

【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30年7月26日 (2018.7.26)

【公表番号】特表2017-534569(P2017-534569A)

【公表日】平成29年11月24日 (2017.11.24)

【年通号数】公開・登録公報2017-045

【出願番号】特願2017-502270(P2017-502270)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 471/14 1 0 2

C 0 7 D 471/14 C S P

A 6 1 K 31/444

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/496

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 35/02

【誤訳訂正書】

【提出日】平成30年5月18日 (2018.5.18)

【誤訳訂正 1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

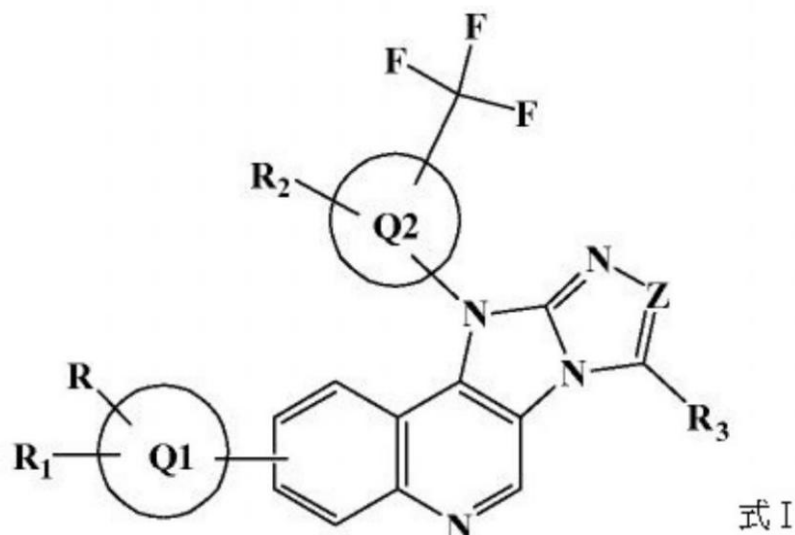
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【化 1】



{ 式中、

Q 1 及び Q 2 は、アリール、5 ～ 6 員ヘテロシクリル又は 9 ～ 11 員ビシクロヘテロシクリルから独立して選択され、

Z は、N 又は C - R であり、

R 及び R₁ は、H、ハロゲン、ハロゲン C₁ ～ C₆ アルキル、- C₁ ～ C₆ アルキル、- OR₇ 又は - NR₇ R₈ から独立して選択され、

R₂ 及び R₃ は、H、ハロゲン、- OH、- C₁ ～ C₆ アルキル、- C₁ ～ C₆ アルコキシル、- C₁ ～ C₆ アルケニル又は - C₁ ～ C₆ アルキニルから独立して選択され、

R₄ 及び R₅ は、H、ハロゲン、ハロゲン C₁ ～ C₆ アルキル、- C₁ ～ C₆ アルキル、- OH、- C₁ ～ C₆ アルコキシル、シクロアルキルから独立して選択されるか、あるいは、R₄ と R₅ の 2 つは、一緒になって脂肪族シクリル又はヘテロシクリルであってよい飽和又は不飽和 3 ～ 8 員環を形成し、

R₇ 及び R₈ は、H、ハロゲン、- C₁ ～ C₆ アルキル、- C₁ ～ C₆ アルキル OH、- C₁ ～ C₆ アルコキシル、- C₁ ～ C₆ アルキル NR₄ R₅、- C(=O) C₁ ～ C₆ アルキル、- C(=O) C₁ ～ C₆ アルキル - R₄ R₅、- C(=O) C₁ ～ C₆ アルキル OH、- C(=O) C₁ ～ C₆ アルコキシル、- C(=O) C₁ ～ C₆ アルキル NR₄ R₅、- C(=O) OC₁ ～ C₆ アルキル、- C(=O) OC₁ ～ C₆ アルキル OH、- C(=O) OC₁ ～ C₆ アルコキシル、- C(=O) OC₁ ～ C₆ アルキル NR₄ R₅、- C(=O) NR₄ C₁ ～ C₆ アルキル、- C(=O) NR₄ C₁ ～ C₆ アルキル OH、- C(=O) NR₄ C₁ ～ C₆ アルコキシル、- C(=O) NR₄ C₁ ～ C₆ アルキル NR₄ R₅ から独立して選択される。 }

【請求項 2】

Q 1 は、ピリジニル、ピリミジニル、キノリニル又はキナゾリニルから独立して選択され、Q 2 は、フェニルであり、

Z は、N であり、

R 及び R₁ は、H 又は - NR₇ R₈ であり、R₂ 及び R₃ は、H、ハロゲン又は - C₁ ～ C₆ アルキルから独立して選択され、

R₄ 及び R₅ は、ハロゲン C₁ ～ C₆ アルキル、- C₁ ～ C₆ アルキルであるか、あるいは、この 2 つは、一緒になって飽和脂肪族シクリル又はヘテロシクリル環を形成し、

