

【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 8 月 30 日 (2012.8.30)

【公表番号】特表 2011-530545 (P2011-530545A)

【公表日】平成 23 年 12 月 22 日 (2011.12.22)

【年通号数】公開・登録公報 2011-051

【出願番号】特願 2011-522392 (P2011-522392)

【国際特許分類】

C 0 7 D 403/10 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/4985 (2006.01)

C 0 7 D 403/14 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 403/10 C S P

C 0 7 D 487/04 1 4 5

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/506

A 6 1 K 31/4985

C 0 7 D 403/14

C 0 7 D 487/04 1 4 6

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 K 45/00

【手続補正書】

【提出日】平成 24 年 7 月 13 日 (2012.7.13)

【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】請求項 1

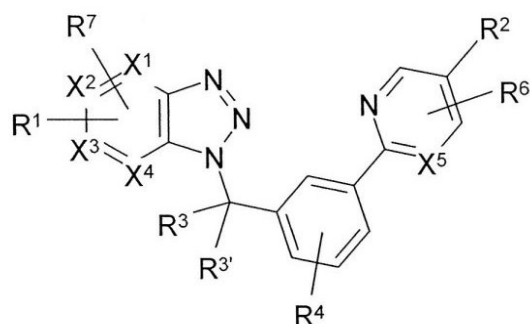
【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項 1】

式 I

【化 1】



I

式中、

X^1 、 X^2 、 X^3 、 X^4 、 X^5 は、各々、互いに独立してCHまたはNを示し、

R^1 、 R^2 、 R^7 は、各々、互いに独立してH、Hal、A、 $[C(R^5)_2]_n OR^5$ 、 $N = CR^5 N(R^5)_2$ 、 SR^5 、 NO_2 、CN、 $[C(R^5)_2]_n COOR^5$ 、 $CON(R^5)_2$ 、 $NR^5 COA$ 、 $NR^5 SO_2 A$ 、 $SO_2 N(R^5)_2$ 、 $S(O)_m A$ 、 $[C(R^5)_2]_n N(R^5)_2$ 、 $[C(R^5)_2]_n Het$ 、 $O[C(R^5)_2]_p OR^5$ 、 $O[C(R^5)_2]_p N(R^5)_2$ 、 $O[C(R^5)_2]_p N^+ O^-(R^5)_2$ 、 $O[C(R^5)_2]_n Het$ 、 $S[C(R^5)_2]_p N(R^5)_2$ 、 $S[C(R^5)_2]_p Het$ 、 $NR^5 [C(R^5)_2]_n N(R^5)_2$ 、 $NR^5 [C(R^5)_2]_n Het$ 、 $NHCON(R^5)_2$ 、 $NHCONH[C(R^5)_2]_p N(R^5)_2$ 、 $NHCONH[C(R^5)_2]_n Het$ 、 $NHCO[C(R^5)_2]_n N(R^5)_2$ 、 $NHCO[C(R^5)_2]_n Het$ 、 $[C(R^5)_2]_n CON(R^5)_2$ 、 $CONR^5 [C(R^5)_2]_n N(R^5)_2$ 、 $CONR^5 [C(R^5)_2]_n NR^5 COOA$ 、 $[C(R^5)_2]_n NR^5 COOA$ 、 $CONR^5 [C(R^5)_2]_n OR^5$ 、 $CONR^5 [C(R^5)_2]_n Het$ 、 $COHet$ 、 COA 、 $CH = CH - COOR^5$ 、 $CH = CH - N(R^5)_2$ 、 $CH = CH - CON(R^5)_2$ 、 $O - [C(R^5)_2]_n - シクロアルキレン - [C(R^5)_2]_n - Het$ 、 $O - [C(R^5)_2]_n - シクロアルキレン - [C(R^5)_2]_n - N(R^5)_2$ 、 $O - [C(R^5)_2]_n - シクロアルキレン - [C(R^5)_2]_n - OR^5$ 、 $[C(R^5)_2]_n Ar$ 、 $O[C(R^5)_2]_n Ar$ 、 $S[C(R^5)_2]_n Ar$ 、 $NR^5 [C(R^5)_2]_n Ar$ 、 $NHCONH[C(R^5)_2]_n Ar$ 、 $NHCO[C(R^5)_2]_n Ar$ または $CONR^5 [C(R^5)_2]_n Ar$ または $COAr$ を示し、

R^3 、 $R^{3'}$ は、各々、互いに独立してH、Fまたは R^8 を示し、

R^3 および $R^{3'}$ は、一緒になってまた2～5個のC原子を有するアルキレン鎖を示し、ここで1つまたは2つの隣接していないCH₂基は、O、NHおよび/または NR^5 によって置き換えられていてもよく、

