

【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27年11月26日(2015.11.26)

【公表番号】特表2014-528453(P2014-528453A)

【公表日】平成26年10月27日(2014.10.27)

【年通号数】公開・登録公報2014-059

【出願番号】特願2014-534755(P2014-534755)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/381 (2006.01)

A 6 1 K 31/4174 (2006.01)

A 6 1 K 31/41 (2006.01)

A 6 1 K 31/505 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/433 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/381

A 6 1 K 31/4174

A 6 1 K 31/41

A 6 1 K 31/505

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/433

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 3/10

A 6 1 P 37/06

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】平成27年10月1日(2015.10.1)

【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

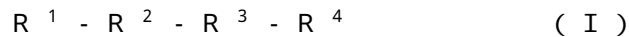
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式 (I) :



で表される R a s アンタゴニスト :

式中、

R³ が、S、O、N、SO、SO₂、またはSeであり、および

R⁴ が、ファルネシルまたはゲラニルゲラニルであり、

さらに

R² が、少なくとも1個のヘテロ原子を有する5員ヘテロ環であり、および
/または

R¹ が、少なくとも1個のヘテロ原子を有する5または6員ヘテロ環である。

【請求項2】

R² または R¹ の前記ヘテロ原子が、O、N、S、SO、およびSO₂ からなる群より選択される請求項1記載の R a s アンタゴニスト。

【請求項3】

R² が、1個または2個のヘテロ原子を有する5員ヘテロ環である場合、R¹ が、CN、C(=O)R⁵、S(=O)(=O)R⁵、CO₂M、SO₃M、またはN(R⁸)置換テトラゾールであり、

式中、

R⁵ が、水素、ヒドロキシル、C₁~C₄アルキルオキシ、C₂~C₄アルケニルオキシ、C₁~C₄ヒドロキシアルキルオキシ、C₁~C₄アミノアルキルオキシ、またはNR⁶R⁷であり、

R⁶ が、水素、ヒドロキシル、C₁~C₄アルキル、C₂~C₄アルケニル、C₁~C₄アミノアルキル、C₁~C₄ヒドロキシアルキル、C₁~C₄アルキルオキシ、もしくはC₁~C₄アルキルアミノであり、およびR⁷ が、水素、C₁~C₄アルキル、C₂~C₄アルケニル、C₁~C₄アミノアルキル、C₁~C₄ヒドロキシアルキル、C₁~C₄アルキルオキシ、もしくはC₁~C₄アルキルアミノであるか、またはR⁶ およびR⁷ が、一緒に、モルホリン、ピペラジン、またはピペルジンを含む環を形成し、

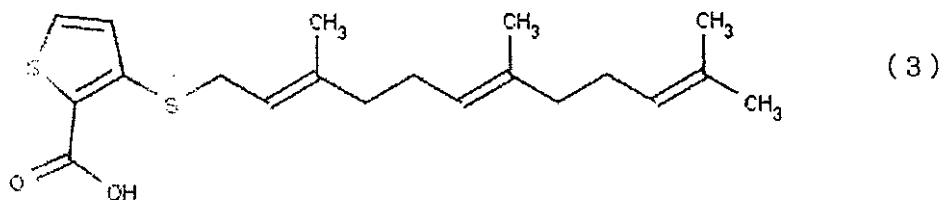
Mが、塩形成有機または無機対イオンであり、さらに

R⁸ が、水素またはC₁~C₄アルキルである、

請求項1記載の R a s アンタゴニスト。

【請求項4】

式 (3) :



を有する請求項3記載の R a s アンタゴニスト。

【請求項5】

R¹ が、少なくとも1個のヘテロ原子を有する5または6員ヘテロ環である場合、R² が、置換または未置換のフェニル環である請求項1記載の R a s アンタゴニスト。

【請求項6】

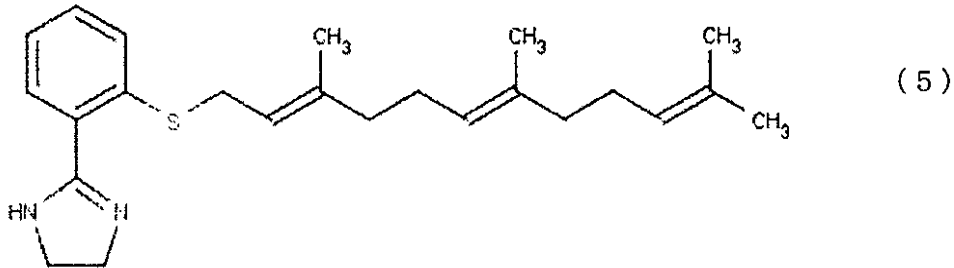
R¹ が、イミダゾリン、イミダゾール、ピラゾール、ピロール、オキサゾール、チアゾール、1,4,5,6-テトラヒドロピリミジン、トリアゾール、またはN(R⁹)置換テトラゾールであり、さらに

式中、

R⁹ が、水素または C 1 ~ C 4 アルキルであり、
 前記置換フェニル環が、C 1、Br、F、I、C 1 ~ C 4 アルキル、または C 1 ~ C 4 アルコキシ、アミノ、モノまたはジ置換アミノで置換されており、および
 前記フェニル環の窒素置換基が、C 1 ~ C 4 アルキルである、
 請求項 5 記載の R a s アンタゴニスト。

