

【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6月7日(2012.6.7)

【公開番号】特開2010-111691(P2010-111691A)

【公開日】平成22年5月20日(2010.5.20)

【年通号数】公開・登録公報2010-020

【出願番号】特願2010-195(P2010-195)

【国際特許分類】

C 0 7 D 417/04 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/428 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/409 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 417/04 C S P

C 0 7 D 417/14 Z N A

A 6 1 K 31/428

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/454

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/409

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 27/02

A 6 1 P 29/00 1 0 1

A 6 1 P 17/00

A 6 1 P 37/08

A 6 1 P 17/06

A 6 1 P 11/06

A 6 1 P 13/12

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 3/10

【手続補正書】

【提出日】平成24年4月16日(2012.4.16)

【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

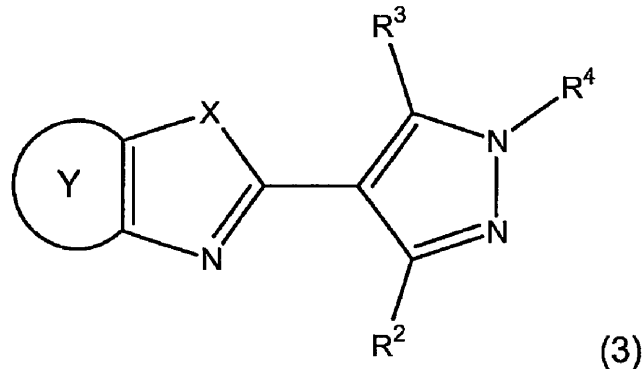
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

哺乳類における過剰増殖性疾患の治療のための薬剤の調製における組成物の使用であって、前記組成物が、薬学的に許容される賦形剤と、化学式(3)：



(式中、

R^2 および R^3 はそれぞれ、アミノ、アミノスルフィニル、アミノスルホニル、アリール、アジド、ハロゲン、ヘテロアルキル、ヘテロアリール、ヒドラジニル、ヒドロカルビル、水素、ヒドロキシル、ニトロ、ニトロソ、ホスフェート、ホスフィネート、ホスホネート、ホスホニウム、ホスホロチオエート、ホスホリル、スルファモイル、スルフェート、スルフィン酸、スルホンアミド、スルホネート、スルホン酸、スルホニル、スルホキシド、チオール、チオウレイド、およびウレイドから選択され；

R^4 は、水素、ヘテロアルキル、ヘテロアリール、およびヒドロカルビルから選択され；

Xは、S、O、および NR^9 から選択され、 R^9 は、水素、ヘテロアルキル、ヘテロアリール、およびヒドロカルビルから選択され；

Yは1または2の窒素原子を有する6員複素環であり、選択的に、アミノ、アミノスルフィニル、アミノスルホニル、アリール、アジド、ハロゲン、ヘテロアルキル、ヘテロアリール、ヒドラジニル、ヒドロカルビル、水素、ヒドロキシル、ニトロ、ニトロソ、ホスフェート、ホスフィネート、ホスホネート、ホスホニウム、ホスホロチオエート、ホスホリル、スルファモイル、スルフェート、スルフィン酸、スルホンアミド、スルホネート、スルホン酸、スルホニル、スルホキシド、チオール、チオウレイド、およびウレイドから選択される1または複数の基によりさらに置換される。)

の化合物を単一の互変異性体、互変異性体混合物、単一の立体異性体、立体異性体混合物、もしくはラセミ体混合物として；または薬学的に許容されるそれらの塩もしくは溶媒和物とを含む薬学的組成物である、

