

【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9日(2012.2.9)

【公表番号】特表2011-506578(P2011-506578A)

【公表日】平成23年3月3日(2011.3.3)

【年通号数】公開・登録公報2011-009

【出願番号】特願2010-538769(P2010-538769)

【国際特許分類】

C 0 7 C 237/42 (2006.01)

C 0 7 C 271/10 (2006.01)

C 0 7 C 235/34 (2006.01)

C 0 7 F 7/18 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/695 (2006.01)

A 6 1 K 38/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/27 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C 237/42 C S P

C 0 7 C 271/10

C 0 7 C 235/34

C 0 7 F 7/18 N

A 6 1 P 43/00 1 2 3

A 6 1 K 31/695

A 6 1 K 37/02

A 6 1 K 31/27

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成23年12月16日(2011.12.16)

【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

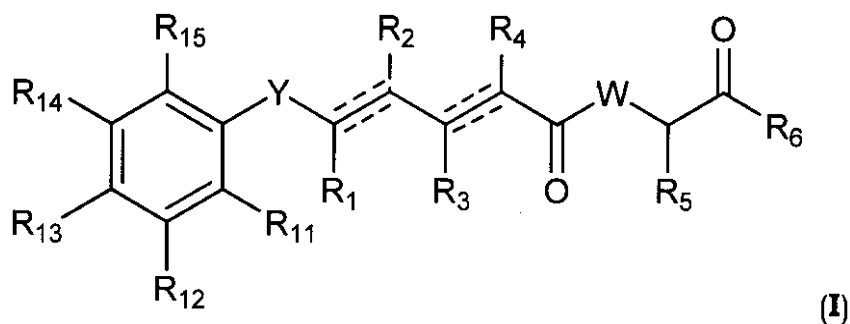
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式Iの化合物

【化1】



(式中、Yは、-CHR_{ay}-, -CHR_{ay}-CHR_{by}-, -CR_{ay}=CR_{by}-, -C≡C-, -CHR_{ay}-CHR_{by}-CHR_{cy}-,

-CHR_{ay}-CR_{by}=CR_{cy}-および-CHR_{ay}-C≡C-から選択され、

各R_{ay}、R_{by}およびR_{cy}は、独立に、水素、置換または非置換C₁~C₁₂アルキル、置換または非置換C₂~C₁₂アルケニルおよび置換または非置換C₂~C₁₂アルキニルから選択され、

各R₁、R₂、R₃、R₄およびR₅は、独立に、水素、置換または非置換C₁~C₁₂アルキル、置換または非置換C₂~C₁₂アルケニルおよび置換または非置換C₂~C₁₂アルキニルから選択され、

R₆は、NR₈R₉およびOR₁₀から選択され、

Wは、OおよびNR₇から選択され、

R₇は、水素、COR_a、COOR_a、置換または非置換C₁~C₁₂アルキル、置換または非置換C₂~C₁₂アルケニルおよび置換または非置換C₂~C₁₂アルキニルから選択され、あるいはR₇およびR₅は、それらが結合している対応するN原子およびC原子と一緒にあって、置換または非置換複素環式基を形成することができ、

R₈は、水素、COR_a、COOR_a、置換または非置換C₂~C₁₂アルケニル、置換または非置換C₂~C₁₂アルキニルおよび置換または非置換C₄~C₁₂アルケニニルから選択され、

R₁₀は、水素、置換または非置換C₂~C₁₂アルケニルおよび置換または非置換C₂~C₁₂アルキニルから選択され、

各点線は、1つまたは複数の追加の結合が存在するという条件で任意選択の追加の結合を表すが、R₁およびR₂が結合しているC原子間に三重結合が存在する場合、R₁およびR₂は存在せず、R₃およびR₄が結合しているC原子間に三重結合が存在する場合、R₃およびR₄は存在せず、

R₉は、水素、COR_a、COOR_a、置換または非置換C₂~C₁₂アルケニル、置換または非置換C₂~C₁₂アルキニルおよび置換または非置換C₄~C₁₂アルケニニルから選択され、

