

【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19年12月6日(2007.12.6)

【公表番号】特表2003-530318(P2003-530318A)

【公表日】平成15年10月14日(2003.10.14)

【出願番号】特願2001-553268(P2001-553268)

【国際特許分類】

C 0 7 D 215/38	(2006.01)
A 6 1 K 9/02	(2006.01)
A 6 1 K 9/08	(2006.01)
A 6 1 K 9/12	(2006.01)
A 6 1 K 9/20	(2006.01)
A 6 1 K 9/48	(2006.01)
A 6 1 K 31/5377	(2006.01)
A 6 1 P 9/00	(2006.01)
A 6 1 P 9/10	(2006.01)
A 6 1 P 11/00	(2006.01)
A 6 1 P 11/06	(2006.01)
A 6 1 P 29/00	(2006.01)
A 6 1 P 35/00	(2006.01)
A 6 1 P 37/04	(2006.01)
A 6 1 P 37/06	(2006.01)
A 6 1 P 43/00	(2006.01)
C 0 7 D 311/58	(2006.01)
C 0 7 D 471/04	(2006.01)

【F I】

C 0 7 D 215/38	
A 6 1 K 9/02	
A 6 1 K 9/08	
A 6 1 K 9/12	
A 6 1 K 9/20	
A 6 1 K 9/48	
A 6 1 K 31/5377	
A 6 1 P 9/00	
A 6 1 P 9/10	
A 6 1 P 11/00	
A 6 1 P 11/06	
A 6 1 P 29/00	
A 6 1 P 35/00	
A 6 1 P 37/04	
A 6 1 P 37/06	
A 6 1 P 43/00	1 1 1
C 0 7 D 311/58	
C 0 7 D 471/04	1 1 7 A

【手続補正書】

【提出日】平成19年10月18日(2007.10.18)

【手続補正1】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】特許請求の範囲

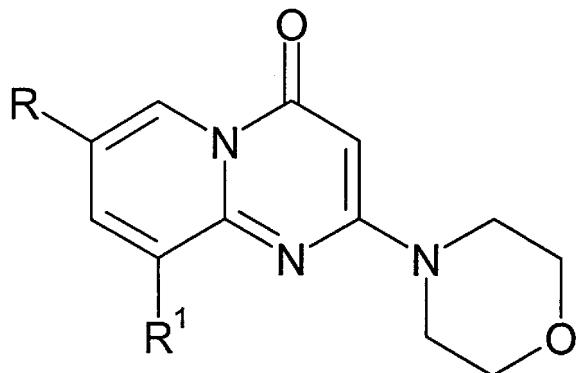
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】 下記式(I)を有する化合物：

【化1】



(I)

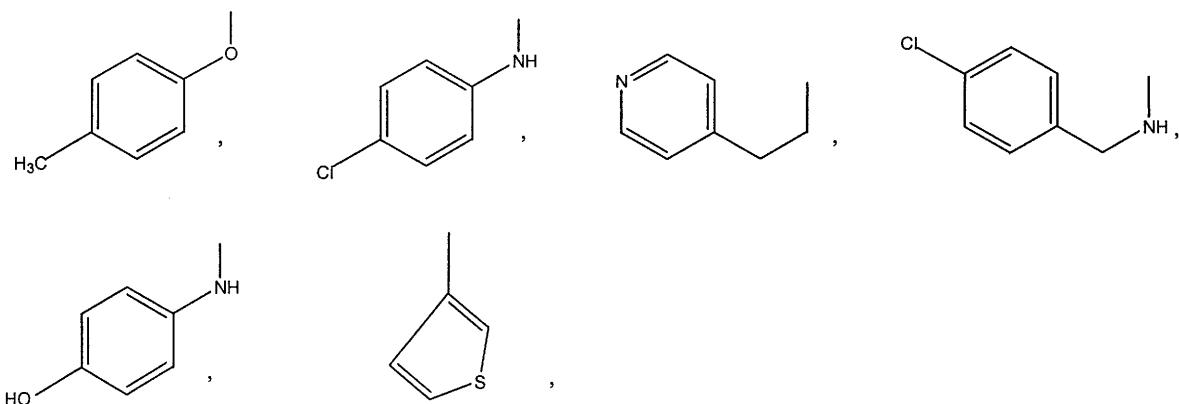
Rは、H、OH、F、Cl、Br、I、C₁-C₆アルキル、アリール又は(CH₂)_n-アリールであり；

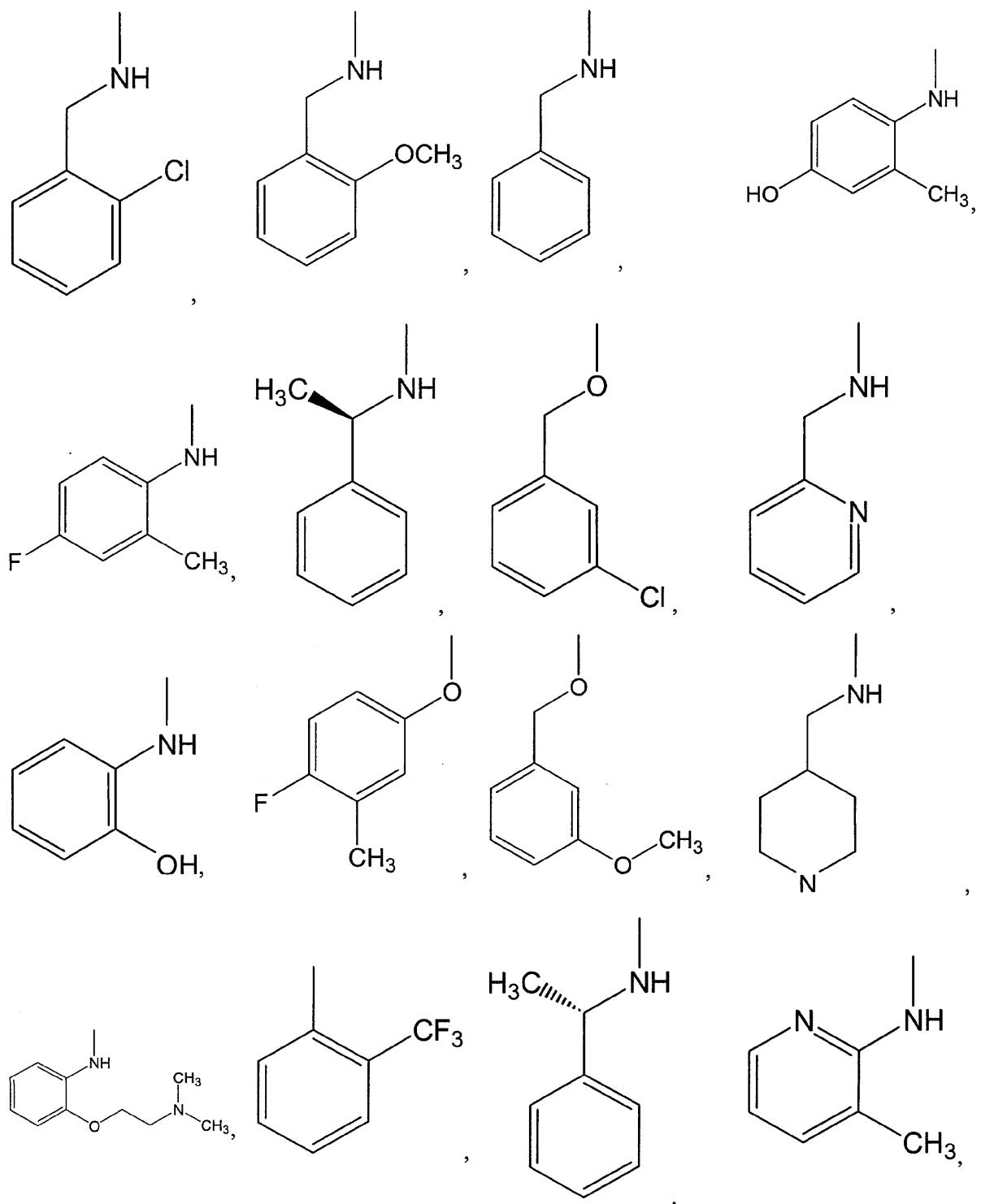
R¹は、OH、F、Cl、Br、I、C₁-C₆アルキル、C₃-C₆シクロアルキル、CH=CH-アリール、C-C-アリール、(CHR³)_n-アリール、NR³-C₁-C₆アルキル、NR³-シクロアルキル、NR³-(CHR³)_n-アリール、(CHR³)_n-NR³-アリール、(CHR³)_n-NR³-アルキル、(CHR³)_n-NR³-シクロアルキル、(CHR³)_n-O-アリール、(CHR³)_n-O-アルキル、(CHR³)_n-O-シクロアルキル、O-(CHR³)_n-アリール、S-(CHR³)_n-アリール、又はCO-アリールであって、nは0、1又は2であり、アルキル、シクロアルキル又はアリールは、任意にF、Cl、Br、I、CN、CO₂H、CO₂R³、N₀₂、CF₃、置換若しくは未置換のC₁-C₆アルキル、置換若しくは未置換のシクロアルキル、置換若しくは未置換のアリール、OCF₃、OR³、OSO₂-アリール、置換若しくは未置換のアミン、NHCOR³、NHSO₂R³、CONHR³、又はSO₂NHR³で置換されていてもよく；