使用。

【請求項 2】

ヘテロアルキルが、アミノヒドロカルボイル(すなわち、 $-NH-C(=O)-Hy$)、アミド(すなわち、 $-C(=O)-NH_2$)、カルボン酸(すなわち、 $-COOH$)、シアノ(すなわち、 $-CN$)、ジヒドロカルビルアミド(すなわち、 $-C(=O)-N(Hy)(Hy)$)、ジヒドロカルビルアミノ(すなわち、 $-N(Hy)(Hy)$)、ジ(ヒドロカルビル)ホスフィド、ホルミル(すなわち、 $-C(=O)H$)、ヒドロカルボイル(すなわち、 $-C(=O)-Hy$)、ヒドロカルボイルオキシ(すなわち、 $-O-C(=O)-Hy$)、ヒドロカルビルアミノ(すなわち、 $-NH-Hy$)、ヒドロカルビルオキシ(すなわち、 $-O-Hy$)、ヒドロカルビルオキシカルボニル(すなわち、 $-C(=O)-O-Hy$)、ヒドロカルビルシロキシ、ヒドロカルビルシリルアミノ、ヒドロカルビルスルフィド(すなわち、 $-S-Hy$)、ヒドロカルビルチオ、ヒドロカルビルアミド(すなわち、 $-C(=O)-N(H)(Hy)$)、イソチオシアネート、N-複素環、パーフルオロヒドロカルビル、チオシアネート、ならびにアルキルアミノ、アミノ、アミノスルフィニル、アミノスルホニル、アジド、ジアルキルアミノ、ハロゲン、ヘ

テロアルキル、ヘテロアリール、ヒドラジニル、ヒドロキシル、ニトロ、ニトロソ、ホスフェート、ホスフィネート、ホスホネート、ホスホニウム、ホスホロチオエート、ホスホリル、スルファモイル、スルフェート、スルフィン酸、スルホンアミド、スルホネート、スルホン酸、スルホニル、スルホキシド、チオール、チオウレイド、およびウレイドから選択される1または複数の基により置換されたヒドロカルビルから選択される、請求項1記載の使用。

【請求項3】

ヒドロカルビルが、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキレン、およびアリールからなる群より選択され、ここで、

アルキル、アルケニル、およびアルキニルは、シクロアルキル、シクロアルキレン、およびアリールから選択される1または複数の Hy^1 基で選択的に置換され、ここで各 Hy^1 基は、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキレン、およびアリールから選択される1または複数の Hy^2 基により選択的に置換され；

シクロアルキル、シクロアルキレン、およびアリールは、1または複数の Hy^2 基により選択的に置換され；

ただし、 Hy^2 がアルキル、アルケニル、またはアルキニルから選択される場合、 Hy^2 は、シクロアルキル、シクロアルキレン、およびアリールから選択される1または複数の Hy^3 基により置換されてもよく、ここで各 Hy^3 基は、アルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、シクロアルキレン、およびアリールから選択される1または複数の Hy^4 基により選択的に置換され、 Hy^2 がシクロアルキル、シクロアルキレン、およびアリールから選択される場合、 Hy^2 は1または複数の Hy^4 基により選択的に置換されることを条件とし；

さらに、アリールは非芳香族炭化水素環に縮合されたアリール環を含むことを条件とする、請求項1記載の使用。

【請求項4】

各場合の R^1 が水素である、請求項1～3のいずれか一項記載の使用。

【請求項5】

R^4 が水素である、請求項1～4のいずれか一項記載の使用。

【請求項6】

R^4 が $\text{C}_1 \sim \text{C}_8$ ヒドロカルビルである、請求項1～4のいずれか一項記載の使用。

【請求項7】

R^2 が水素である、請求項1～6のいずれか一項記載の使用。

【請求項8】

R^2 が低級アルキルおよび低級ハロアルキルから選択される、請求項1～6のいずれか一項記載の使用。

【請求項9】

R^2 がアミノである、請求項1～6のいずれか一項記載の使用。

【請求項10】

R^2 が複素環である、請求項1～6のいずれか一項記載の使用。

【請求項11】

R^2 がN-複素環である、請求項1～6のいずれか一項記載の使用。

【請求項12】

R^2 がヒドロカルビルである、請求項1～6のいずれか一項記載の使用。

【請求項13】

R^3 が水素である、請求項1～12のいずれか一項記載の使用。

【請求項14】

R^3 がフェニルおよび置換フェニルから選択される、請求項1～12のいずれか一項記載の使用。

【請求項15】

R^3 が、アミノ、アミノスルフィニル、アミノスルホニル、アリール、アジド、ハロゲン、ヘテロアルキル、ヘテロアリール、ヒドラジニル、ヒドロカルビル、水素、ヒドロキシ

ル、ニトロ、ニトロソ、ホスフェート、ホスフィネート、ホスホネート、ホスホニウム、ホスホロチオエート、ホスホリル、スルファモイル、スルフェート、スルフィン酸、スルホンアミド、スルホネート、スルホン酸、スルホニル、スルホキシド、チオール、チオウレイド、およびウレイドから選択される1または複数の置換基により置換されたフェニルである、請求項14記載の使用。

