

【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27年12月17日 (2015.12.17)

【公表番号】特表2015-520770(P2015-520770A)

【公表日】平成27年7月23日 (2015.7.23)

【年通号数】公開・登録公報2015-046

【出願番号】特願2015-514538(P2015-514538)

【国際特許分類】

C 0 7 D 215/54 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/47 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/18 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 215/54 C S P

C 0 7 D 401/04

A 6 1 K 31/47

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 1/04

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 15/00

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 1/18

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 43/00 1 0 1

【手続補正書】

【提出日】平成27年10月23日 (2015.10.23)

【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

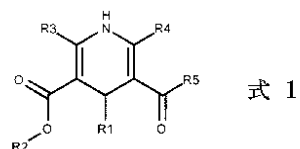
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

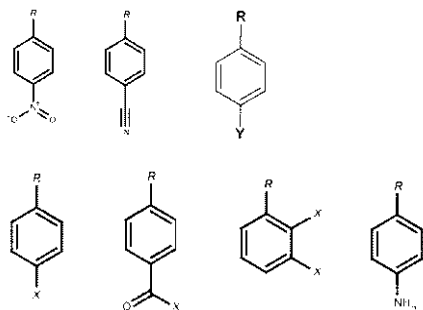
分泌依存性疾患の治療用の薬剤として使用される n o t c h シグナル伝達経路の阻害物質としての下記一般式 I に従う化合物：

【化 1】



(式中、R 1 は、

【化 2】

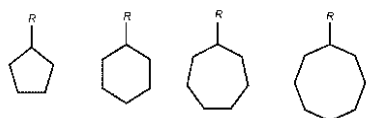


の 1 つであり、

ここで、X は H 又は F、Cl、Br 若しくは I で代表されるハロゲンであり、Y は COOCH₃ 若しくは CF₃、又は COOH であり、

R 2 は C₁ ~ C₈ の直鎖若しくは分岐アルキル基、又は C₅ ~ C₈ の炭素環構造、又は

【化 3】

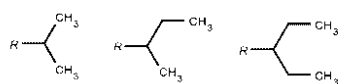


の 1 つであり、

R 3 は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基であり、

R 4 は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基、又は

【化 4】



から選択される分岐アルキル基であり、

R 5 は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基であり、

R 4 及び R 5 が C₃ 基により閉環して、基：

【化 5】



を有する C₆ 環構造を形成してもよく、

ここで、R 6 及び / 又は R 7 は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基であり、

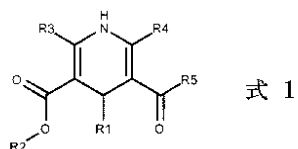
、

置換基 R 1、R 2、R 4、R 5 の「R」は一般式 I の骨格を表す)。

【請求項 2】

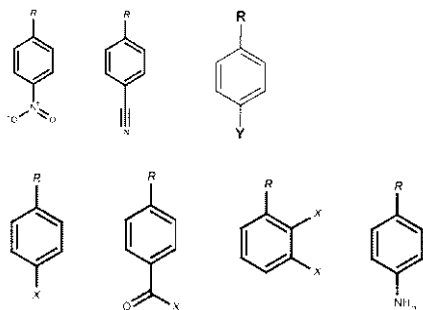
老化プロセスの減速、逆転 及び / 又は未然の阻害用の薬剤として使用される下記一般式 I に従う化合物：