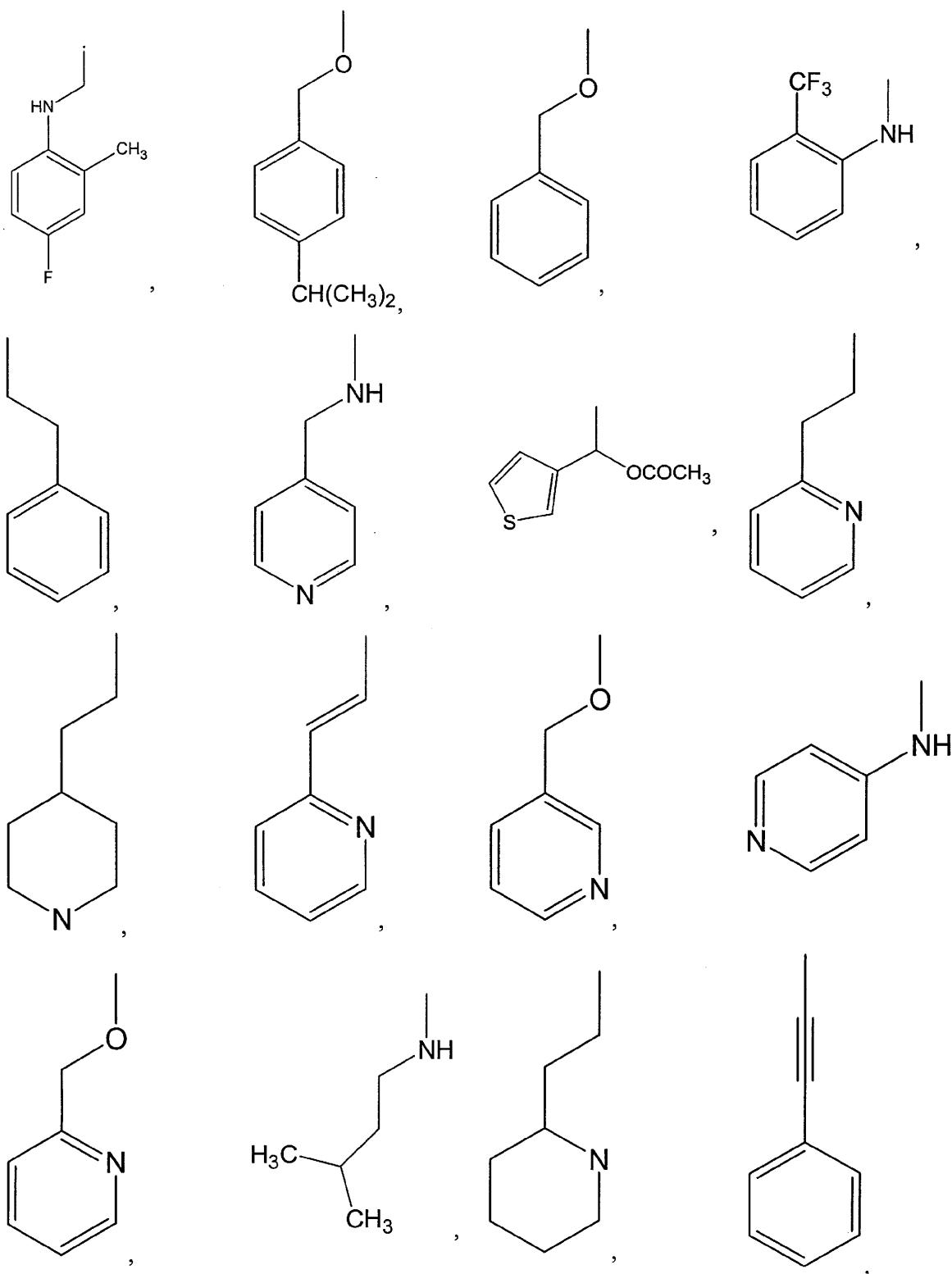
R³は、H、又は置換若しくは未置換のC₁-C₆アルキル、置換若しくは未置換のアリールである。

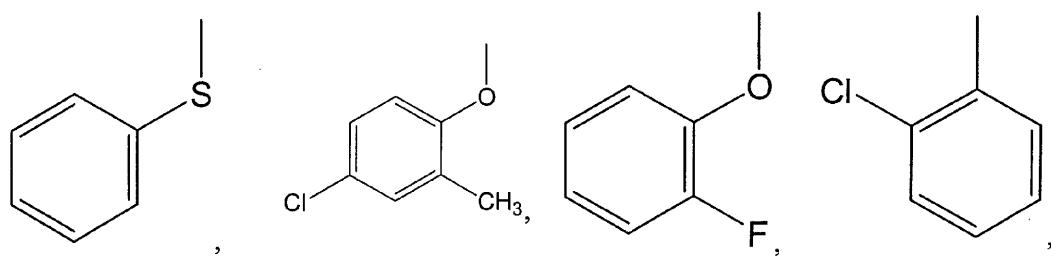
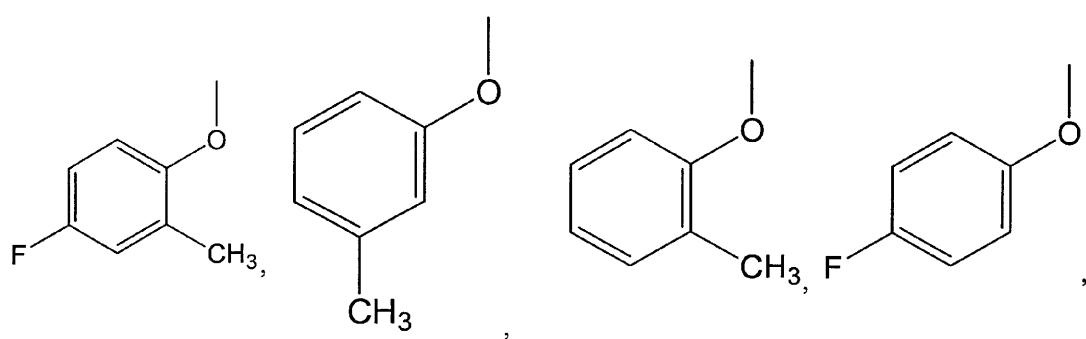
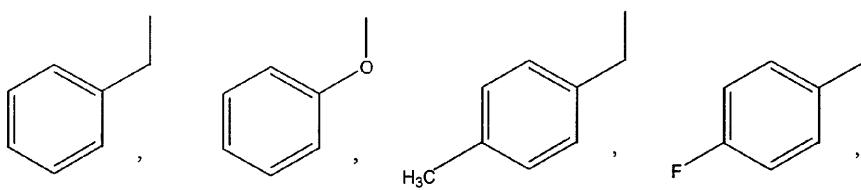
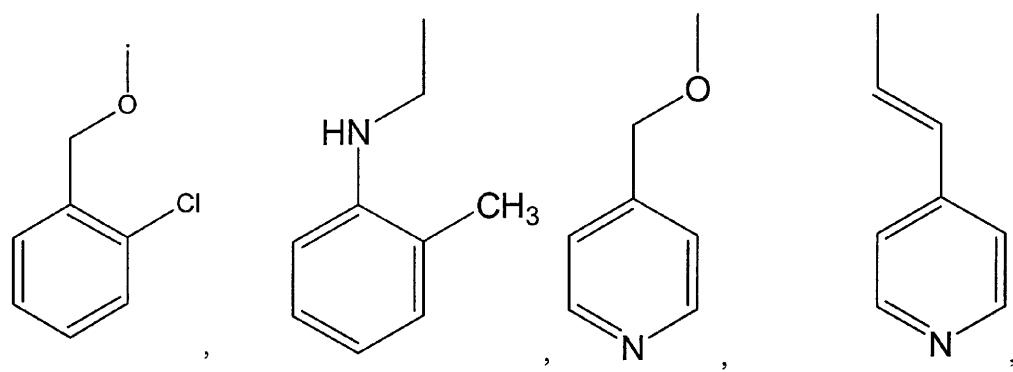
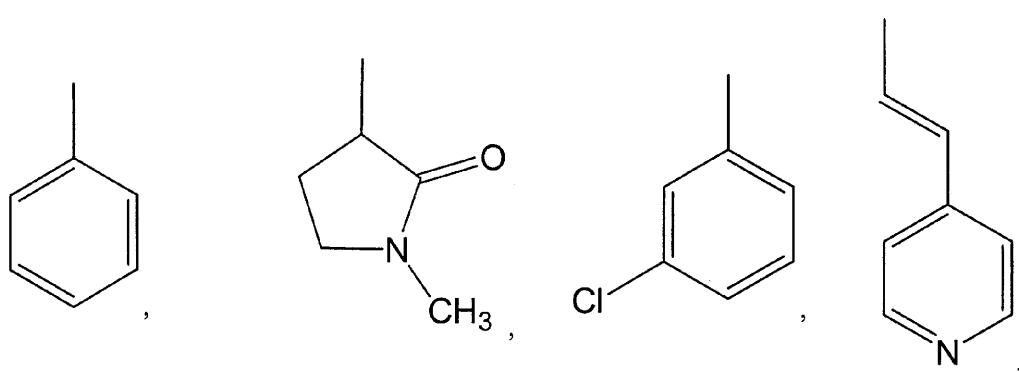
【請求項2】 R¹が、-CH₃、Br、並びに以下に示す基からなる群より選択されるものである、請求項1記載の化合物。

