

【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18年1月5日(2006.1.5)

【公表番号】特表2005-500401(P2005-500401A)

【公表日】平成17年1月6日(2005.1.6)

【年通号数】公開・登録公報2005-001

【出願番号】特願2003-523201(P2003-523201)

【国際特許分類】

C 0 7 C 233/88 (2006.01)

A 6 1 K 31/167 (2006.01)

A 6 1 K 31/18 (2006.01)

A 6 1 K 31/27 (2006.01)

A 6 1 K 31/381 (2006.01)

A 6 1 K 31/40 (2006.01)

A 6 1 K 31/4409 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/04 (2006.01)

C 0 7 C 311/21 (2006.01)

C 0 7 C 311/46 (2006.01)

C 0 7 C 311/47 (2006.01)

C 0 7 D 207/34 (2006.01)

C 0 7 D 213/75 (2006.01)

C 0 7 D 213/81 (2006.01)

C 0 7 D 333/34 (2006.01)

【F I】

C 0 7 C 233/88

A 6 1 K 31/167

A 6 1 K 31/18

A 6 1 K 31/27

A 6 1 K 31/381

A 6 1 K 31/40

A 6 1 K 31/4409

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/04

C 0 7 C 311/21

C 0 7 C 311/46

C 0 7 C 311/47

C 0 7 D 207/34

C 0 7 D 213/75

C 0 7 D 213/81

C 0 7 D 333/34

【手続補正書】

【提出日】平成17年8月2日(2005.8.2)

【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

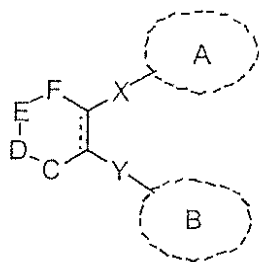
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I :

【化 1】



(I)

{ 式中：A および B は、

アルキル，アルケニル，アルキニル，アリールアルキル，ヘテロアリールアルキル，シクロアルキル，ヘテロシクロアルキル，アリールおよびヘテロアリールからなる基より夫々独立に選択される；

ここでアリールアルキル，ヘテロアリールアルキル，シクロアルキル，ヘテロシクロアルキル，アリールおよびヘテロアリール基が単結合を通し他の環と結合することが出来るか、または少くとも1個の他の環と縮合してもよく、

場合によりこれらの環が一つもしくははより多くの位置で：

アルキル，アルコキシ，アリール，アリールオキシ，アリールアルキル，アリールアルキルオキシ，シアノ，ハロゲン，ニトロ，オキソ，チオノもしくは CH_nX_m (ここで X はハロゲンであり m は 1 - 3 でありおよび n は 3 - m である)；

$S(O)R$ もしくは $S(O)_2R$ (式中 R はヒドロキシル，アルキル，アルコキシ，アリール，アリールオキシ，アリールアルキルおよびアリールアルキルオキシからなる基より選択される)；

$C(O)R$ ， $NHC(O)R$ もしくは $(CH_2)_nC(O)OR$ (式中、R は水素，ヒドロキシル，アルキル，アルコキシ，アリール，アリールオキシ，アリールアルキルおよびアリールアルキルオキシからなる基より選択され、n は 0 - 11 である)；

$S(O)_2OR$ ， OR ， SR ， $B(OR)_2$ ， PR_3 ， $P(O)(OR)_2$ ， $OP(O)(OR)_2$ もしくは $=NOR$ (式中、R は水素，アルキル，アリール，アリールアルキルからなる基より選択される)；または

NRR' ， $NRS(O)_2R'$ ， SO_2NRR' もしくは $CONRR'$ (式中、R は水素，アルキル，アリール，アリールアルキルからなる基より選択され、R' は水素，ヒドロキシル，アルキル，アルコキシ，アリール，アリールオキシ，アリールアルキルおよびアリールアルキルオキシからなる基より選択される)により置換することが出来る。

但し、

(i) A がアルキル，アルケニルもしくはアルキニル基である場合、B はアリールアルキル，ヘテロアリールアルキル，シクロアルキル，ヘテロシクロアルキル，アリールもしくはヘテロアリール基であり；

(ii) B がアルキル，アルケニルもしくはアルキニル基である場合、A はアリールアルキル，ヘテロアリールアルキル，シクロアルキル，ヘテロシクロアルキル，アリールもしくはヘテロアリール基である。