【化 6】



(式中、R 1 は、

【化 7】

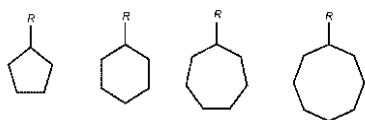


の 1 つであり、

ここで、X は H 又は F、Cl、Br 若しくは I で代表されるハロゲンであり、Y は COOCH₃ 若しくは CF₃、又は COOH であり、

R 2 は C₁ ~ C₈ の直鎖若しくは分岐アルキル基、又は C₅ ~ C₈ の炭素環構造、又は

【化 8】

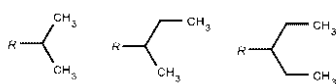


の 1 つであり、

R 3 は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基であり、

R 4 は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基、又は

【化 9】



から選択される分岐アルキル基であり、

R 5 は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基であり、

R 4 及び R 5 が C₃ 基により閉環して、基：

【化 10】



を有する C₆ 環構造を形成してもよく、

ここで、R 6 及び / 又は R 7 は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基であり、

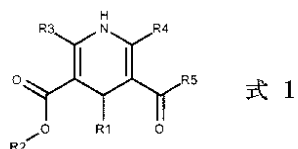
、

置換基 R 1、R 2、R 4、R 5 の「R」は一般式 I の骨格を表す)。

【請求項 3】

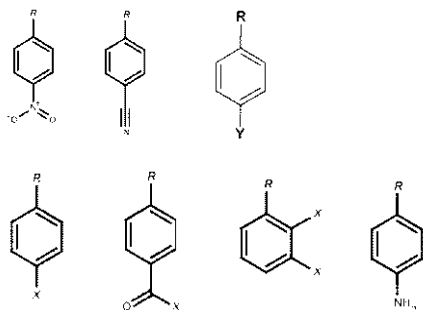
癌の予防処置の薬剤として使用される下記一般式 I に従う化合物：

【化 1 1】



(式中、R 1 は、

【化 1 2】

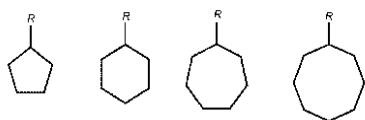


の 1 つであり、

ここで、X は H 又は F、Cl、Br 若しくは I で代表されるハロゲンであり、Y は COOCH₃ 若しくは CF₃、又は COOH であり、

R 2 は C₁ ~ C₈ の直鎖若しくは分岐アルキル基、又は C₅ ~ C₈ の炭素環構造、又は

【化 1 3】

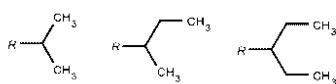


の 1 つであり、

R 3 は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基であり、

R 4 は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基、又は

【化 1 4】



から選択される分岐アルキル基であり、

R 5 は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基であり、

R 4 及び R 5 が C₃ 基により閉環して、基：

【化 1 5】



を有する C₆ 環構造を形成してもよく、

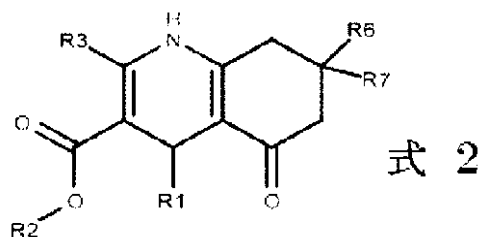
ここで、R 6 及び / 又は R 7 は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基であり、