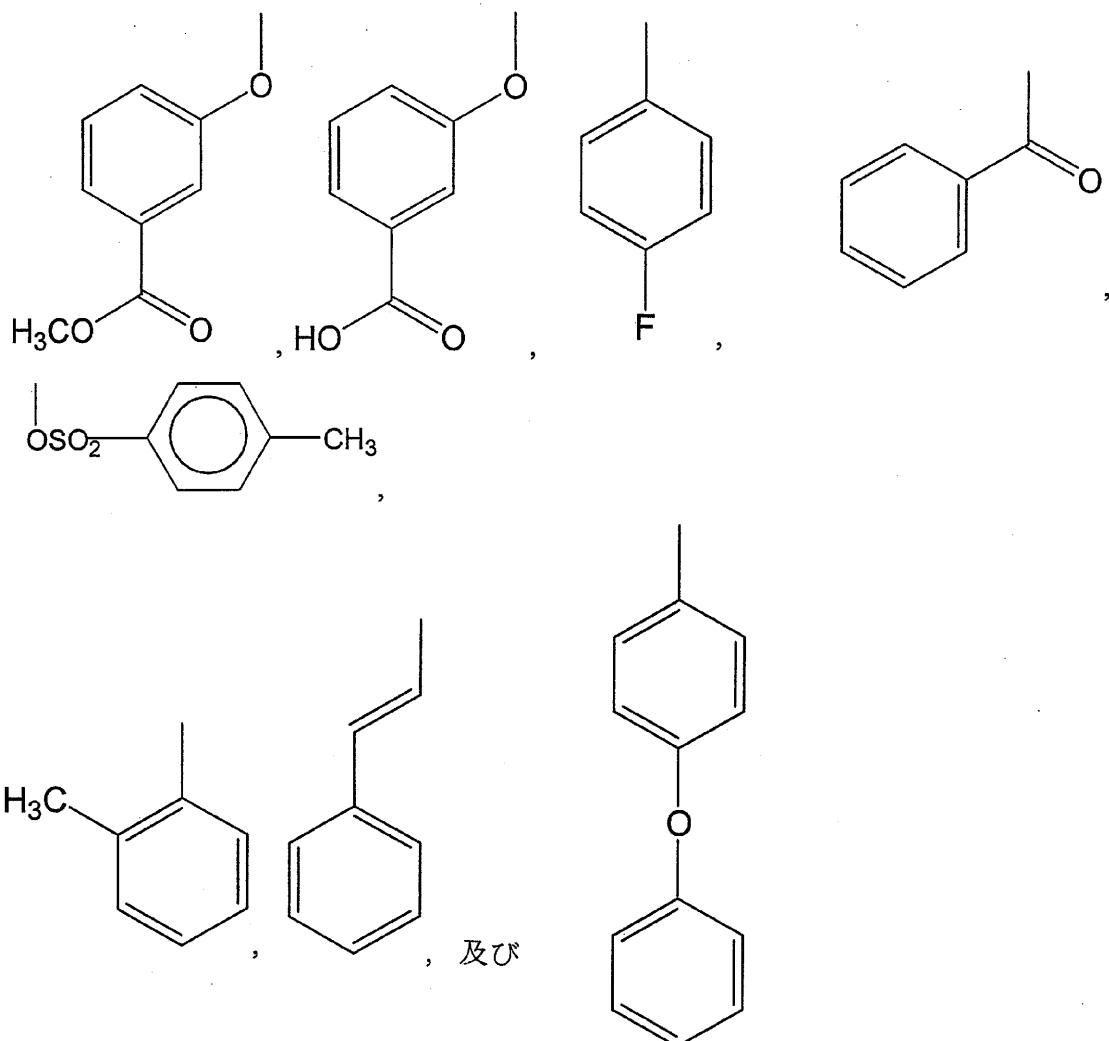
【化2】











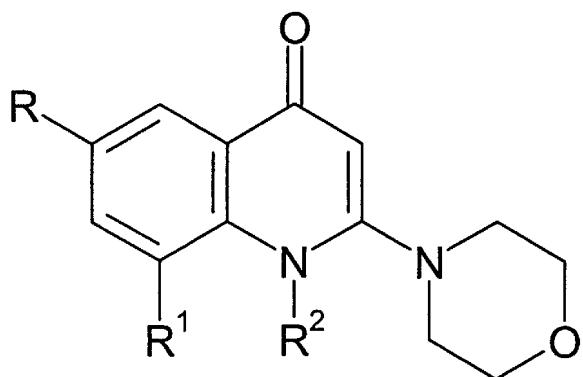
【請求項3】 アルキル、シクロアルキル又はアリールが、任意にF、Cl、Br、I、CN、CO₂H、CO₂R³、NO₂、CF₃、置換若しくは未置換のC₁-C₆アルキル、置換若しくは未置換のシクロアルキル、置換若しくは未置換のアリール、OH、OCH₃、OCF₃、OR³、OSO₂-アリール、置換若しくは未置換のアミン、NHCOR³、NHSO₂R³、CONHR³、又はSO₂NHR³で置換されてもよく、R³がC₁-C₆アルキルである、請求項1又は2記載の化合物(I)。

【請求項4】 RがH、F、Cl、又はC₁-C₆アルキルであり、R¹が、(CHR³)_n-アリール、NR³-(CHR³)_n-アリール、(CHR³)_n-NR³-アリール、(CHR³)_n-O-アリール、O-(CHR³)_n-アリール、又はS-(CHR³)_n-アリールであって、nは0、1又は2である、請求項1～3のいずれか1項記載の化合物(I)。

【請求項5】 RがH、F、Cl、又はメチルであり、R¹が、フェニル、ベンジル、ベンジルオキシ、ベンジルアミン、フェニルアミノメチル、又は2-メチル-4-フルオロフェニルアミノメチルである、請求項1～4のいずれか1項記載の化合物(I)。

【請求項6】 下記式(I)を有する化合物：

【化3】



(II)

