

【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23年7月7日(2011.7.7)

【公表番号】特表2010-528009(P2010-528009A)

【公表日】平成22年8月19日(2010.8.19)

【年通号数】公開・登録公報2010-033

【出願番号】特願2010-509367(P2010-509367)

【国際特許分類】

C 07 D 417/12	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 K 45/00	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 19/10	(2006.01)
A 61 P 19/02	(2006.01)
A 61 P 9/10	(2006.01)
A 61 P 13/12	(2006.01)
A 61 P 35/02	(2006.01)
A 61 P 15/00	(2006.01)
A 61 P 13/08	(2006.01)
A 61 P 1/16	(2006.01)
A 61 P 11/00	(2006.01)
A 61 P 19/00	(2006.01)
A 61 P 29/00	(2006.01)
A 61 K 31/501	(2006.01)
A 61 K 31/4439	(2006.01)
A 61 K 31/497	(2006.01)
C 07 D 487/04	(2006.01)
A 61 K 31/519	(2006.01)
C 07 D 417/14	(2006.01)
A 61 K 31/506	(2006.01)
A 61 K 31/444	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
C 07 D 495/04	(2006.01)
C 07 D 471/04	(2006.01)
A 61 K 31/496	(2006.01)

【F I】

C 07 D 417/12	C S P
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 K 45/00	
A 61 P 35/00	
A 61 P 19/10	
A 61 P 19/02	
A 61 P 9/10	
A 61 P 13/12	
A 61 P 35/02	
A 61 P 15/00	
A 61 P 13/08	
A 61 P 1/16	
A 61 P 11/00	

A 6 1 P 19/00  
 A 6 1 P 29/00 1 0 1  
 A 6 1 K 31/501  
 A 6 1 K 31/4439  
 A 6 1 K 31/497  
 C 0 7 D 487/04 1 4 3  
 A 6 1 K 31/519  
 C 0 7 D 417/14  
 A 6 1 K 31/506  
 A 6 1 K 31/444  
 A 6 1 K 31/5377  
 C 0 7 D 495/04 1 0 5 Z  
 C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z  
 A 6 1 K 31/496

## 【手続補正書】

【提出日】平成23年5月17日(2011.5.17)

## 【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

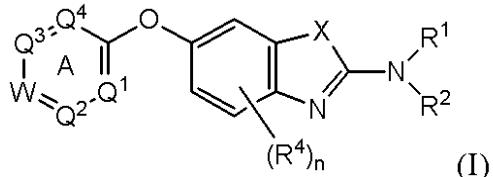
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

遊離、オキシド、エステル、プロドラッグ、薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物の形態の式(I)：

## 【化1】



## 〔式中：

XはSであり；

Aは、WがC-R<sup>3</sup>またはNであり、Q<sup>1</sup>、Q<sup>2</sup>、Q<sup>3</sup>およびQ<sup>4</sup>はそれぞれ独立してC-R<sup>3</sup>またはNであり、Q<sup>1</sup>、Q<sup>2</sup>、Q<sup>3</sup>およびQ<sup>4</sup>の少なくとも1個がNであり、Q<sup>1</sup>、Q<sup>2</sup>、Q<sup>3</sup>、Q<sup>4</sup>およびWの3個以下がNである6員環であり；

R<sup>1</sup>はL-R<sup>1</sup><sup>b</sup>であり、ここでLが共有結合、-CH<sub>2</sub>-または-CH(CH<sub>3</sub>)-であり、R<sup>1</sup><sup>b</sup>がシクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、アリール、置換アリール、ヘテロシクリル、置換ヘテロ環式、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールから選択され；

R<sup>2</sup>は水素またはメチルであり；

各R<sup>3</sup>はそれぞれ独立して水素またはR<sup>3</sup><sup>a</sup>であり、ここでR<sup>3</sup><sup>a</sup>はそれぞれ独立して、ハロ、アルキル、置換アルキル、アルケニル、置換アルケニル、アルキニル、置換アルキニル、カルボニトリル、アリール、置換アリール、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロ環式、置換ヘテロ環式、アミノ、置換アミノ、アシル、アシルアミノ、アルコキシ、置換アルコキシ、カルボキシル、カルボキシリエステル、置換スルホニル、アミノスルホニルおよびアミノカルボニルから成る群から選択されるか；または2個の隣接した炭素原

子上の 2 個の R<sup>3a</sup> がそれらと結合している炭素原子と一体となって、アリール、置換アリール、ヘテロ環式、置換ヘテロ環式、ヘテロアリールまたは置換ヘテロアリールから選択される基を形成し；

R<sup>4</sup> はそれぞれ独立して、アルキル、置換アルキル、アルコキシ、置換アルコキシ、アミノ、置換アミノまたはハロであり；そして

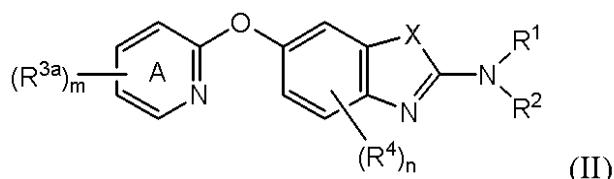
n は 0、1 または 2 である]

の化合物。

**【請求項 2】**

遊離、オキシド、エステル、プロドラッグ、薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物の形態の式 (II) :

**【化 2】**



[式中：

X が S であり；

R<sup>1</sup> が L - R<sup>1b</sup> であり、ここで L が共有結合、-CH<sub>2</sub>- または -CH(C<sub>2</sub>H<sub>5</sub>) - であり、R<sup>1b</sup> がシクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、アリール、置換アリール、ヘテロシクリル、置換ヘテロ環式、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールから選択され；

R<sup>2</sup> が水素またはメチルであり；

各 R<sup>3a</sup> がそれぞれ独立して、ハロ、ニトロ、ヒドロキシアミノ、アルキル、置換アルキル、アルケニル、置換アルケニル、アルキニル、置換アルキニル、カルボニトリル、アリール、置換アリール、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロ環式、置換ヘテロ環式、アミノ、置換アミノ、アシル、アシルアミノ、アルコキシ、置換アルコキシ、カルボキシリル、カルボキシリルエステル、置換スルホニル、アミノスルホニルおよびアミノカルボニルから成る群から選択されるか；または 2 個の隣接した炭素原子上の 2 個の R<sup>3a</sup> 基がそれらと結合している炭素原子と一体となって、アリール、置換アリール、ヘテロ環式、置換ヘテロ環式、ヘテロアリールまたは置換ヘテロアリールから選択される基を形成し；

R<sup>4</sup> がそれぞれ独立して、アルキル、置換アルキル、アルコキシ、置換アルコキシ、アミノ、置換アミノまたはハロであり；

m が 0、1、2 または 3 であり、そして

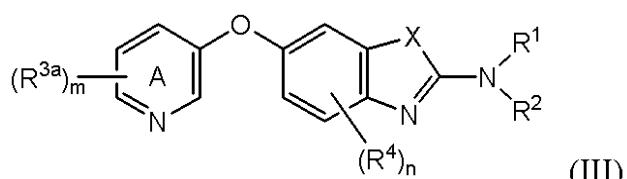
n が 0、1 または 2 である]

である請求項 1 に記載の化合物。

**【請求項 3】**

遊離、オキシド、エステル、プロドラッグ、薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物の形態の式 (III) :

**【化 3】**



[式中：

X が S であり；

R<sup>1</sup> が L - R<sup>1b</sup> であり、ここで L が共有結合、-CH<sub>2</sub>- または -CH(CH<sub>3</sub>)- であり、R<sup>1b</sup> がシクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、アリール、置換アリール、ヘテロシクリル、置換ヘテロ環式、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールから選択され；

R<sup>2</sup> が水素またはメチルであり；

各 R<sup>3a</sup> がそれぞれ独立して、ハロ、ニトロ、ヒドロキシアミノ、アルキル、置換アルキル、アルケニル、置換アルケニル、アルキニル、置換アルキニル、カルボニトリル、アリール、置換アリール、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロ環式、置換ヘテロ環式、アミノ、置換アミノ、アシル、アシルアミノ、アルコキシ、置換アルコキシ、カルボキシリル、カルボキシルエステル、置換スルホニル、アミノスルホニルおよびアミノカルボニルから成る群から選択されるか；または 2 個の隣接した炭素原子上の 2 個の R<sup>3a</sup> 基がそれらと結合している炭素原子と一体となって、アリール、置換アリール、ヘテロ環式、置換ヘテロ環式、ヘテロアリールまたは置換ヘテロアリールから選択される基を形成し；

R<sup>4</sup> はそれぞれ独立して、アルキル、置換アルキル、アルコキシ、置換アルコキシ、アミノ、置換アミノまたはハロであり；

m が 0、1、2 または 3 であり、そして

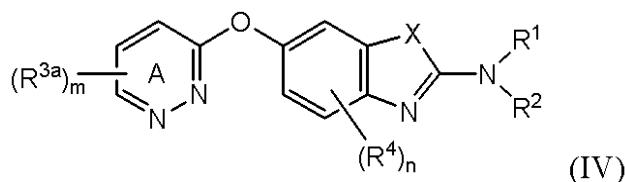
n が 0、1 または 2 である】

である請求項 1 に記載の化合物。

#### 【請求項 4】

遊離、オキシド、エステル、プロドラッグ、薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物の形態の式 (IV) :

#### 【化 4】



〔式中：

X が S であり；

R<sup>1</sup> が L - R<sup>1b</sup> であり、ここで L が共有結合、-CH<sub>2</sub>- または -CH(CH<sub>3</sub>)- であり、R<sup>1b</sup> がシクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、アリール、置換アリール、ヘテロシクリル、置換ヘテロ環式、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールから選択され；

R<sup>2</sup> が水素またはメチルであり；

各 R<sup>3a</sup> がそれぞれ独立して、水素、ハロ、ニトロ、ヒドロキシアミノ、アルキル、置換アルキル、アルケニル、置換アルケニル、アルキニル、置換アルキニル、カルボニトリル、アリール、置換アリール、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロ環式、置換ヘテロ環式、アミノ、置換アミノ、アシル、アシルアミノ、アルコキシ、置換アルコキシ、カルボキシリル、カルボキシルエステル、置換スルホニル、アミノスルホニルおよびアミノカルボニルから成る群から選択されるか；または 2 個の隣接した炭素原子上の 2 個の R<sup>3a</sup> 基がそれらと結合している炭素原子と一体となって、アリール、置換アリール、ヘテロ環式、置換ヘテロ環式、ヘテロアリールまたは置換ヘテロアリールから選択される基を形成し；

