

【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24年2月2日(2012.2.2)

【公表番号】特表2010-511694(P2010-511694A)

【公表日】平成22年4月15日(2010.4.15)

【年通号数】公開・登録公報2010-015

【出願番号】特願2009-539869(P2009-539869)

【国際特許分類】

C 0 7 C 327/44 (2006.01)

C 1 2 N 9/99 (2006.01)

A 6 1 K 31/277 (2006.01)

A 6 1 K 31/16 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

C 1 2 N 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 35/04 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 C 327/44 C S P

C 1 2 N 9/99

A 6 1 K 31/277

A 6 1 K 31/16

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 21/00

A 6 1 P 3/00

A 6 1 P 35/00

C 1 2 N 9/12

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 35/04

A 6 1 P 19/02

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 9/10 1 0 1

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 17/02

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 3/10

【手続補正書】

【提出日】平成22年12月2日(2010.12.2)

【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

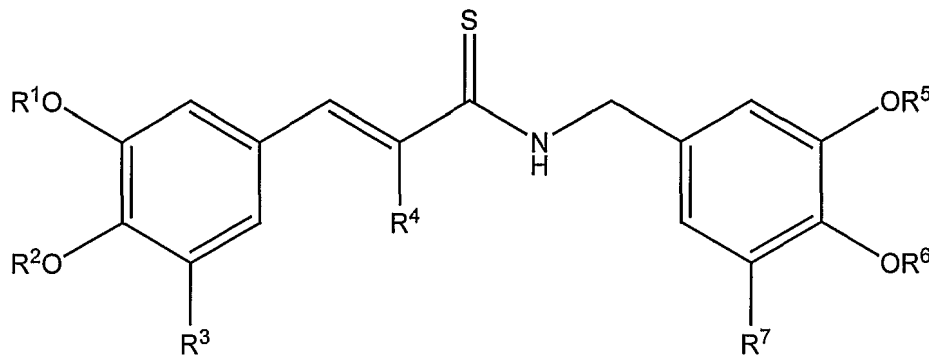
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式1の構造：

【化1】



(式中、

R^1 、 R^2 、 R^5 および R^6 は独立に、 H 、 $C_1 - C_4$ アルキル、アシル、および加水分解の際にヒドロキシルを生じる官能基から選択され、

R^3 および R^7 は独立に、 H 、ハロゲン、ハロアルキルおよび OR^8 から選択され、 R^8 は、 H 、 $C_1 - C_4$ アルキル、アシル、または加水分解の際にヒドロキシルを生じる官能基であり、

R^4 は、 H または CN である)

によって表される化合物(その塩、水和物、溶媒和物、多形、光学異性体、幾何異性体、鏡像異性体、ジアステレオマー、および混合物を含む)。

【請求項2】

R^4 が CN である、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R^1 、 R^2 、 R^5 および R^6 が、各々、水素であるか、または

R^1 、 R^2 、 R^5 および R^6 が、各々、 CH_3 であるか、または

R^3 および R^7 が、各々、水素、ハロゲン、ハロメチル、 OH もしくは OCH_3 であるか、または

R^1 、 R^2 、 R^5 および R^6 が、各々、 H であり、 R^3 がハロゲンであり、かつ R^7 が OH であるか、または

R^1 、 R^2 、 R^5 および R^6 が、各々 H であり、かつ R^3 および R^7 が各々、ハロゲンであるか、または

R^1 、 R^2 、 R^5 および R^6 が、各々、 H であり、 R^3 がハロメチルであり、かつ R^7 が OH であるか、または

R^1 、 R^2 、 R^5 および R^6 が、各々、 H であり、 R^3 がハロゲンであり、かつ R^7 が H であるか、または

R^1 、 R^2 、 R^5 および R^6 が、各々、 H であり、 R^3 が OH であり、かつ R^7 がハロゲンであるか、または

R^1 、 R^2 、 R^5 および R^6 が、各々、 CH_3 であり、 R^3 がハロゲンであり、かつ R

R^7 が OCH_3 であるか、または

R^1 、 R^2 、 R^5 および R^6 が、各々、 CH_3 であり、かつ R^3 および R^7 が、各々、ハロゲンである、請求項 2 に記載の化合物。

【請求項 4】

R^4 が水素である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 5】

R^1 、 R^2 、 R^5 および R^6 が、各々、水素であるか、または

R^1 、 R^2 、 R^5 および R^6 が、各々、 CH_3 であるか、または

R^3 および R^7 が、各々、水素、ハロゲン、ハロメチル、 OH もしくは OCH_3 であるか、または

R^1 、 R^2 、 R^5 および R^6 が、各々、 H であり、 R^3 がハロゲンであり、かつ R^7 が OH であるか、または

R^1 、 R^2 、 R^5 および R^6 が、各々、 H であり、かつ R^3 および R^7 が、各々、ハロゲンであるか、または

R^1 、 R^2 、 R^5 および R^6 が、各々、 H であり、 R^3 がハロメチルであり、かつ R^7 が OH であるか、または

R^1 、 R^2 、 R^5 および R^6 が、各々、 H であり、 R^3 がハロゲンであり、かつ R^7 が H であるか、または

R^1 、 R^2 、 R^5 および R^6 が、各々、 H であり、 R^3 が OH であり、かつ R^7 がハロゲンであるか、または

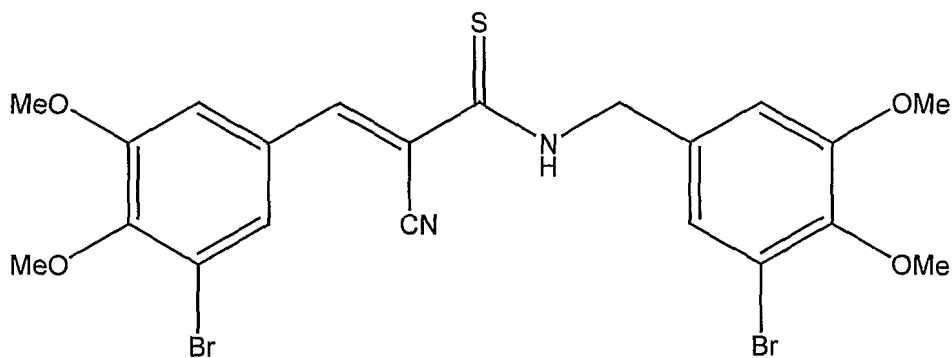
R^1 、 R^2 、 R^5 および R^6 が、各々、 CH_3 であり、 R^3 がハロゲンであり、かつ R^7 が OCH_3 であるか、または

R^1 、 R^2 、 R^5 および R^6 が、各々、 CH_3 であり、かつ R^3 および R^7 が、各々、ハロゲンである、請求項 4 に記載の化合物。