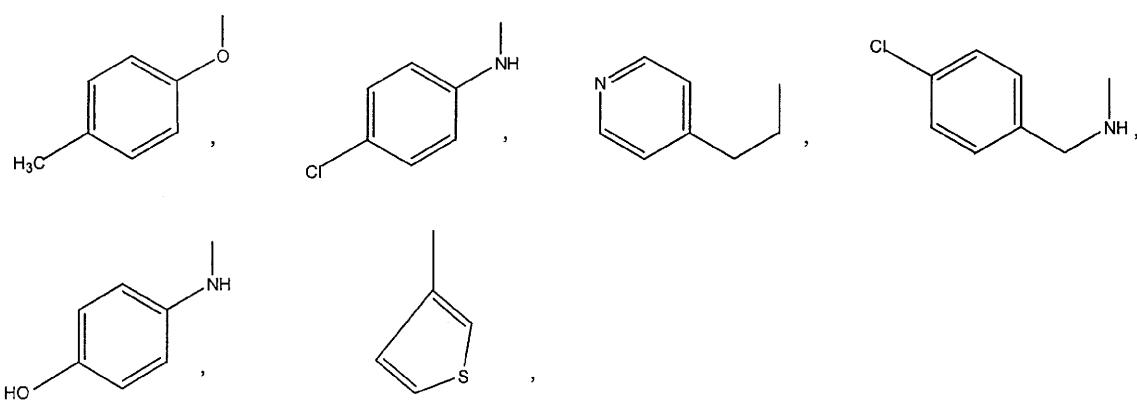
R及びR²は、独立にH、OH、F、Cl、Br、I、C₁-C₆アルキル、アリール又は(CH₂)_n-アリールであり；

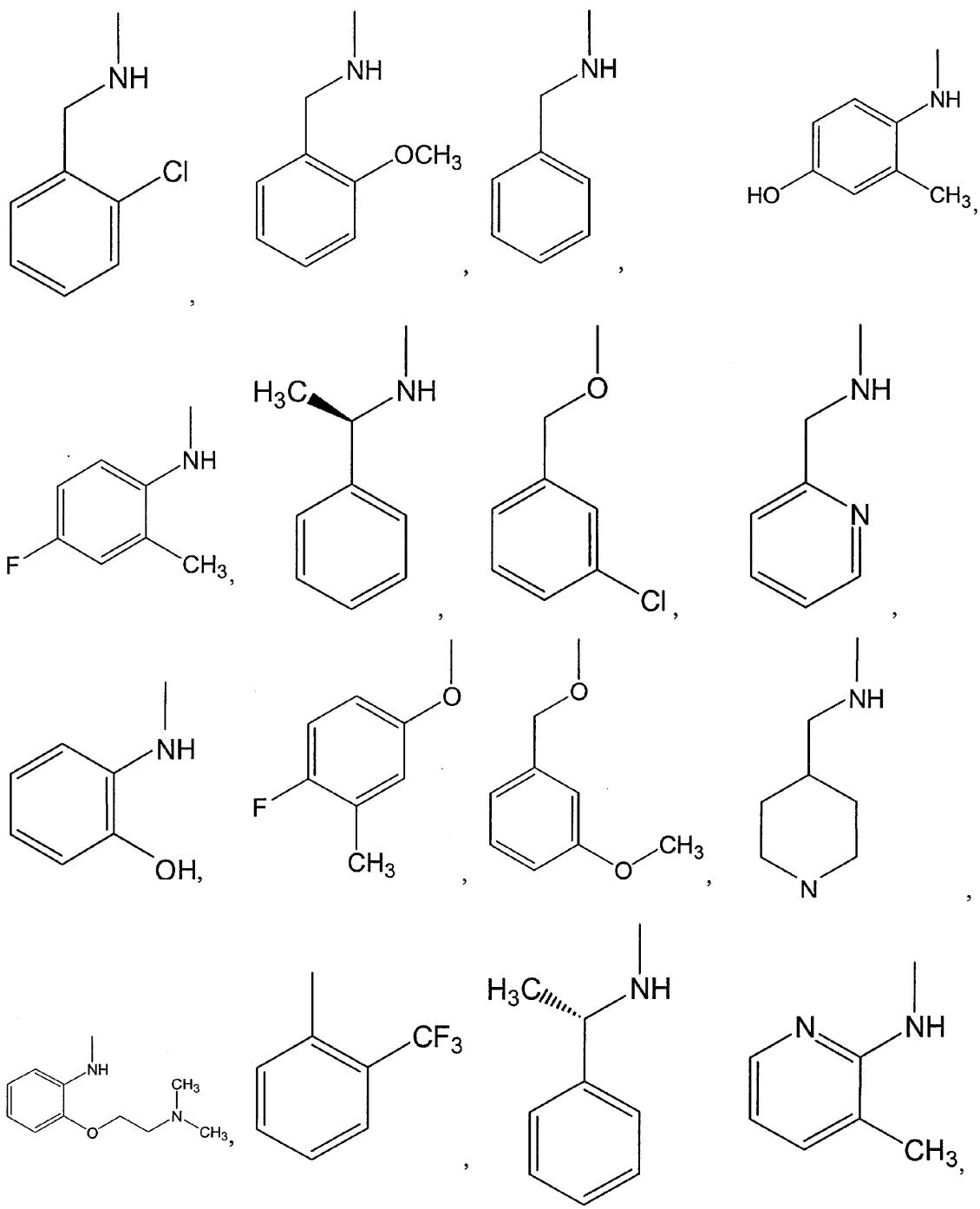
R¹は、H、OH、F、Cl、Br、I、C₁-C₆アルキル、C₃-C₆シクロアルキル、CH=CH-アリール、C-C-アリール、(CHR³)_n-アリール、NR³-C₁-C₆アルキル、NR³-シクロアルキル、NR³-(CHR³)_n-アリール、(CHR³)_n-NR³-アリール、(CHR³)_n-NR³-アルキル、(CHR³)_n-NR³-シクロアルキル、(CHR³)_n-O-アリール、(CHR³)_n-O-アルキル、(CHR³)_n-O-シクロアルキル、O-(CHR³)_n-アリール、S-(CHR³)_n-アリール、又はCO-アリールであって、nは0、1又は2であり、アルキル、シクロアルキル又はアリールは、任意にF、Cl、Br、I、CN、CO₂H、CO₂R³、NO₂、CF₃、置換若しくは未置換のC₁-C₆アルキル、置換若しくは未置換のシクロアルキル、置換若しくは未置換のアリール、OCF₃、OR³、OSO₂-アリール、置換若しくは未置換のアミン、NHCOR³、NHSO₂R³、CONHR³、又はSO₂NHR³で置換されていてもよく；

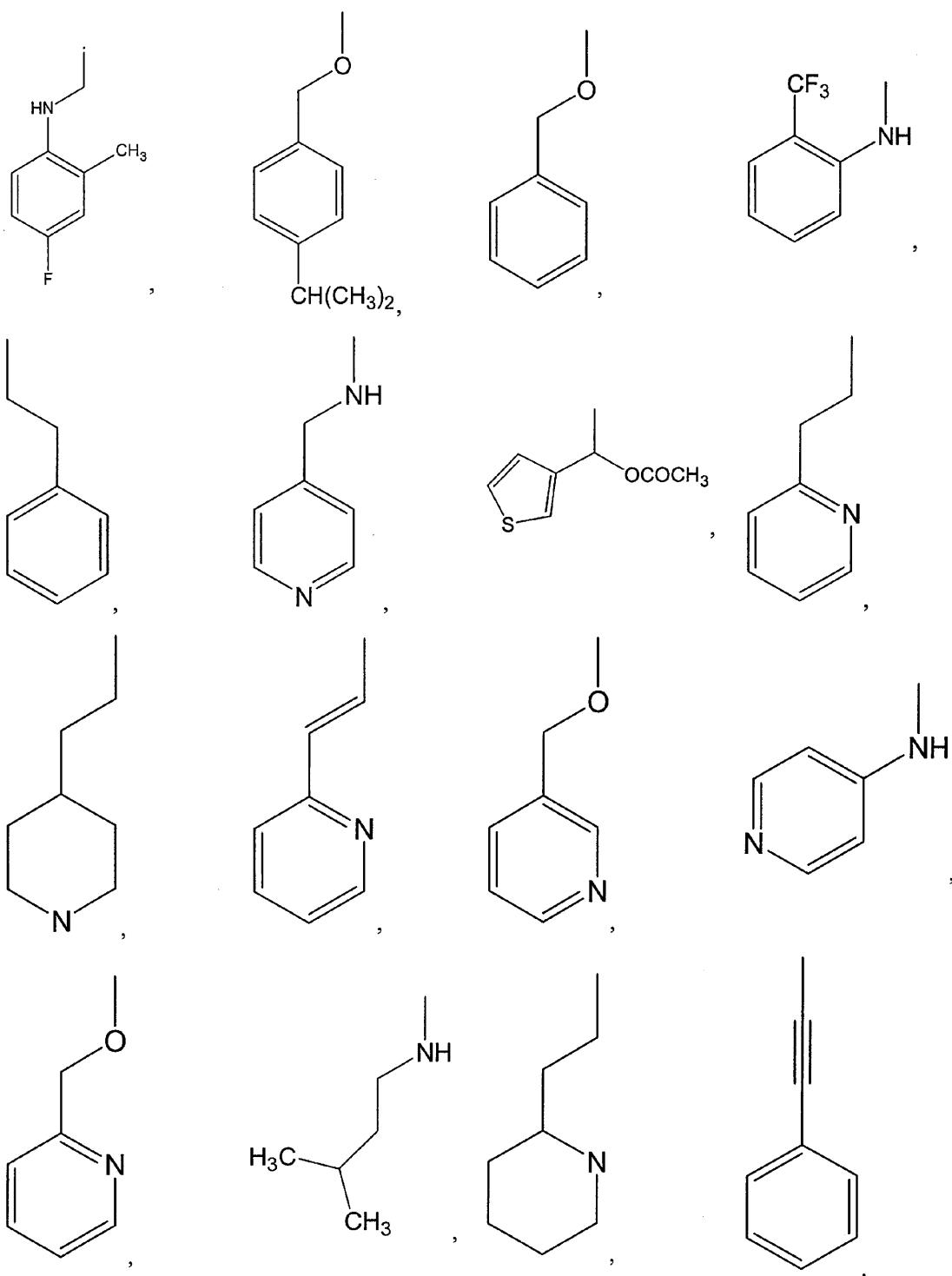
R³は、H、又は置換若しくは未置換のC₁-C₆アルキル、置換若しくは未置換のアリールである。