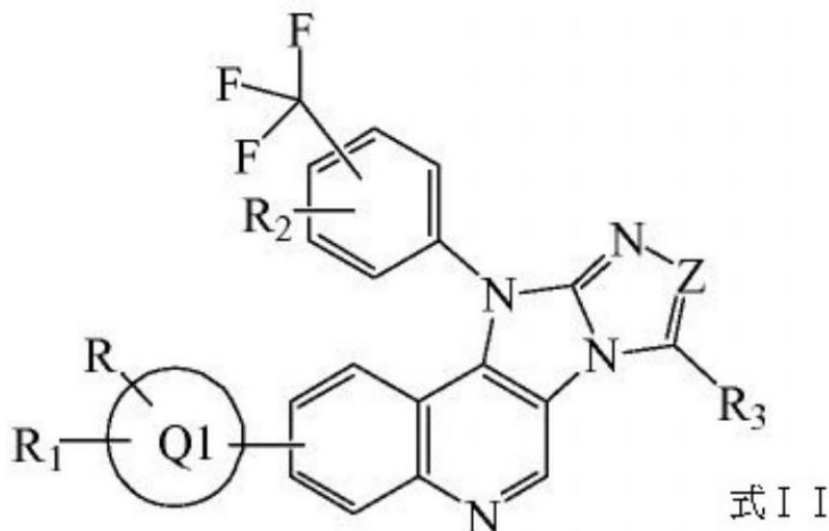
R₇ 及び R₈ は、H、- C(=O) C₁ ～ C₆ アルキル、- C₁ ～ C₆ アルキル NR₄ R₅ 又は - C(=O) C₁ ～ C₆ アルキル NR₄ R₅ から独立して選択される、

請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 3】

式 I I で表される、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【化 2】



{ 式中、

Q 1 は、アリール、5 ～ 6 員ヘテロシクリル又は 9 ～ 11 員ビシクロヘテロシクリルから独立して選択され、

Z は、N 又は C - R であり、

R 及び R₁ は、H、ハロゲン、ハロゲン C₁ ～ C₆ アルキル、- C₁ ～ C₆ アルキル、- O R₇ 又は - N R₇ R₈ から独立して選択され、

R₂ 及び R₃ は、H、- O H、- C₁ ～ C₆ アルキル、- C₁ ～ C₆ アルコキシル、- C₁ ～ C₆ アルケニル又は - C₁ ～ C₆ アルキニルから独立して選択され、

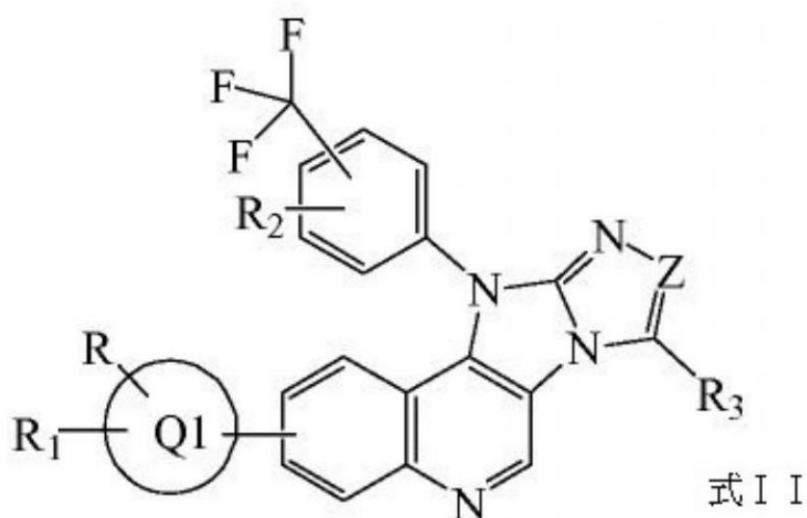
R₄ 及び R₅ は、H、ハロゲン C₁ ～ C₆ アルキル、- C₁ ～ C₆ アルキルから独立して選択されるか、あるいは、この 2 つは、一緒になって飽和脂肪族シクリル又はヘテロシクリル環を形成し、

R₇ 及び R₈ は、H、ハロゲン、- C₁ ～ C₆ アルキル、- C₁ ～ C₆ アルキル O H、- C₁ ～ C₆ アルコキシル、- C₁ ～ C₆ アルキル N R₄ R₅、- C (= O) C₁ ～ C₆ アルキル、- C (= O) C₁ ～ C₆ アルキル - R₄ R₅、- C (= O) C₁ ～ C₆ アルキル O H、- C (= O) C₁ ～ C₆ アルコキシル、- C (= O) C₁ ～ C₆ アルキル N R₄ R₅、- C (= O) O C₁ ～ C₆ アルキル、- C (= O) O C₁ ～ C₆ アルキル O H、- C (= O) O C₁ ～ C₆ アルコキシル、- C (= O) O C₁ ～ C₆ アルキル N R₄ R₅、- C (= O) N R₄ C₁ ～ C₆ アルキル、- C (= O) N R₄ C₁ ～ C₆ アルキル O H、- C (= O) - N R₄ C₁ ～ C₆ アルコキシル、- C (= O) N R₄ C₁ ～ C₆ アルキル N R₄ R₅ から独立して選択される。 }