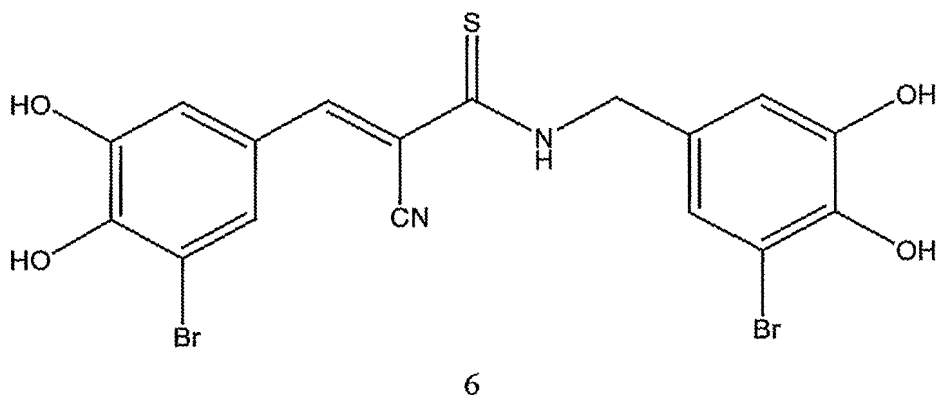
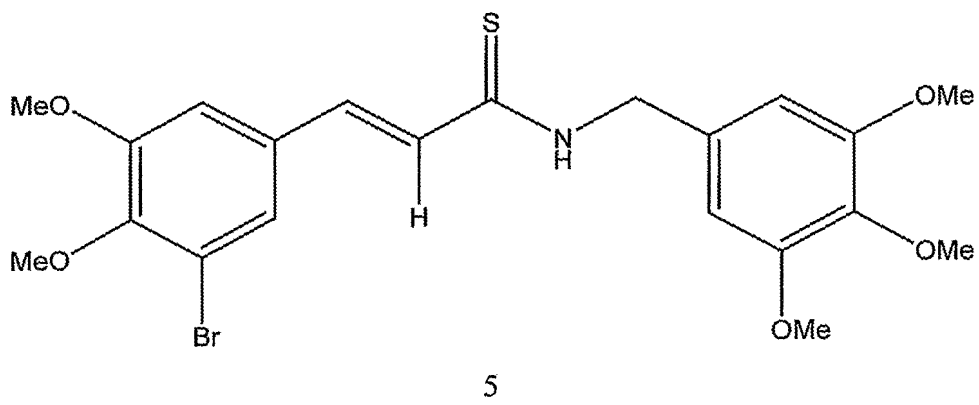
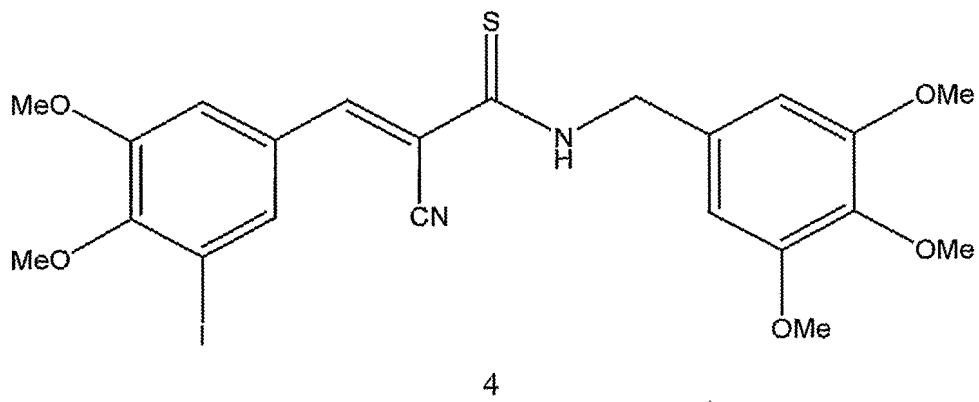
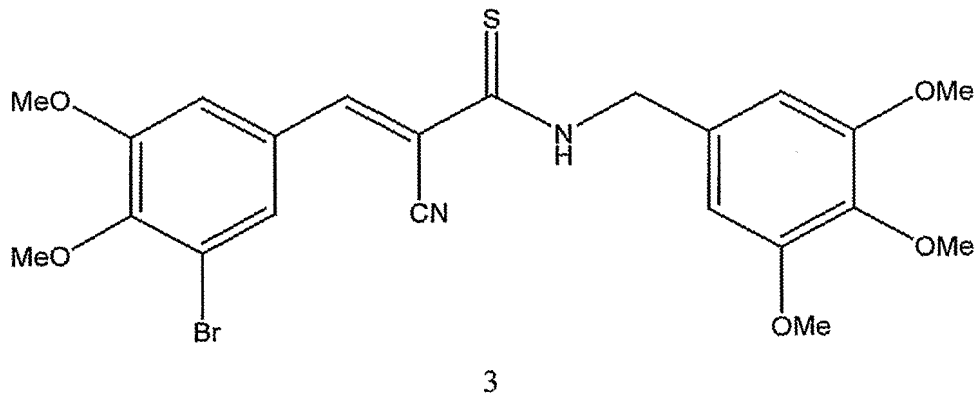
【請求項 6】