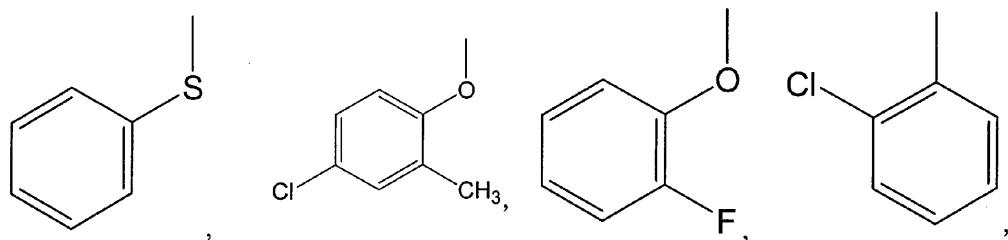
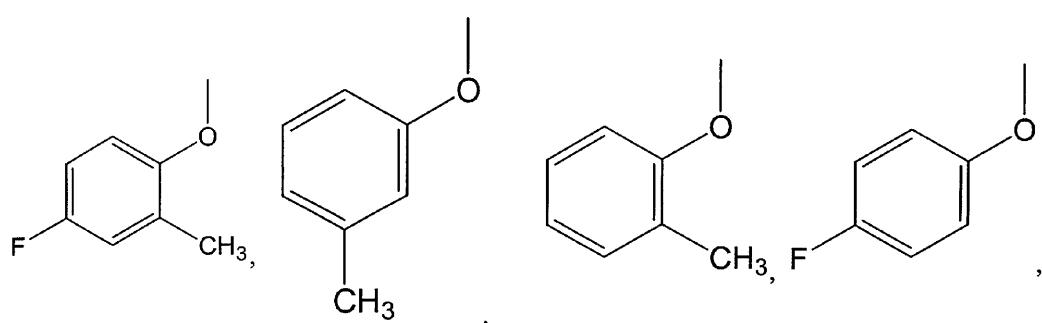
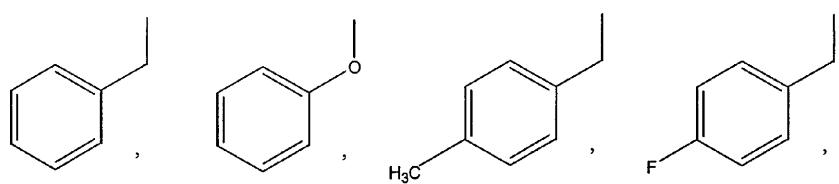
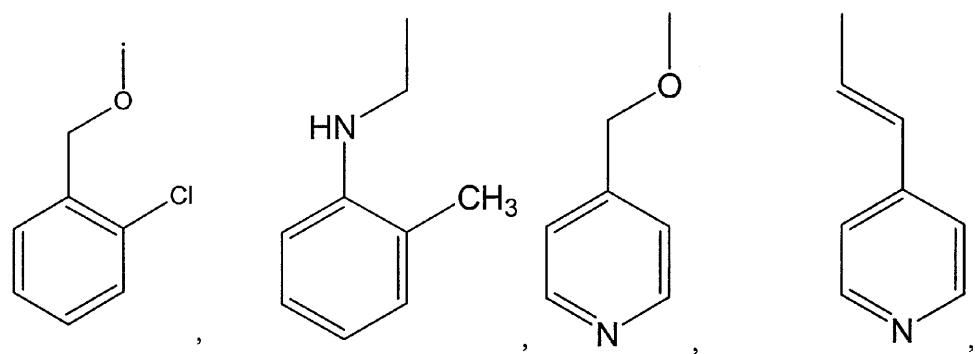
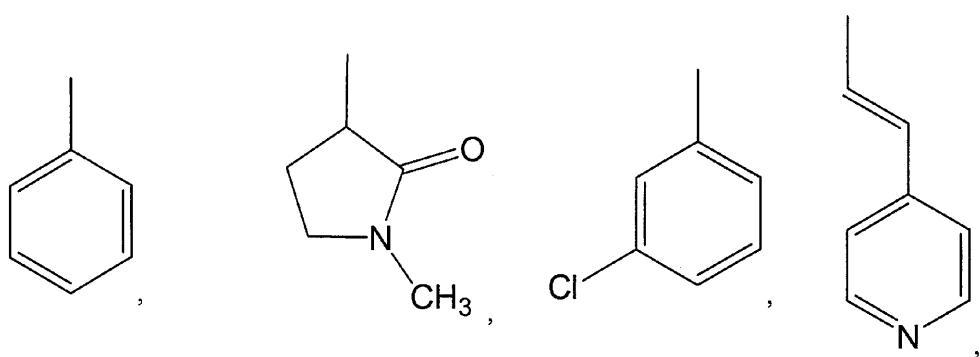
【請求項7】 R¹が、-CH₃、Br、並びに以下に示す基からなる群より選択されるものである、請求項6記載の化合物(II)。