R<sup>4</sup> がそれぞれ独立して、アルキル、置換アルキル、アルコキシ、置換アルコキシ、アミノ、置換アミノまたはハロであり；

m が 0、1、2 または 3 であり、そして

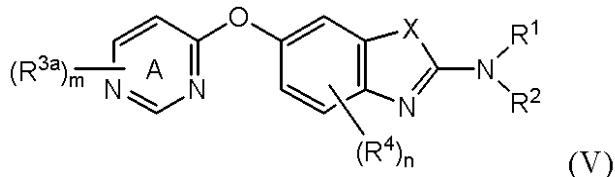
n が 0、1 または 2 である】

である請求項1に記載の化合物。

【請求項5】

遊離、オキシド、エステル、プロドラッグ、薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物の形態の式(V)：

【化5】



(V)

〔式中：

XがSであり；

R<sup>1</sup>がL-R<sup>1b</sup>であり、ここでLが共有結合、-CH<sub>2</sub>-または-CH(CH<sub>3</sub>)-であり、R<sup>1b</sup>がシクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、アリール、置換アリール、ヘテロシクリル、置換ヘテロ環式、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールから選択され；

R<sup>2</sup>が水素またはメチルであり；

各R<sup>3a</sup>がそれぞれ独立して、水素、ハロ、ニトロ、ヒドロキシアミノ、アルキル、置換アルキル、アルケニル、置換アルケニル、アルキニル、置換アルキニル、カルボニトリル、アリール、置換アリール、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロ環式、置換ヘテロ環式、アミノ、置換アミノ、アシリル、アシリルアミノ、アルコキシ、置換アルコキシ、カルボキシル、カルボキシルエステル、置換スルホニル、アミノスルホニルおよびアミノカルボニルから成る群から選択されるか；または2個の隣接した炭素原子上の2個のR<sup>3a</sup>基がそれらと結合している炭素原子と一体となって、アリール、置換アリール、ヘテロ環式、置換ヘテロ環式、ヘテロアリールまたは置換ヘテロアリールから選択される基を形成し；

R<sup>4</sup>はそれぞれ独立して、アルキル、置換アルキル、アルコキシ、置換アルコキシ、アミノ、置換アミノまたはハロであり；

mが0、1、2または3であり、そして

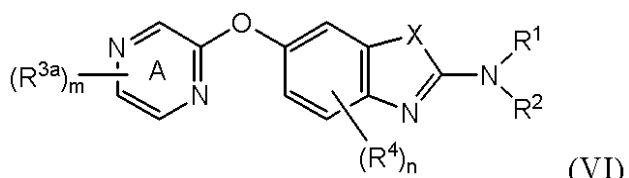
nは0、1または2である]

である請求項1に記載の化合物。

【請求項6】

遊離、オキシド、エステル、プロドラッグ、薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物の形態の式(VI)：

【化6】



(VI)

〔式中：

XがSであり；

R<sup>1</sup>がL-R<sup>1b</sup>であり、ここでLが共有結合、-CH<sub>2</sub>-または-CH(CH<sub>3</sub>)-であり、R<sup>1b</sup>がシクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、アリール、置換アリール、ヘテロシクリル、置換ヘテロ環式、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールから選択され；

R<sup>2</sup>が水素またはメチルであり；

各  $R^{3a}$  がそれぞれ水素または  $R^{3a}$  であり、ここで  $R^{3a}$  がそれぞれ独立して、ハロ、ニトロ、ヒドロキシアミノ、アルキル、置換アルキル、アルケニル、置換アルケニル、アルキニル、置換アルキニル、カルボニトリル、アリール、置換アリール、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロ環式、置換ヘテロ環式、アミノ、置換アミノ、アシル、アシリアルアミノ、アルコキシ、置換アルコキシ、カルボキシリル、カルボキシリルエステル、置換スルホニル、アミノスルホニルおよびアミノカルボニルから成る群から選択されるか；または2個の隣接した炭素原子上の2個の  $R^{3a}$  基がそれらと結合している炭素原子と一体となって、アリール、置換アリール、ヘテロ環式、置換ヘテロ環式、ヘテロアリールまたは置換ヘテロアリールから選択される基を形成し；

$R^4$  がそれぞれ独立して、アルキル、置換アルキル、アルコキシ、置換アルコキシ、アミノ、置換アミノまたはハロであり；

$m$  が0、1、2または3であり、そして

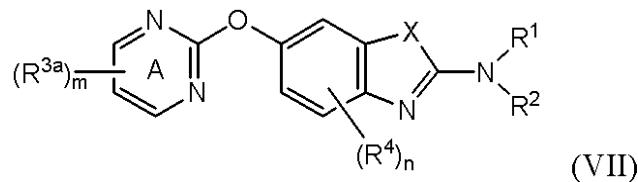
$n$  は0、1または2である】

である請求項1に記載の化合物。

【請求項7】

遊離、オキシド、エステル、プロドラッグ、薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物の形態の式(VII)：

【化7】



〔式中：

$X$  がSであり；

$R^1$  がL- $R^{1b}$  であり、ここでLが共有結合、-CH<sub>2</sub>-または-CH(CH<sub>3</sub>)-であり、 $R^{1b}$  がシクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、アリール、置換アリール、ヘテロシクリル、置換ヘテロ環式、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールから選択され；

$R^2$  が水素またはメチルであり；

各  $R^{3a}$  がそれぞれ独立して、ハロ、ニトロ、ヒドロキシアミノ、アルキル、置換アルキル、アルケニル、置換アルケニル、アルキニル、置換アルキニル、カルボニトリル、アリール、置換アリール、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロ環式、置換ヘテロ環式、アミノ、置換アミノ、アシル、アシリアルアミノ、アルコキシ、置換アルコキシ、カルボキシリル、カルボキシリルエステル、置換スルホニル、アミノスルホニルおよびアミノカルボニルから成る群から選択されるか；または2個の隣接した炭素原子上の2個の  $R^{3a}$  基がそれらと結合している炭素原子と一体となって、アリール、置換アリール、ヘテロ環式、置換ヘテロ環式、ヘテロアリールまたは置換ヘテロアリールから選択される基を形成し；

$R^4$  がそれぞれ独立して、アルキル、置換アルキル、アルコキシ、置換アルコキシ、アミノ、置換アミノまたはハロであり；

$m$  が0、1、2または3であり、そして

$n$  は0、1または2である】

である請求項1に記載の化合物。

【請求項8】

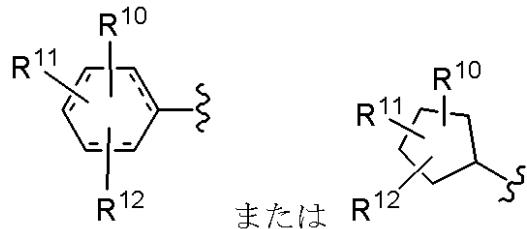
$R^{1b}$  がフェニル、フラン-2-イル、フラン-3-イル、テトラヒドロピラン-2-イル、テトラヒドロピラン-3-イル、テトラヒドロピラン-4-イル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシリル、シクロヘプチル、シクロオクチル、

シクロヘキセニル、ピリジン-2-イル、ピリジン-3-イル、ピリジン-4-イル、2,3-ジヒドロベンゾフラン、2,3-ジヒドロベンゾ[*b*][1,4]ジオキシン、3,4-ジヒドロ-2H-ベンゾ[*b*][1,4]ジオキセピン、ピラジニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジノン、ピロリジノン、ピリジン-2(1H)-オン、モルホリノ、ナフチル、ビシクロ[3.1.1]ヘプタン、ビシクロ[2.2.1]ヘプタン、1,2,3,4-テトラヒドロナフタレン、2,3-ジヒドロ-1H-インデンおよびアゼパン-2-オンから選択され、ここでR<sup>1</sup><sup>b</sup>はそれぞれ置換または非置換である、請求項1から7のいずれかに記載の化合物。

## 【請求項9】

R<sup>1</sup><sup>b</sup>が

## 【化8】



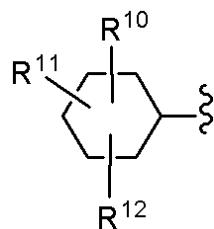
[式中、点線は飽和結合または不飽和結合であり；そして

R<sup>1</sup><sup>0</sup>、R<sup>1</sup><sup>1</sup>およびR<sup>1</sup><sup>2</sup>は独立して、水素、ハロ、ヒドロキシ、アルキル、置換アルキル、アルコキシ、置換アルコキシ、アミノ、置換アミノ、シクロアルキル、置換シクロアルキル、ヘテロシクリル、置換ヘテロシクリル、アリール、置換アリール、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールから成る群から選択されるか；またはR<sup>1</sup><sup>1</sup>はR<sup>1</sup><sup>2</sup>と一体となって、アリール、置換アリール、ヘテロシクリル、置換ヘテロシクリル、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールから成る群から選択される基を形成する]である、請求項8に記載の化合物。

## 【請求項10】

R<sup>1</sup><sup>b</sup>が

## 【化9】



[式中、R<sup>1</sup><sup>0</sup>、R<sup>1</sup><sup>1</sup>およびR<sup>1</sup><sup>2</sup>は請求項9に記載する通りである。]

である、請求項9に記載の化合物。

## 【請求項11】

R<sup>1</sup><sup>0</sup>、R<sup>1</sup><sup>1</sup>およびR<sup>1</sup><sup>2</sup>が独立して、水素、ハロ、ヒドロキシル、アルキル、置換アルキルおよびアルコキシから成る群から選択される、請求項9に記載の化合物。

## 【請求項12】

R<sup>1</sup><sup>0</sup>、R<sup>1</sup><sup>1</sup>およびR<sup>1</sup><sup>2</sup>の少なくとも1個がヒドロキシである、請求項9に記載の化合物。

## 【請求項13】

R<sup>1</sup><sup>1</sup>がR<sup>1</sup><sup>2</sup>と一体となってアリールまたは置換アリールを形成する、請求項9に記載の化合物。