以下の

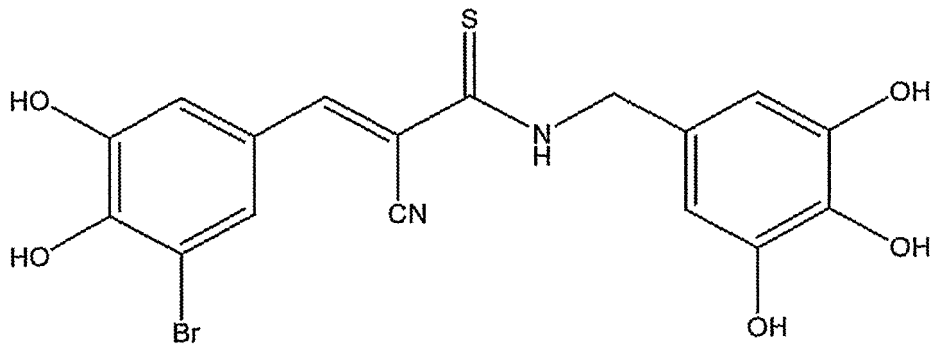
【化 2】



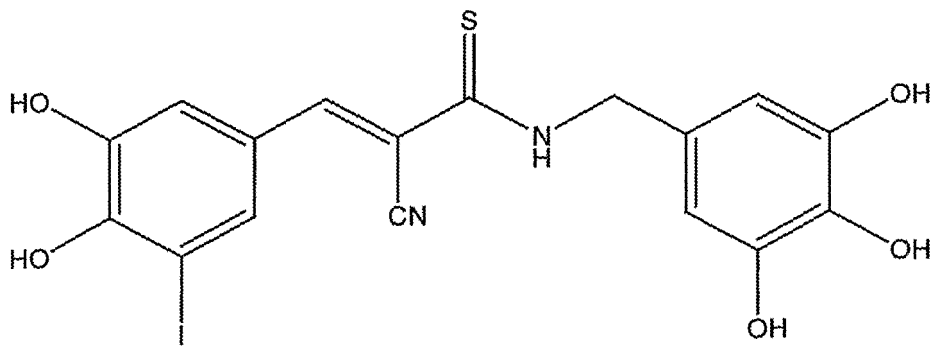
【化 3】



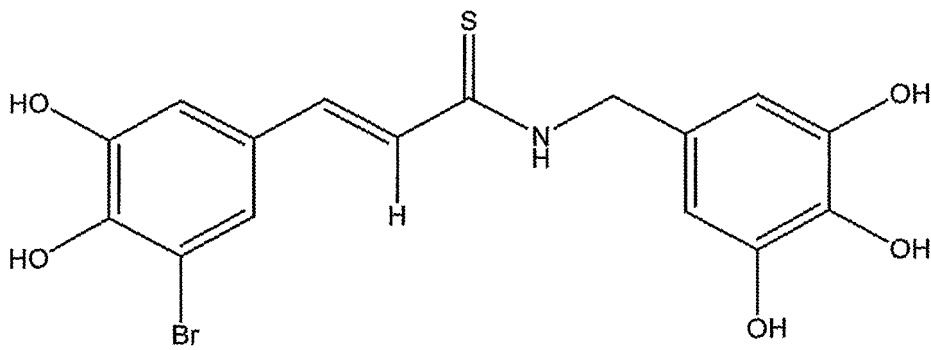
【化 4】



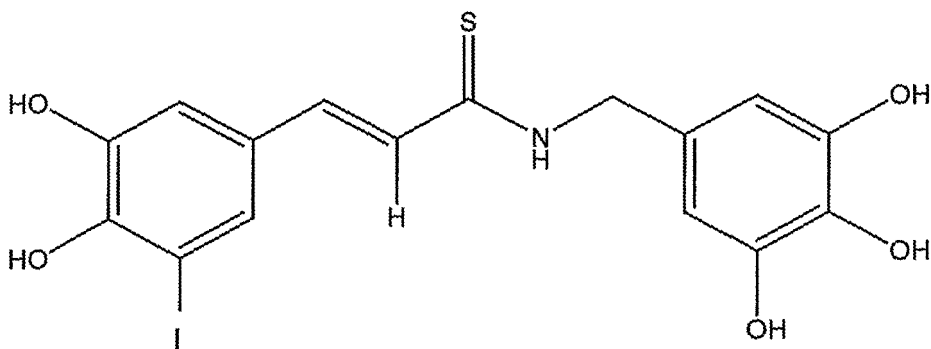
7



8

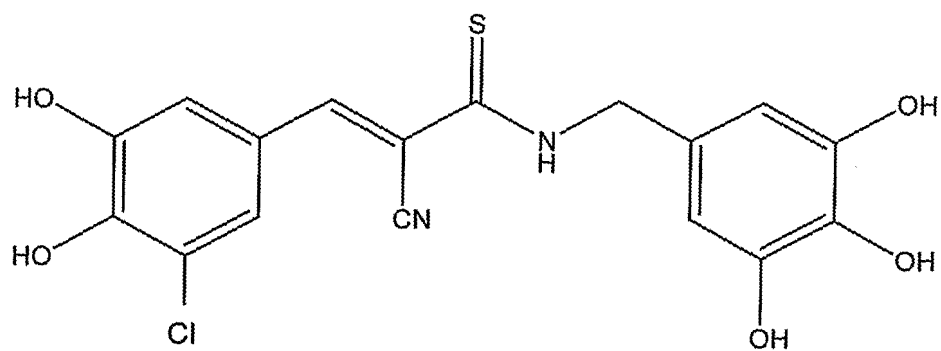


9

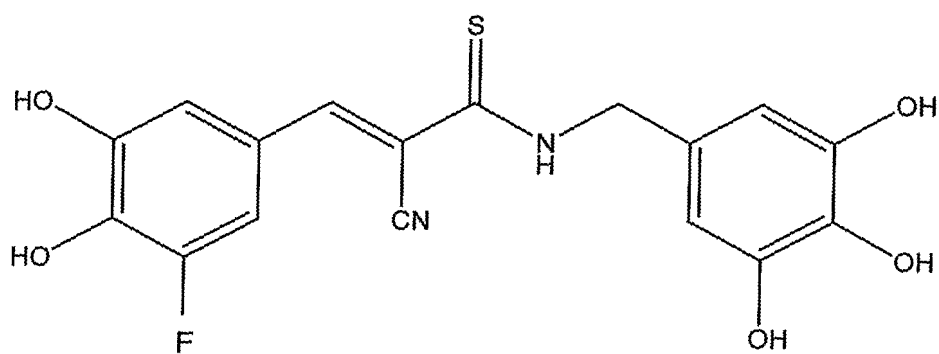


10

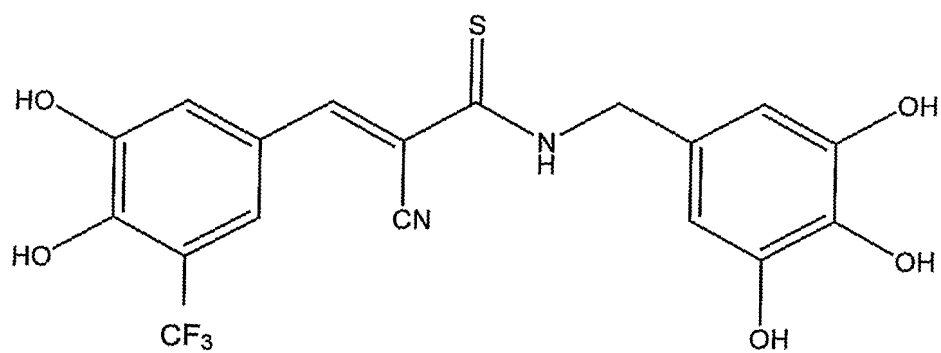
【化 5】



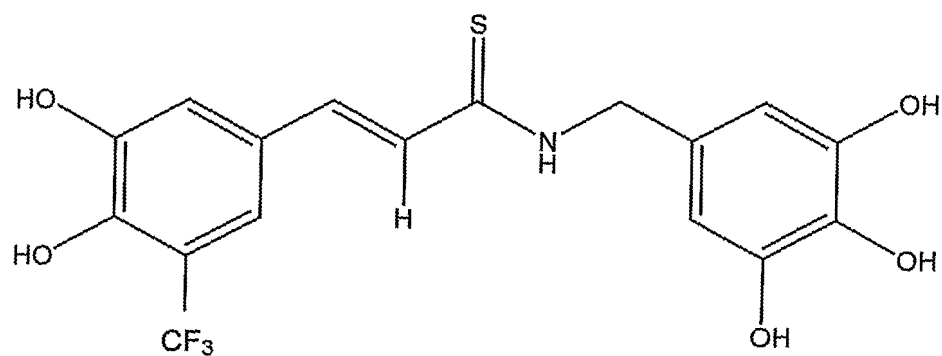
11



12

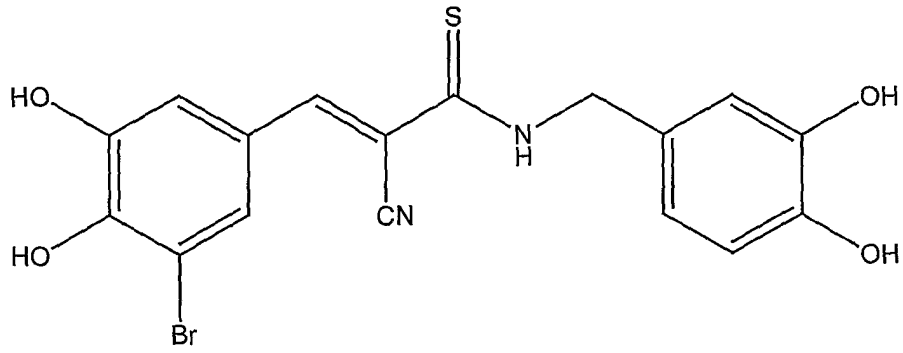


13

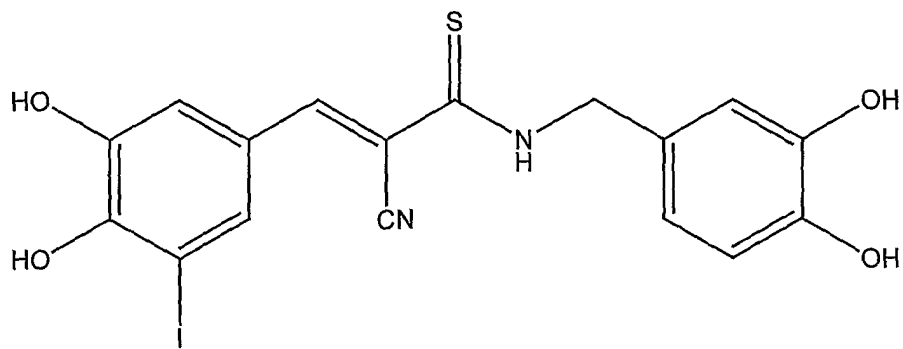


14

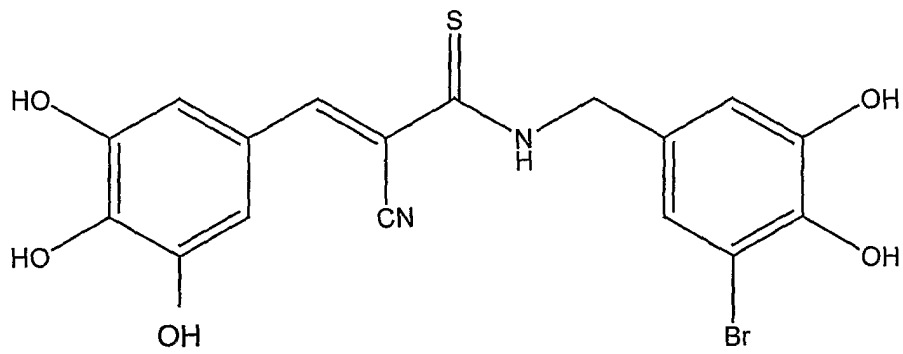
【化 6】



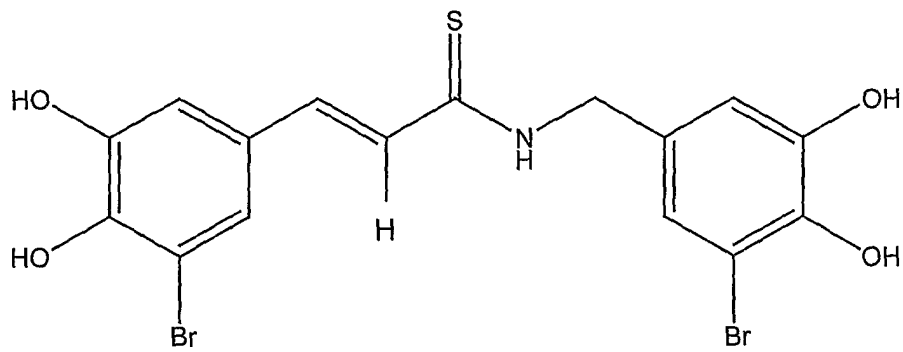
15



16

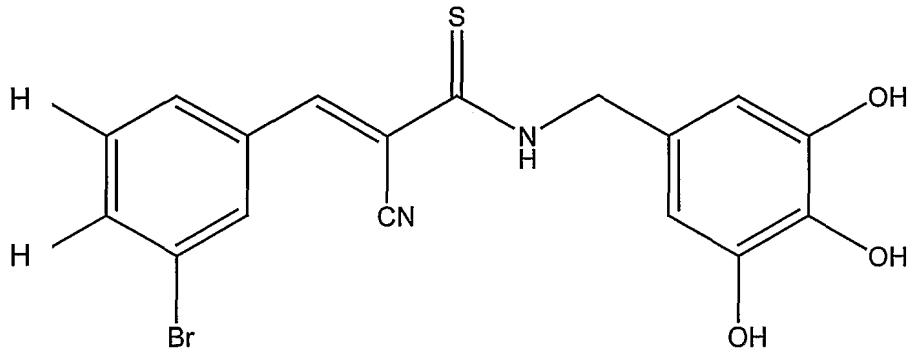


17



18. および

【化 7】



19

からなる群から選択される化合物。

【請求項 7】

治療上有効量の請求項 1 または請求項 6 に記載の化合物と、薬理的に許容できる担体または賦形剤とを含む、医薬組成物。

【請求項 8】

タンパク質チロシンキナーゼ (PTK) によって媒介されるシグナル伝達経路を阻害するための医薬の調製のための、請求項 1 または請求項 6 に記載の化合物の使用。