置換基 R 1、R 2、R 4、R 5 の「R」は一般式 I の骨格を表す)。

【請求項 4】

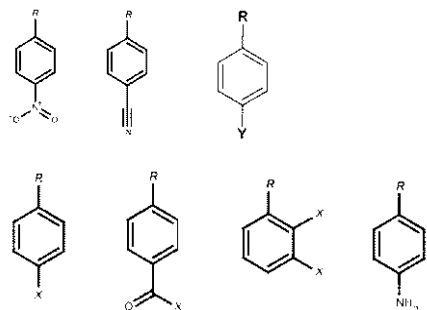
下記一般式 I I を有する、癌の処置の薬剤として使用される化合物：

【化 1 6】



(式中、 (式中、 R 1 は、

【化 1 7】

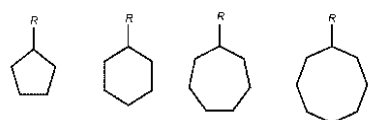


の 1 つであり、

ここで、X は H 又は F、Cl、Br 若しくは I で代表されるハロゲンであり、Y は COOCH₃ 若しくは CF₃、又は COOH であり、

R 2 は C₁ ~ C₈ の直鎖若しくは分岐アルキル基、又は C₅ ~ C₈ の炭素環構造、又は

【化 1 8】



の 1 つであり、

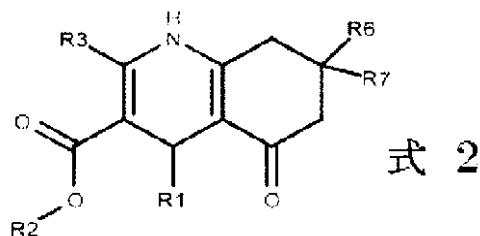
R 3 は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基であり、

R 6 及び / 又は R 7 は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基である) 。

【請求項 5】

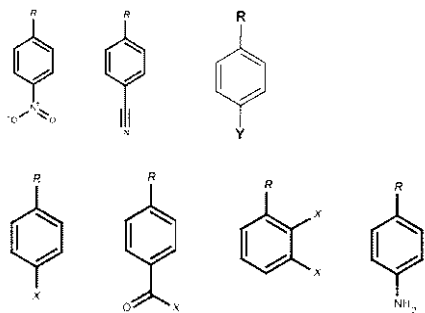
下記一般式 I I を有する、老化プロセスの減速、逆転 及び / 又は未然の阻害用の薬剤として使用される化合物：

【化 1 9】



(式中、 (式中、 R 1 は、

【化 2 0】

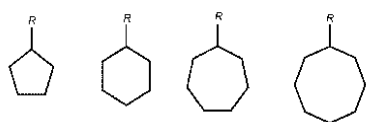


の 1 つであり、

ここで、X は H 又は F、C l、B r 若しくは I で代表されるハロゲンであり、Y は C O O C H₃ 若しくは C F₃、又は C O O H であり、

R₂ は C₁ ~ C₈ の直鎖若しくは分岐アルキル基、又は C₅ ~ C₈ の炭素環構造、又は

【化 2 1】



の 1 つであり、

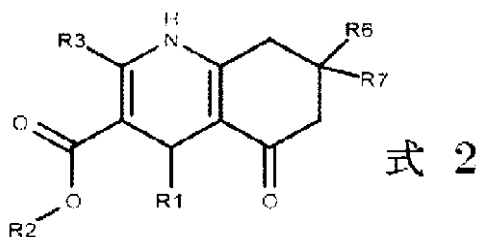
R₃ は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基であり、

R₆ 及び / 又は R₇ は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基である)。

【請求項 6】

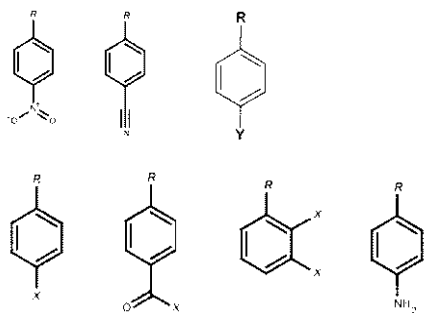
下記一般式 I I を有する、癌の予防処置用の薬剤として使用される化合物：

【化 2 2】



(式中、(式中、R₁ は、

【化 2 3】

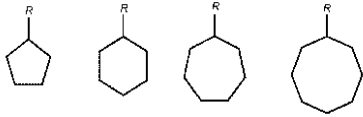


の 1 つであり、

ここで、X は H 又は F、C l、B r 若しくは I で代表されるハロゲンであり、Y は C O O C H₃ 若しくは C F₃、又は C O O H であり、