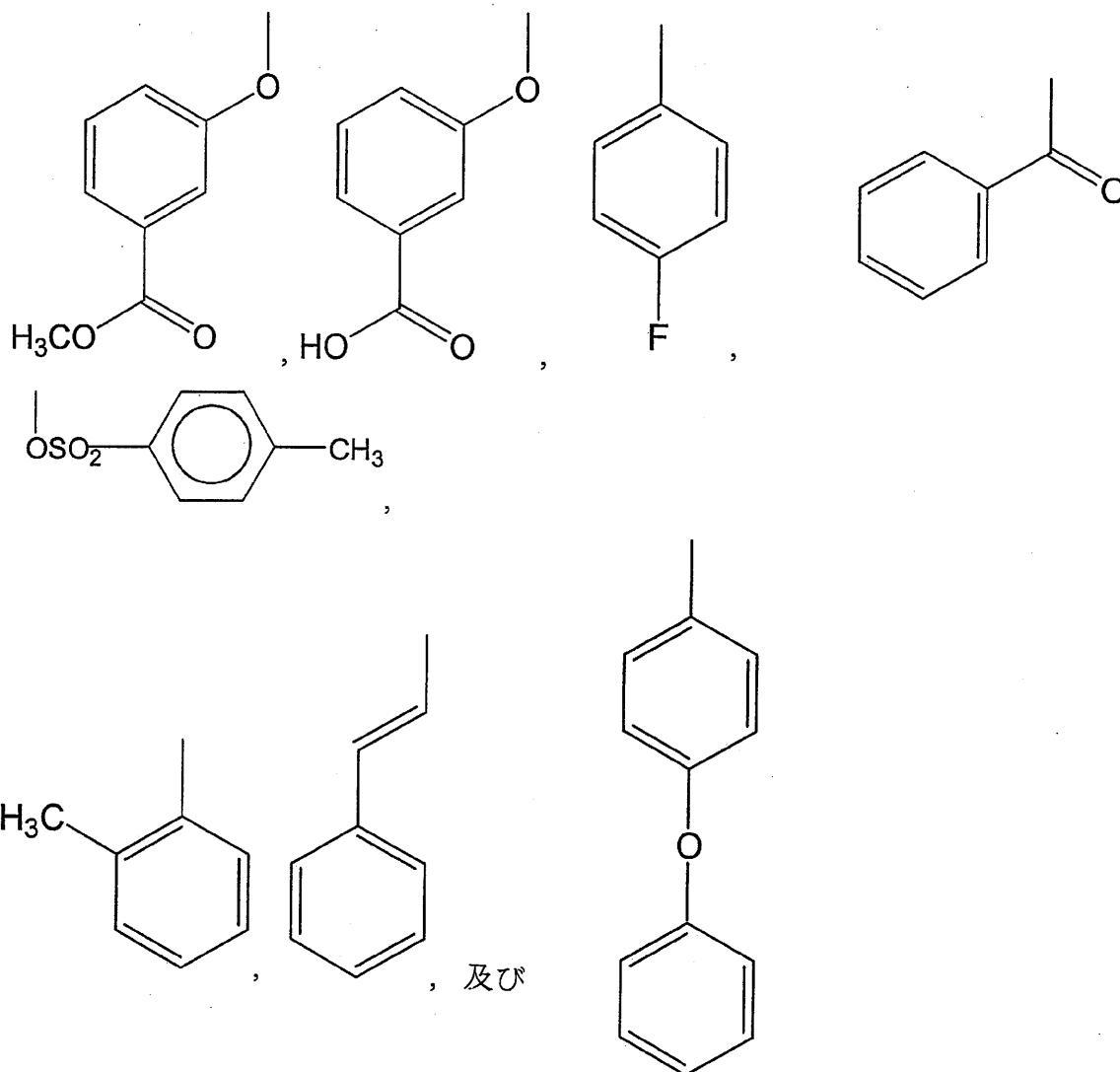
【化4】









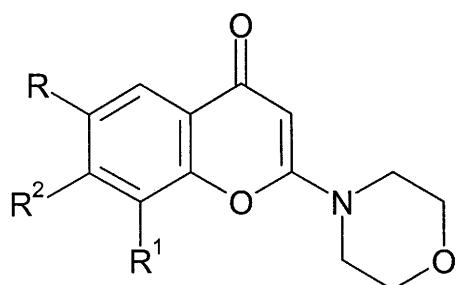


【請求項 8】 RがH、F、CI、又はC₁-C₆アルキルであり、R¹が、(CHR³)_n-アリール、NR³-(CHR³)_n-アリール、(CHR³)_n-NR³-アリール、(CHR³)_n-O-アリール、O-(CHR³)_n-アリール、又はS-(CHR³)_n-アリールであって、nは0、1又は2である、請求項6又は7記載の化合物(II)。

【請求項 9】 RがH、F、CI、又はC₁-C₆アルキルであり、R¹が、フェノキシ、2-メチルフェノキシ、2-メチル-4-フルオロフェノキシ、又は3-カルボキシフェノキシである、請求項6～8のいずれか1項記載の化合物(II)。

【請求項 10】 下記式(III)を有する化合物：

【化5】



(III)

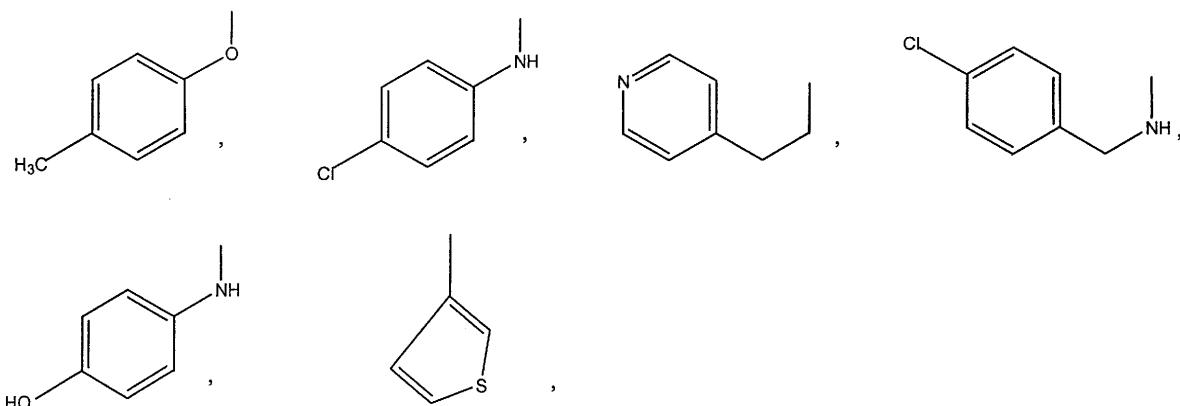
Rは、H、OH、F、Cl、Br、I、C₁-C₆アルキル、アリール、又は(CH₂)_n-アリールであり；

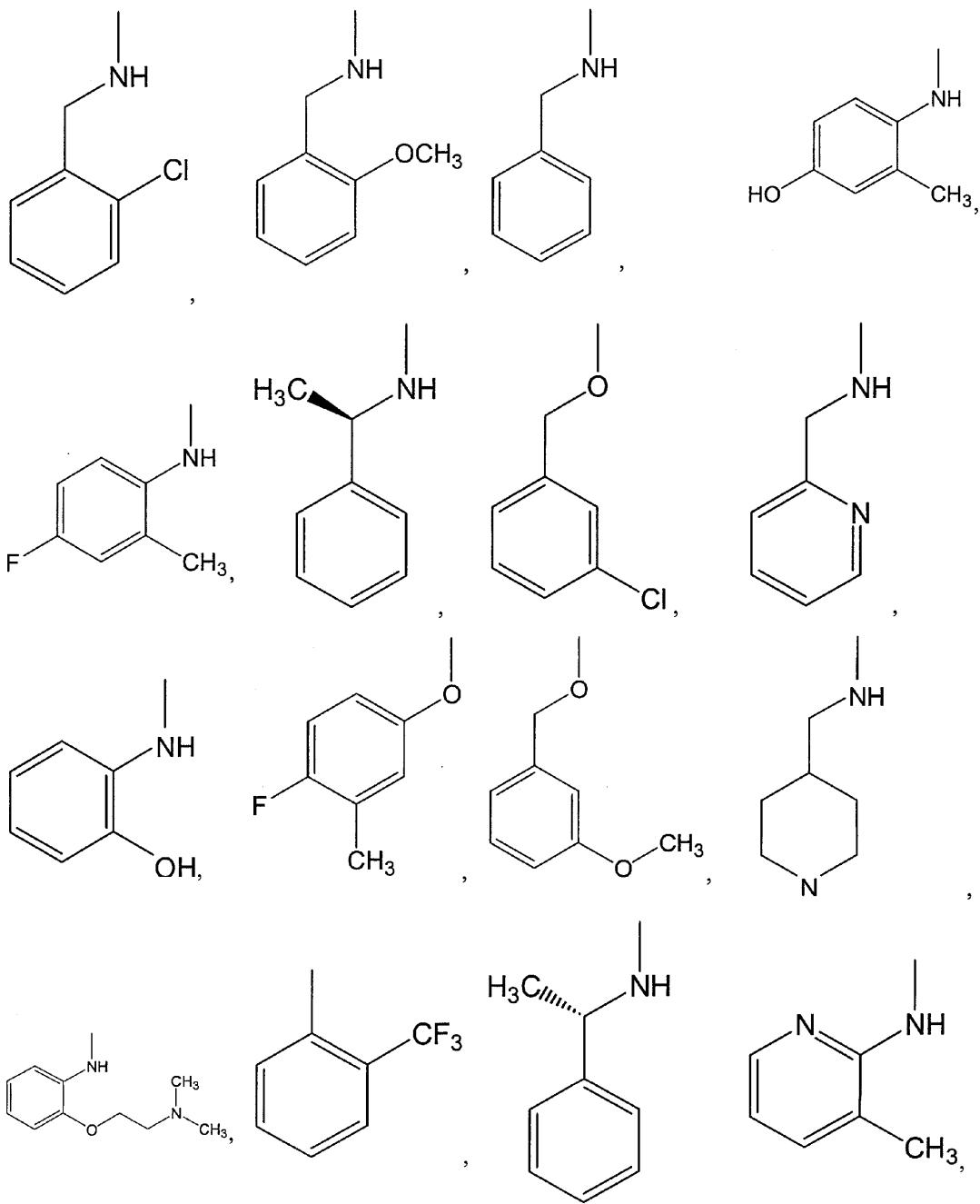
R¹及びR²は、独立にH、OH、F、Cl、Br、I、C₁-C₆アルキル、C₃-C₆シクロアルキル、CH=CH-アリール、C=C-アリール、(CHR³)-アリール、NR³-C₁-C₆アルキル、NR³-シクロアルキル、NR³-(CHR³)_n-アリール、(CHR³)_n-NR³-アリール、(CHR³)_n-NR³-アルキル、(CHR³)_n-NR³-シクロアルキル、(CHR³)_n-O-アリール、(CHR³)_n-O-アルキル、(CHR³)_n-O-シクロアルキル、O-(CHR³)_n-アリール、S-(CHR³)_n-アリール、又はCO-アリールであって、nは0、1又は2であり、アルキル、シクロアルキル又はアリールは、任意にF、Cl、Br、I、CN、CO₂H、CO₂R³、NO₂、CF₃、置換若しくは未置換のC₁-C₆アルキル、置換若しくは未置換のシクロアルキル、置換若しくは未置換のアリール、OCF₃、OR³、OSO₂-アリール、置換若しくは未置換のアミン、NHCOR³、NHSO₂R³、CONHR³、又はSO₂NHR³で置換されていてもよく；