R^4 、 R^6 は、各々、互いに独立してH、AまたはHalを示し、

R^5 は、Hまたは R^8 を示し、

R^8 は、1～6個のC原子を有する非分枝状または分枝状アルキルを示し、

Aは、1～10個のC原子を有する非分枝状または分枝状アルキルを示し、ここで1～7個のH原子は、OH、F、Clおよび/またはBrによって置き換えられていてもよく、かつ/またはここで、1つまたは2つのCH₂基は、O、 NR^8 、NH、S、SO、SO₂および/またはCH=CH基によって置き換えられていてもよく、

あるいは、

3～7個のC原子を有し、OHによって単置換されていてもよい環状アルキルを示し、

Arは、フェニル、ナフチルまたはビフェニルを示し、その各々は、非置換であるか、またはHal、A、 OR^5 、 $N(R^5)_2$ 、 SR^5 、 NO_2 、CN、 $COOR^5$ 、 $CON(R^5)_2$ 、 $NR^5 COA$ 、 $NR^5 SO_2 A$ 、 $SO_2 N(R^5)_2$ および/または $S(O)_m A$ によって単置換、二置換もしくは三置換されており、

Hetは、1～4個のN、Oおよび/またはS原子を有する単環式、二環式または三環式の飽和、不飽和または芳香族複素環を示し、これは、非置換であるか、またはHal、A、 OR^5 、 $N(R^5)_2$ 、 SR^5 、 NO_2 、CN、 $COOR^5$ 、 $CON(R^5)_2$ 、 $NR^5 COA$ 、 $NR^5 SO_2 A$ 、 $SO_2 N(R^5)_2$ 、 $S(O)_m A$ 、 $CO - Het^1$ 、 Het^1 、 $[C(R^5)_2]_n N(R^5)_2$ 、 $[C(R^5)_2]_n OR^5$ 、 $[C(R^5)_2]_n Het^1$ 、 $O[C(R^5)_2]_p N(R^5)_2$ 、 $O[C(R^5)_2]_p OR^5$ 、 $O[C(R^5)_2]_n Het^1$ 、 $NHCOOA$ 、 $NHCON(R^5)_2$ 、 $NHCOO[C(R^5)_2]_p N(R^5)_2$ 、 $NHCOO[C(R^5)_2]_n Het^1$ 、 $NHCONH[C(R^5)_2]_n N(R^5)_2$ 、 $NHCONH[C(R^5)_2]_n Het^1$ 、 $OCONH[C(R^5)_2]_n N(R^5)_2$ 、 $OCONH[C(R^5)_2]_n Het^1$ 、 $CO - Het^1$ 、CHO、COA、=S、=NH、=NAおよび/または=O(カルボニル酸素)によって単置換、二置換もしくは三置換されていてもよく、

H e t ¹ は、1 ~ 2 個の N および / または O 原子を有する単環式の飽和複素環を示し、これは、A、C O O A、O A、O H、H a l および / または = O (カルボニル酸素) によって単置換または二置換されていてもよく、

H a l は、F、C l、B r または I を示し、

m は、0、1 または 2 を示し、

n は、0、1、2、3 または 4 を示し、

p は、1、2、3 または 4 を示す、

で表される化合物、または、それらの薬学的に使用可能な塩、互変異性体もしくは立体異性体、すべての比率でのそれらの混合物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】請求項 1 1

【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項 1 1】

A r が、非置換であるか、または H a l、A および / または C N によって単置換、二置換もしくは三置換されているフェニルを示す、

請求項 1 ~ 1 0 のいずれか一項に記載の化合物、または、それらの薬学的に使用可能な塩、互変異性体もしくは立体異性体、すべての比率でのそれらの混合物。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】請求項 1 3

【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項 1 3】

X ¹、X ²、X ³、X ⁴、X ⁵ が、各々、互いに独立して C H または N を示し、

R ¹ が、H、H a l、A、S (O) _m A、A r、H e t、O [C (R ⁵) ₂]_n A r、O [C (R ⁵) ₂]_n H e t または O R ⁵ を示し、

R ⁷ が、H または H a l を示し、

R ² が、A、H a l、[C (R ⁵) ₂]_n N (R ⁵) ₂、[C (R ⁵) ₂]_n H e t、O [C (R ⁵) ₂]_p N (R ⁵) ₂、O [C (R ⁵) ₂]_n H e t、[C (R ⁵) ₂]_n O R ⁵、O [C (R ⁵) ₂]_p O R ⁵、O - [C (R ⁵) ₂]_n - シクロアルキレン - [C (R ⁵) ₂]_n - N (R ⁵) ₂、[C (R ⁵) ₂]_n N R ⁵ C O O A または C H = C H - C O O R ⁵ を示し、