【請求項 4】

式 I I で表される、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

【化 3】



{ 式中、

Q 1 は、ピリジニル、ピリミジニル、キノリニル又はキナゾリニルから独立して選択され

、

Z は、N であり、

R 及び R₁ は、H 又は -NR₇R₈ であり、

R₂ 及び R₃ は、H、ハロゲン又は -C₁ ~ C₆ アルキルから独立して選択され、

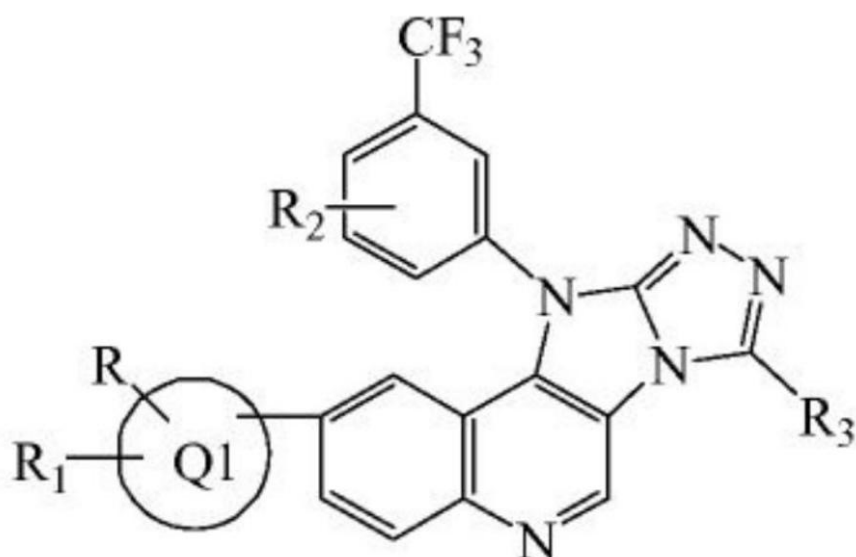
R₄ 及び R₅ は、H、ハロゲン C₁ ~ C₆ アルキル、-C₁ ~ C₆ アルキルから独立して選択されるか、あるいは、この 2 つは、一緒になって飽和脂肪族シクリル又はヘテロシクリル環を形成し、

R₇ 及び R₈ は、H、-C(=O)C₁ ~ C₆ アルキル、-C₁ ~ C₆ アルキル NR₄R₅ 又は -C(=O)C₁ ~ C₆ アルキル NR₄R₅ から独立して選択される。 }

【請求項 5】

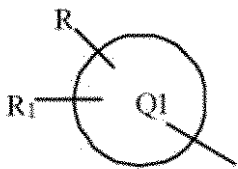
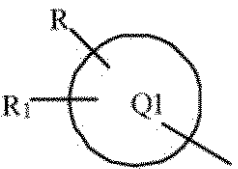
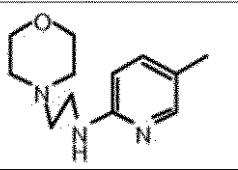
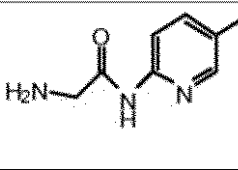
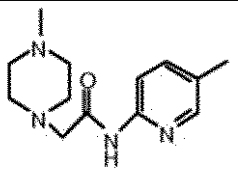
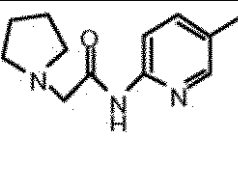
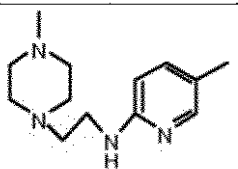
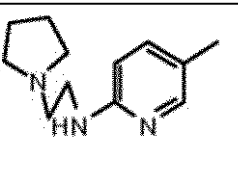
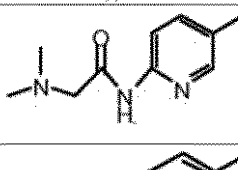
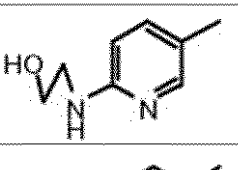
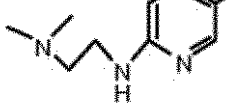
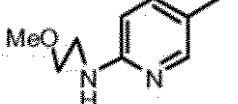
以下からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