【請求項16】

R^3 が、ヒドロキシル、低級アルコキシ、低級アルキルから選択される1または複数の置換基で置換されたフェニルである、請求項14記載の使用。

【請求項17】

R^3 がヘテロアルキルである、請求項1～12のいずれか一項記載の使用。

【請求項18】

R^3 が、アミノ、ヒドロカルビルアミノ、およびジヒドロカルビルアミノから選択される、請求項1～12のいずれか一項記載の使用。

【請求項19】

R^3 がヒドロカルビルアミノであり、ここでヒドロカルビルはアラルキルである、請求項18記載の使用。

【請求項20】

R^3 がヒドロカルビルアミノであり、ここでヒドロカルビルはアルキルである、請求項18記載の使用。

【請求項21】

R^3 がアミノである、請求項18記載の使用。

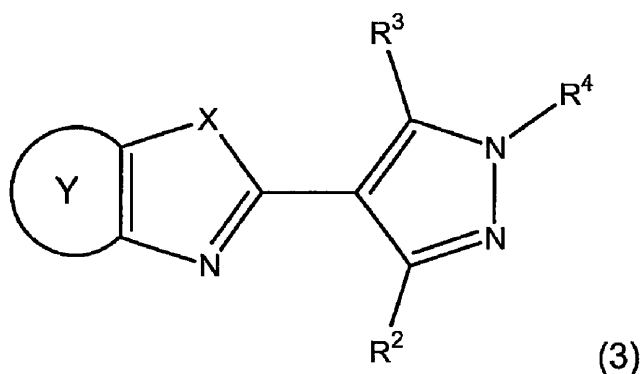
【請求項22】

R^3 がヒドロカルビルである、請求項1～12のいずれか一項記載の使用。

【請求項23】

哺乳類における過剰増殖性疾患の治療のための薬剤の調製における化合物の使用であって、前記化合物が、

単一の互変異性体、互変異性体混合物、単一の立体異性体、立体異性体混合物、もしくはラセミ体混合物としての化学式(3)：



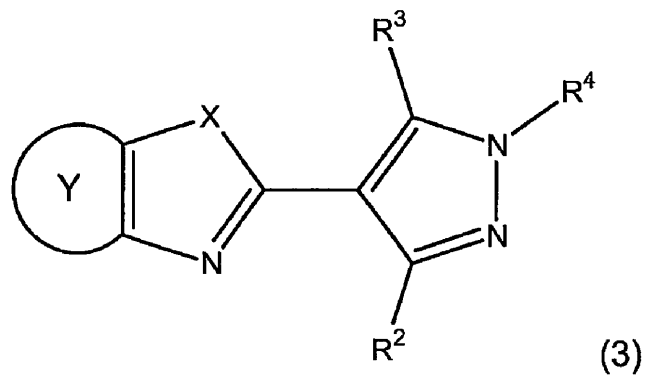
の化合物；または薬学的に許容されるそれらの塩もしくは溶媒和物であって；ここで、各場合の R^3 は複素環であり；

R^2 、 R^4 、X、及びYは、前記請求項1に記載した定義に同じである、使用。

【請求項24】

哺乳類における過剰増殖性疾患の治療のための薬剤の調製における化合物の使用であって、前記化合物が、

単一の互変異性体、互変異性体混合物、単一の立体異性体、立体異性体混合物、もしくはラセミ体混合物としての化学式(3)：



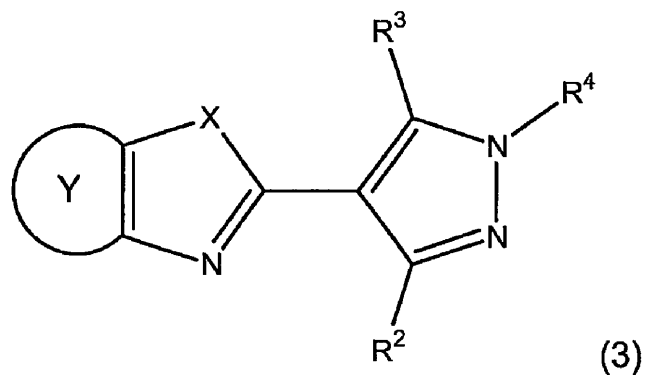
の化合物；または薬学的に許容されるそれらの塩もしくは溶媒和物であって；ここで、
各場合の R^2 はアミノであり；