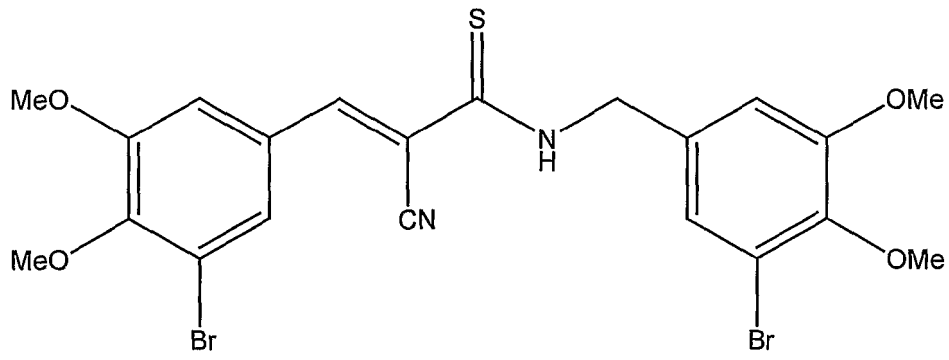
【請求項 9】

前記タンパク質キナーゼが受容体型タンパク質チロシンキナーゼ (RTK) であり、前記受容体型タンパク質キナーゼが、血小板由来増殖因子受容体 (PDGFR)、線維芽細胞増殖因子受容体 (FGFR)、肝細胞増殖因子受容体 (HGF)、インスリン受容体、インスリン様増殖因子 - 1 受容体 (IGF-1R)、上皮増殖因子受容体 (EDFR)、神経成長因子受容体 (NGFR)、血管内皮増殖因子受容体 (VEGFR)、およびマクロファージコロニー刺激因子 (M-CSFR) からなる群から選択される、請求項 8 に記載の使用。