## 【請求項14】

R<sup>1</sup><sup>b</sup>が

## 【化10】

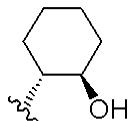


である、請求項10に記載の化合物。

## 【請求項15】

R<sup>1</sup><sup>b</sup>が

## 【化11】

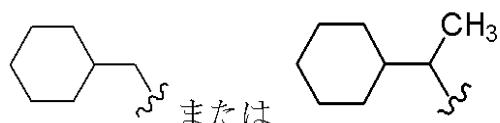


である、請求項10に記載の化合物。

## 【請求項16】

R<sup>1</sup>が

## 【化12】

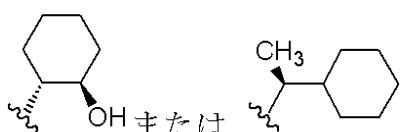


である、請求項10に記載の化合物。

## 【請求項17】

R<sup>1</sup>が

## 【化13】



である、請求項10に記載の化合物。

## 【請求項18】

各R<sup>3</sup><sup>a</sup>がそれぞれ独立して、ハロ、ニトロ、ヒドロキシアミノ、アルキル、置換アルキル、アルケニル、置換アルケニル、アルキニル、置換アルキニル、カルボニトリル、アリール、置換アリール、シクロアルキル、置換シクロアルキル、シクロアルケニル、置換シクロアルケニル、ヘテロアリール、置換ヘテロアリール、ヘテロ環式、置換ヘテロ環式、アミノ、置換アミノ、アシル、アシルアミノ、アルコキシ、置換アルコキシ、カルボキシル、カルボキシリエステル、置換スルホニル、アミノスルホニルおよびアミノカルボニルから成る群から選択される、請求項1~7の何れかに記載の化合物。

## 【請求項19】

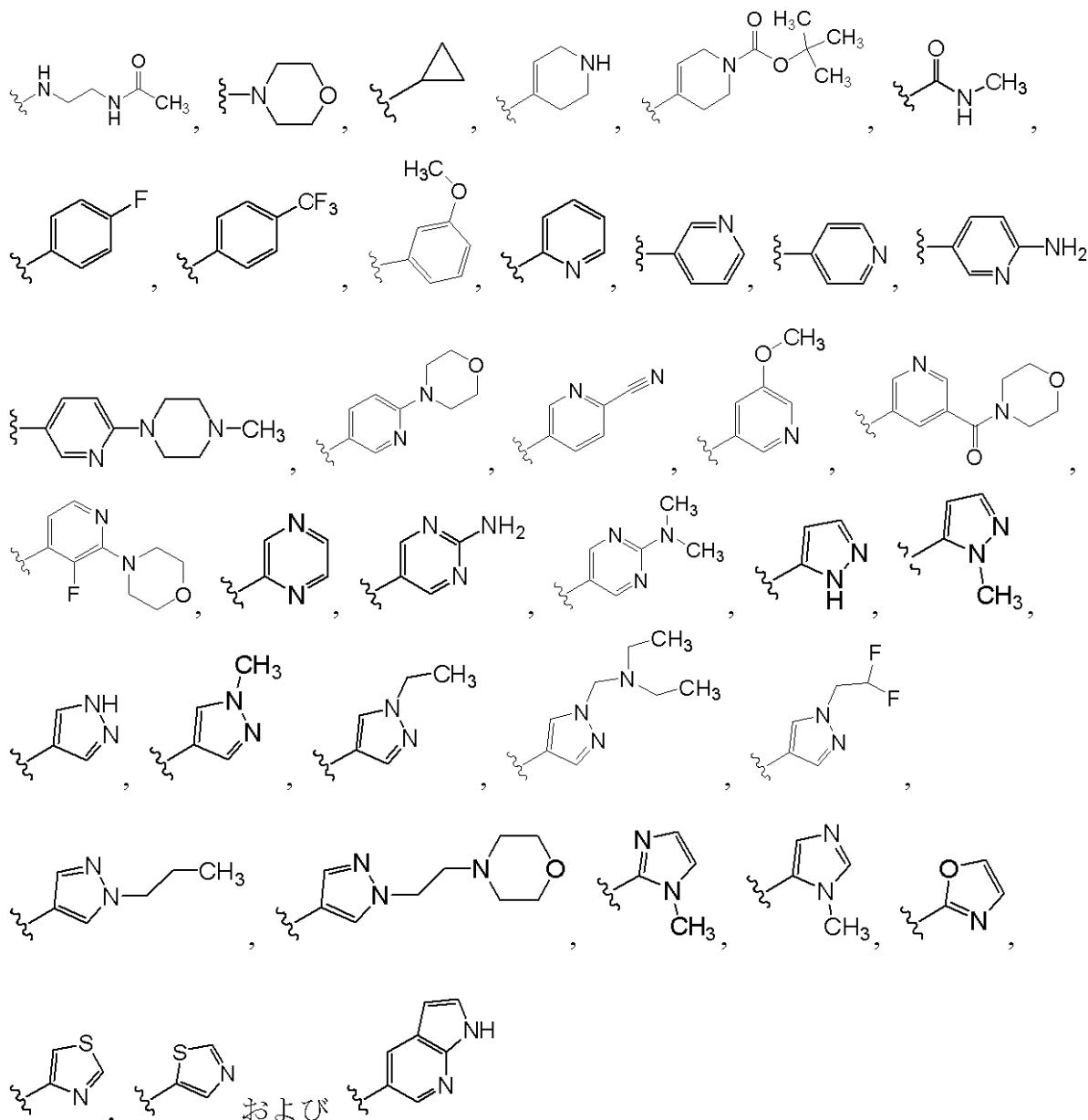
各R<sup>3</sup><sup>a</sup>がそれぞれ、F、Cl、Br、-NHOH、-NO<sub>2</sub>、-CN、アミノ、C<sub>1~3</sub>アルキル、C<sub>3~7</sub>シクロアルキル、C<sub>3~7</sub>シクロアルケニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジノン、ピロリジノン、ピリジン-2(1H)-オン、モルホリノ、チアモルホリノ、フェニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、フリル、チエニル、フラニル、ピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、ナフチルおよびピロロ[2,3-b]ピリジニルから成る群から選択され、

ここで、該アミノ、C<sub>1~3</sub>アルキル、C<sub>3~7</sub>シクロアルキル、C<sub>3~7</sub>シクロアルケニル、ピロリジニル、ピペリジニル、ピペリジノン、ピロリジノン、ピリジン-2(1H

) - オン、モルホリノ、チアモルホリノ、フェニル、ピロリル、ピラゾリル、イミダゾリル、イソオキサゾリル、イソチアゾリル、フリル、チエニル、フラニル、ピリジニル、ピラジニル、ピリミジニル、ピリダジニル、ナフチルまたはピロロ[2,3-b]ピリジニルは、ハロ、ヒドロキシ、ハロアルキル、アルコキシ、ハロアルコキシ、アリールオキシ、アシルアミノ、アミノ、アミノカルボニル、カルボニトリル、カルボキシリエステル、カルボキシル、置換スルホニル、アルキル、置換アルキル、ヘテロ環式および置換ヘテロ環式から成る群から独立して選択される0、1、2または3個の置換基で置換されている、請求項18に記載の化合物。

【請求項 20】

各  $R^3$  a が F、Cl、Br、-NH<sub>2</sub>、-NHOH、-NO<sub>2</sub>、-CN、-CF<sub>3</sub>、  
【化 14】



から成る群から独立して選択される、請求項 19 に記載の化合物。

## 【請求項 21】

2個の隣接する炭素原子上の2個のR<sup>3</sup><sup>a</sup>が、それらが結合している炭素原子と一体となって、アリール、置換アリール、ヘテロ環式、置換ヘテロ環式、ヘテロアリールおよび置換ヘテロアリールから選択される基を形成する、請求項1～7の何れかに記載の化合物。

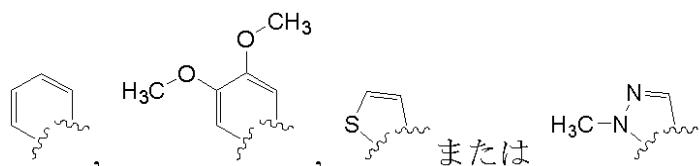
## 【請求項 2 2】

2 個の隣接する炭素原子上の 2 個の  $R^{3\alpha}$  が、それらが結合している炭素原子と一体となって、ベンゼン、チオフェンまたはピラゾール環を意味し、ここで該ベンゼン、チオフェンまたはピラゾール環はハロ、ヒドロキシ、アルキル、アルコキシから独立して選択される 0、1、2 または 3 個の置換基で置換されている、請求項 2 1 に記載の化合物。