R^3 は、ヒドロカルビル、-O-ヒドロカルビル、および-S-ヒドロカルビルから選択され；
 R^4 、X、及びYは、前記請求項 1 に記載した定義に同じである、使用。

【請求項 2 5】

哺乳類における過剰増殖性疾患の治療のための薬剤の調製における化合物の使用であって、前記化合物が、

単一の互変異性体、互変異性体混合物、単一の立体異性体、立体異性体混合物、もしくはラセミ体混合物としての化学式(3)：



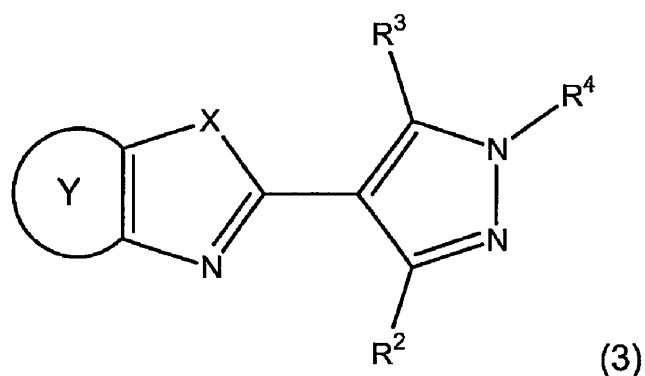
の化合物；または薬学的に許容されるそれらの塩もしくは溶媒和物であって；ここで、
各場合の R^3 は水素であり；

R^2 、 R^4 、X、及びYは、前記請求項 1 に記載した定義に同じである、使用。

【請求項 2 6】

哺乳類における過剰増殖性疾患の治療のための薬剤の調製における化合物の使用であって、前記化合物が、

単一の互変異性体、互変異性体混合物、単一の立体異性体、立体異性体混合物、もしくはラセミ体混合物としての化学式(3)：



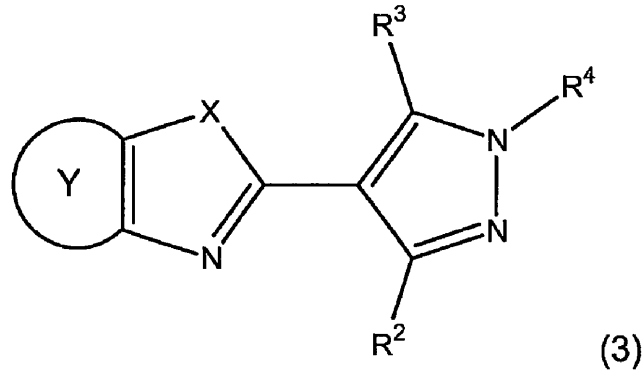
の化合物；または薬学的に許容されるそれらの塩もしくは溶媒和物であって；ここで、各場合の R^3 はヒドロカルビルであり；

R^2 、 R^4 、X、及びYは、前記請求項1に記載した定義に同じである、使用。

【請求項27】

哺乳類における過剰増殖性疾患の治療のための薬剤の調製における化合物の使用であって、前記化合物が、

単一の互変異性体、互変異性体混合物、単一の立体異性体、立体異性体混合物、もしくはラセミ体混合物としての化学式(3)：



の化合物；または薬学的に許容されるそれらの塩もしくは溶媒和物であって；ここで、各場合の R^3 はハロゲン置換ヒドロカルビルであり；

R^2 、 R^4 、X、及びYは、前記請求項1に記載した定義に同じである、使用。

【請求項28】

過剰増殖性疾患が腫瘍細胞の増殖を含む、請求項1～27のいずれか一項記載の使用。

【請求項29】

過剰増殖性疾患が新生内膜過形成を含む、請求項1～27のいずれか一項記載の使用。

【請求項30】

過剰増殖性疾患がリンパ増殖性疾患である、請求項1～27のいずれか一項記載の使用。

【請求項31】

過剰増殖性疾患が血管形成または新血管形成を含む、請求項1～27のいずれか一項記載の使用。

【請求項32】

新血管形成が眼新血管形成である、請求項31記載の使用。

【請求項33】

眼新血管形成が、角膜、虹彩、網膜、または脈絡膜の新血管形成である、請求項32記載の使用。