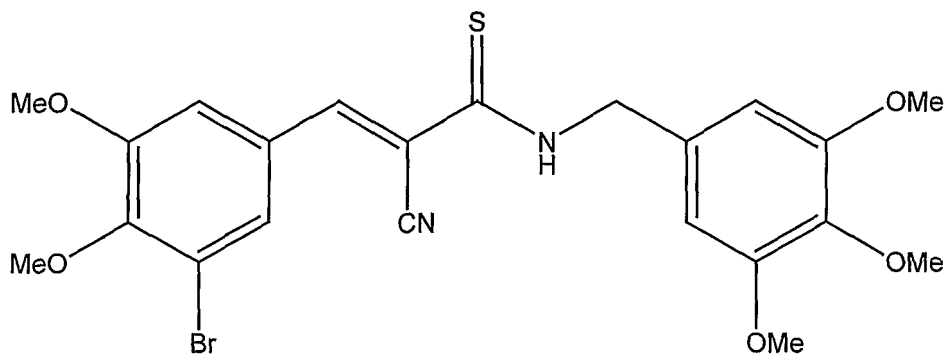
【請求項 10】

前記化合物が、

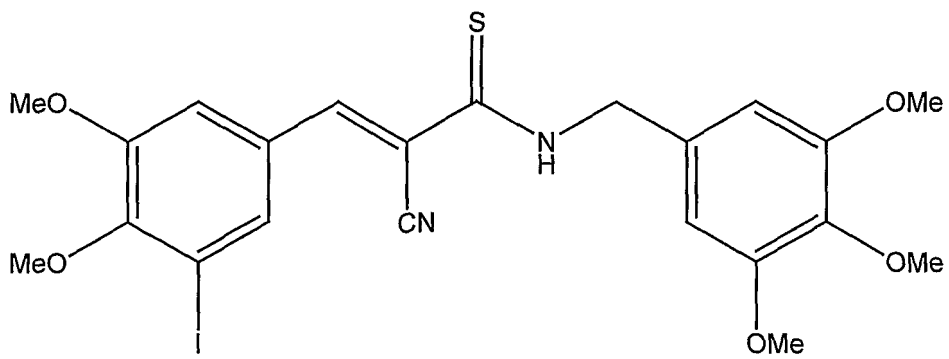
【化 8】



2

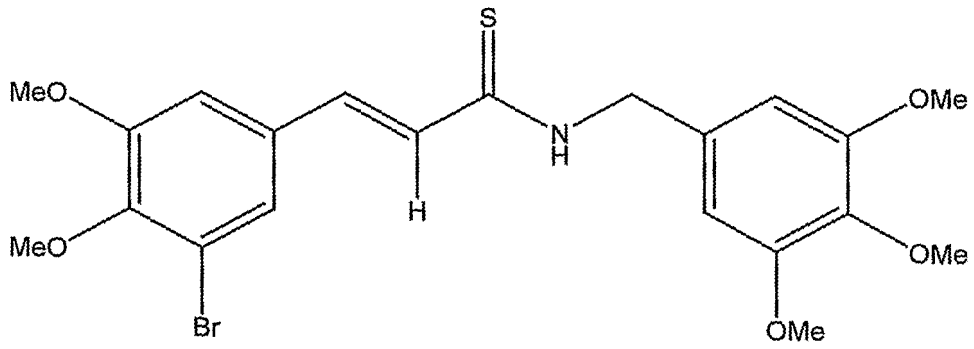


3

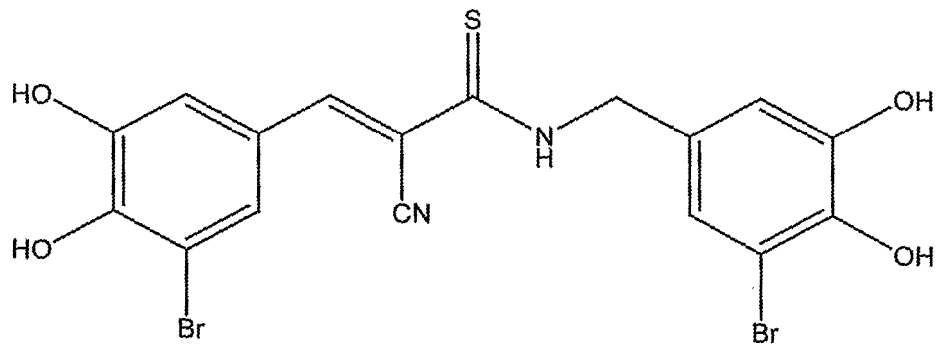


4

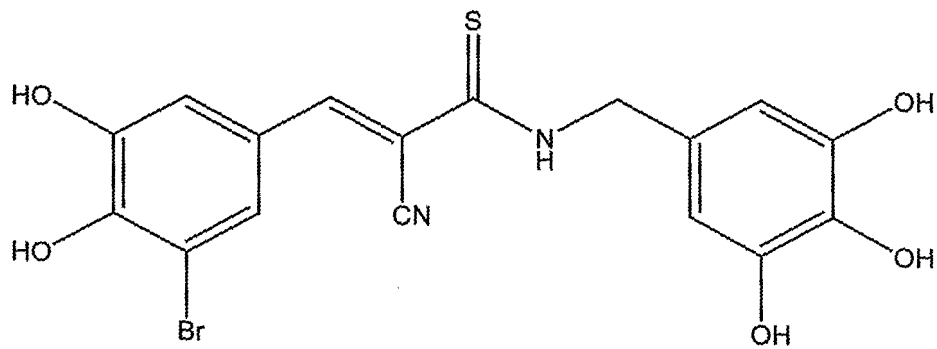
【化 9】



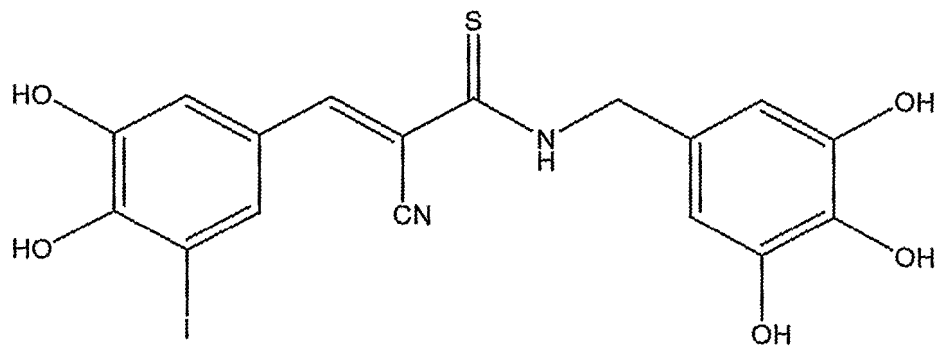
5



6

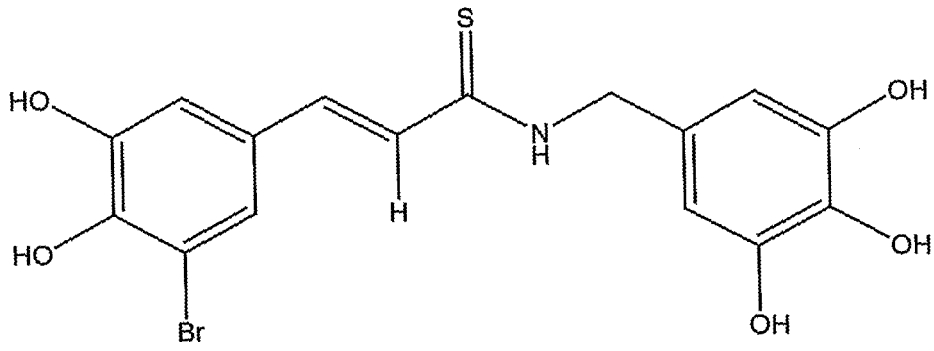


7

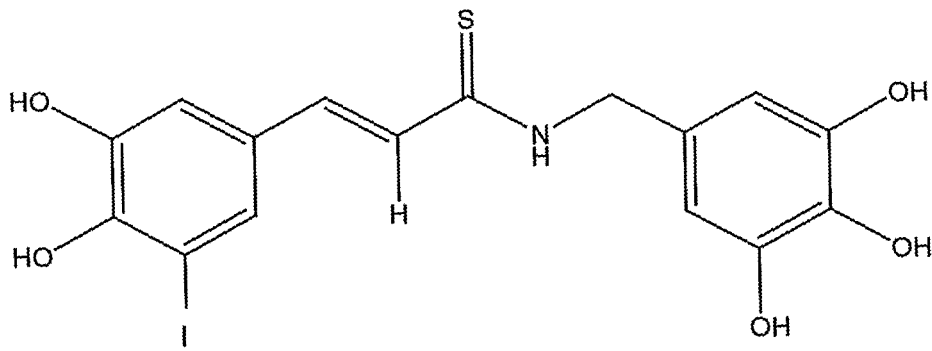


8

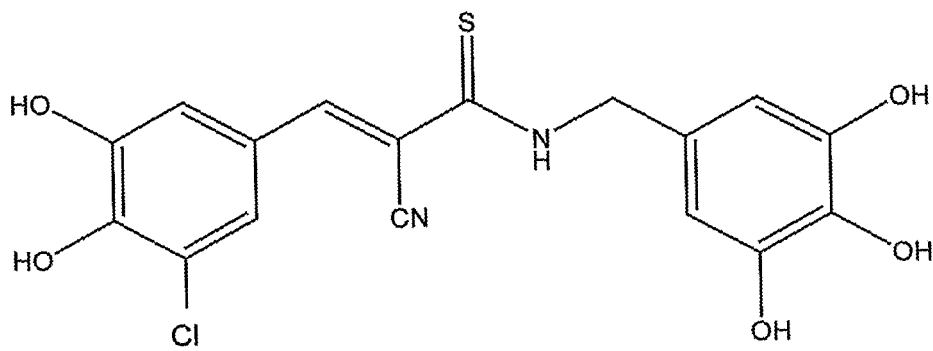
【化 1 0】



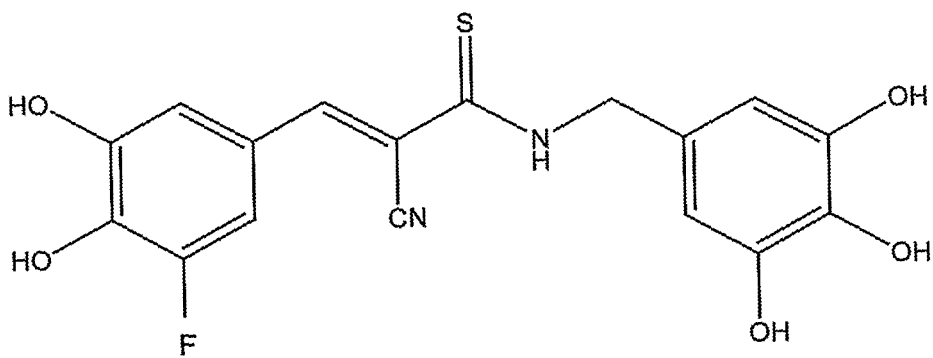
9



10

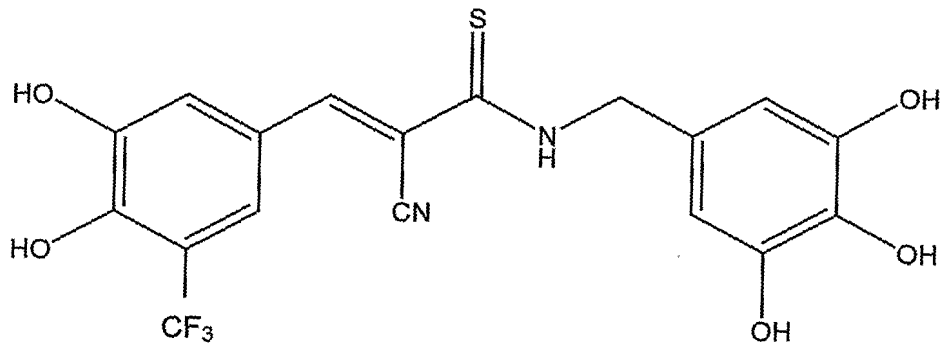


11

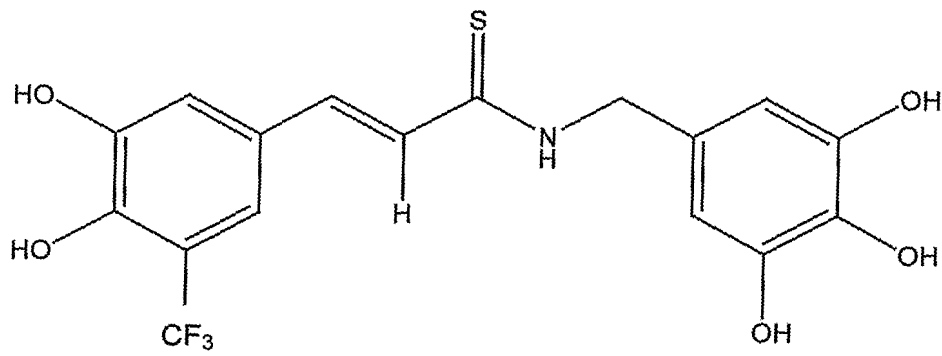


12

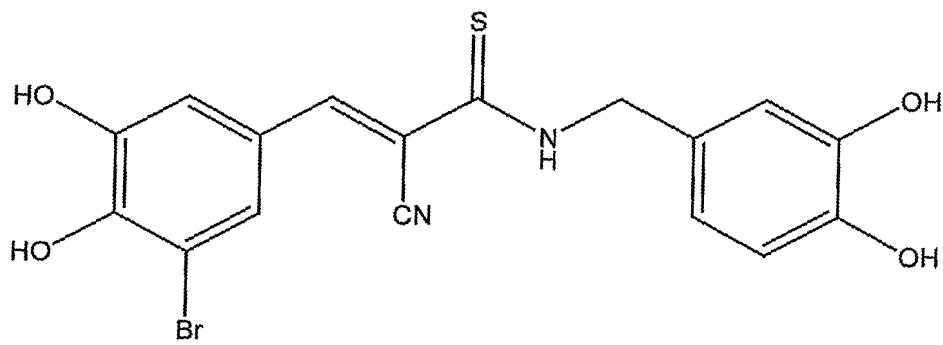
【化 1 1】



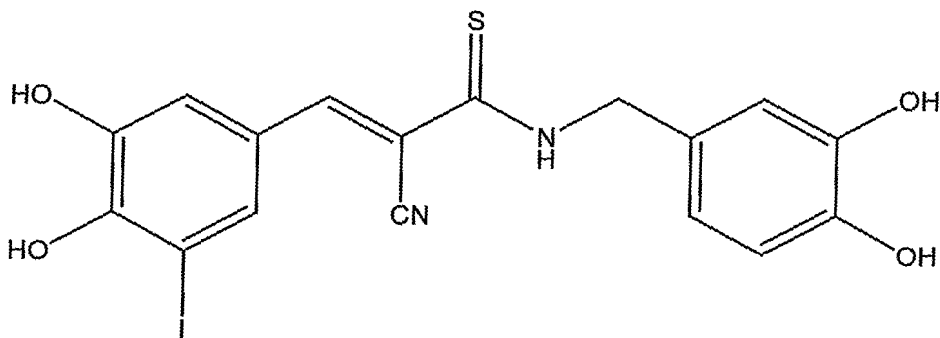
13



14

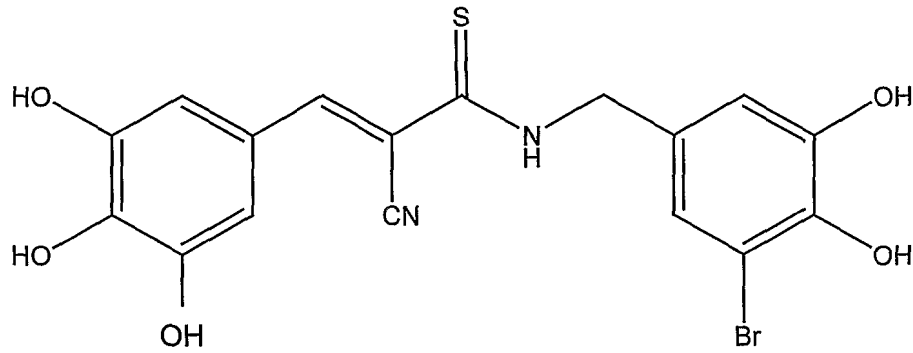