中心環の点線結合は二重結合または非局在化した芳香族結合の可能性を示すものである。

C は CR^1 ，窒素，酸素または硫黄であり；

D は CR^2 ，窒素，酸素または硫黄であり；

E は CR^3 ，窒素，酸素または硫黄であり；

F は CR^4 ，窒素，酸素，硫黄または無しである。

但し、C，D，E もしくは F の少くとも一つが CR であり；並びに

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 が :

水素, アルキル, アルケニル, アルキニル, アルコキシ, アリール, アリールオキシ, アリールアルキル, アリールアルキルオキシ, シクロアルキル, シアノ, ハロゲン, ヘテロアリール, ニトロまたは CH_nX_m (ここで X はハロゲンであり; m は 1 - 3 であり、 n は 3 - m である);

$S(O)R$ もしくは $S(O)_2R$ (式中、 R はヒドロキシ, アルキル, アルコキシ, アリール, アリールオキシ, アリールアルキル, アリールアルキルオキシからなる基から選択される);

$C(O)R$, $NHC(O)R$ もしくは $(CH_2)_nC(O)R$ (式中、 R は水素, ヒドロキシル, アルキル, アルコキシ, アリール, アリールオキシ, アリールアルキルおよびアリールアルキルオキシからなる基より選択され、 n は 0 - 11 である);

$S(O)_2OR$, OR , SR , $B(OR)_2$, PR_3 , $P(O)(OR)_2$, $OP(O)(OR)_2$, $=NOR$, (式中 R は水素, アルキル, アリール, アリールアルキルからなる基より選択される);

NRR' , $NRS(O)_2R'$, SO_2NRR' , $CONRR'$ (式中、 R が水素, アルキル, アリール, アリールアルキルからなる基より選択され、並びに R' は水素, ヒドロキシル, アルキル, アルコキシ, アリール, アリールオキシ, アリールアルキルおよびアリールアルキルオキシからなる基より選択される);

から夫々独立に選択されるか;

または R^1 および R^2 、もしくは R^2 および R^3 、もしくは R^3 および R^4 の一つはそれらが結合する炭素原子と一緒にあって、炭素環式もしくはヘテロ環式を形成する。

X および Y は、 SO_2NR , $NRSO_2$, $C(O)NR$, $NRC(O)$, $C(S)NR$, $NRC(S)$, $NRC(O)O$, $NRC(S)S$, $C(O)O$, $OC(O)$, $S(O)_2O$, OSO_2 , SO_2 , $OS(O)$, OSO_2NR , $NRS(O)_2NR'$, $C(S)SSNR$, $NRSSC(S)$, $P(O)(OR)NR'$, $NRP(O)(OR')$, $NRP(O)(OR')O$, $CR=CR'$, $NRC(O)NR'$, NR , $C=NO-$, $-ON=C$, $C=N$, $N=C$, $N=N(O)-$, $N(O)=N$, $N=N$ および直接結合からなる基より独立に各々選択された連結基であり; ここで R および R' は水素, アルキル, アルケニル, アルキニル, シクロアルキル, アリール, アリールアルキル, アシル, アルコキシアシル, アリールオキシアシルもしくはアミノアシルからなる基より各々独立に選択される。但し、

(i) X が $NRSO_2$ であれば、 Y は $CONR$, $CR=CR'$, $NRC(O)$, $NRC(S)$, NR , $NRC(O)O$ もしくは $NRC(O)NR$ でなく;

(ii) Y が $NRSO_2$ であれば、 X は $CONR$, $CR=CR'$, $NRC(O)$, $NRC(S)$, NR , $NRC(O)O$ もしくは $NRC(O)NR$ でなく;

(iii) X が $CONR$ であれば、 Y は $CONR$ もしくは $NRCO$ でなく;

(iv) Y が $CONR$ であれば、 Y は $CONR$ もしくは $NRCO$ でなく;

(v) X が $NRCO$ であれば、 Y は $NRCO$ でなく;

(vi) Y が $NRCO$ であれば、 X は $NRCO$ でなく;

(vii) Y が $NRSO_2$ であり、並びに A がヒドロキノンもしくは置換されたヒドロキノンであれば、 X は $CONR$, SO_2NR , $NRCONR'$ もしくは $NRSO_2NR'$ でなく;

(viii) X および Y が $NRSO_2$ であり、 A および B がトリルであれば、 R^2 および R^3 は水素もしくはハロゲンでなく;

(ix) X が直接結合であれば、 Y は直接結合でなく; 並びに

(x) Y が直接結合であれば、 X は直接結合でない。}

の化合物並びに医薬的に受容し得るそれらの塩。

【請求項 2】

X が SO_2NR^5 であり、 Y が $CONR^6$ であり、並びに R^5 および R^6 が H , アルキルおよびアリールからなる基より夫々独立に選択される請求項 1 に記載の式 I の化合物。