【化 4】



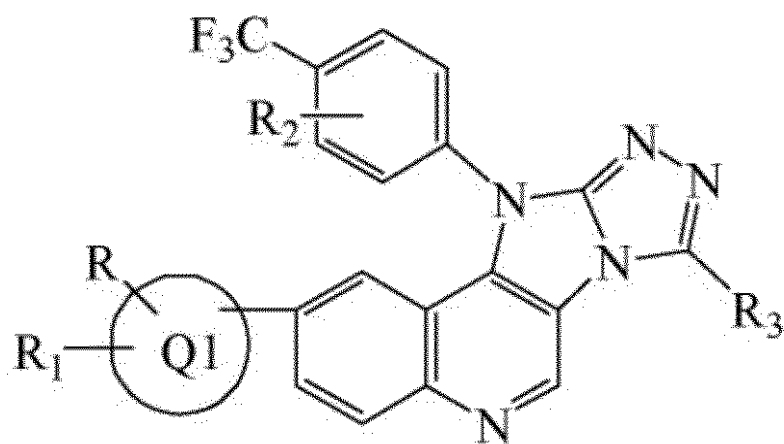
(式中、

【表 1】

	R2	R3		R2	R3
3-ピリジン	4-F	CH ₂ CH ₃	2-フルオロフェニル	4-Cl	H
3-ピリジン	4-F	H	N-(5-ピリジン-2-イル)アセトアミド	4-Cl	H
3-キノリン	4-F	H	3-キノリン	H	H
3-キノリン	4-Cl	H	3-ピリジン	H	H
3-ピリジン	4-Cl	H	3-キノリン	5-CF ₃	H
5-ピリジン-2-アミン	4-Cl	H	3-キノリン	5-F	H
3-フルオロフェニル	4-Cl	H	3-キノリン	6-F	H
3, 4-ジフルオロフェニル	4-Cl	H			
	H	H		H	H
	H	H		H	H
	H	H		H	H
	H	H		H	H
	H	H		H	H

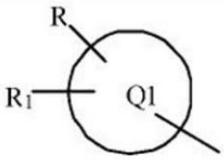
	H	H		4-Cl	H
	H	H		4-Cl	H
	4-Cl	H		4-Cl	H
	4-Cl	H		4-Cl	H
	4-Cl	H		4-Cl	H
	4-Cl	H		4-Cl	H
	4-Cl	H		4-Cl	H
	4-Cl	H			

であり、
【化 5】



式中、

【表 2】

	R2	R3
3-キノリン	H	H

である。)

【請求項 6】

以下からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩。

16 - (3 - (トリフルオロメチル)フェニル) - 4 - (ピリジン - 3 - イル) - 8, 11, 13, 14, 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8.6.0.0², 7.0¹¹, 1⁵]ヘキサデカ - 1(10), 2, 4, 6, 8, 12, 14 - ヘプタエン;

12 - エチル - 16 - [4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 4 - (ピリジン - 3 - イル) - 8, 11, 13, 14, 16 - ペンタアザテトラシクロ [8.6.0.0², 7.0¹¹, 1⁵]ヘキサデカ - 1(10), 2, 4, 6, 8, 12, 14 - ヘプタエン;

12 - エチル - 16 - [4 - フルオロ - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 4 - (キノリン - 3 - イル) - 8, 11, 13, 14, 16 - ペンタアザテトラシクロ [8.6.0.0², 7.0¹¹, 1⁵]ヘキサデカ - 1(10), 2, 4, 6, 8, 12, 14 - ヘプタエン;

16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 4 - (キノリン - 3 - イル) - 8, 11, 13, 14, 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8.6.0.0², 7.0¹¹, 1⁵]ヘキサデカ - 1(10), 2, 4, 6, 8, 12, 14 - ヘプタエン;

16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 4 - (ピリジン - 3 - イル) - 8, 11, 13, 14, 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8.6.0.0², 7.0¹¹, 1⁵]ヘキサデカ - 1(10), 2, 4, 6, 8, 12, 14 - ヘプタエン;

5 - {16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 8, 11, 13, 14, 16 - ペンタアザテトラシクロ [8.6.0.0², 7.0¹¹, 1⁵] - ヘキサデカ - 1(10), 2, 4, 6, 8, 12, 14 - ヘプタエン - 4 - イル}ピリジン - 2 - アミン;

16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 4 - (3 - フルオロフェニル) - 8, 11, 13, 14, 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8.6.0.0², 7.0¹¹, 1⁵]ヘキサデカ - 1(10), 2, 4, 6, 8, 12, 14 - ヘプタエン;

16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 4 - (3, 4 - ジフルオロフェニル) - 8, 11, 13, 14, 16 - ペンタアザテトラシクロ [8.6.0.0², 7.0¹¹, 1⁵]ヘキサデカ - 1(10), 2, 4, 6, 8, 12, 14 - ヘプタエン;