R ³、R ³ ' が、各々、互いに独立して H または R ⁸ を示し、

R ⁴、R ⁶ が、H を示し、

R ⁵ が、H または R ⁸ を示し、

R ⁸ が、1 ~ 6 個の C 原子を有する非分枝状または分枝状アルキルを示し、

A が、1 ~ 1 0 個の C 原子を有する非分枝状または分枝状アルキルを示し、

ここで 1 ~ 7 個の H 原子が、O H、F、C l および / または B r によって置き換えられていてもよく、

あるいは、

3 ~ 7 個の C 原子を有し、O H によって単置換されていてもよい、環状アルキルを示し、

A r が、非置換であるか、または H a l、A および / または C N によって単置換、二置換もしくは三置換されているフェニルを示し、

H e t が、1 ~ 4 個の N、O および / または S 原子を有し、非置換であるか、または H a l、A、C O O R ⁵、O [C (R ⁵) ₂]_p O R ⁵、[C (R ⁵) ₂]_n H e t ¹、O [C (R ⁵) ₂]_n H e t ¹ および / または = O (カルボニル酸素) によって単置換、二置換もしくは三置換されていてもよい、単環式の飽和、不飽和または芳香族複素環を示し、H e t ¹ が、ピペリジニル、ピロリジニル、モルホリニル、ピペラジニル、オキサゾリジ

ニルまたはイミダゾリジニルを示し、ここで、当該ラジカルがまた、C O O A、= O および / または A によって単置換または二置換されていてもよく、

H a l が、F、C l、B r または I を示し、

m が、0、1 または 2 を示し、

n が、0、1、2、3 または 4 を示し、

p が、1、2、3 または 4 を示す、

請求項 1 ~ 6、8、10 ~ 12 のいずれか一項に記載の化合物、または、それらの薬学的に使用可能な塩、互変異性体もしくは立体異性体、すべての比率でのそれらの混合物。

【手続補正 4】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】請求項 16

【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項 16】

請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の式 I で表される少なくとも 1 種の化合物、および / または、これらの薬学的に使用可能な塩、互変異性体もしくは立体異性体、すべての比率でのこれらの混合物、ならびに、任意に賦形剤および / または補助剤を含む、医薬。

【手続補正 5】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】請求項 17

【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項 17】

請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の化合物、または、これらの薬学的に使用可能な塩、互変異性体もしくは立体異性体、すべての比率でのこれらの混合物の、キナーゼシグナル伝達の阻害、調節および / または調整が作用を奏する疾患の処置のための医薬の製造のための使用。

【手続補正 6】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】請求項 20

【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項 20】

固形腫瘍が、扁平上皮、膀胱、胃、腎臓、頭頸部、食道、子宮頸部、甲状腺、腸、肝臓、脳、前立腺、尿生殖路、リンパ系、喉頭および / または肺の腫瘍の群に由来する、請求項 19 に記載の使用。

【手続補正 7】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】請求項 24

【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項 24】

腫瘍が、急性骨髄性白血病、慢性骨髄性白血病、急性リンパ性白血病および / または慢性リンパ性白血病の群に由来する、請求項 23 に記載の使用。

【手続補正 8】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】請求項 25

【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項 25】

請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の式 I で表される少なくとも 1 種の化合物および / または、これらの薬学的に使用可能な塩もしくは立体異性体、すべての比率でのこれらの混合物、ならびに少なくとも 1 種の他の医薬活性成分を含む、医薬。

【手続補正 9】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】請求項 26

【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項 26】

(a) 請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の式 I で表される化合物および / または、これらの薬学的に使用可能な塩もしくは立体異性体、すべての比率でのこれらの混合物の有効量、

ならびに

(b) さらになる医薬活性成分の有効量

の個別のパックからなる、セット(キット)。

【手続補正 10】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0026

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0026】

A_r は、フェニル、ナフチルまたはビフェニルを示し、その各々は、非置換であるか、または H_a1、A、OR⁵、N(R⁵)₂、SR⁵、NO₂、CN、COOR⁵、CON(R⁵)₂、NR⁵COA、NR⁵SO₂A、SO₂N(R⁵)₂ および / または S(O)_mA によって単置換、二置換もしくは三置換されており、

【手続補正 11】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0131

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0131】

好ましいのは、さらに、血液および免疫系の腫瘍を処置するための、好ましくは急性骨髄性白血病、慢性骨髄性白血病、急性リンパ性白血病および / または慢性リンパ性白血病の群から選択される腫瘍を処置するための使用である。