

【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 07 D 403/10	(2006.01)
C 07 D 487/04	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 K 31/506	(2006.01)
A 61 K 31/4985	(2006.01)
C 07 D 403/14	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 35/02	(2006.01)
A 61 K 45/00	(2006.01)

【F I】

C 07 D 403/10	C S P
C 07 D 487/04	1 4 5
A 61 K 31/5377	
A 61 K 31/506	
A 61 K 31/4985	
C 07 D 403/14	
C 07 D 487/04	1 4 6
A 61 P 35/00	
A 61 P 35/02	
A 61 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

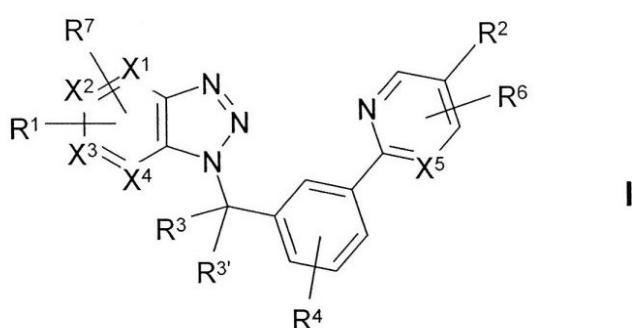
【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項1】

式I

【化1】



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(R⁵)₂]_nOR⁵
 、N=CR⁵N(R⁵)₂、SR⁵、NO₂、CN、[C(R⁵)₂]_nCOOR⁵、C
 ON(R⁵)₂、NR⁵COA、NR⁵SO₂A、SO₂N(R⁵)₂、S(O)_mA、
 [C(R⁵)₂]_nN(R⁵)₂、[C(R⁵)₂]_nHet、O[C(R⁵)₂]_pO
 R⁵、O[C(R⁵)₂]_pN(R⁵)₂、O[C(R⁵)₂]_pN⁺O⁻(R⁵)₂、
 O[C(R⁵)₂]_nHet、S[C(R⁵)₂]_pN(R⁵)₂、S[C(R⁵)₂]_pHet、
 NR⁵[C(R⁵)₂]_nN(R⁵)₂、NR⁵[C(R⁵)₂]_nHet、
 NHCON(R⁵)₂、NHCONH[C(R⁵)₂]_pN(R⁵)₂、NHCONH[C(R⁵)₂]_nHet、
 NHCO[C(R⁵)₂]_nN(R⁵)₂、NHCO[C(R⁵)₂]_nHet、[C(R⁵)₂]_nCON(R⁵)₂、CONR⁵[C(R⁵)₂]_nN(R⁵)₂、CONR⁵[C(R⁵)₂]_nNR⁵COOA、[C(R⁵)₂]_nNR⁵COOA、CONR⁵[C(R⁵)₂]_nOR⁵、CONR⁵[C(R⁵)₂]_nH
 et、COHet、COA、CH=CH-COOR⁵、CH=CH-N(R⁵)₂、CH
 =CH-CON(R⁵)₂、O-[C(R⁵)₂]_n-シクロアルキレン-[C(R⁵)₂]_n-Het、O-[C(R⁵)₂]_n-シクロアルキレン-[C(R⁵)₂]_n-N
 (R⁵)₂、O-[C(R⁵)₂]_n-シクロアルキレン-[C(R⁵)₂]_n-OR⁵
 、[C(R⁵)₂]_nAr、O[C(R⁵)₂]_nAr、S[C(R⁵)₂]_nAr、N
 R⁵[C(R⁵)₂]_nAr、NHCONH[C(R⁵)₂]_nAr、NHCO[C(R⁵)₂]_nArまたはCONR⁵[C(R⁵)₂]_nArまたはCOArを示し、
 R³、R³'は、各々、互いに独立してH、FまたはR⁸を示し、

R^3 、 R^3 は、略々、互いに独立して H、F または R。を示し、

R^3 および R^3' は、一緒にになってまた 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 CH_2 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、NR⁸、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、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、

Hetは、1~4個のN、Oおよび/S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Halo、A、OR⁵、N(R⁵)₂、SR⁵、NO₂、CN、COOR⁵、CON(R⁵)₂、NR⁵COA、NR⁵SO₂A、SO₂N(R⁵)₂、S(O)_mA、CO-Het¹、Het¹、[C(R⁵)₂]_nN(R⁵)₂、[C(R⁵)₂]_nOR⁵、[C(R⁵)₂]_nHet¹、O[C(R⁵)₂]_pN(R⁵)₂、O[C(R⁵)₂]_pOR⁵、O[C(R⁵)₂]_nHet¹、NHCOOA、NHCON(R⁵)₂、NHCOO[C(R⁵)₂]_pN(R⁵)₂、NHCOO[C(R⁵)₂]_nHet¹、NHCONH[C(R⁵)₂]_nN(R⁵)₂、NHCONH[C(R⁵)₂]_nHet¹、OCONH[C(R⁵)₂]_nHet¹、CO-Het¹、CHO、COA、=S、=NH、=NAおよび/Sまたは=O(カルボニル酸素)によって单置換、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、COOA、OA、OH、Hal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、

Halは、F、Cl、Br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11

【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項11】

Arが、非置換であるか、またはHal、Aおよび/またはCN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1～10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13

【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項13】

X¹、X²、X³、X⁴、X⁵が、各々、互いに独立してCHまたはNを示し、

R¹が、H、Hal、A、S(O)_mA、Ar、Het、O[C(R⁵)₂]_nAr、O[C(R⁵)₂]_nHetまたはOR⁵を示し、

R⁷が、HまたはHalを示し、

R²が、A、Hal、[C(R⁵)₂]_nN(R⁵)₂、[C(R⁵)₂]_nHet、O[C(R⁵)₂]_pN(R⁵)₂、O[C(R⁵)₂]_nHet、[C(R⁵)₂]_nO(R⁵、O[C(R⁵)₂]_pOR⁵、O-[C(R⁵)₂]_n-シクロアルキレン-[C(R⁵)₂]_n-N(R⁵)₂、[C(R⁵)₂]_nNR⁵COOAまたはCH=CH-COOOR⁵を示し、

R³、R^{3'}が、各々、互いに独立してHまたはR⁸を示し、

R⁴、R⁶が、Hを示し、

R⁵が、HまたはR⁸を示し、

R⁸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、1～10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原子が、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、

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が、非置換であるか、またはHal、Aおよび/またはCN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、

Het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Hal、A、COOR⁵、O[C(R⁵)₂]_pOR⁵、[C(R⁵)₂]_nHet¹、O[C(R⁵)₂]_nHet¹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、Het¹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、COOA、=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、急性骨髓性白血病、慢性骨髓性白血病、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 2 6

【補正方法】変更

【補正の内容】

【請求項 2 6】

(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】0 0 2 6

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 2 6】

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 a 1 、 A 、 O R ⁵ 、 N (R ⁵) ₂ 、 S R ⁵ 、 N O ₂ 、 C N 、 C O O R ⁵ 、 C O N (R ⁵) ₂ 、 N R ⁵ C O A 、 N R ⁵ S O ₂ A 、 S O 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、

【手続補正 11】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 3 1

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 3 1】

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、好ましくは急性骨髓性白血病、慢性骨髓性白血病、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。