## 【請求項 2 3】

2 個の隣接する炭素原子上の 2 個の  $R^{3\alpha}$  が、それらが結合している炭素原子と一体となって、

## 【化 1 5】

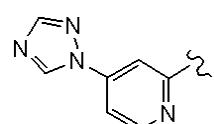


を形成する、請求項 2 1 に記載の化合物。

## 【請求項 2 4】

A が

## 【化 1 6】

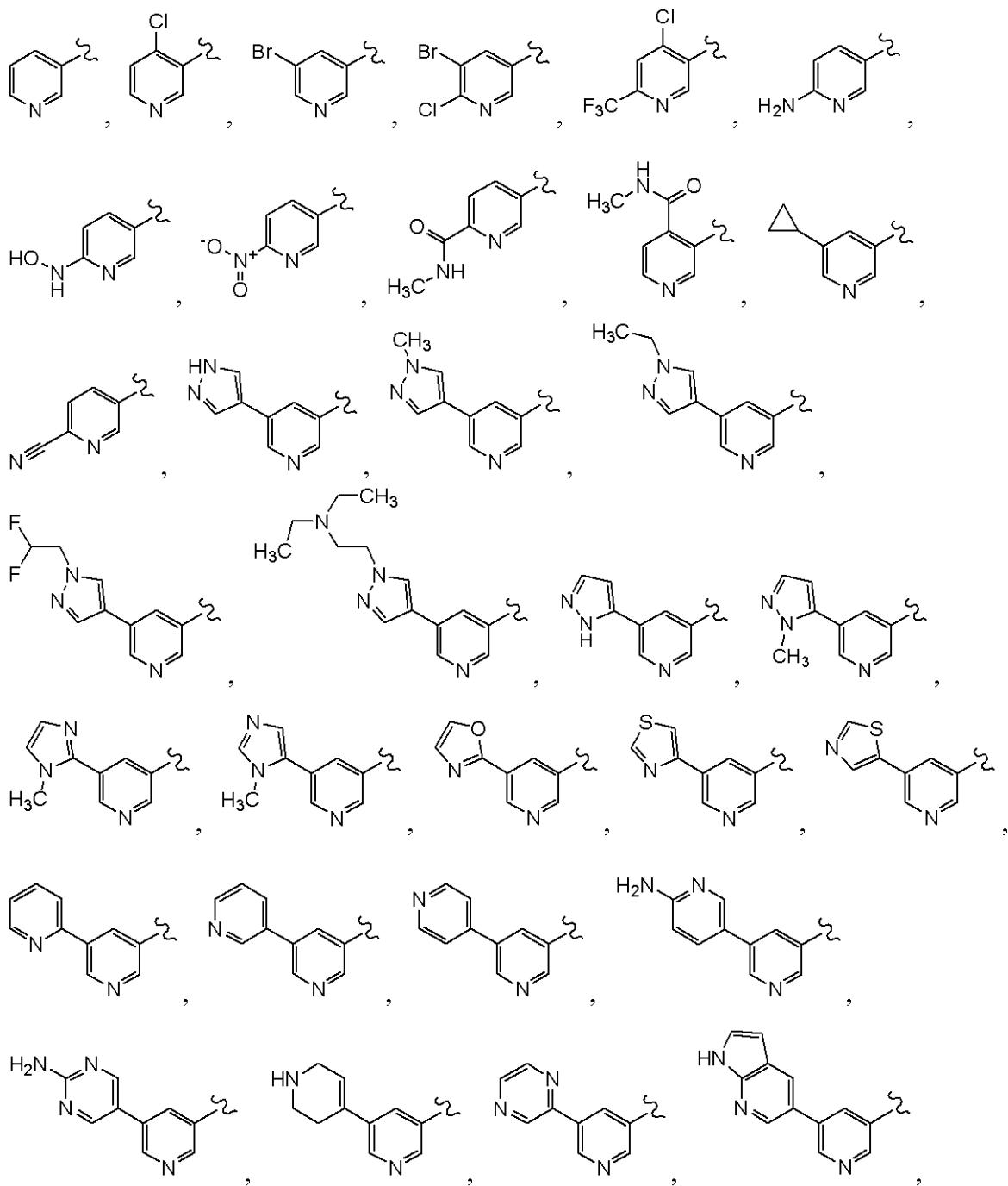


である、請求項 2 に記載の化合物。

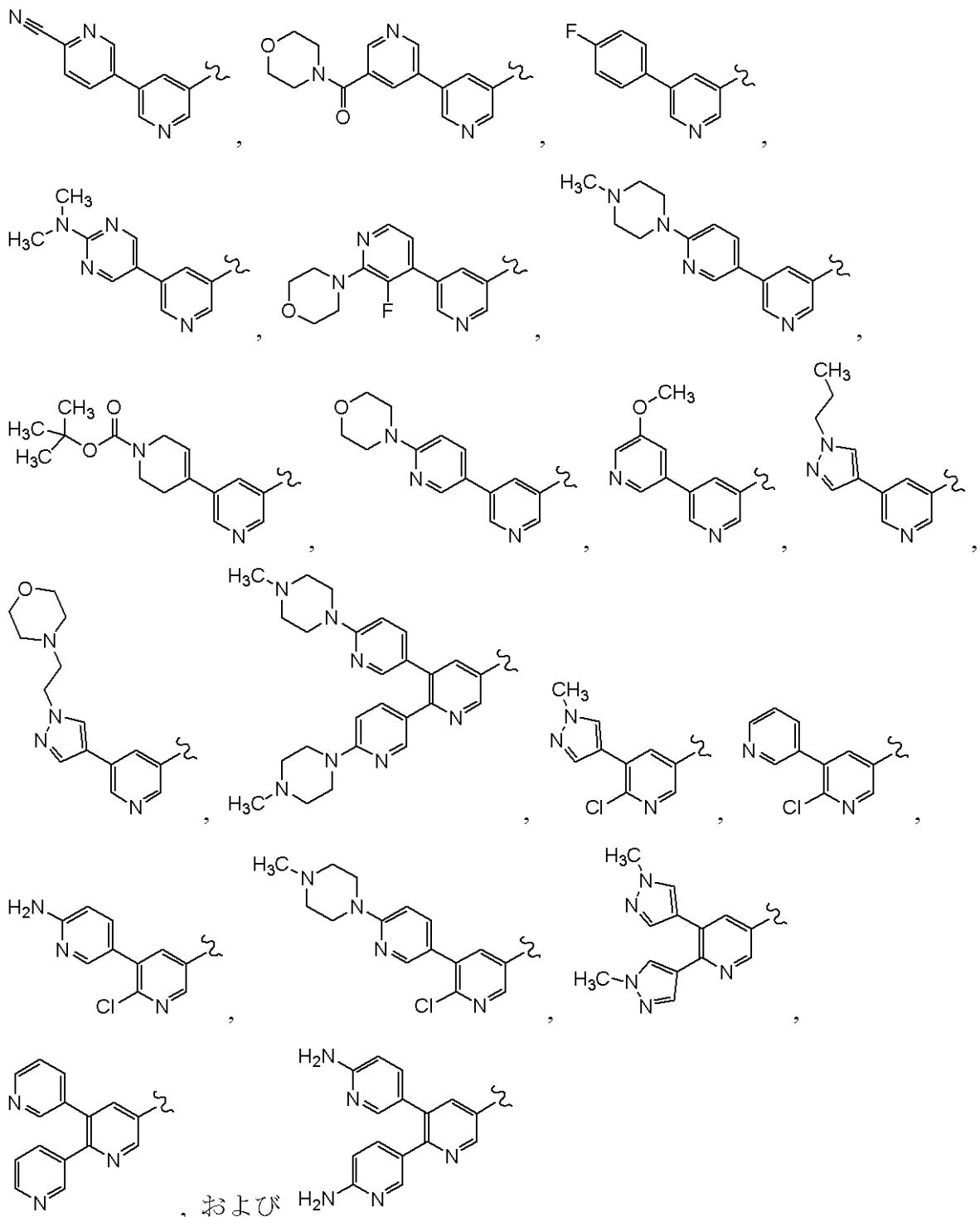
## 【請求項 2 5】

A が

【化 1 7】



## 【化18】

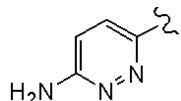


から成る群から選択される、請求項3に記載の化合物。

## 【請求項26】

Aが

## 【化19】

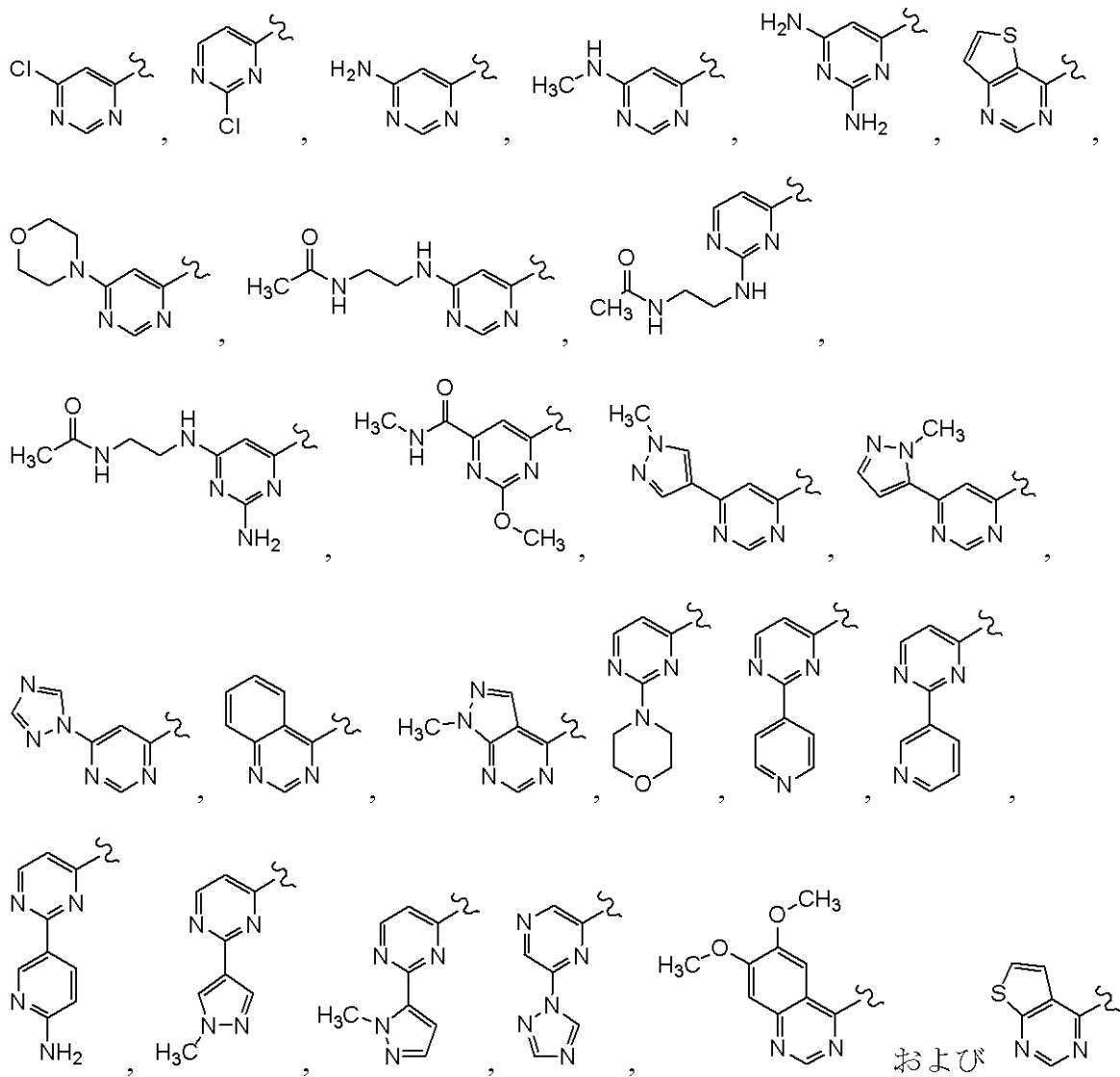


である、請求項4に記載の化合物。

## 【請求項27】

Aが

【化 2 0】

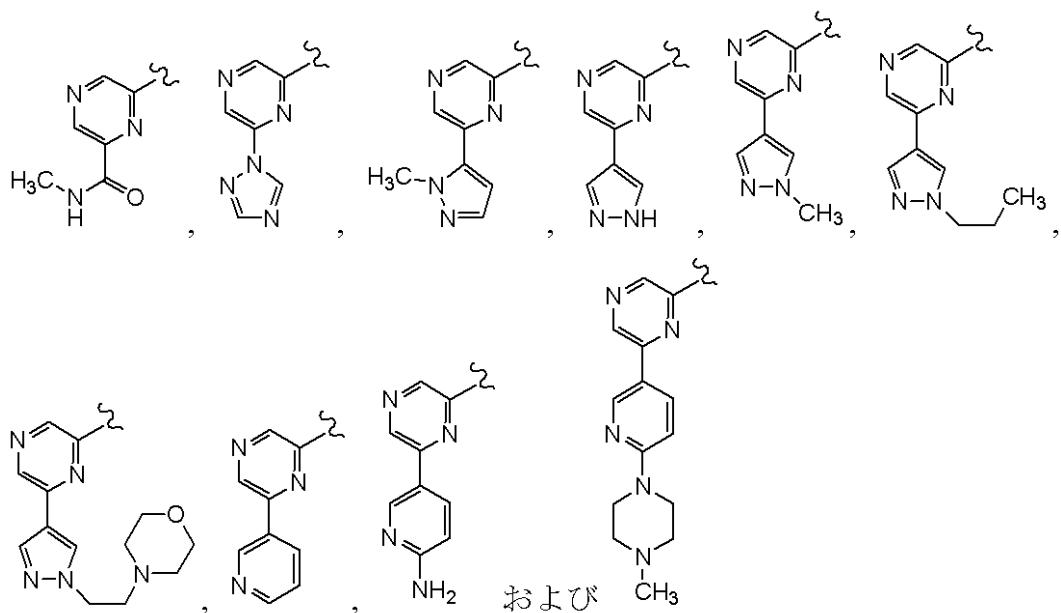


から成る群から選択される、請求項 5 に記載の化合物。

## 【請求項 28】

A が

【化 2 1】



から成る群から選択される、請求項 6 に記載の化合物。

## 【請求項 29】

次の表：

【表1】

化合物	構造	名称
1		6-(4-クロロピリジン-3-イルオキシ)-N-(シクロヘキシリルメチル)ベンゾ[d]チアゾール-2-アミン
2		6-(6-クロロピリミジン-4-イルオキシ)-N-(シクロヘキシリルメチル)ベンゾ[d]チアゾール-2-アミン
3		6-(2-(シクロヘキシリルメチルアミノ)ベンゾ[d]チアゾール-6-イルオキシ)ピリミジン-2,4-ジアミン
4		6-(2-クロロピリミジン-4-イルオキシ)-N-(シクロヘキシリルメチル)ベンゾ[d]チアゾール-2-アミン
5		(1R,2R)-2-(6-(6-クロロピリミジン-4-イルオキシ)ベンゾ[d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール
6		(1R,2R)-2-(6-(2-クロロピリミジン-4-イルオキシ)ベンゾ[d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール
7		(1R,2R)-2-(6-(4-クロロピリジン-3-イルオキシ)ベンゾ[d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール
8		6-(6-アミノピリミジン-4-イルオキシ)-N-(シクロヘキシリルメチル)ベンゾ[d]チアゾール-2-アミン

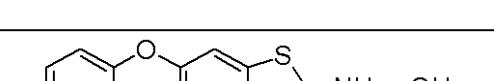
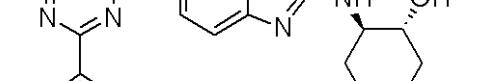
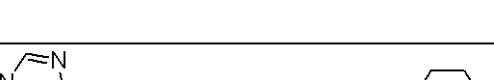
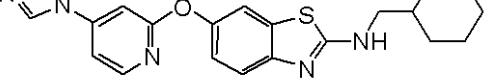
【表2】

9		(1R, 2R)-2-(6-(6-アミノピリミジン-4-イルオキシ)ベンゾ[d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール
10		6-(2-(シクロヘキシルメチルアミノ)ベンゾ[d]チアゾール-6-イルオキシ)-2-メトキシ-N-メチルピリミジン-4-カルボキサミド
11		N-(シクロヘキシルメチル)-6-(6-モルホリノピリミジン-4-イルオキシ)ベンゾ[d]チアゾール-2-アミン
12		N-(2-(6-(2-(シクロヘキシルメチルアミノ)ベンゾ[d]チアゾール-6-イルオキシ)ピリミジン-4-イルアミノ)エチル)アセトアミド
13		N-(シクロヘキシルメチル)-6-(6-(メチルアミノ)ピリミジン-4-イルオキシ)ベンゾ[d]チアゾール-2-アミン
14		N-(2-(2-アミノ-6-(2-(シクロヘキシルメチルアミノ)ベンゾ[d]チアゾール-6-イルオキシ)ピリミジン-4-イルアミノ)エチル)アセトアミド
15		N-(シクロヘキシルメチル)-6-(2-モルホリノピリミジン-4-イルオキシ)ベンゾ[d]チアゾール-2-アミン

【表3】

1 6		N - (2 - (4 - (2 - (シクロヘキシルメチルアミノ)ベンゾ [d] チアゾール-6 -イルオキシ) ピリミジン-2 -イルアミノ) エチル) アセトアミド
1 7		N - (シクロヘキシルメチル) - 6 - (6, 7 -ジメトキシキナゾリン-4 -イルオキシ) ベンゾ [d] チアゾール-2 -アミン
1 8		(1 R, 2 R) - 2 - (6 - (キナゾリン-4 -イルオキシ) ベンゾ [d] チアゾール-2 -イルアミノ) シクロヘキサノール
1 9		(1 R, 2 R) - 2 - (6 - (6, 7 -ジメトキシキナゾリン-4 -イルオキシ) ベンゾ [d] チアゾール-2 -イルアミノ) シクロヘキサノール
2 0		N - (シクロヘキシルメチル) - 6 - (6 - (1 -メチル-1 H -ピラゾール-4 -イル) ピリミジン-4 -イルオキシ) ベンゾ [d] チアゾール-2 -アミン
2 1		N - (シクロヘキシルメチル) - 6 - (2 - (1 -メチル-1 H -ピラゾール-4 -イル) ピリミジン-4 -イルオキシ) ベンゾ [d] チアゾール-2 -アミン

【表4】