16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 4 - (2 - フルオロフェニル) - 8, 11, 13, 14, 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8.6.0.0², 7.0¹¹, 1⁵]ヘキサデカ - 1(10), 2, 4, 6, 8, 12, 14 - ヘプタエン;

N - (5 - {16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 8, 11, 13, 14, 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8.6.0.0², 7.0¹¹, 1⁵]ヘキサデカ - 1(10), 2, 4, 6, 8, 12, 14 - ヘプタエン - 4 - イル}ピリジン - 2 - イル)アセトアミド;

4 - (キノリン - 3 - イル) - 16 - [3 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 8 , 1
 1 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン ;
 16 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル)フェニル] - 4 - (キノリン - 3 - イル)
 - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン ;
 16 - [3 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 4 - (キノリン - 3 -
 イル) - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² ,
 7 . 0¹¹ , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン
 ;
 16 - [2 - フルオロ - 5 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 4 - (キノリン - 3 -
 イル) - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² ,
 7 . 0¹¹ , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン
 ;
 4 - (キノリン - 3 - イル) - 16 - [4 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 8 , 1
 1 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン
 2 - アミノ - N - (5 - { 16 - [3 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 8 , 11 ,
 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵]
 ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジ
 ン - 2 - イル) アセトアミド ;
 N - [2 - (モルホリン - 4 - イル)エチル] - 5 - { 16 - [3 - (トリフルオロメチ
 ル)フェニル] - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0 .
 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプ
 タエン - 4 - イル } ピリジン - 2 - アミン ;
 2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - N - (5 - { 16 - [3 - (トリフルオロメ
 チル)フェニル] - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0
 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘ
 プタエン - 4 - イル } ピリジン - 2 - イル) アセトアミド ;
 2 - (ジメチルアミノ) - N - (5 - { 16 - [3 - (トリフルオロメチル)フェニル]
 - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹
 , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 -
 イル } ピリジン - 2 - イル) アセトアミド ;
 2 - (モルホリン - 4 - イル) - N - (5 - { 16 - [3 - (トリフルオロメチル)フェ
 ニル] - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² ,
 7 . 0¹¹ , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン
 - 4 - イル } ピリジン - 2 - イル) アセトアミド ;
 2 - (メチルアミノ) - N - (5 - { 16 - [3 - (トリフルオロメチル)フェニル] -
 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹
 , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イ
 ル } ピリジン - 2 - イル) アセトアミド ;
 2 - アミノ - N - (5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル]
 - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹
 , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 -
 イル } ピリジン - 2 - イル) アセトアミド ;
 N - (5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 8 , 11 ,
 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] -
 ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジ
 ン - 2 - イル) - 2 - (ジメチルアミノ) アセトアミド ;
 N - (5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル)フェニル] - 8 , 11 ,

13, 14, 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] -
 ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジ
 ン - 2 - イル) - 2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) アセトアミド ;
 N - (5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 ,
 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] -
 ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジ
 ン - 2 - イル) - 2 - (モルホリン - 4 - イル) アセトアミド ;
 N - (5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 ,
 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] -
 ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジ
 ン - 2 - イル) - 2 - (4 - オキソピペリジン - 1 - イル) アセトアミド ;
 N - (5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 ,
 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] -
 ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジ
 ン - 2 - イル) - 2 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) アセトアミド ;
 N - (5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 ,
 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] -
 ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジ
 ン - 2 - イル) - 2 - (ピロリジン - 1 - イル) アセトアミド ;
 5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 , 13 ,
 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] - ヘキサ
 デカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } - N - [2 -
 (ピロリジン - 1 - イル) エチル] ピリジン - 2 - アミン ;
 5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 , 13 ,
 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] - ヘキサ
 デカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } - N - [2 -
 (モルホリン - 4 - イル) エチル] ピリジン - 2 - アミン ;
 5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 , 13 ,
 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] - ヘキサ
 デカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } - N - (2 -
 メトキシエチル) ピリジン - 2 - アミン ;
 メチル ({ 2 - [(5 - { 16 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 ,
 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵]
 ヘキサデカ - 1 (10) , 2 (7) , 3 , 5 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル }
 ピリジン - 2 - イル) アミノ] エチル }) アミン ;
 ジメチル ({ 2 - [(5 - { 16 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11
 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵
] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリ
 ジン - 2 - イル) アミノ] エチル }) アミン ;
 2 - (ピロリジン - 1 - イル) - N - (5 - { 16 - [3 - (トリフルオロメチル) フェ
 ニル] - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² ,
 7 . 0¹¹ , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン
 - 4 - イル } ピリジン - 2 - イル) アセトアミド ;
 N - [2 - (ピロリジン - 1 - イル) エチル] - 5 - { 16 - [3 - (トリフルオロメチ
 ル) フェニル] - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 .
 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプ
 タエン - 4 - イル } ピリジン - 2 - アミン ;
 2 - [(5 - { 16 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 , 13 , 14
 , 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] - ヘキサデカ
 - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジン - 2 - イ