各R₁₁、R₁₂、R₁₃、R₁₄およびR₁₅は、独立に、水素、ハロゲン、OR_a、COR_a、COOR_a、OCOR_a、OCOOR_a、OCONR_aR_b、CONR_aR_b、OS(O)R_a、OSO₂R_a、OP(O)(R_a)OR_b、OSiR_aR_bR_c、NR_aR_b、NR_aCOR_b、NR_aCONR_aR_b、NR_aS(O)R_b、NR_aSO₂R_b、NR_aC(=NR_a)NR_aR_b、SR_a、S(O)R_a、SO₂R_a、S(O)NR_aR_b、SO₂NR_aR_b、S(O)OR_a、SO₂OR_a、置換または非置換C₁~C₁₂アルキル、置換または非置換C₂~C₁₂アルケニルおよび置換または非置換C₂~C₁₂アルキニルから選択され、

各R_a、R_bおよびR_cは、独立に、水素、置換または非置換C₁~C₁₂アルキル、置換または非置換C₂~C₁₂アルケニル、置換または非置換C₂~C₁₂アルキニル、置換または非置換アリールおよび置換または非置換複素環式基から選択される)、または

薬学的に許容できるその塩、互変異性体、もしくは立体異性体。

【請求項 2】

R₁、R₂、R₃およびR₄が、独立に、水素および置換または非置換C₁~C₆アルキルから選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項 3】

R₁、R₂、R₃およびR₄が水素である、請求項2に記載の化合物。

【請求項 4】

R₁₁、R₁₄およびR₁₅が水素である、請求項1から3のいずれかに記載の化合物。

【請求項 5】

Yが、-CHR_{ay}-、-CR_{ay}=CR_{by}-および-CHR_{ay}-CR_{by}=CR_{cy}-から選択され、R_{ay}、R_{by}およびR_{cy}が、独立に、水素および置換または非置換C₁~C₆アルキルから選択される、請求項1から4のいずれかに記載の化合物。

【請求項 6】

R_{ay}、R_{by}およびR_{cy}が、独立に、水素およびメチルから選択される、請求項5に記載の化合物。

【請求項 7】

R₁₂、R₁₃が、独立に、水素、OR_a、OCOR_aおよびOSiR_aR_bR_cから選択され、R_a、R_bおよびR_cが、独立に、水素および置換または非置換C₁~C₆アルキルから選択される、請求項1から6のいずれかに記載の化合物。

【請求項 8】

R_{12} が、水素および OR_a から選択される、請求項7に記載の化合物。

【請求項9】

R_{13} が、水素、 OR_a および $OSiR_aR_bR_c$ から選択される、請求項7または8に記載の化合物。

【請求項10】

R_a 、 R_b および R_c が、独立に、水素、置換または非置換メチル、置換または非置換エチル、置換または非置換プロピル、置換または非置換イソプロピル、置換または非置換tert-ブチルから選択される、請求項7から9のいずれかに記載の化合物。

【請求項11】

R_5 が、水素および置換または非置換 $C_1 \sim C_6$ アルキルから選択される、請求項1から10のいずれかに記載の化合物。

【請求項12】

R_5 が、メチル、イソプロピルおよびtert-ブチルから選択される、請求項11に記載の化合物。

【請求項13】

Wが NR_7 であり、 R_7 が請求項1に記載の通りである、請求項1から12のいずれかに記載の化合物。

【請求項14】

R_7 が水素である、請求項13に記載の化合物。

【請求項15】

Wが NR_7 であり、 R_7 および R_5 が、それらが結合している対応するN原子およびC原子と一緒に、置換または非置換ピロリジン基を形成する、請求項1から10のいずれかに記載の化合物。

【請求項16】

R_6 が NR_8R_9 であり、 R_8 が水素であり、 R_9 が水素、置換または非置換 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、置換または非置換 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニルおよび置換または非置換 $C_4 \sim C_{12}$ アルケニニルから選択される、請求項1から15のいずれかに記載の化合物。

【請求項17】

R_9 が、1つまたは複数の位置においてハロゲン、 OR' 、 $=O$ 、 $OCOR'$ 、 $OCONHR'$ 、 $OCONR'R'$ 、 $CONHR'$ 、 $CONR'R'$ および保護OHで置換されている置換 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニルであり、 R' 基のそれぞれが、独立に、水素、置換または非置換 $C_1 \sim C_{12}$ アルキル、置換または非置換 $C_2 \sim C_{12}$ アルケニル、置換または非置換 $C_2 \sim C_{12}$ アルキニルおよび置換または非置換アリールから選択される、請求項16に記載の化合物。

