

【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2004-522781(P2004-522781A)

【公表日】平成16年7月29日(2004.7.29)

【年通号数】公開・登録公報2004-029

【出願番号】特願2002-567304(P2002-567304)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/404 (2006.01)

A 6 1 K 31/47 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 209/26 (2006.01)

C 0 7 D 209/42 (2006.01)

C 0 7 D 215/18 (2006.01)

【F I】

A 6 1 K 31/404

A 6 1 K 31/47

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 43/00 1 2 3

C 0 7 D 209/26

C 0 7 D 209/42

C 0 7 D 215/18

【手続補正書】

【提出日】平成17年2月9日(2005.2.9)

【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

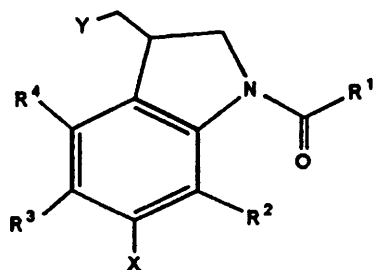
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

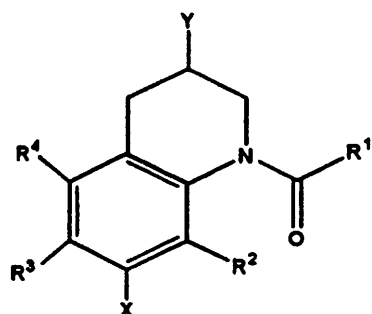
【請求項1】

動物の治療による処置の方法において使用するための組成物の製造における一般式IまたはIAの化合物あるいはその塩の使用：

【化1】



I



IA

(ここで、XはHであり；

Yは、脱離基であり；

R^1 は、-Ar、-NH₂、または R^8 であり；

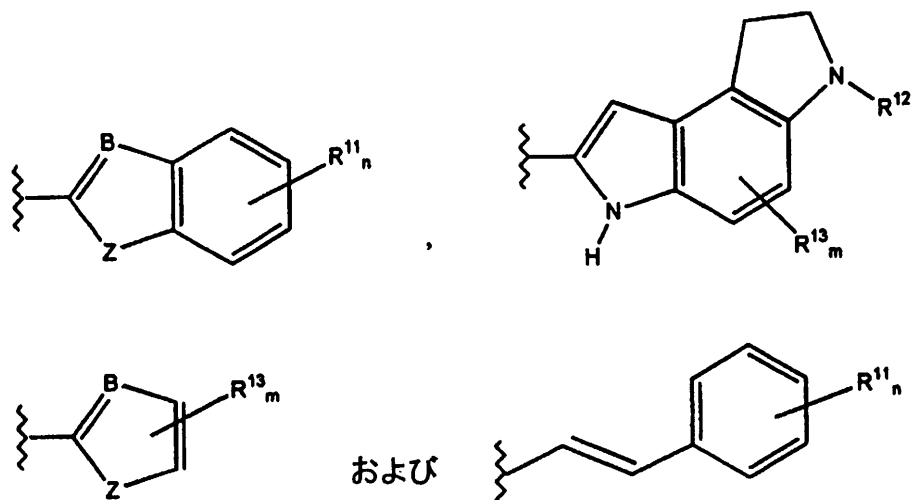
R^2 および R^3 は、各々独立して、H、 C_{1-4} アルキル、-OH、 C_{1-4} アルコキシ、-CN、Cl、Br、I、-NO₂、-NH₂、-NHCOR⁹、-COOH、-CONHR¹⁰、-NHCOOR¹⁰および-COOR¹⁰から選択され；

R^4 は、H、 C_{1-4} アルキル、CN、Cl、Br、I、NO₂、NH₂、-NHCOR⁹、-COOH、-CONHR¹⁰、-NHCOOR¹⁰および-COOR¹⁰から選択され；

R^8 、 R^9 および R^{10} は、独立して、 C_{1-4} アルキル、必要に応じて置換されたフェニル、 C_{7-12} -アラルキル、必要に応じて置換されたヘテロアリールおよびリガンドから選択され；