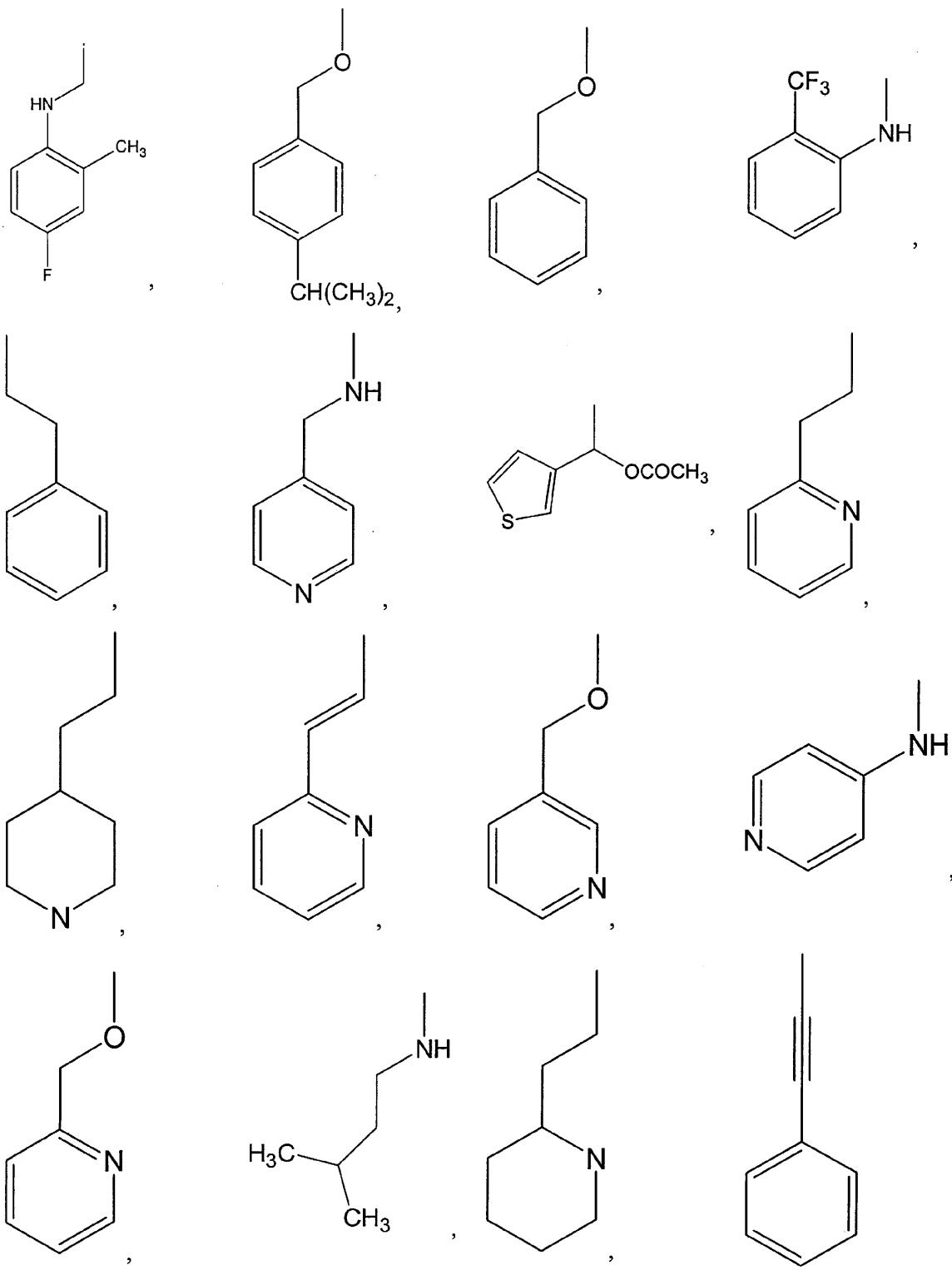
R³は、H、又は置換若しくは未置換のC₁-C₆アルキル、置換若しくは未置換のアリールである。

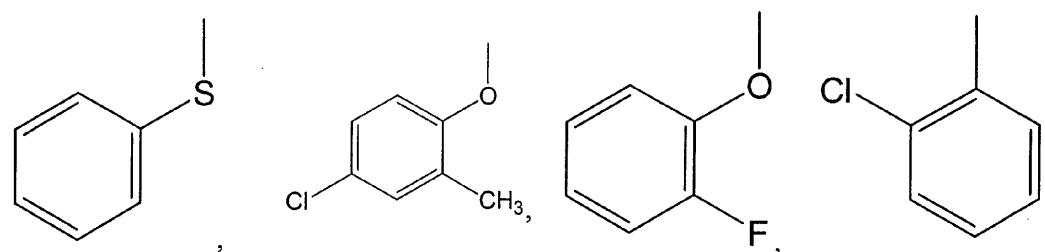
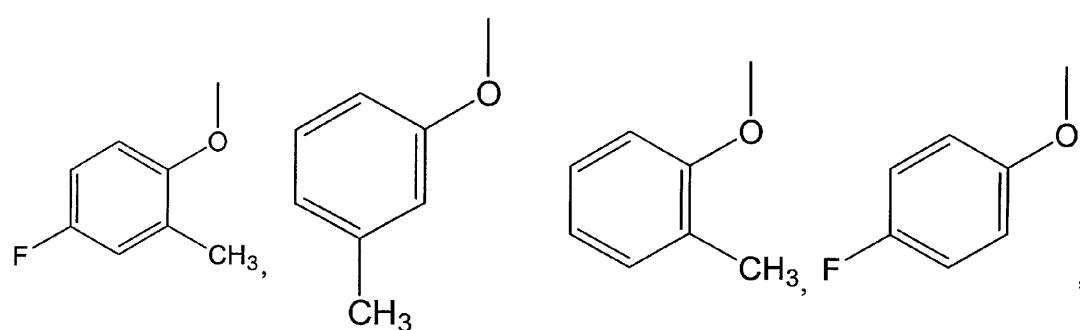
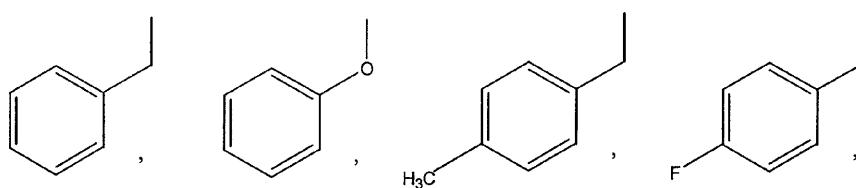
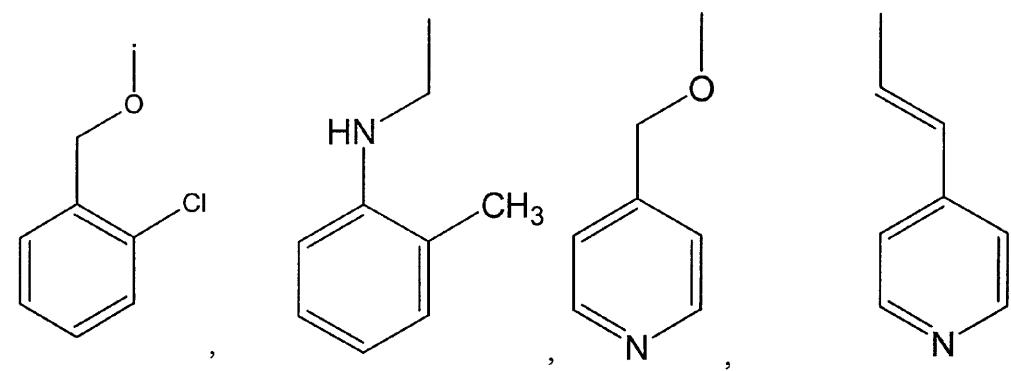
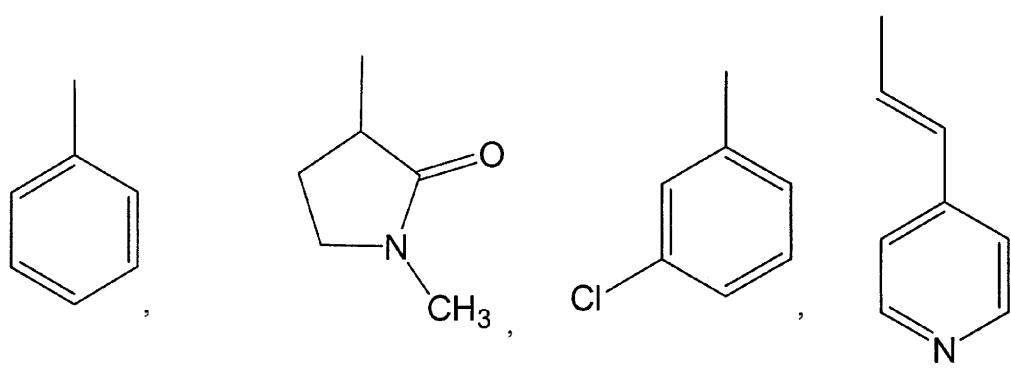
【請求項 11】 R¹が、-CH₃、Br、並びに以下に示す基からなる群より選択されるものである、請求項 10 記載の化合物。