【請求項 7】

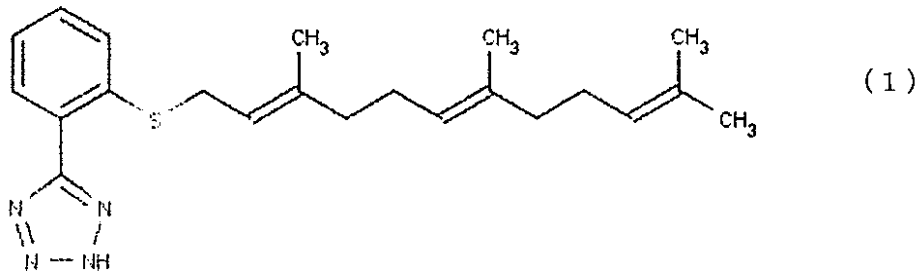
式 (5) :



を有する請求項 5 記載の R a s アンタゴニスト。

【請求項 8】

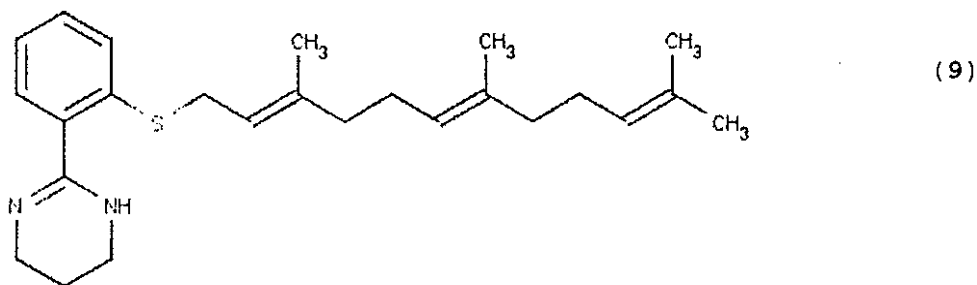
式 (1) :



を有する請求項 5 記載の R a s アンタゴニスト。

【請求項 9】

式 (9) :



を有する請求項 5 記載の R a s アンタゴニスト。

【請求項 10】

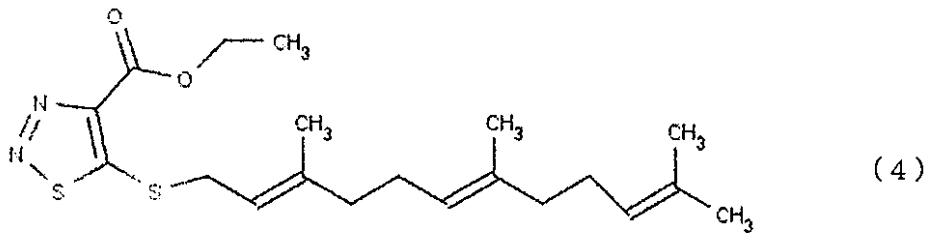
R² が、少なくとも 3 個のヘテロ原子を有する 5 員ヘテロ環である場合、R¹ が、C (= O) R¹⁰ であり、および R¹⁰ が、水素、ヒドロキシル、または C 1 ~ C 4 アルキルオキシである、請求項 1 記載の R a s アンタゴニスト。

【請求項 11】

R² が、チアジアゾール基またはオキサジアゾール基である、請求項 10 記載の R a s アンタゴニスト。

【請求項 12】

式 (4) :



を有する請求項 10 記載の R a s アンタゴニスト。

【請求項 13】

患者において悪性もしくは非悪性の疾患または病理学的状態に関連する R a s 誘導細胞増殖を抑制するための組成物であって、前記増殖を抑制するのに有効な量の請求項 1 から 12 いずれか 1 項記載の R a s アンタゴニストを含む組成物。

【請求項 14】

前記患者が、全身性のエリテマトーデス (S L E)、多発性硬化症 (M S)、抗リン脂質抗体症候群 (A P S)、関節リウマチ、1 型糖尿病、臓器拒絶反応、および慢性移植片対宿主病の内の少なくとも 1 種に繋がる免疫系の調節障害を患っている請求項 13 記載の組成物。

【請求項 15】

前記患者が、2 型糖尿病に繋がる内分泌系および内分泌ホルモンの標的の内の少なくとも 1 つの調節障害を患っている請求項 13 記載の組成物。

【請求項 16】

前記患者が、粥状動脈硬化症に繋がる組織傷害、組織損傷、および局所血管炎症の内の少なくとも 1 種を患っている請求項 13 記載の組成物。

【請求項 17】

非経口、経口、局所、鼻腔内、経鼻、口腔または経皮投与される、請求項 13 記載の組成物。

【請求項 18】

悪性もしくは非悪性の疾患または病理学的状態に関連する R a s 誘導細胞増殖を抑制するための組成物であって、請求項 1 から 12 いずれか 1 項記載の R a s アンタゴニストを含み、該 R a s アンタゴニストが、前記細胞増殖を抑制するのに有効な量で細胞に接触させられる、組成物。

【請求項 19】

前記悪性疾患が、神経膠芽腫、腺癌、軟部肉腫、および白血病の内の少なくとも 1 種である請求項 18 記載の組成物。

【請求項 20】

前記非悪性疾患が、乾癬、神経線維腫症 1 型 (N F - 1)、N F - 1 関連悪性腫瘍、多発性嚢胞腎疾患 (P K D)、血管形成術後再狭窄、組織線維症、および筋ジストロフィーの内の少なくとも 1 種である請求項 18 記載の組成物。

【請求項 21】

R a s 誘導細胞増殖を抑制するための組成物であって、前記増殖を抑制するのに有効な量の請求項 1 から 12 いずれか 1 項記載の R a s アンタゴニストを含み、前記増殖が、組織傷害または組織損傷により開始される、組成物。