Arは、

【化2】



および

から選択され(ここで、Bは、Nまたは CR^{14} であり；

ZはO、S、-CH=CH-、またはNHであり；

各 R^{11} は、OH、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルキル、-NO₂、-NH₂、-NHR¹⁷、-NR¹⁷₂、-N⁺R¹⁷₃、-CN、Cl、Br、I、-NHCOR¹⁵、-COOH、-CONHR¹⁶、NHCOOR¹⁶およびCOOR¹⁶から選択され；

nは0～4の範囲の整数であり；

R^{12} は、 H 、 $-COAr^1$ 、 $-CONH_2$ 、 $-COOH$ 、 $-COR^{16}$ または $-COOR^{16}$ であり；

各 R^{13} は、 OH 、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルキル、 $-NO_2$ 、 $-NH_2$ 、 $-NHR^{17}$ 、 $-NR^{17}_2$ 、 $-N^+R^{17}_3$ 、 $-CN$ 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-NHCOR^{15}$ 、 $-COOH$ 、 $-CONHR^{16}$ 、 $-NHCOOR^{16}$ および $-COOR^{16}$ から選択され；

m は0、1または2であり；

R^{14} は、 OH 、 C_{1-4} アルコキシ、 C_{1-4} アルキル、 $-NO_2$ 、 $-NH_2$ 、 $-CN$ 、 Cl 、 Br 、 I 、 $-NHCOR^{15}$ 、 $-COOH$ 、 $-CONHR^{16}$ 、 $-COOR^{16}$ 、 $-NHCOOR^{16}$ および H から選択され；

R^{15} は、 C_{1-4} アルキル、必要に応じて置換されたフェニル、必要に応じて置換されたヘテロアリール、 C_{7-12} アラルキル、リガンドおよび Ar^1 から選択され；

R^{16} は、 C_{1-4} アルキル、必要に応じて置換されたフェニル、 C_{7-12} -アラルキルおよび必要に応じて置換されたヘテロアリールおよびリガンドから選択され；

各 R^{17} は、 C_{1-4} -アルキル、必要に応じて置換されたフェニル、必要に応じて置換されたヘテロアリール(heteraryl)および C_{7-12} -アラルキルから選択され；そして

Ar^1 は、 Ar と同じ基(groups)から選択される(但し、任意の1つの環における多くとも1つの基 R^{11} または R^{13} が基 Ar^1 を含む)。

【請求項2】

動物がヒトである、請求項1に記載の使用。

【請求項3】

処置が腫瘍の処置である、請求項1または請求項2に記載の使用。

【請求項4】

Y が、 $-OCOOR^5$ 、 $-OCONHR^6$ 、 Cl 、 Br 、および $-OSOOR^7$ (ここで、 R^5 、 R^6 および R^7 は、独立して、 C_{1-4} アルキル、必要に応じて置換されたフェニル、 C_{7-12} -アラルキル、および必要に応じて置換されたヘテロアリールから選択される)から選択される、先の請求項のいずれかに記載の使用。

【請求項5】

治療による動物の腫瘍の処置における使用のための請求項1および4のいずれかにおいて定義される(defined)ような一般式Iの化合物。

【請求項6】

1-(クロロメチル)-6-ベンゾイル-3-((5-メトキシ-1H-インドール-2-イル)カルボニル)-1,2ジヒドロ-3H-ピロロ[3,2-e]インドール；および

3-(クロロメチル)-1-[(5-メトキシインドール-2-イル)カルボニル]インドリン(indoline)から選択される、請求項5に記載の化合物。

【請求項7】

請求項1および4のいずれかに定義されるような一般式Iの化合物ならびに薬学的に許容される賦形剤を含む腫瘍の処置のための薬学的組成物。

【請求項8】

請求項1および4のいずれかに定義されるような式IAの化合物。

【請求項9】

1-((5-メトキシ-1H-インドール-2-イル)カルボニル)-4-クロロ-1,2,3,4-テトラヒドロキノリンである、請求項8に記載の化合物。

【請求項10】

治療による動物の処置における使用のための請求項8または請求項9に記載の化合物。

【請求項11】

請求項8または請求項9に記載の化合物および薬学的に許容される賦形剤を含む、薬学的組成物。