2 2		(1 R, 2 R) - 2 - (6 - (6 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリミジン - 4 - イルオキシ) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - イルアミノ) シクロヘキサノール
2 3		(1 R, 2 R) - 2 - (6 - (2 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリミジン - 4 - イルオキシ) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - イルアミノ) シクロヘキサノール
2 4		6 - (4 - (1 H - 1 , 2 , 4 - トリアゾール - 1 - イル) ピリジン - 2 - イルオキシ) - N - (シクロヘキシリルメチル) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - アミン
2 5		(1 R, 2 R) - 2 - (6 - (6 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) ピリミジン - 4 - イルオキシ) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - イルアミノ) シクロヘキサノール
2 6		(1 R, 2 R) - 2 - (6 - (2 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) ピリミジン - 4 - イルオキシ) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - イルアミノ) シクロヘキサノール
2 7		(1 R, 2 R) - 2 - (6 - (2 - (ピリジン - 3 - イル) ピリミジン - 4 - イルオキシ) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - イルアミノ) シクロヘキサノール

【表5】

28		(1R, 2R)-2-(6-(2-(2-(2-methyl-1H-pyrazin-3-yl)oxy)-4-ethyl-4H-thieno[3,2-d]imidazol-4-yl)amino)-2-oxycyclohexyl
29		(1R, 2R)-2-(6-(2-(2-(6-amino-1H-pyrazin-2-yl)oxy)-4-ethyl-4H-thieno[3,2-d]imidazol-4-yl)amino)-2-oxycyclohexyl
30		(S)-N-(1-(2-(2-(2-(2-methyl-1H-pyrazin-3-yl)oxy)-4-ethyl-4H-thieno[3,2-d]imidazol-4-yl)amino)-2-oxycyclohexyl)-2-aminocyclohexane
31		(S)-N-(1-(2-(2-(2-(2-methyl-1H-pyrazin-3-yl)oxy)-4-ethyl-4H-thieno[3,2-d]imidazol-4-yl)amino)-2-oxycyclohexyl)-2-aminocyclohexane
32		(S)-N-(1-(2-(2-(2-(2-methyl-1H-pyrazin-3-yl)oxy)-4-ethyl-4H-thieno[3,2-d]imidazol-4-yl)amino)-2-oxycyclohexyl)-2-aminocyclohexane

【表6】

3 3		(S) - 6 - (2 - (6 - アミノピリジン - 3 - イル) ピリミジン - 4 - イルオキシ) - N - (1 - シクロヘキシリルエチル) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - アミン
3 4		(S) - N - (1 - シクロヘキシリルエチル) - 6 - (2 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) ピリミジン - 4 - イルオキシ) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - アミン
3 5		(S) - 6 - (6 - クロロピリミジン - 4 - イルオキシ) - N - (1 - シクロヘキシリルエチル) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - アミン
3 6		(S) - 6 - (2 - クロロピリミジン - 4 - イルオキシ) - N - (1 - シクロヘキシリルエチル) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - アミン
3 7		N - (シクロヘキシリルメチル) - 6 - (チエノ [2, 3 - d] ピリミジン - 4 - イルオキシ) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - アミン
3 8		N - (シクロヘキシリルメチル) - 6 - (チエノ [3, 2 - d] ピリミジン - 4 - イルオキシ) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - アミン
3 9		(S) - 6 - (4 - (1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ピリジン - 2 - イルオキシ) - N - (1 - シクロヘキシリルエチル) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - アミン