15

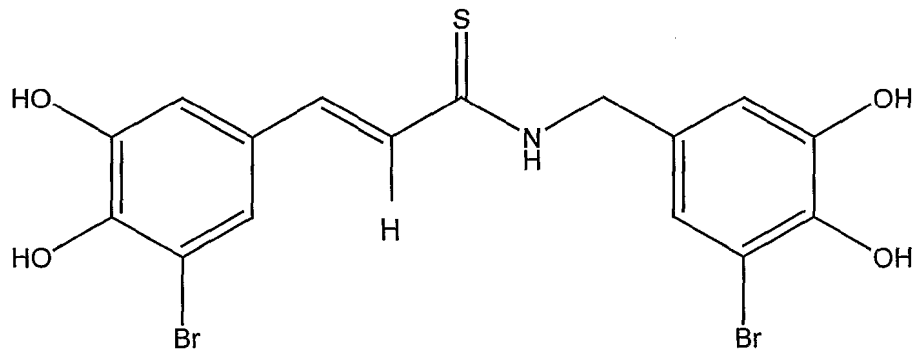


16

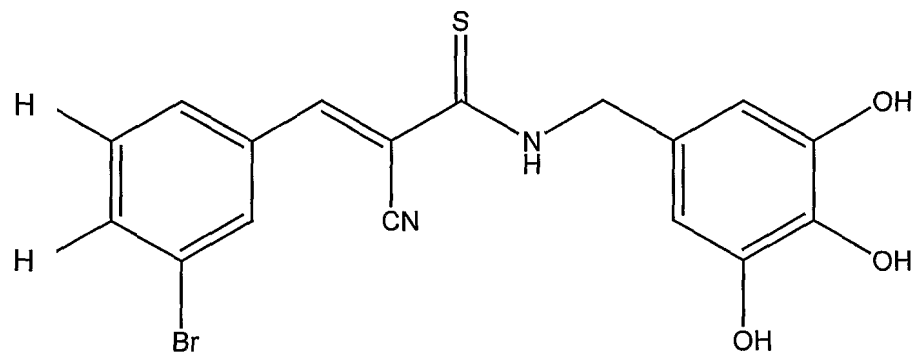
【化 1 2】



17



18、および



19

からなる群から選択される、請求項 8 または請求項 9 に記載の使用。

【請求項 1 1】

タンパク質チロシンキナーゼ (PTK) によって媒介されるシグナル伝達経路を阻害するための、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 2】

タンパク質チロシンキナーゼ (PTK) 関連障害を治療または予防するための医薬の調製のための、請求項 1 または請求項 6 に記載の化合物の使用であって、

前記 PTK 関連障害は、細胞増殖性障害、線維障害、もしくは代謝障害であるか、または

前記 PTK 関連障害は癌である、使用。

【請求項 1 3】

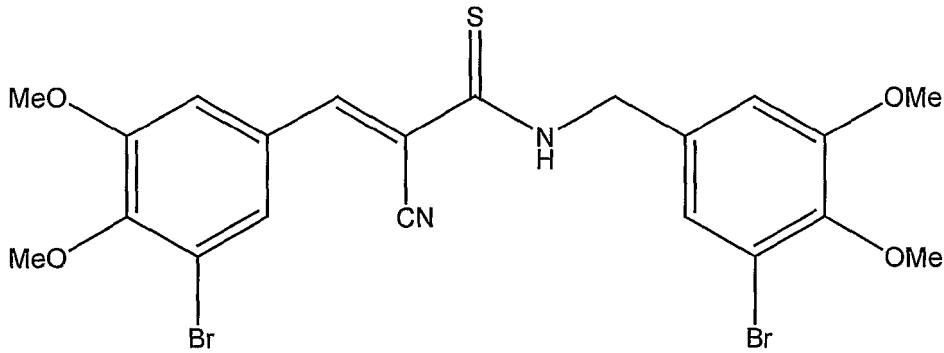
前記タンパク質キナーゼが受容体型タンパク質チロシンキナーゼ (RTK) であり、前記受容体型タンパク質キナーゼが、血小板由来増殖因子受容体 (PDGFR)、線維芽細

胞増殖因子受容体 (FGFR)、肝細胞増殖因子受容体 (HGFR)、インスリン受容体、インスリン様増殖因子-1受容体 (IGF-1R)、上皮増殖因子受容体 (EGFR)、神経成長因子受容体 (NGFR)、血管内皮増殖因子受容体 (VEGFR)、およびマクロファージコロニー刺激因子 (M-CSFR) からなる群から選択される、請求項 1.2 に記載の使用。