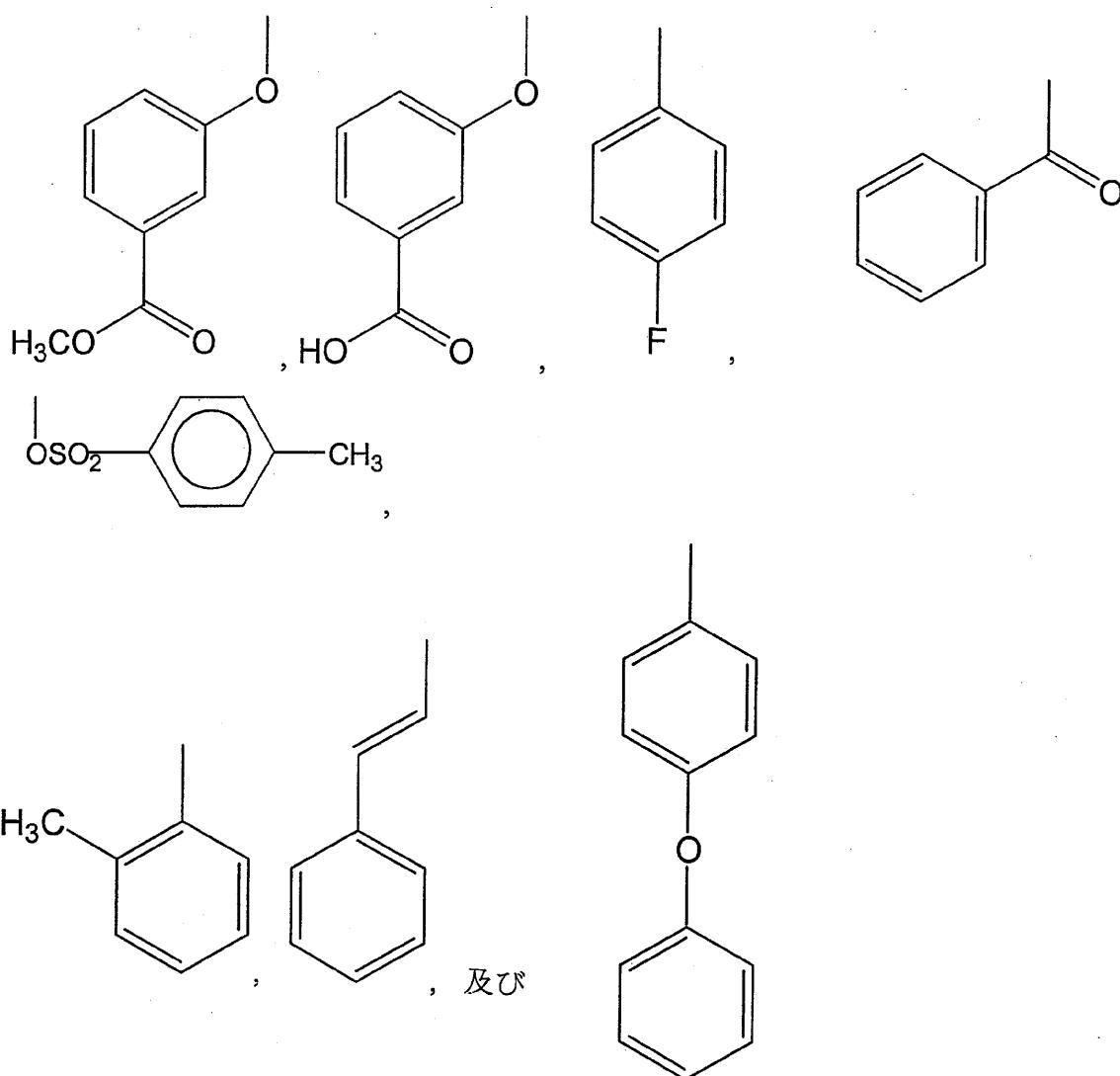
【化 6】











【請求項 12】 RがH、F、Cl、又はC₁-C₆アルキルであり、R¹が、(CHR³)_n-アリール、NR³-(CHR³)_n-アリール、(CHR³)_n-NR³-アリール、(CHR³)_n-O-アリール、O-(CHR³)_n-アリール、又はS-(CHR³)_n-アリールであって、nは0、1又は2である、請求項10又は11記載の化合物(III)。

【請求項 13】 患者においてホスホイノシチド3-キナーゼを阻害する方法であって、患者に対し、該患者においてホスホイノシチド3-キナーゼを阻害するのに有効な量の請求項1～12のいずれか1項記載の化合物を投与することを含む、上記方法。

【請求項 14】 治療に用いるための、請求項1～12のいずれか1項記載の化合物。

【請求項 15】 心血管疾患の予防又は治療方法であって、その予防又は治療が必要な患者に対し、有効量の請求項1～12のいずれか1項記載の化合物を投与することを含む、上記方法。

【請求項 16】 ホスホイノシチド3-キナーゼの阻害が有効である状態の治療に用いるための、請求項1～12のいずれか1項記載の化合物を含む医薬。

【請求項 17】 血栓症の阻害が有効である状態の治療に用いるための、請求項1～12のいずれか1項記載の化合物を含む医薬。

【請求項 18】 冠状動脈閉塞、発作、急性冠状血管症候群、急性心筋梗塞、再狭窄、アテローム性動脈硬化症又は不安定狭心症といった心血管疾患の治療又は予防に用いるための、請求項1～12のいずれか1項記載の化合物を含む医薬。

【請求項 19】 例えば喘息、慢性閉塞性肺疾患、及び気管支炎のような呼吸器疾患の治療又は予防に用いるための、請求項1～12のいずれか1項記載の化合物を含む医薬

【請求項 20】 神経膠腫、前立腺癌、小細胞肺癌又は乳癌といった癌の治療又は予防に用いるための、請求項 1～12 のいずれか 1 項記載の化合物を含む医薬。

【請求項 21】 例えは自己免疫疾患又は炎症性疾患のような白血球細胞機能障害に関連する疾患の治療又は予防に用いるための、請求項 1～12 のいずれか 1 項記載の化合物を含む医薬。

【請求項 22】 医薬が投与剤形である、請求項 17～21 のいずれか 1 項記載の医薬の使用。

【請求項 23】 投与剤形が、錠剤、カプセル剤、静脈内投与用製剤、鼻腔内投与用製剤、経皮投与用製剤、筋内注射用製剤、シロップ剤、坐剤、エーロゾル又はペッサリーの剤形である、請求項 22 記載の使用。

【請求項 24】 錠剤が、経口、舌下又は口腔投与用に製剤化されたものである、請求項 23 記載の使用。

【請求項 25】 投与剤形が約 5～約 500mg の化合物を含むものである、請求項 22 記載の使用。

【請求項 26】 投与剤形が約 25～約 300mg の化合物を含むものである、請求項 25 記載の使用。