R₂ は C₁ ~ C₈ の直鎖若しくは分岐アルキル基、又は C₅ ~ C₈ の炭素環構造、又は

【化 2 4】



の 1 つであり、

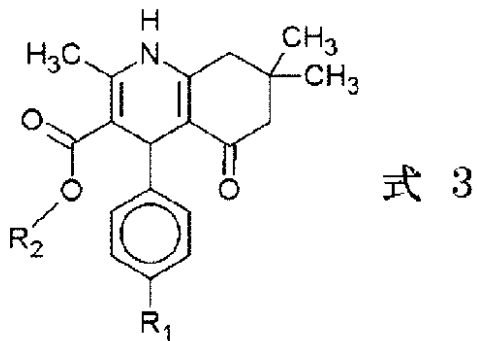
R 3 は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基であり、

R 6 及び / 又は R 7 は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基である) 。

【請求項 7】

下記一般式 I I I を有する、癌の処置の薬剤として使用される化合物：

【化 7】

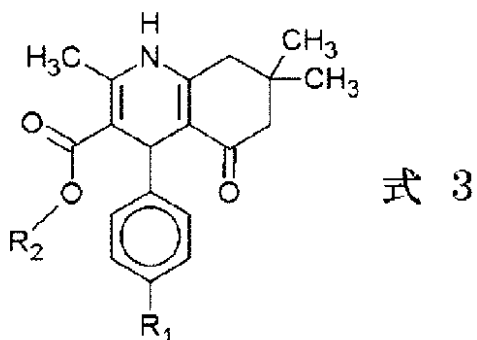


(式中、R 1 は H、COOCH₃、COOH、CN、NO₂、CF₃ 又は NH₂ であり、R 2 は C₁ ~ C₈ 若しくは C₂ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基、又は C₅、C₆、C₇ 若しくは C₈ の炭素環構造である) 。

【請求項 8】

下記一般式 I I I を有する、老化プロセスの減速、逆転 及び / 又は未然の阻害用の薬剤として使用される化合物：

【化 2 6】

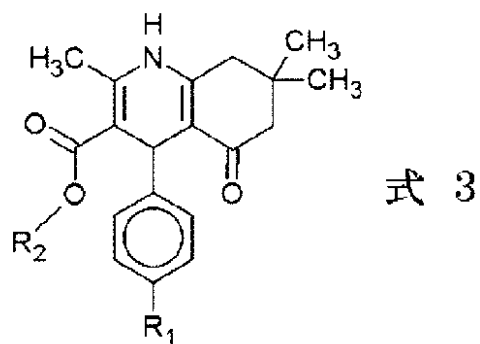


(式中、R 1 は H、COOCH₃、COOH、CN、NO₂、CF₃ 又は NH₂ であり、R 2 は C₁ ~ C₈ 若しくは C₂ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基、又は C₅、C₆、C₇ 若しくは C₈ の炭素環構造である) 。

【請求項 9】

下記一般式 I I I を有する、癌の予防処置用の薬剤として使用される化合物：

【化 2 7】

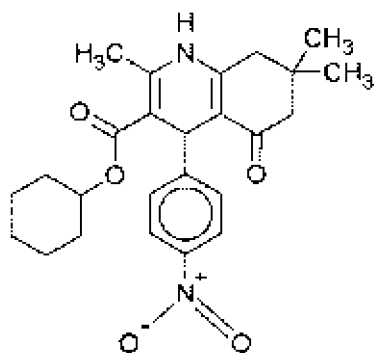


(式中、R₁はH、COOCH₃、COOH、CN、NO₂、CF₃又はNH₂であり、R₂はC₁～C₈若しくはC₂～C₆の直鎖若しくは分岐アルキル基、又はC₅、C₆、C₇若しくはC₈の炭素環構造である)。