ル) アミノ] エタン - 1 - オール ;

N - (2 - メトキシエチル) - 5 - { 16 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹ 1 , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジン - 2 - アミン ;

{ 2 - [(5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹ 1 , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジン - 2 - イル) アミノ] エチル } - ジメチルアミン ;

5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹ 1 , 1⁵] - ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } - N - [2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) エチル] - ピリジン - 2 - アミン ;

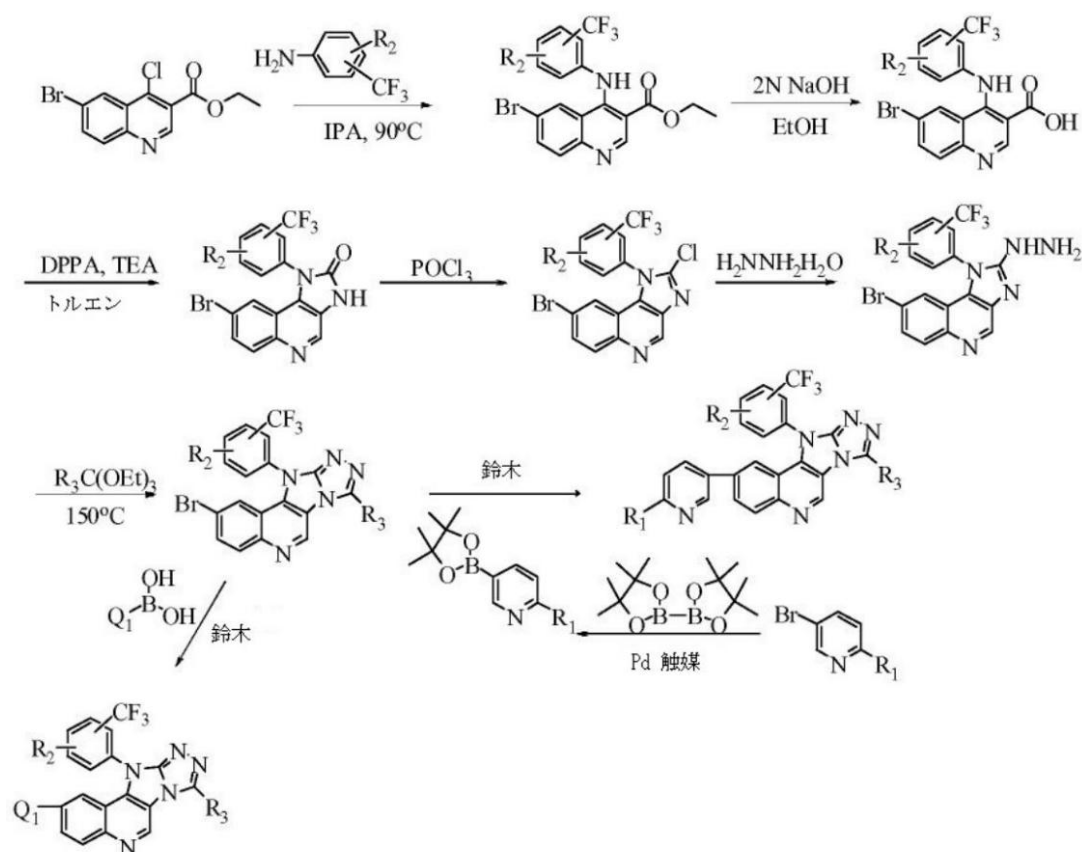
2 - [(5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹ 1 , 1⁵] - ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジン - 2 - イル) アミノ] エタノール ;

4 - (ピリジン - 3 - イル) - 16 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 , 14 , 16 - テトラアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹ 1 , 1⁵] - ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン

【請求項 7】

以下の化学プロセスの使用によって表される、請求項 1 に記載の式 I を有する化合物を作製する方法。

【化 6】



{ R₁ は、
 - NH₂、- NHCH₃、- N(CH₃)₂、- NHCOCH₃、- NHCO(CH₂)_nCH₃、- NHCO(CH₂)_nNH₂、- NHCO(CH₂)_nNHCH₃、- NH

CO(CH₂)_nN(CH₃)₂、-NHCO(CH₂)_n-ピロリジン、-NHCO(CH₂)_n-ピペラジン、-NHCO(CH₂)_n-モルホリン、-NH(CH₂)_nNHCH₃、-NH(CH₂)_nN(CH₃)₂、-NH(CH₂)_n-ピロリジン、-NH(CH₂)_n-ピペラジン、-NH(CH₂)_n-モルホリンから選択され、
nは、1、2、3又は4であり、

