

【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22年11月4日(2010.11.4)

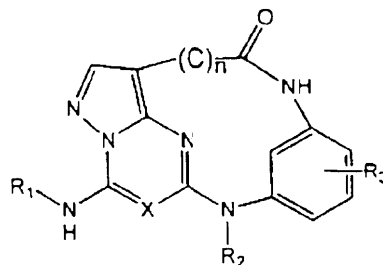
【公表番号】特表2010-503690(P2010-503690A)  
 【公表日】平成22年2月4日(2010.2.4)  
 【年通号数】公開・登録公報2010-005  
 【出願番号】特願2009-528344(P2009-528344)  
 【国際特許分類】

C 0 7 D 487/18 (2006.01)  
 A 6 1 K 31/53 (2006.01)  
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)  
 A 6 1 P 37/06 (2006.01)  
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 487/18 C S P  
 A 6 1 K 31/53  
 A 6 1 P 35/00  
 A 6 1 P 25/00  
 A 6 1 P 37/06  
 A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】  
 【提出日】平成22年9月14日(2010.9.14)  
 【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】  
 構造  
 【化1】



[ここで

$R_1$ は場合により置換されていることができるアルキル、アルケニル、アルキニル、シクロアルキル、アリール又はヘテロアリールであり、

$R_2$ は水素、アルキル、アルケニル、アルキニル、アリール又はヘテロアリールであり、

$R_3$ は水素、場合により置換されていることができるアルキル、アルケニル、アルキニル、アリール、ヘテロアリール又はハロゲンであり、

(C)は置換されたアルキル、アルケニル又はアリールであり、

nは2～6の整数であり；そして

XはC H又はNである ]  
を有する化合物。

【請求項 2】

XがNである請求項 1 の化合物。

【請求項 3】

R<sub>1</sub>が場合により置換されていることができるC 1 - 6 アルキル、C 3 - 6 シクロアルキル、アリール又はヘテロアリールである請求項 2 の化合物。