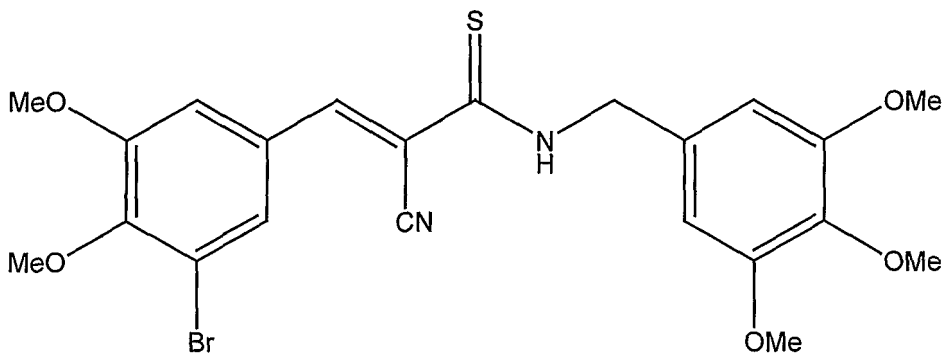
【請求項 1.4】

前記化合物が、

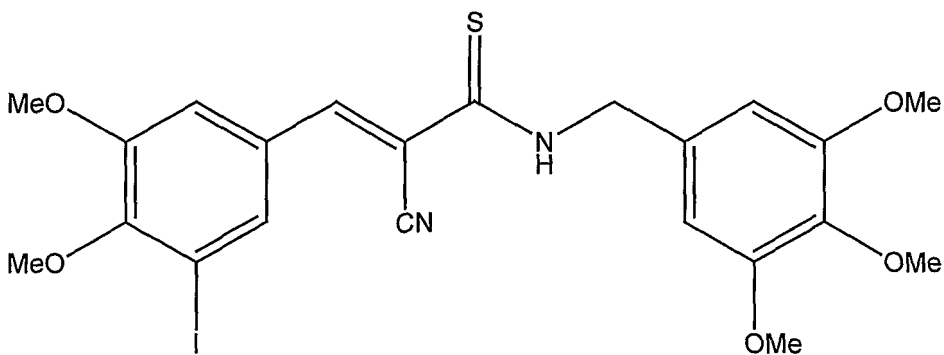
【化 1.3】



2

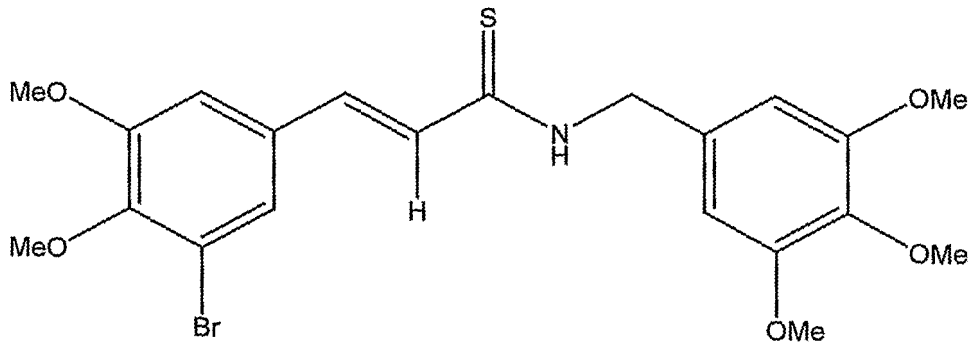


3

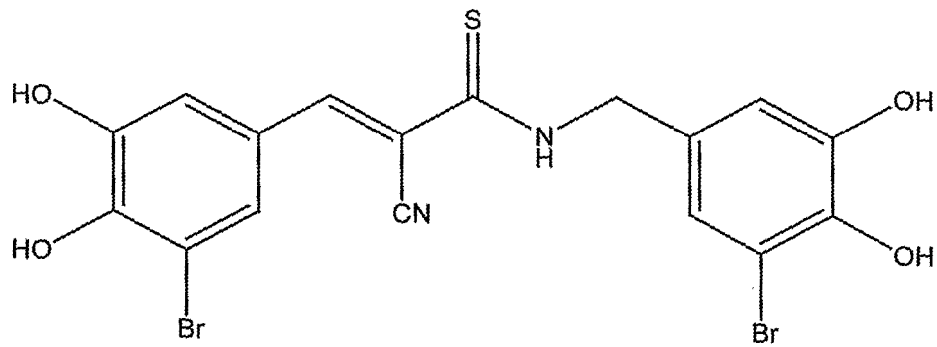


4

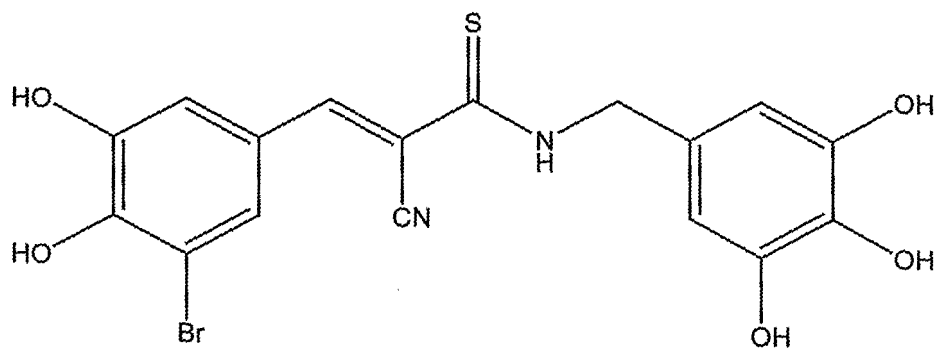
【化 1 4】



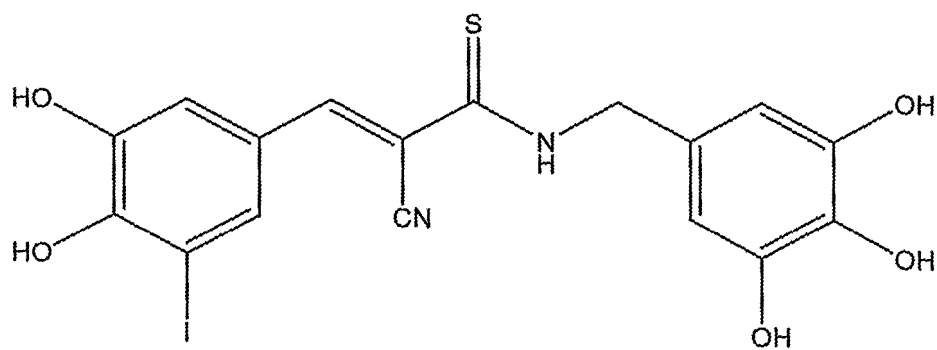
5



6

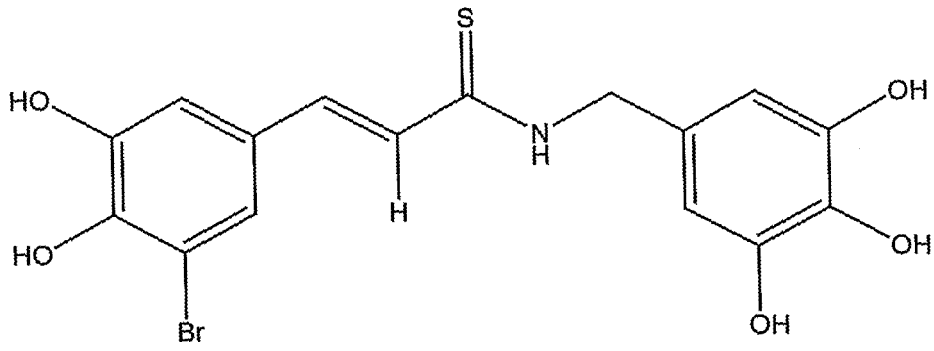


7

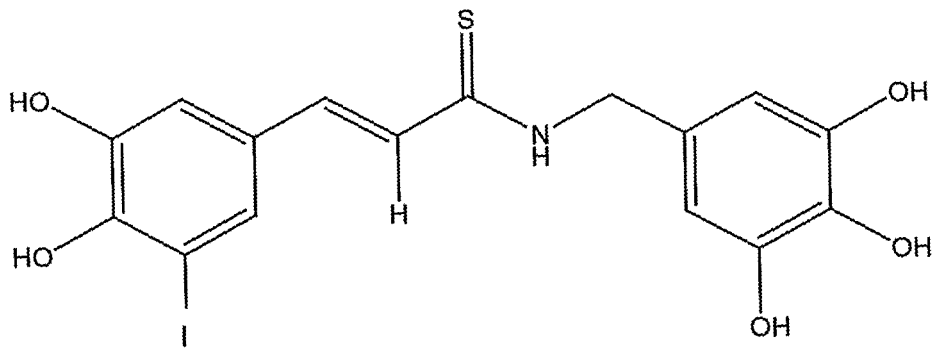


8

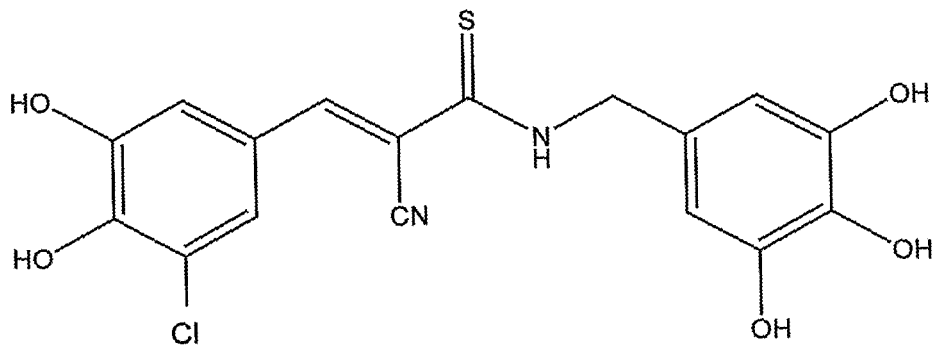
【化 1 5】



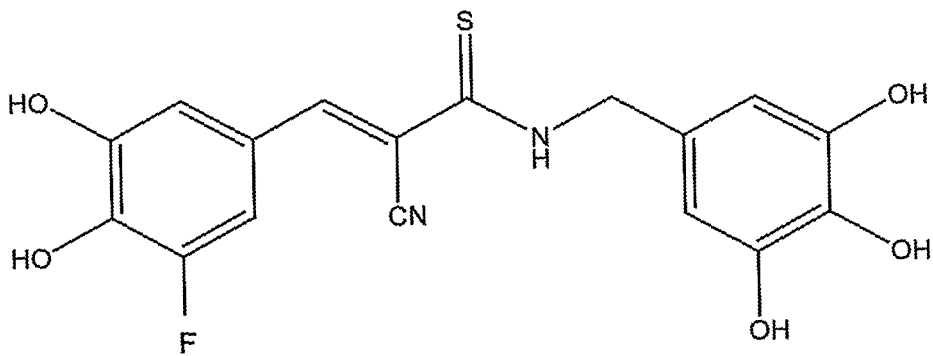