R₂は、H、ハロゲン又は-C1~C6アルキルであり、R₃は、H又は-C1~C6アルキルであり、

Q1は、ピリジン、ピリミジン、キノリン又はキナゾリンから独立して選択される。}

【請求項8】

請求項1~6のいずれか一項に記載の化合物であってQ1がヘテロアリアルである化合物を含む、癌の治療に使用するための医薬組成物。

【請求項9】

癌の治療に使用するための薬剤の製造における、請求項1~6のいずれか一項に記載の化合物であってQ1がヘテロアリアルである化合物の使用。

【誤訳訂正2】

【訂正対象書類名】明細書

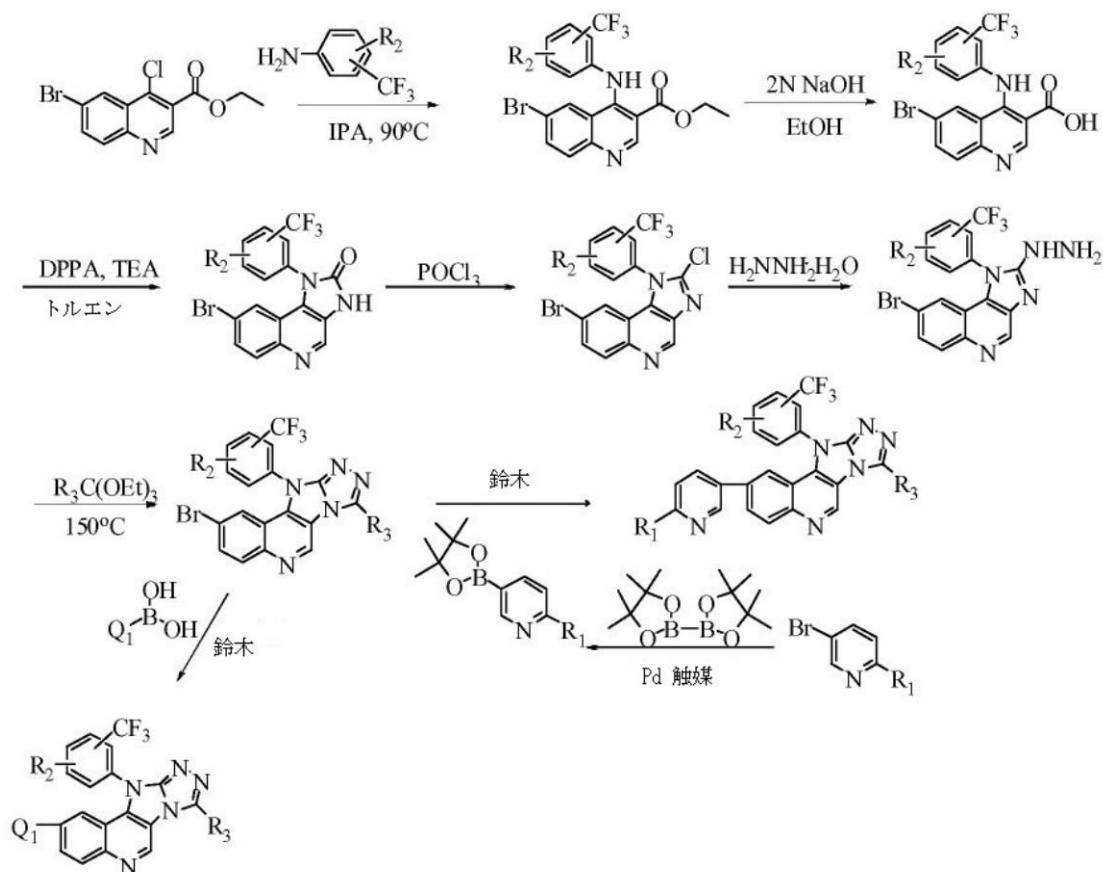
【訂正対象項目名】0050

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0050】

【化3】



R1は、

-NH₂、-NHCH₃、-N(CH₃)₂、-NHCOCH₃、-NHCO(CH₂)_nCH₃、-NHCO(CH₂)_nNH₂、-NHCO(CH₂)_nNHCH₃、-NHCO(CH₂)_nN(CH₃)₂、-NHCO(CH₂)_n-ピロリジン、-NHCO(CH₂)_n-ピペラジン、-NHCO(CH₂)_n-モルホリン、-NH(CH₂)_nNHCH₃、-NH(CH₂)_nN(CH₃)₂、-NH(CH₂)_n-ピロリジン、-N

H (C H ₂) _n - ピペラジン、 - NH (C H ₂) _n - モルホリンから選択され、
 n は、 1、 2、 3 又は 4 であり、
 R 2 は、 H、 ハロゲン又は - C 1 ~ C 6 アルキルであり、 R 3 は、 H 又は - C 1 ~ C 6 アルキルであり、
 Q 1 は、 ピリジン、 ピリミジン、 キノリン又はキナゾリンから独立して選択される。