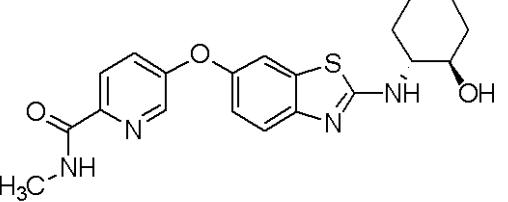
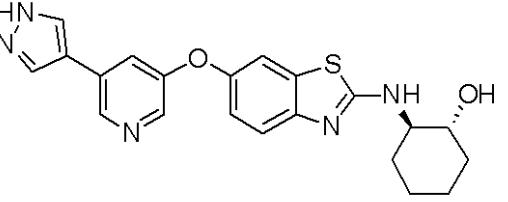
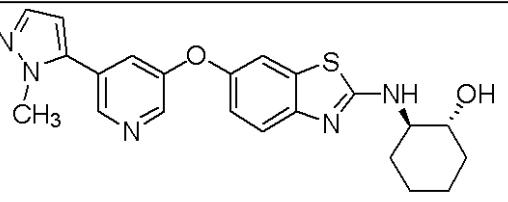
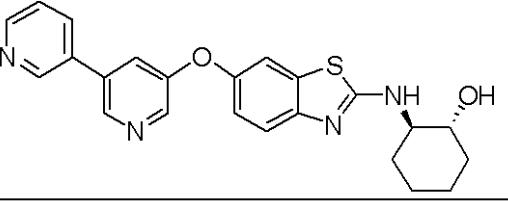
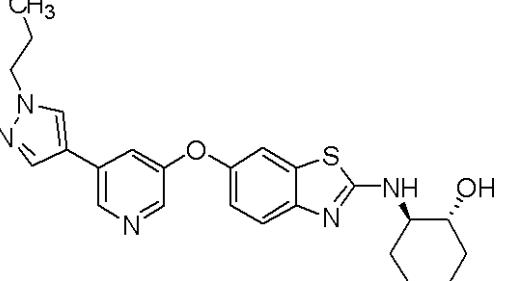
【表7】

4 0		(S) - 6 - (6 - (1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ピラジン - 2 - イルオキシ) - N - (1 - シクロヘキシルエチル) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - アミン
4 1		(S) - 6 - (6 - (1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ピリミジン - 4 - イルオキシ) - N - (1 - シクロヘキシルエチル) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - アミン
4 2		(1 R, 2 R) - 2 - (6 - (1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ピラジン - 2 - イルオキシ) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - イルアミノ) シクロヘキサンオール
4 3		(1 R, 2 R) - 2 - (6 - (1 H - 1, 2, 4 - トリアゾール - 1 - イル) ピリミジン - 4 - イルオキシ) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - イルアミノ) シクロヘキサンオール
4 4		N - (シクロヘキシルメチル) - 6 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾロ [3, 4 - d] ピリミジン - 4 - イルオキシ) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - アミン
4 5		(1 R, 2 R) - 2 - (6 - (5 - ブロモピリジン - 3 - イルオキシ) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - イルアミノ) シクロヘキサンオール
4 6		(1 R, 2 R) - 2 - (6 - (5 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾロ [3, 4 - d] ピリミジン - 6 - オキシ) ピリジン - 3 - イルオキシ) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - イルアミノ) シクロヘキサンオール

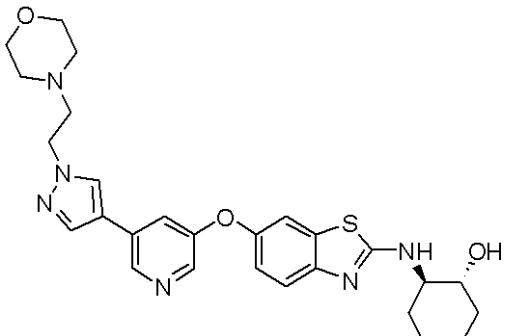
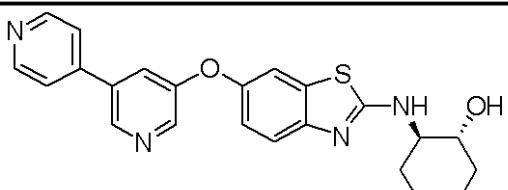
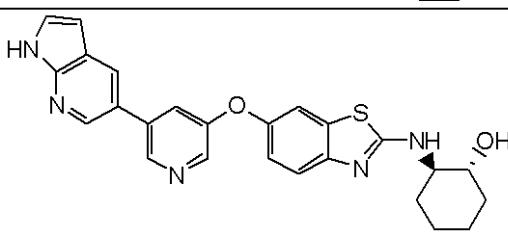
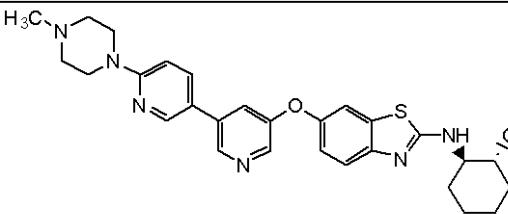
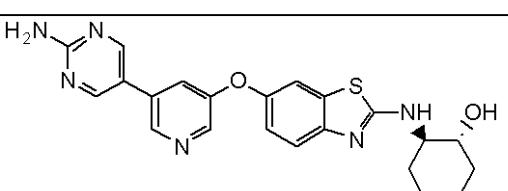
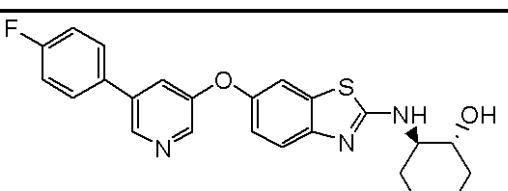
【表8】

4 7		(1R, 2R)-2-(6-(6'-アミノ-3-ピリジン-5-イルオキシ)-ベンゾ[d]チアゾール-2-イルアミノ)-シクロヘキサノール
4 8		5-(2-(シクロヘキシルメチルアミノ)-ベンゾ[d]チアゾール-6-イルオキシ)-N-メチルピコリンアミド
4 9		3-(2-(シクロヘキシルメチルアミノ)-ベンゾ[d]チアゾール-6-イルオキシ)-N-メチルイソニコチンアミド
5 0		6-(2-(シクロヘキシルメチルアミノ)-ベンゾ[d]チアゾール-6-イルオキシ)-N-メチルピラジン-2-カルボキサミド
5 1		(S)-6-(2-(1-シクロヘキシルエチルアミノ)-ベンゾ[d]チアゾール-6-イルオキシ)-N-メチルピラジン-2-カルボキサミド
5 2		6-(2-((1R, 2R)-2-ヒドロキシシクロヘキシルアミノ)-ベンゾ[d]チアゾール-6-イルオキシ)-N-メチルピラジン-2-カルボキサミド
5 3		(S)-5-(2-(1-シクロヘキシルエチルアミノ)-ベンゾ[d]チアゾール-6-イルオキシ)-N-メチルピコリンアミド

【表9】

5 4		5 - (2 - ((1 R, 2 R) - 2 - ヒドロキシシクロヘキシルアミノ) ベンゾ [d] チアゾール - 6 - イルオキシ) - N - メチルピコリンアミド
5 5		(1 R, 2 R) - 2 - (6 - (5 - (1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリジン - 3 - イルオキシ) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - イルアミノ) シクロヘキサノール
5 6		(1 R, 2 R) - 2 - (6 - (5 - (1 - メチル - 1 H - ピラゾール - 5 - イル) ピリジン - 3 - イルオキシ) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - イルアミノ) シクロヘキサノール
5 7		(1 R, 2 R) - 2 - (6 - (3, 3' - ビビリジン - 5 - イルオキシ) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - イルアミノ) シクロヘキサノール
5 8		(1 R, 2 R) - 2 - (6 - (5 - (1 - プロピル - 1 H - ピラゾール - 4 - イル) ピリジン - 3 - イルオキシ) ベンゾ [d] チアゾール - 2 - イルアミノ) シクロヘキサノール

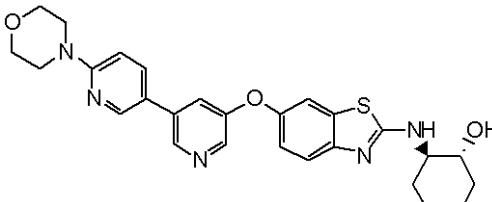
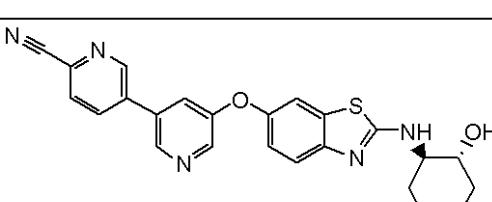
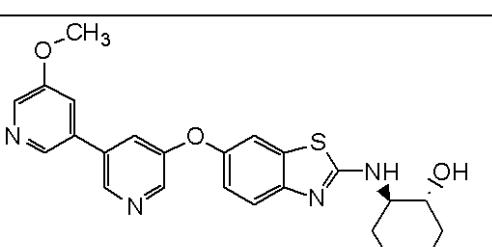
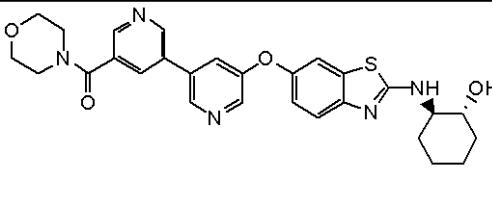
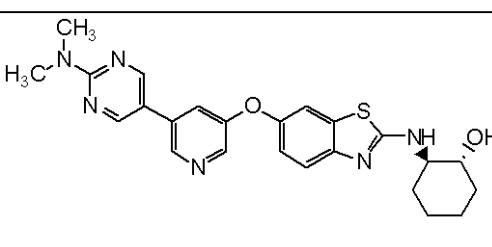
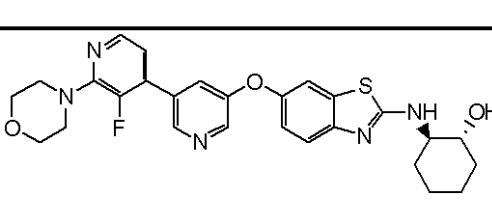
【表10】