【請求項 3】

XがSO₂NR⁵であり、YがNR⁶COであり、並びにR⁵およびR⁶が請求項2に記載の通りである請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項 4】

XがSO₂NR⁵であり、YがSO₂NR⁶であり、並びにR⁵およびR⁶が請求項2に記載の通りである請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項 5】

XがSO₂NR⁵であり、YがNR⁶SO₂であり、並びにR⁵およびR⁶が請求項2に記載の通りである請求項1に記載の式Iの化合物(Aがアルキルであり、並びにBがハイドロキノンまたは置換したハイドロキノンである化合物を除く)。

【請求項 6】

XがNR⁵SO₂であり、YがNR⁶SO₂であり、並びにR⁵およびR⁶が請求項2に記載の通りである請求項1に記載の式Iの化合物(AおよびBがトリルでありR²およびR³が水素またはハロゲンである化合物を除く)。

【請求項 7】

XがNR⁵CONR⁶であり、YがNR⁷CONR⁸であり、並びにR⁵およびR⁶が請求項2に記載の通りであり、R⁷およびR⁸が水素、アルキルおよびアリアルからなる基より夫々独立に選択される請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項 8】

XがSO₂NR⁵であり、YがNR⁶CSであり、並びにR⁵およびR⁶が請求項2に記載の通りである請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項 9】

XがSO₂NR⁵であり、YがNR⁶CO₂であり、並びにR⁵およびR⁶が請求項2に記載の通りである請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項 10】

XがSO₂NR⁵であり、YがNR⁶であり、並びにR⁵およびR⁶が請求項2に記載の通りである請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項 11】

XがSO₂NR⁵であり、YがNR⁶P(O)R⁷であり、並びにR⁵およびR⁶が請求項2に記載の通りであり、R⁷が水素、アルキル、アリアル、アルコキシおよびアリアルオキシからなる基より選択される請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項 12】

XがSO₂NR⁵であり、YがN=CHであり、並びにR⁵が請求項2に記載の通りである請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項 13】

XがSO₂Oであり、YがCONR⁵であり、並びにR⁵が請求項2に記載の通りである請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項 14】

XがSO₂Oであり、YがNR⁵COであり、並びにR⁵が請求項2に記載の通りである請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項 15】

XがOSO₂であり、YがCONR⁵であり、並びにR⁵が請求項2に記載の通りである請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項 16】

XがSO₂Oであり、YがSO₂Oである請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項 17】

XがSO₂Oであり、YがOSO₂である請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項 18】

AおよびBが、ピロリジン、ペペリジン、ペペラジン、モルフォリン、チオフェン、ピロール、ピラゾール、イミダゾール、1,2,3-トリアゾール、1,2,4-トリアゾ

ール, オキサゾール, イソオキサゾール, チアゾール, イソチアゾール, フラン, 1, 2, 3 - オキサジアゾール, 1, 2, 4 - オキサジアゾール, 1, 2, 5 - オキサジアゾール, 1, 3, 4 - オキサジアゾール, 1, 2, 3, 4 - オキサトリアゾール, 1, 2, 3, 5 - オキサトリアゾール, 1, 2, 3 - チアジアゾール, 1, 2, 4 - チアジアゾール, 1, 2, 5 - チアジアゾール, 1, 3, 4 - チアジアゾール, 1, 2, 3, 4 - チアトリアゾール, 1, 2, 3, 5 - チアトリアゾール, テトラゾール, ベンゼン, ピリジン, ピリダジン, ピリミジン, ピラジン, トリアジン, インデン, ナフタレン, インドール, イソインドール, インドリジン, ベンゾフラン, ベンゾチオフェン, インダゾール, ベンズイミダゾール, ベンズチアゾール, プリン, キノリジン, キノリン, イソキノリン, シンノリン, フタラジン, キナゾリン, キノキサリン, ナフチリジン, プテリジン, フルオレン, カルバゾール, カルボリン, アクリジン, フェナジンおよびアンスラセンよりなる群から選択され、それらは場合により、一つまたはそれより多くの位置で、アルキル, アルコキシ, アリール, アリールオキシ, アルカリル, アルカリルオキシ, ハロゲン, トリハロメチル, オキソ, = S, S(O)R, SO₂NRR', S(O)₂OR, SR, B(OR)₂, PR₃, P(O)(OR)₂, OP(O)(OR)₂, NO₂, NRR', N(O)R, OR, CN, C(O)R, NHC(O)R, (CH₂)_nCO₂RおよびCONRR' で置換される(式中、RおよびR'はH, アルキル, アルコキシ, アリール, アリールオキシ, アリールアルキルおよびアリールアルキオキシからなる基より夫々独立に選択され; nは0 - 11である)請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項19】