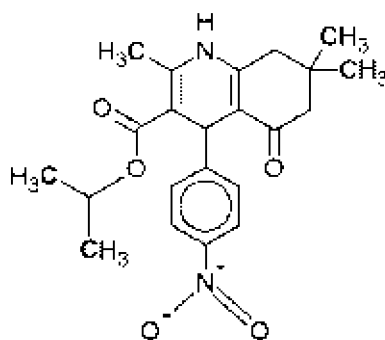
【請求項 10】

以下の化合物グループから選択される請求項7～9のいずれかーに記載の薬剤として使用される化合物：

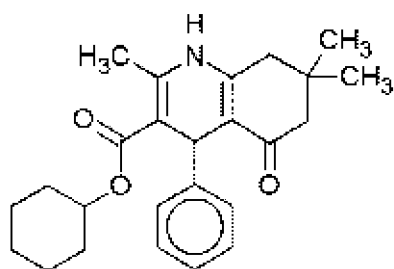
【化 2 8】



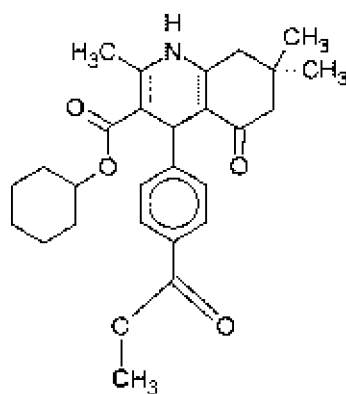
FLI-06



FLI-24

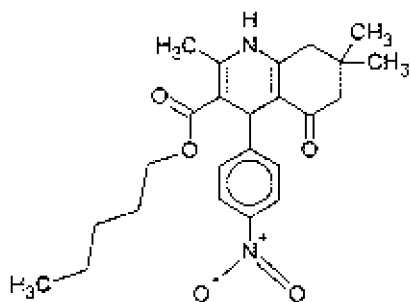


FLI-25

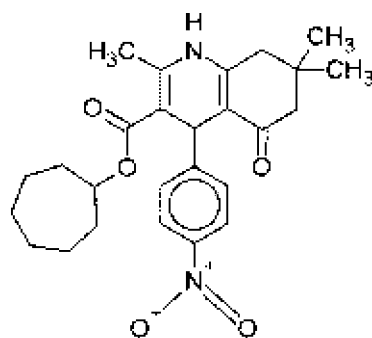


FLI-26

5



FLI-27



FLI-28

【請求項 1 1】

癌の処置のための請求項 1、4、7 又は 10 のいずれかーに記載の薬剤としての使用のための化合物であって、そこにおいて癌が、慢性リンパ球性白血病（CLL）、食道がん、神経膠腫、結腸がん、血液がん、大腸がん、子宮頸がん、膵臓がん、乳がん又は肺がんである、化合物。

【請求項 1 2】

血液がんが、リンパ腫又は白血病であり、該リンパ腫が T 細胞リンパ腫、B 細胞リンパ腫又はホジキンリンパ腫である、請求項 1 1 に記載の化合物。

【請求項 1 3】

請求項 2、5、8 又は 10 のいずれかーに記載の薬剤としての使用のための化合物であって、老化プロセスが細胞老化関連分泌現象（SASP）によって特徴付けられ、SASP が炎症誘発性サイトカイン、又は IL-6 及び IL-8 の分泌により特徴付けられる、化合物。

【請求項 1 4】

請求項 1 ~ 1 3 のいずれか一項に記載の化合物の 1 つ又は複数と、薬学的に許容可能な

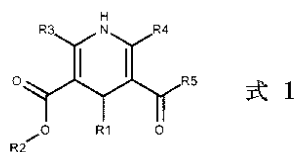
担体物質とを含む医薬組成物。

【請求項 15】

n o t c h シグナル伝達経路の阻害物質としての一般式 I、一般式 I I 又は一般式 I I I のいずれかに記載の化合物の i n v i t r o 使用；