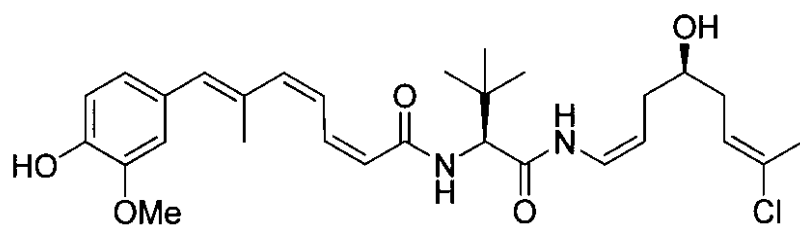
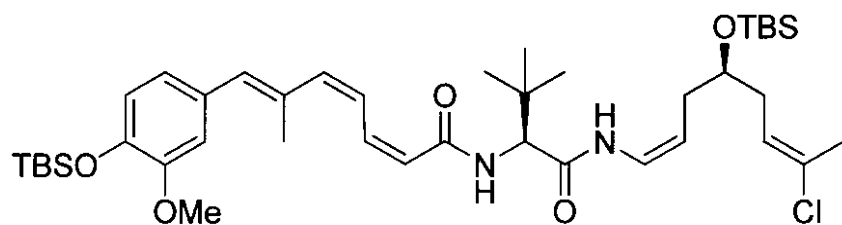
【請求項18】

R_1 および R_2 が結合しているC原子間に1つの追加の結合が存在し、 R_3 および R_4 が結合しているC原子間に別の追加の結合が存在する、請求項1から17のいずれかに記載の化合物。

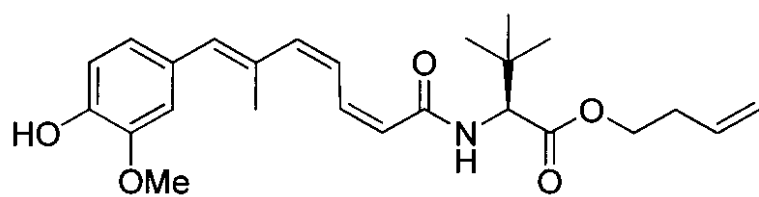
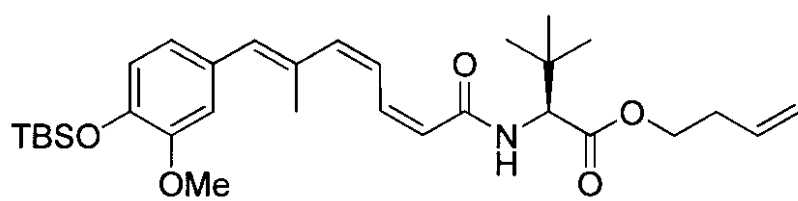
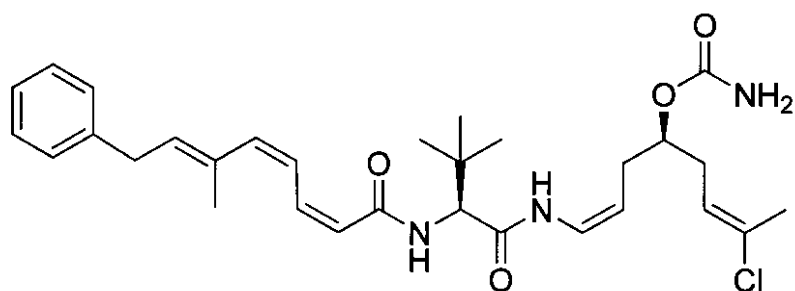
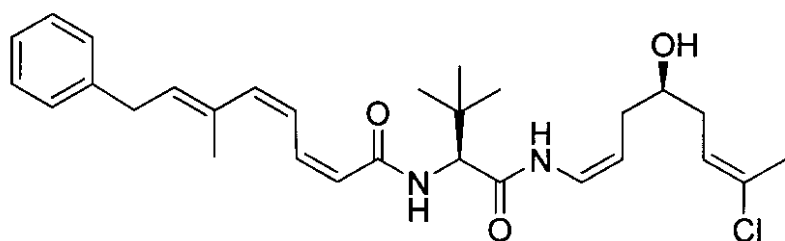
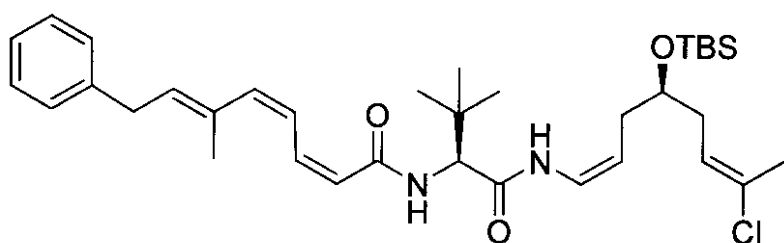
【請求項19】