【誤訳訂正 3】

【訂正対象書類名】明細書

【訂正対象項目名】0078

【訂正方法】変更

【訂正の内容】

【0078】

異なるアニリン及び異なるボロン酸を使用することにより、実施例 3 に記載の方法に従って、以下の化合物例を同様に調製した。

N - [2 - (モルホリン - 4 - イル) エチル] - 5 - { 16 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジン - 2 - アミン ;

2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) - N - (5 - { 16 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジン - 2 - イル) アセトアミド ;

2 - (ジメチルアミノ) - N - (5 - { 16 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジン - 2 - イル) アセトアミド ;

2 - (モルホリン - 4 - イル) - N - (5 - { 16 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジン - 2 - イル) アセトアミド ;

2 - (メチルアミノ) - N - (5 - { 16 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジン - 2 - イル) アセトアミド ;

2 - アミノ - N - (5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジン - 2 - イル) アセトアミド ;

N - (5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] - ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジン - 2 - イル) - 2 - (ジメチルアミノ) アセトアミド ;

N - (5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] - ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジン - 2 - イル) - 2 - (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) アセトアミド ;

N - (5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] - ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジン - 2 - イル) - 2 - (モルホリン - 4 - イル) アセトアミド ;

N - (5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 ,

13, 14, 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] -
 ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジ
 ン - 2 - イル) - 2 - (4 - オキソピペリジン - 1 - イル) アセトアミド ;
 N - (5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 ,
 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] -
 ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジ
 ン - 2 - イル) - 2 - (4 - ヒドロキシピペリジン - 1 - イル) アセトアミド ;
 N - (5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 ,
 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] -
 ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジ
 ン - 2 - イル) - 2 - (ピロリジン - 1 - イル) アセトアミド ;
 5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 , 13 ,
 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] - ヘキサ
 デカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } - N - [2 -
 (ピロリジン - 1 - イル) エチル] ピリジン - 2 - アミン ;
 5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 , 13 ,
 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] - ヘキサ
 デカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } - N - [2 -
 (モルホリン - 4 - イル) エチル] ピリジン - 2 - アミン ;
 5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 , 13 ,
 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] - ヘキサ
 デカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } - N - (2 -
 メトキシエチル) ピリジン - 2 - アミン ;
 メチル ({ 2 - [(5 - { 16 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 ,
 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵]
 ヘキサデカ - 1 (10) , 2 (7) , 3 , 5 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル }
 ピリジン - 2 - イル) アミノ] エチル }) アミン ;
 ジメチル ({ 2 - [(5 - { 16 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11
 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵
] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリ
 ジン - 2 - イル) アミノ] エチル }) アミン ;
 2 - (ピロリジン - 1 - イル) - N - (5 - { 16 - [3 - (トリフルオロメチル) フェ
 ニル] - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² ,
 7 . 0¹¹ , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン
 - 4 - イル } ピリジン - 2 - イル) アセトアミド ;
 N - [2 - (ピロリジン - 1 - イル) エチル] - 5 - { 16 - [3 - (トリフルオロメチ
 ル) フェニル] - 8 , 11 , 13 , 14 , 16 ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 .
 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプ
 タエン - 4 - イル } ピリジン - 2 - アミン ;
 2 - [(5 - { 16 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 11 , 13 , 14
 , 16 - ペンタアザテトラシクロ [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵] - ヘキサデカ
 - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピリジン - 2 - イ
 ル) アミノ] エタン - 1 - オール ;
 N - (2 - メトキシエチル) - 5 - { 16 - [3 - (トリフルオロメチル) フェニル] -
 8 , 11 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹
 , 1⁵] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イ
 ル } ピリジン - 2 - アミン ;
 { 2 - [(5 - { 16 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 1
 1 , 13 , 14 , 16 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0² , 7 . 0¹¹ , 1⁵
] ヘキサデカ - 1 (10) , 2 , 4 , 6 , 8 , 12 , 14 - ヘプタエン - 4 - イル } ピ

リジン - 2 - イル) アミノ] エチル} - ジメチルアミン ;
5 - { 1 6 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 1 1 , 1 3 ,
1 4 , 1 6 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0 ² , ⁷ . 0 ^{1 1} , ^{1 5}] - ヘキサ
デカ - 1 (1 0) , 2 , 4 , 6 , 8 , 1 2 , 1 4 - ヘプタエン - 4 - イル } - N - [2
- (4 - メチルピペラジン - 1 - イル) エチル] - ピリジン - 2 - アミン ;
2 - [(5 - { 1 6 - [4 - クロロ - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル] - 8 , 1 1
, 1 3 , 1 4 , 1 6 - ペンタアザテトラシクロ - [8 . 6 . 0 . 0 ² , ⁷ . 0 ^{1 1} , ^{1 5}
] - ヘキサデカ - 1 (1 0) , 2 , 4 , 6 , 8 , 1 2 , 1 4 - ヘプタエン - 4 - イル } ピ
リジン - 2 - イル) アミノ] エタノール ;