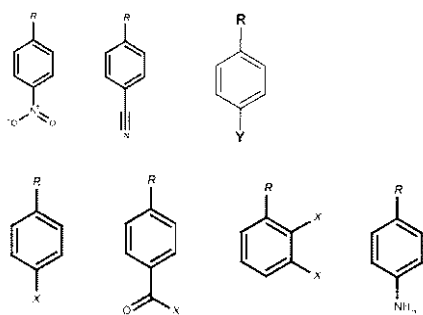
一般式 I を有する化合物：

【化 29】



(式中、R 1 は、

【化 30】

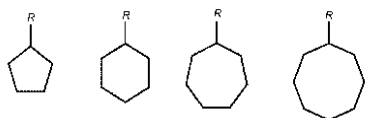


の 1 つであり、

ここで、X は H 又は F、C l、B r 若しくは I で代表されるハロゲンであり、Y は C O O C H₃ 若しくは C F₃、又は C O O H であり、

R 2 は C₁ ~ C₈ の直鎖若しくは分岐アルキル基、又は C₅ ~ C₈ の炭素環構造、又は

【化 31】

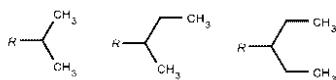


の 1 つであり、

R 3 は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基であり、

R 4 は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基、又は

【化 32】



から選択される分岐アルキル基であり、

R 5 は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基であり、

R 4 及び R 5 が C₃ 基により閉環して、基：

【化 33】



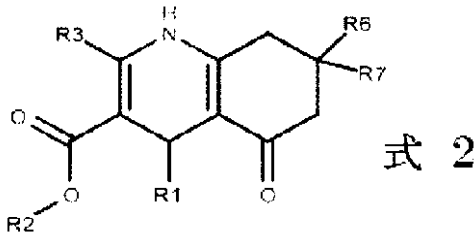
を有する C₆ 環構造を形成してもよく、

ここで、R 6 及び / 又は R 7 は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基であり、

置換基 R₁、R₂、R₄、R₅の「R」は一般式 I の骨格を表す）、

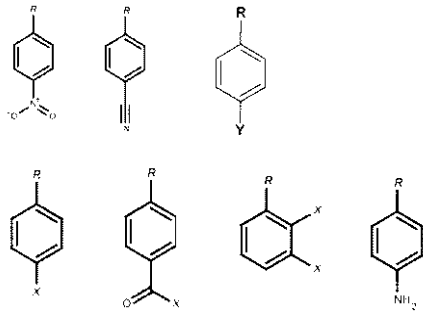
一般式 I I を有する化合物：

【化 3 4】



(式中、(式中、R₁は、

【化 3 5】

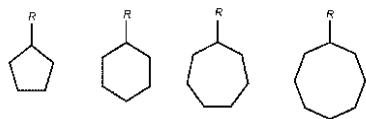


の 1 つであり、

ここで、X は H 又は F、Cl、Br 若しくは I で代表されるハロゲンであり、Y は COOCH₃ 若しくは CF₃、又は COOH であり、

R₂ は C₁ ~ C₈ の直鎖若しくは分岐アルキル基、又は C₅ ~ C₈ の炭素環構造、又は

【化 3 6】



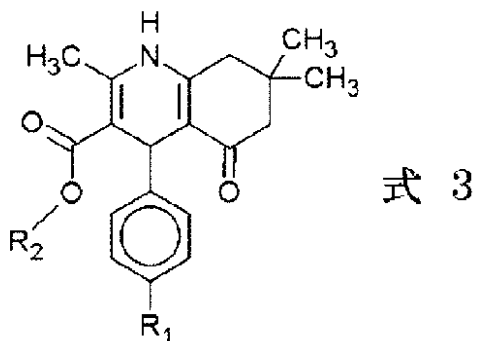
の 1 つであり、

R₃ は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基であり、

R₆ 及び / 又は R₇ は H、又は C₁ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基である）、

一般式 I I I を有する化合物：

【化 3 7】



(式中、R₁ は H、COOCH₃、COOH、CN、NO₂、CF₃ 又は NH₂ であり、R₂ は C₁ ~ C₈ 若しくは C₂ ~ C₆ の直鎖若しくは分岐アルキル基、又は C₅、C₆、

C₇ 若しくは C₈ の炭素環構造である)。