以下の式

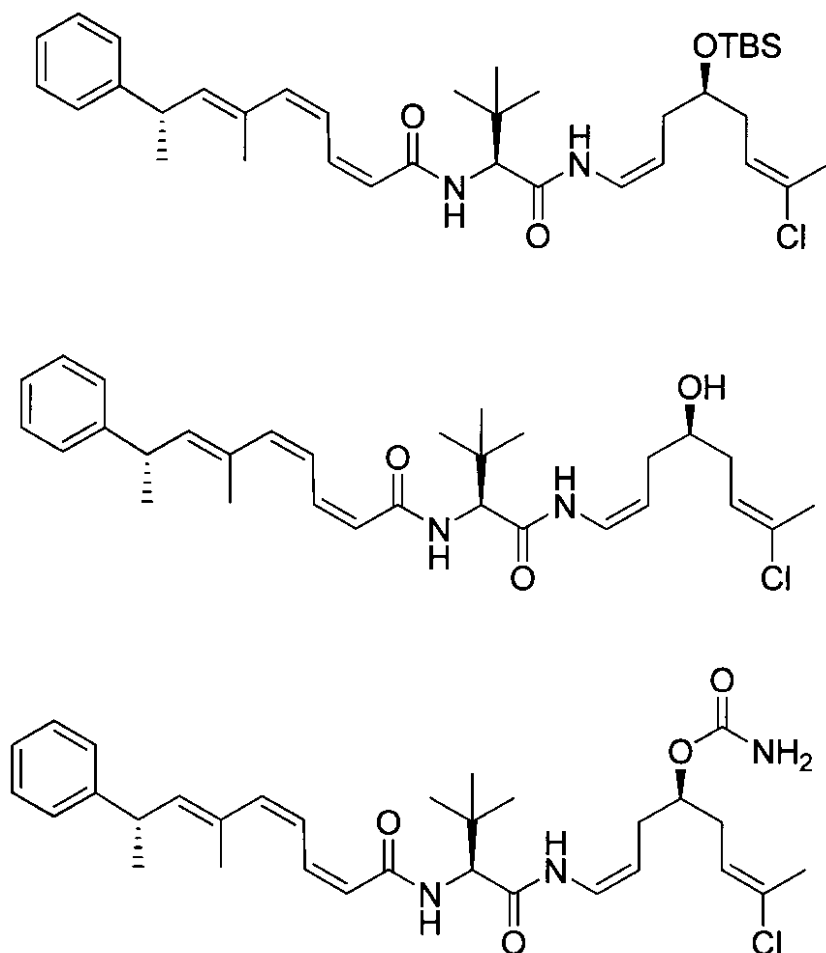
【化 2 A】



【化 2 B】



【化 2 C】



を有する、請求項1に記載の化合物または薬学的に許容できるその塩、互変異性体、もしくは立体異性体。

【請求項 2 0】

請求項1から19のいずれかに記載の化合物または薬学的に許容できるそれらの塩、互変異性体、もしくは立体異性体および薬学的に許容できる希釈剤または担体を含む、医薬組成物。