9



10

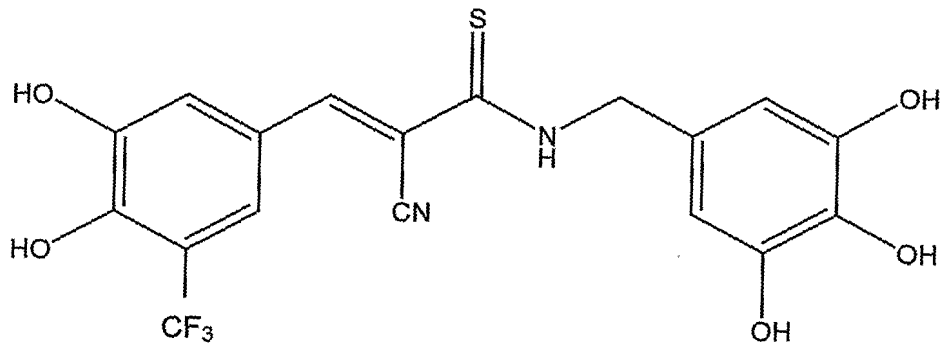


11

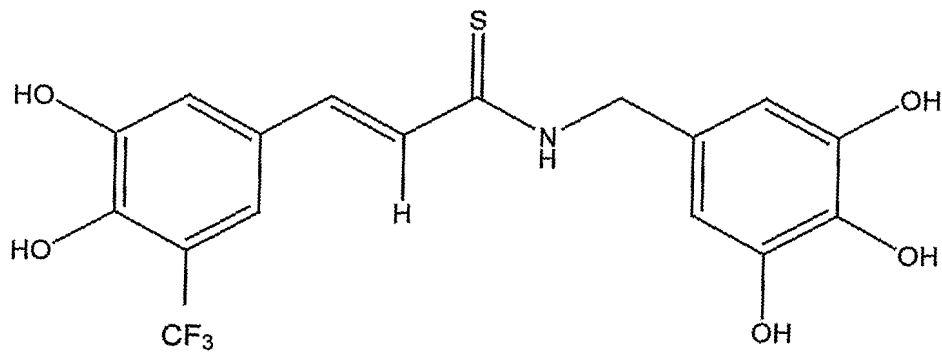


12

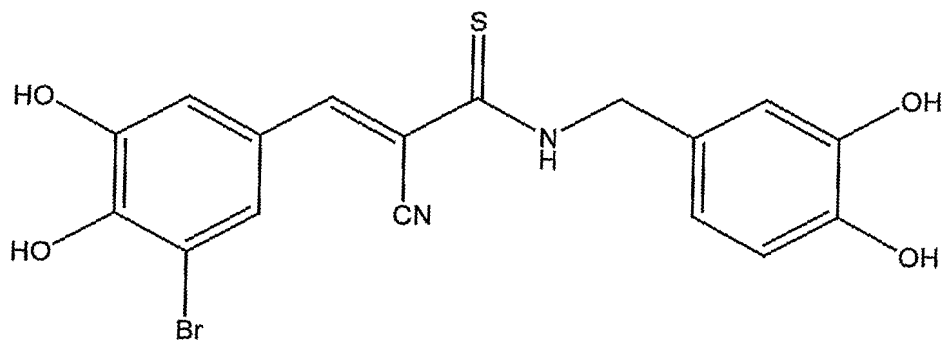
【化 1 6】



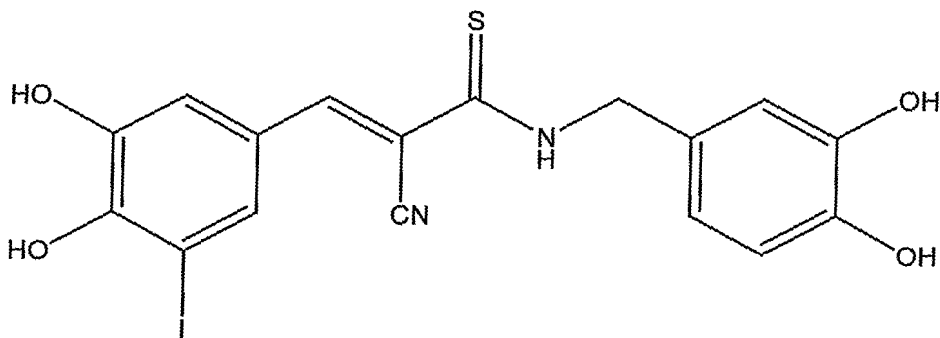
13



14

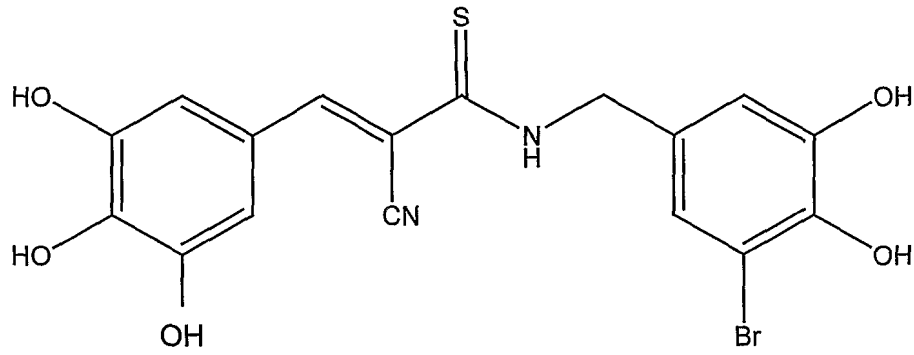


15

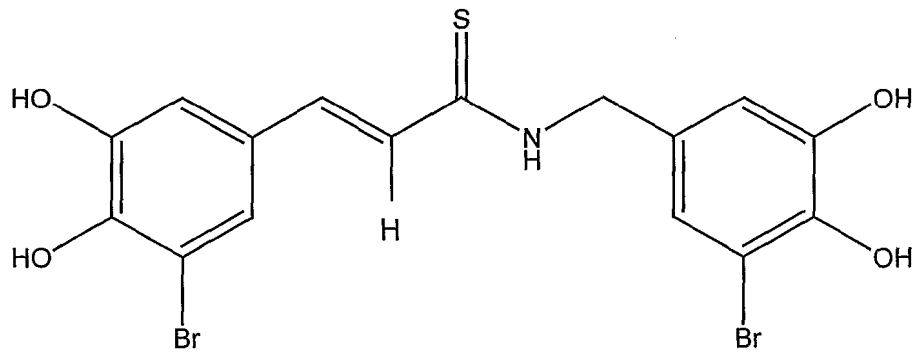


16

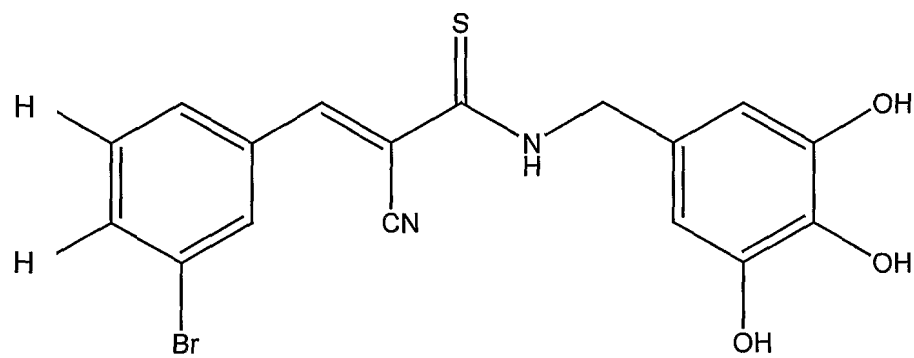
【化 17】



17



18、および



19

からなる群から選択される、請求項 1 2 または請求項 1 3 に記載の使用。

【請求項 1 5】

タンパク質チロシンキナーゼ (P T K) 関連障害を治療または予防するための、請求項 7 に記載の医薬組成物。