5 9		(1R, 2R)-2-(6-(5-(1-(2-methoxyethyl)pyridin-2-yl)-1H-pyrazole-4-yl)pyridin-3-yl)-3-(cyclohexylamino)-2-hydroxypropan-1-ol
6 0		(1R, 2R)-2-(6-(3,4'-bipyridin-5-yl)pyridin-3-yl)-3-(cyclohexylamino)-2-hydroxypropan-1-ol
6 1		(1R, 2R)-2-(6-(5-(1H-pyrazole-4-yl)pyridin-2-yl)pyridin-3-yl)-3-(cyclohexylamino)-2-hydroxypropan-1-ol
6 2		(1R, 2R)-2-(6-(6-(4-methylpiperazin-1-yl)pyridin-2-yl)pyridin-3-yl)-3-(cyclohexylamino)-2-hydroxypropan-1-ol
6 3		(1R, 2R)-2-(6-(5-(2-aminoimidazo[1,2-b]pyridin-5-yl)pyridin-2-yl)pyridin-3-yl)-3-(cyclohexylamino)-2-hydroxypropan-1-ol
6 4		(1R, 2R)-2-(6-(5-(4-fluorophenyl)pyridin-2-yl)pyridin-3-yl)-3-(cyclohexylamino)-2-hydroxypropan-1-ol

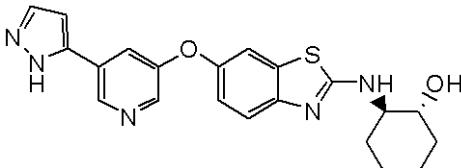
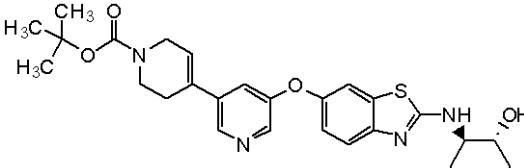
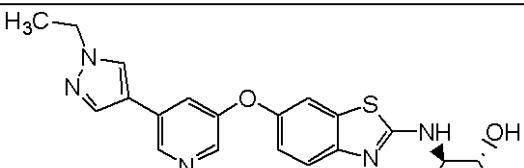
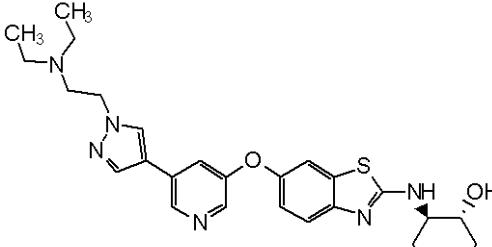
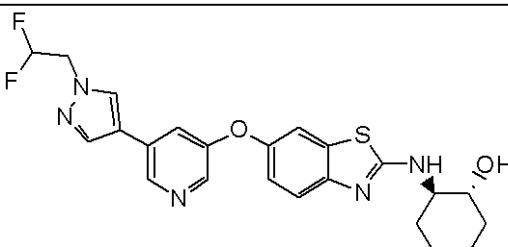
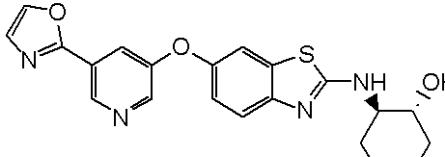
【表11】

65		(1R, 2R)-2-(6-(5-(cyclopropylmethyl)-3-pyridinyl)oxy)-3-(1R,2R)-2-(6-(5-(cyclohexylamino)-3-thienyl)-3-thienyl)-3-thienylamine
66		(1R, 2R)-2-(6-(5-(1-methyl-1H-imidazol-2-yl)-3-pyridinyl)oxy)-3-(1R,2R)-2-(6-(5-(cyclohexylamino)-3-thienyl)-3-thienyl)-3-thienylamine
67		(1R, 2R)-2-(6-(5-(2,3'-bibenzimidazol-5-yl)-3-pyridinyl)oxy)-3-(1R,2R)-2-(6-(5-(cyclohexylamino)-3-thienyl)-3-thienyl)-3-thienylamine
68		(1R, 2R)-2-(6-(5-(1-methyl-1H-imidazol-2-yl)-3-pyridinyl)oxy)-3-(1R,2R)-2-(6-(5-(cyclohexylamino)-3-thienyl)-3-thienyl)-3-thienylamine
69		(1R, 2R)-2-(6-(5-(thiazol-2-yl)-3-pyridinyl)oxy)-3-(1R,2R)-2-(6-(5-(cyclohexylamino)-3-thienyl)-3-thienyl)-3-thienylamine
70		(1R, 2R)-2-(6-(5-(thiazol-5-yl)-3-pyridinyl)oxy)-3-(1R,2R)-2-(6-(5-(cyclohexylamino)-3-thienyl)-3-thienyl)-3-thienylamine
71		N-(cyclohexylmethyl)-N-(6-(5-(4-nitrophenyl)-3-pyridinyl)oxy)-2-(6-(5-(cyclohexylamino)-3-thienyl)-3-thienyl)-3-thienylamine

【表12】

72		(1R, 2R)-2-(6-(6'-モルホリノ-3,3'-ビピリジン-5-イルオキシ)ベンゾ[d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール
73		5'-(2-((1R, 2R)-2-ヒドロキシシクロヘキシルアミノ)ベンゾ[d]チアゾール-6-イルオキシ)-3,3'-ビピリジン-6-カルボニトリル
74		(1R, 2R)-2-(6-(5'-メトキシ-3,3'-ビピリジン-5-イルオキシ)ベンゾ[d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール
75		(5'-(2-((1R, 2R)-2-ヒドロキシシクロヘキシルアミノ)ベンゾ[d]チアゾール-6-イルオキシ)-3,3'-ビピリジン-5-イル)(モルホリノ)メタノン
76		(1R, 2R)-2-(6-(5-(2-(ジメチルアミノ)ピリミジン-5-イル)ピリジン-3-イルオキシ)ベンゾ[d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール
77		(1R, 2R)-2-(6-(3'-フルオロ-2'-モルホリノ-3,4'-ビピリジン-5-イルオキシ)ベンゾ[d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール

【表13】

78		(1R, 2R)-2-(6-(5-(1H-ピラゾール-4-イル)-3-ヒドロ-2-アザビシクロ[2.2.1]ヘプタ-2-イルアミノ)-3-チエニル)ピリジン-3-オキシ)ベンゾ[d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール
79		t <sub>er</sub> t-ブチル-4-(5-(2-(1R, 2R)-2-ヒドロキシシクロヘキシリアミノ)ピリジン-3-イルオキシ)ピリジン-3-イル)-5, 6-ジヒドロピリジン-1(2H)-カルボキシレート
80		(1R, 2R)-2-(6-(5-(1-エチル-1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-イルオキシ)ベンゾ[d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール
81		(1R, 2R)-2-(6-(5-(1-(2-(ジエチルアミノ)エチル)-1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-イルオキシ)ベンゾ[d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール
82		(1R, 2R)-2-(6-(5-(2-(2,2-ジフルオロエチル)-1H-ピラゾール-4-イル)ピリジン-3-イルオキシ)ベンゾ[d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール
83		(1R, 2R)-2-(6-(5-(オキサゾール-2-イル)ピリジン-3-イルオキシ)ベンゾ[d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール

【表 1 4】

【表15】

9 1		(1R, 2R)-2-(6-(1-methyl-1H-pyrazole-5-yl)pyrazin-2-yl)-N-(6-(cyclohexylamino)-2-thiophenyl)-4-methylimidazole-1-ylmethanol [d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール
9 2		(1R, 2R)-2-(6-(1H-pyrazole-4-yl)pyrazin-2-yl)-N-(6-(cyclohexylamino)-2-thiophenyl)-4-methylimidazole-1-ylmethanol [d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール
9 3		(1R, 2R)-2-(6-(1-methyl-1H-pyrazole-4-yl)pyrazin-2-yl)-N-(6-(cyclohexylamino)-2-thiophenyl)-4-methylimidazole-1-ylmethanol [d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール
9 4		(1R, 2R)-2-(6-(1-propyl-1H-pyrazole-4-yl)pyrazin-2-yl)-N-(6-(cyclohexylamino)-2-thiophenyl)-4-methylimidazole-1-ylmethanol [d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール
9 5		(1R, 2R)-2-(6-(1-(2-methoxyethyl)-1H-pyrazole-4-yl)pyrazin-2-yl)-N-(6-(cyclohexylamino)-2-thiophenyl)-4-methylimidazole-1-ylmethanol [d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール
9 6		(1R, 2R)-2-(6-(pyridin-3-yl)pyrazin-2-yl)-N-(6-(cyclohexylamino)-2-thiophenyl)-4-methylimidazole-1-ylmethanol [d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール

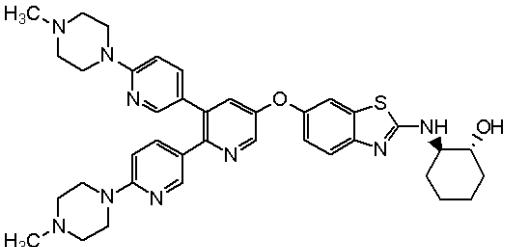
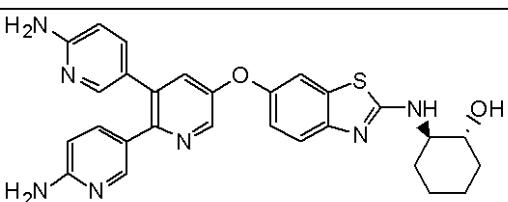
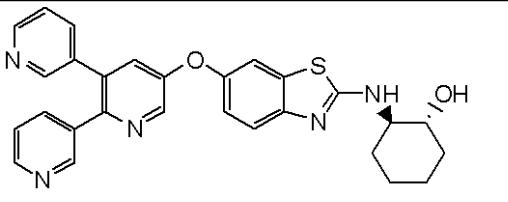
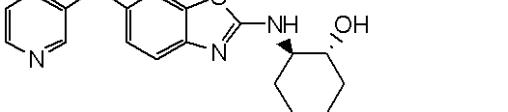
【表16】

97		(1R, 2R)-2-(6-(6-(6-(2-amino-4-chloropyridin-3-yl)pyridin-2-yl)oxy)-3-(cyclohexylamino)-6-hydroxypyridine-2-yl)benzene [d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール
98		(1R, 2R)-2-(6-(6-(4-methylpiperazin-1-yl)pyridin-2-yl)oxy)-3-(cyclohexylamino)-6-hydroxypyridine-2-yl)benzene [d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール
99		(1R, 2R)-2-(6-(5-bromo-2-chloropyridin-3-yl)pyridin-2-yl)oxy)-3-(cyclohexylamino)-6-hydroxypyridine-2-yl)benzene [d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール
100		(S)-6-(6-(2-amino-4-chloropyridin-3-yl)pyridin-2-yl)oxy)-3-(cyclohexylmethylamino)-6-hydroxypyridine-2-yl)benzene [d]チアゾール-2-アミン
101		(S)-N-(1-(cyclohexylmethylamino)-6-(2-hydroxy-4-nitropyridin-3-yl)pyridin-2-yl)benzene [d]チアゾール-2-アミン
102		(1R, 2R)-2-(6-(5-chloro-2-(1-methyl-1H-pyrazin-2-yl)pyridin-3-yl)pyridin-2-yl)oxy)-3-(cyclohexylamino)-6-hydroxypyridine-2-yl)benzene [d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール

【表17】

103		(1R, 2R)-2-(6-(2-chloro-6'-(4-methylpiperazin-1-ylmethyl)-3',3'-bipyridine-5'-yl)oxy)-5-thienylmethylamine cyclohexyl ester [d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール
104		(1R, 2R)-2-(6-(6'-(4-aminophenyl)-2-chloro-3',3'-bipyridine-5'-yl)oxy)-5-thienylmethylamine cyclohexyl ester [d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール
105		(1R, 2R)-2-(6-(2-chloro-6'-(3',3'-bipyridine-5'-ylmethyl)-3',3'-bipyridine-5'-yl)oxy)-5-thienylmethylamine cyclohexyl ester [d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール
106		(1R, 2R)-2-(6-(5,6-bis(1-methyl-1H-pyrazol-4-yl)-4-yl)-2-(5-thienylmethylamino)-3',3'-bipyridine-5'-yl)oxy)cyclohexyl ester [d]チアゾール-2-イルアミノ)シクロヘキサノール

【表18】

107		(1R, 2R)-2-(6-(5, 6-bis(6-(4-methylpiperazin-1-yl)pyridin-4-yl)-3-pyridyl)oxy)-3-thiophenyl-N-(cyclohexyl)amino
108		(1R, 2R)-2-(6-(5, 6-bis(6-(4-aminopyridin-2-yl)pyridin-4-yl)-3-pyridyl)oxy)-3-thiophenyl-N-(cyclohexyl)amino
109		(1R, 2R)-2-(6-(5, 6-bis(6-(4-pyridin-2-yl)pyridin-4-yl)-3-pyridyl)oxy)-3-thiophenyl-N-(cyclohexyl)amino
110		(1R, 2R)-2-(6-(4-(4-hydroxybutyl)-3-thiophenyl)-N-(cyclohexyl)amino)pyridin-2-yl

から選択される、遊離、オキシド、エステル、プロドラッグ、薬学的に許容される塩もしくは溶媒和物の形態の請求項1に記載の化合物。

【請求項30】

有効成分として請求項1～29のいずれかに記載の化合物を含む、ヒトまたは動物対象のCSF-1R活性の阻害に有効な医薬。

【請求項31】

有効成分がCSF-1R阻害について1μM未満のIC<sub>50</sub>値を示す、請求項30に記載の医薬。

【請求項32】

さらなる薬剤をさらに含む、請求項30または31に記載の医薬。

【請求項33】

さらなる薬剤がビスホスホネートである、請求項32に記載の医薬。

【請求項34】

有効成分がRafキナーゼよりもCSF-1Rを選択的に阻害する、請求項30に記載の医薬。

【請求項35】

有効成分がRafキナーゼよりも、IC<sub>50</sub>値において5倍、10倍、20倍、30倍、50倍、100倍、250倍、500倍、750倍、1000倍または2000倍以上の活性でCSF-1Rを阻害する、請求項34に記載の医薬。

【請求項36】

C S F - 1 R 介在性障害ががん、骨粗鬆症、関節炎、アテローム性動脈硬化症、慢性糸球体腎炎および組織球増殖症から成る群から選択される、請求項3 0から3 5の何れかに記載の医薬。

【請求項 3 7】

C S F - 1 R 介在性障害が骨髓性白血病、特発性骨髓線維症、乳がん、子宮頸がん、卵巣がん、子宮内膜がん、前立腺がん、肝細胞がん、多発性骨髓腫、肺がん、腎臓がん、骨がん、色素性絨毛結節性滑膜炎および腱鞘巨細胞腫から成る群から選択される、請求項3 0から3 5の何れかに記載の医薬。

【請求項 3 8】

C S F - 1 R 介在性障害がリウマチ様関節炎である、請求項3 0から3 5の何れかに記載の医薬。

【請求項 3 9】

C S F - 1 R をインピトロで阻害する方法であって、細胞と請求項 1 ~ 7 の何れかの化合物を接触させることを含む方法。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 0 0 6

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 0 0 6】

近年の Herceptin (登録商標) および Avastin (登録商標) の成功は、特異的生物学的標的を標的とした治療薬の開発の重要性を強調する。これらの薬剤は有害事象を低減し、より大きな予測可能性を有し、処置において医師による柔軟性がより大きくなり、そして特定の標的のよりよい理解を研究者らに与えることができる。さらに、標的治療は、同一のシグナル伝達経路によって影響される複数の適応症を、より少なく、潜在的により容易に毒性を管理して、処置することが可能となる (BioCentury, V. 14(10) Feb, 2006)。がんまたは他の疾患に関連した経路において組み込まれる C S F - 1 R のような個々のキナーゼの阻害は、下流キナーゼを効果的に調節することができ、それによって全経路に作用を及ぼすことができる。しかし、491種のヒトプロテインキナーゼドメインの活性部位は高度に保存されており、これが選択的阻害剤の設計を極めて困難な挑戦としている (Cohen 2005)。したがって、選択的 C S F - 1 R 阻害剤のような選択的キナーゼ阻害剤が必要とされている。

【手続補正 3】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0 1 7 4

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0 1 7 4】

有糸分列進行に関与するキナーゼの阻害剤は、オーロラキナーゼの阻害剤、Polo 様キナーゼ (PLK) の阻害剤 (例えば PLK - 1 の阻害剤)、bub - 1 の阻害剤および bub - 1 R の阻害剤を含むが、これらに限定されない。抗増殖剤は、アンチセンス RNA および DNA オリゴヌクレオチド、例えば G3139、ODN698、RVASKRA S、GEM231 および INX3001、ならびに代謝拮抗剤、例えばエノシタビン、カルモフル、テガフル、ペントスタチン、ドキシフルリジン、トリメトレキセート、フルダラビン、カペシタビン、ガロシタビン、シタラビンオクフォスフェート、フォステアビンナトリウム水和物、ラルチトレキセド、パルチトレキシド、エミテフル、チアゾフリン、デシタビン、ノラトレキセド、ペメトレキセド、ネルザラビン、2' - デオキシ - 2' - メチリデンシチジン、2' - フルオロメチレン - 2' - デオキシシチジン、N - [5 - (2,3 - ジヒドロ - ベンゾフリル) スルホニル] - N' - (3,4 - ジクロロフェニル) ウレア、N6 - [4 - デオキシ - 4 - [N2 - [2 (E), 4 (E) - テトラデカ

ジエノイル]グリシルアミノ]-L-グリセロ-B-L-マンノ-ヘプトピラノシリ]アデニン、アブリジン、エクチナサイジン、トロキサシタビン、4-[2-アミノ-4-オキソ4,6,7,8-テトラヒドロ-3H-ピリミジノ[5,4-b][1,4]チアジン-6-イル-(S)-エチル]-2,5-チエニル-L-グルタミン酸、アミノブテリン、5-フルオロウラシル、アラノシン、11-アセチル-8-(カルバモイルオキシメチル)-4-ホルミル-6-メトキシ-14-オキサ-1,1-ジアザテトラシクロ(7.4.1.0.0)-テトラデカ-2,4,6-トリエン-9-イル酢酸エステル、スウェインソニン、ロメトレキソール、デクスラゾキサン、メチオニナーゼ、2'-シアノ-2'-デオキシ-N4-パルミトイyl-1-B-D-アラビノフラノシリシトシンおよび3-アミノピリジン-2-カルボキシアルデヒドチオセミカルバゾンを含む。治療剤を標的としたモノクローナル抗体は、がん細胞特異的または標的細胞特異的モノクローナル抗体と結合した細胞傷害剤またはラジオアイソトープを有する治療剤を含む。例えばBexarが含まれる。HMG-CoAレダクターゼ阻害剤は、3-ヒドロキシ-3-メチルグルタリール-CoAレダクターゼの阻害剤である。HMG-CoAレダクターゼの阻害活性を有する化合物は、当該技術分野において周知のアッセイ、例えば米国特許第4,231,938号およびWO 84/02131に記載または引用されているものを用いて、容易に同定することができる。使用することができるHMG-CoAレダクターゼ阻害剤の例は、ロバスタチン(MEVACOR(登録商標))；米国特許第4,231,938号、第4,294,926号および第4,319,039号参照)、シンバスタチン(ZOCOR(登録商標))；米国特許第4,444,784号、第4,820,850号および第4,916,239号参照)、プラバスタチン(PRAVACHOL(登録商標))；米国特許第4,346,227号、第4,537,859号、第4,410,629号、第5,030,447号および第5,180,589号参照)、フルバスタチン(LESCOL(登録商標))；米国特許第5,354,772号、第4,911,165号、第4,929,437号、第5,189,164号、第5,118,853号、第5,290,946号および第5,356,896号参照)およびアトルバスタチン(LIPITOR(登録商標))；米国特許第5,273,995号、第4,681,893号、第5,489,691号および第5,342,952号参照)を含むが、これらに限定されない。これらおよび本方法に使用することができるさらなるHMG-CoAレダクターゼ阻害剤の構造式は、M. Yalpani, "Cholesterol Lowering Drugs", Chemistry & Industry, pp. 85-89 (5 Feb. 1996)の87ページおよび米国特許第4,782,084号および第4,885,314号に記載されている。ある態様において、HMG-CoAレダクターゼ阻害剤はロバスタチンまたはシンバスタチンから選択される。

## 【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0184

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0184】

本体用の化合物と他の抗がん剤は、推奨される最大臨床用量またはより少ない用量で投与することができる。本態様の組成物における活性化合物の用量レベルは、投与経路、疾患の重症度および患者の応答に基づいて、望まれる治療応答が得られるように変化し得る。本組合せは、別個の組成物として、または療法の薬剤を含む単剤形態として投与することができる。組合せとして投与するとき、治療剤は別個の組成物として、同時もしくは別の時点で投与される組成物として、または1個の組成物として投与することができる治療剤を製剤することができる。