該化合物が、N-(2, 6-ジイソプロピルフェニル)-2-(2, 6-ジイソプロピルフェニルスルファモイル)-ベンズアミド, N-フェニル-2-フェニルスルファモイルベンズアミド, N-[2-(4-メトキシフェニルスルファモイル)-フェニル]-イソニコチンアミド, N-[2-(4-メトキシフェニルスルファモイル)-フェニル]-4-ニトロベンズアミド, N-[2-(4-メトキシフェニルスルファモイル)-フェニル]-4-フルオロベンズアミド, 1-m-トリル-3-[4-(3-m-トリル-ウレイド)-ピリジン-3-イル]-尿素, 2-(4-メトキシベンゼンスルフォニルアミノ)-N-ピリジン-4-イル-ベンズアミド, [2-(4-メトキシフェニル-スルファモイル)-フェニル]-カルバミン酸tert-ブチルエステル, ベンゼン-1, 2-ジスルホン酸1-[(4-メトキシフェニル)-アミド]2-ピリジン-4-イルアミド, ベンゼン-1, 2-ジスルホン酸ビス-[(4-メトキシフェニル)-アミド], チオフェン-2-スルホン酸[2-(4-メトキシフェニル-スルファモイル)-フェニル]-アミド, 1, 2-ビス(2, 4, 6-トリイソプロピル-N-フェニル)-ベンゼンスルホンアミド, 2-[ベンジル-(4-メトキシフェニル)-スルファモイル]-N-ピリジン-4-イル-ベンズアミド, 2-(4-メトキシフェニル)-スルファモイル]-N-ピリジン-4-イル-ベンズアミド, 4-フルオロ-N-[2-(3, 4, 5-トリメトキシベンゼンスルフォニルアミノ)-フェニル]-ベンズアミド, 1H-ピロール-2-カルボン酸[2-(3, 4, 5-トリメトキシベンゼンスルフォニル-アミノ)-フェニル]-ベンズアミドおよびN-[2-(3, 4, 5-トリメトキシベンゼンスルフォニルアミノ)-フェニル]-イソニコチンアミドから選択される請求項1に記載の式Iの化合物。

【請求項20】

該化合物がN-(2, 6-ジイソプロピルフェニル)-2-(2, 6-ジイソプロピルフェニルスルファモイル)-ベンズアミドである請求項2に記載の化合物。

【請求項21】

該化合物が[2-(4-メトキシフェニル)-スルファモイル]-N-ピリジン-4-イル-ベンズアミドである請求項2に記載の化合物。

【請求項22】

該化合物がチオフェン-2-スルホン酸[2-(4-メトキシフェニルスルファモイル)-フェニル]-アミドである請求項6に記載の化合物。

【請求項 2 3】

該化合物が N - [2 - (4 - メトキシフェニルスルファモイル) - フェニル] - イソニコチンアミドである請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 2 4】

請求項 1 から 2 3 のいずれか一つに記載する化合物の治療上有効な量または医薬的に受容し得る担体もしくは賦形剤を含む医薬的な組成物。

【請求項 2 5】

請求項 1 から 2 3 のいずれか一つに記載する化合物または医薬的に受容し得るそれらの塩の治療上有効な量を、それらを必要としている患者に投与することを含み、異常なもしくは不適当な細胞増殖に起因する疾病もしくは疾患の予防および/または治療処置のための方法。

【請求項 2 6】

該処置が腫瘍成長、腫瘍転移および関連する脈管形成を含む腫瘍性疾病もしくは腫瘍に依存性疾患の処置である請求項 2 5 に記載の方法。

【請求項 2 7】

該投与が、脈管形成を含む異常もしくは不適当な細胞増殖に起因する疾病もしくは疾患について別の予防もしくは治療処置と共に行う請求項 2 5 または請求項 2 6 に記載の方法。

【請求項 2 8】

該患者がヒトである請求項 2 5 から 2 7 に記載するいずれか一つの方法。

【請求項 2 9】

異常もしくは不適当な細胞増殖に起因する疾病もしくは疾患の予防および/または治療処置に対する組成物の製造において、請求項 1 から 2 3 のいずれか一つに記載する化合物または医薬的に受容し得るそれらの塩の使用。