【請求項 2 1】

請求項1から19のいずれかに記載の化合物または薬学的に許容できるそれらの塩、互変異性体、もしくは立体異性体を含む、癌を治療する医薬品として使用するための薬剤。

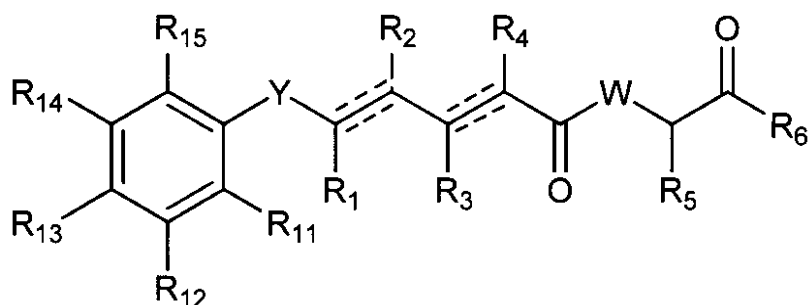
【請求項 2 2】

癌の治療における使用のための、請求項 2 0 に記載の組成物。

【請求項 2 3】

フラグメントCおよびD

【化 3】

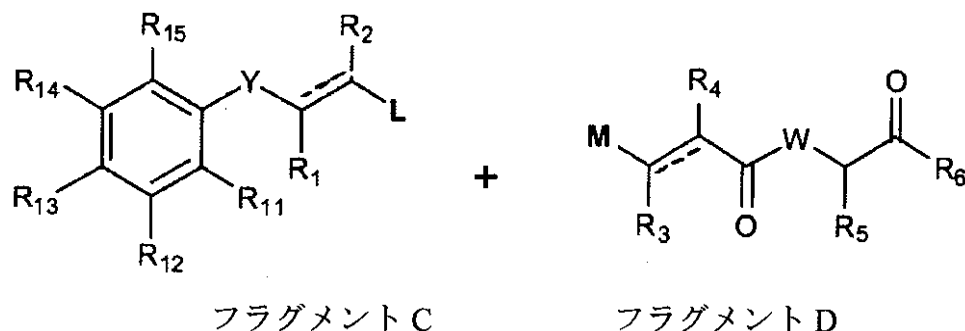


(式中、 R_1 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 、 R_6 、 R_{11} 、 R_{12} 、 R_{13} 、 R_{14} 、 R_{15} 、YおよびWは、望ましい基

または必要に応じた適切な保護基であり、LおよびMは、適切な反応基または脱離基である

をカップリングすることを含む、式Iの化合物

【化4】



(式中、Y、W、ならびにR₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆、R₁₁、R₁₂、R₁₃、R₁₄およびR₁₅は、請求項1から19のいずれかに記載したとおりである)

を調製するための方法。

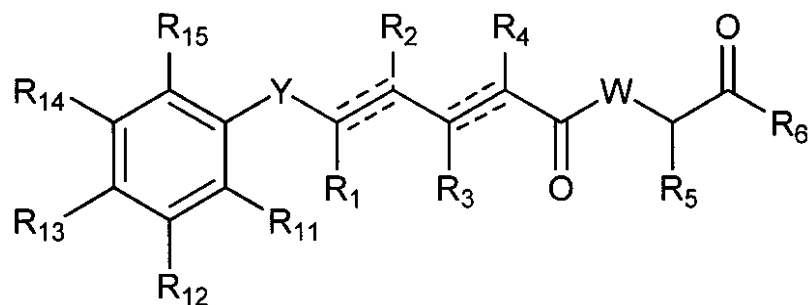
【請求項24】

前記式Iの化合物が、請求項19に記載したいずれかの化合物である、請求項23に記載の方法。

【請求項25】

フラグメントAおよびB

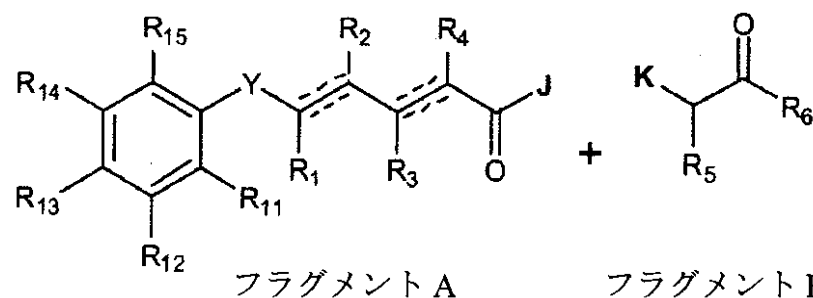
【化5】



(式中、R₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆、R₁₁、R₁₂、R₁₃、R₁₄、R₁₅、およびYは、望ましい基または必要に応じた適切な保護基であり、JおよびKは、適切な反応基または脱離基である)

をカップリングすることを含む、式Iの化合物

【化6】



(式中、Y、W、ならびにR₁、R₂、R₃、R₄、R₅、R₆、R₁₁、R₁₂、R₁₃、R₁₄およびR₁₅は、請求項1から19のいずれかに記載したとおりである)

を調製するための方法。

【請求項26】

前記式Iの化合物が、請求項19に記載したいずれかの化合物である、請求項25に記載の方法。