

【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 17 年 4 月 7 日 (2005.4.7)

【公表番号】特表 2004-518633 (P2004-518633A)

【公表日】平成 16 年 6 月 24 日 (2004.6.24)

【年通号数】公開・登録公報 2004-024

【出願番号】特願 2002-532456 (P2002-532456)

【国際特許分類第 7 版】

C 07 D 487/14

A 61 K 31/407

A 61 K 31/7056

A 61 P 35/00

A 61 P 43/00

C 07 D 495/14

C 07 H 19/23

【F I】

C 07 D 487/14

A 61 K 31/407

A 61 K 31/7056

A 61 P 35/00

A 61 P 43/00 1 1 1

C 07 D 495/14 C

C 07 H 19/23

【手続補正書】

【提出日】平成 15 年 5 月 29 日 (2003.5.29)

【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

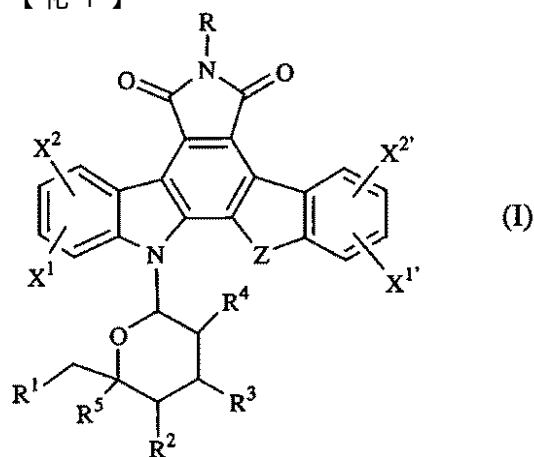
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

トポイソメラーゼ I および腫瘍細胞の増殖を抑制するのに用いる、式 (I) :

【化 1】



[ 式中、 $X^1$ 、 $X^{1'}$ 、 $X^2$  および  $X^{2'}$  はそれぞれ独立して、水素、ハロゲン、シアノ、 $O$   
 $R^6$ 、 $-CF_3$ 、アルキルカルボニル、 $C_{1-7}$  アルキル、ニトロ、 $NR^6R^7$ 、 $SR^6$  および  $C$

(O)OR<sup>6</sup>からなる群から選ばれ、ここで、上記C<sub>1-7</sub>アルキルは必要に応じて、ハロゲン、CN、SR<sup>6</sup>、OR<sup>6</sup>およびNR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>からなる群から選ばれる置換基の1つ以上で置換されてよく；

ZはNH、OおよびSからなる群から選ばれ；

Rは水素、OH、OC<sub>1-7</sub>アルキル、NH<sub>2</sub>、N(C<sub>1-3</sub>アルキル)<sub>2</sub>またはC<sub>1-7</sub>アルキル、ここで、上記C<sub>1-7</sub>アルキルは必要に応じて、ハロゲン、CN、SR<sup>6</sup>、OR<sup>6</sup>およびNR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>からなる群から選ばれる置換基の1つ以上で置換されてよく；

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>およびR<sup>4</sup>はそれぞれ独立して、水素、C<sub>1-7</sub>アルキル、C<sub>3-7</sub>シクロアルキル、ハロゲン、アジド、NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、NHC(O)NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、NHC(O)OR<sup>6</sup>、C(O)OR<sup>6</sup>、SR<sup>6</sup>およびOR<sup>6</sup>からなる群から選ばれ、ここで、上記C<sub>1-7</sub>アルキルは必要に応じて、ハロゲン、CN、SR<sup>6</sup>、OR<sup>6</sup>およびNR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>からなる群から選ばれる置換基の1つ以上で置換されてよく；

R<sup>5</sup>はC<sub>1-7</sub>アルキル、C<sub>3-7</sub>シクロアルキル、ハロゲン、アジド、NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、NHC(O)NR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>、NHC(O)OR<sup>6</sup>、C(O)OR<sup>6</sup>、SR<sup>6</sup>およびOR<sup>6</sup>からなる群から選ばれ、ここで、上記C<sub>1-7</sub>アルキルは必要に応じて、ハロゲン、CN、SR<sup>6</sup>、OR<sup>6</sup>およびNR<sup>6</sup>R<sup>7</sup>からなる群から選ばれる置換基の1つ以上で置換されてよく；および

R<sup>6</sup>およびR<sup>7</sup>はそれぞれ独立して、水素、C<sub>1-7</sub>アルキルおよびC<sub>3-7</sub>シクロアルキルからなる群から選ばれ、ここで、上記C<sub>1-7</sub>アルキルは必要に応じて、ハロゲン、CN、OH、OC<sub>1-3</sub>アルキル、NH<sub>2</sub>およびN(C<sub>1-3</sub>アルキル)<sub>2</sub>からなる群から選ばれる置換基の1つ以上で置換されてよく、あるいは

R<sup>6</sup>とR<sup>7</sup>はそれらが結合する窒素原子と共に合して、O、NおよびSからなる群から選ばれる同一もしくは異なるヘテロ原子の1個または2個を含有する非芳香族5～8員複素環を形成する]

で示される化合物、またはその立体異性体もしくは医薬的に許容しうる塩もしくは溶媒化合物。

【請求項2】

Rが水素である請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

ZがNHである請求項1に記載の化合物。

【請求項4】

X<sup>2'</sup>、X<sup>2</sup>、X<sup>1</sup>およびX<sup>1'</sup>が共にFである請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

X<sup>2'</sup>およびX<sup>2</sup>が共にFで、X<sup>1</sup>およびX<sup>1'</sup>が共にHである請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

X<sup>2</sup>がFで、X<sup>2'</sup>、X<sup>1</sup>およびX<sup>1'</sup>が共にHである請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

X<sup>2'</sup>がFで、X<sup>2</sup>、X<sup>1</sup>およびX<sup>1'</sup>が共にHである請求項1に記載の化合物。

【請求項8】

R<sup>1</sup>、R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>、R<sup>4</sup>およびR<sup>5</sup>がそれぞれ独立して、H、OH、F、アジドおよびアミノからなる群から選ばれる請求項1に記載の化合物。

【請求項9】

請求項1～8のいずれか1つに記載の式(I)の化合物またはその立体異性体もしくは医薬的に許容しうる塩もしくは溶媒化合物、および必要に応じて医薬用担体から成る医薬組成物。

【請求項10】

腫瘍成長を抑制する薬剤の製造のための、請求項1～8のいずれか1つに記載の化合物またはその立体異性体もしくは医薬的に許容しうる塩もしくは溶媒化合物の使用。