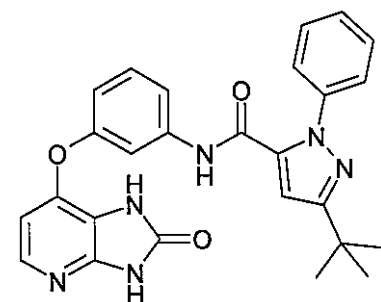
CJS 3753

58



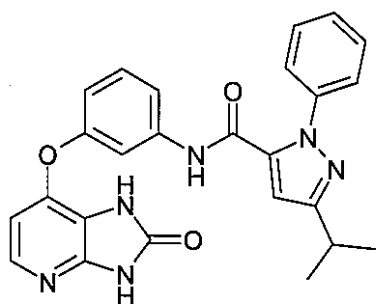
CJS 3754

60



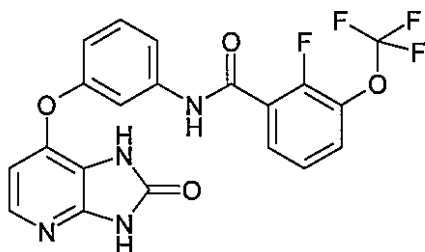
CJS 3757

61



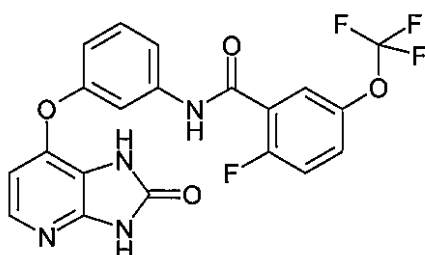
CJS 3758

62



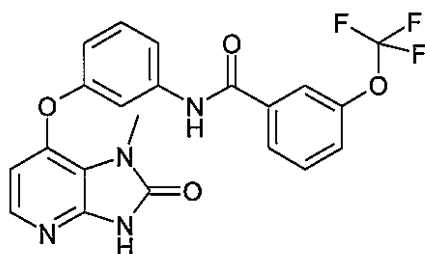
CJS 3759

63



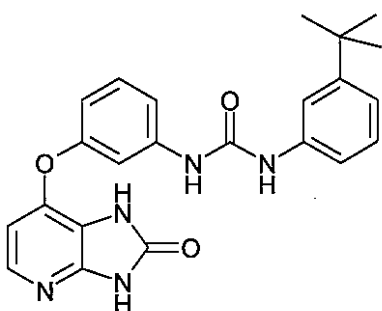
CJS 3760

65



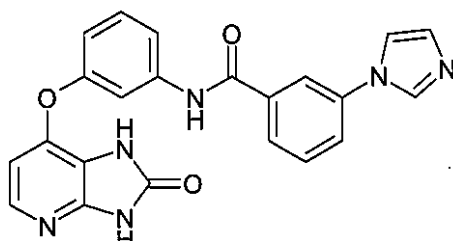
CJS 3768

66



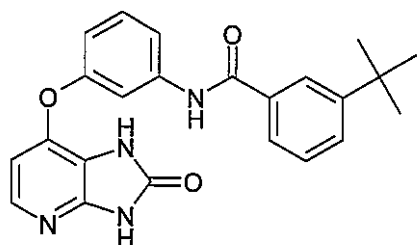
CJS 3779

67



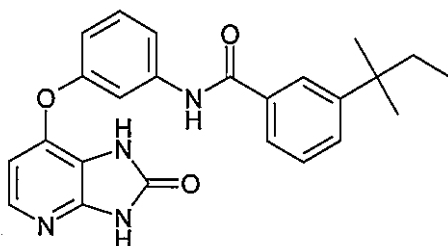
CJS 3900

69



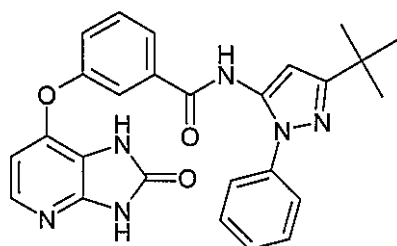
CJS 3902

70



CJS 3903

72



CJS 3906

【請求項 20】

請求項 1 ～ 19 のいずれか 1 項に記載の化合物および医薬として許容される担体もしくは希釈剤を含む、医薬組成物。

【請求項 21】

請求項 1 ～ 19 のいずれか 1 項に記載の化合物と、医薬として許容される担体もしくは希釈剤とを混合することを含む、医薬組成物の調製方法。

【請求項 22】

ヒトまたは動物体を治療による処置において使用するための、請求項 1 ～ 19 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 23】

癌の治療による処置において使用するための、請求項 1 ～ 19 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 24】

固形腫瘍癌の治療による処置において使用するための、請求項 1 ～ 19 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 25】

黒色腫または悪性黒色腫の治療による処置において使用するための、請求項 1 ～ 19 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 26】

結腸直腸癌の治療による処置において使用するための、請求項 1 ～ 19 のいずれか 1 項に記載の化合物。

【請求項 27】

癌の治療のための医薬の製造における、請求項 1 ～ 19 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 28】

固形腫瘍癌の治療のための医薬の製造における、請求項 1 ～ 19 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 29】

黒色腫または悪性黒色腫の治療のための医薬の製造における、請求項 1 ～ 19 のいずれ

か 1 項に記載の化合物の使用。

【請求項 30】

結腸直腸癌の治療のための医薬の製造における、請求項 1 ～ 19 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。