【請求項 4】

R<sub>1</sub>が場合により置換されていることができるシクロプロピル、i - P r 又は n - P r である請求項 3 の化合物。

【請求項 5】

R<sub>1</sub>がフェニルである請求項 3 の化合物。

【請求項 6】

フェニル基が少なくとも1 個の置換基を有し、それはアルコキシ、アルコキシカルボニル又はアミノカルボニルである請求項 5 の化合物。

【請求項 7】

アルコキシ基がエトキシである請求項 6 の化合物。

【請求項 8】

アルコキシカルボニル基がエトキシカルボニルである請求項 6 の化合物。

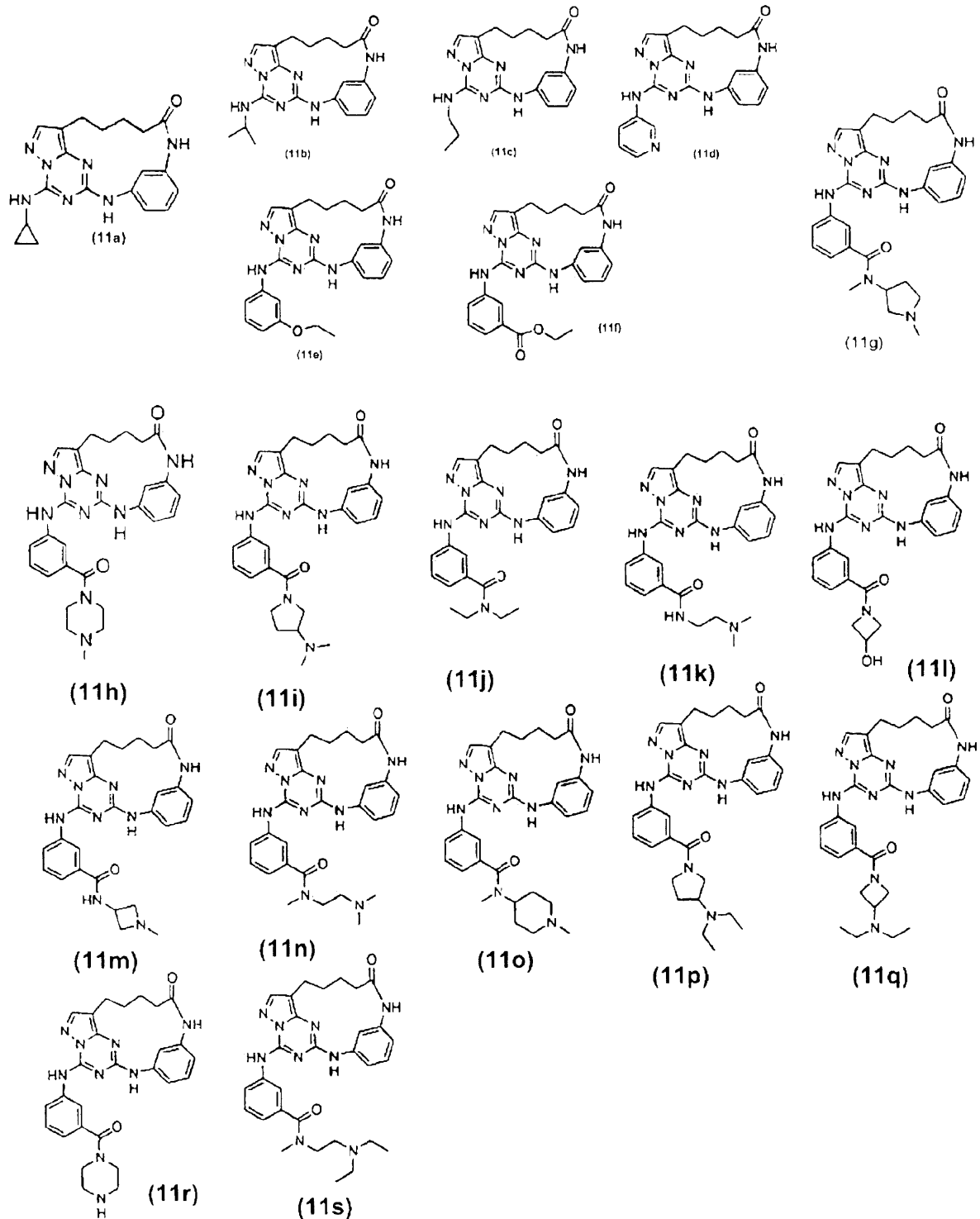
【請求項 9】

ヘテロアリール基がピリジンである請求項 3 の化合物。

【請求項 10】

化合物が

## 【化 2】



より成る群から選ばれる請求項 2 の化合物。

## 【請求項 1 1】

化合物が

(11, 14) 3, 5 N - {シクロプロピル - ピラゾロ [1, 5 - a] [1, 3, 5] トリアジン - 4 - イル - アミノ} - (2 N, 4 N) - フェニル - 1, 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

(11, 14) 3, 5 N - {イソプロピル - ピラゾロ [1, 5 - a] [1, 3, 5] トリアジン - 4 - イル - アミノ} - (2 N, 4 N) - フェニル - 1, 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

(11, 14)3, 5N - { n - プロピル - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2N, 4N ) - フェニル - 1, 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

(11, 14)3, 5N - { ピリド - 3 - イル - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2N, 4N ) - フェニル - 1, 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

(11, 14)3, 5N - { ( 3 - エトキシフェニル ) - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2N, 4N ) - フェニル - 1, 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

(11, 14)3, 5N - { ( 3 - エトキシカルボニルフェニル ) - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2N, 4N ) - フェニル - 1, 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

(11, 14)3, 5N - { 3 - ( 3 - { [ メチル ( 1 - メチルピロリジン - 3 - イル ) アミノ ] カルボニル } フェニル ) - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2N, 4N ) - フェニル - 1, 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

(11, 14)3, 5N - { 3 - ( ピペラジン - 1 - イルカルボニル ) フェニル - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2N, 4N ) - フェニル - 1, 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

(11, 14)3, 5N - { 3 - [ 3 - ( ジメチルアミノ ) ピロリジン - 1 - イル ] カルボニル } フェニル - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2N, 4N ) - フェニル - 1, 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

(11, 14)3, 5N - { 4 - [ ( 3 - { [ 3 - ( ジメチルアミノ ) ピロリジン - 1 - イル ] カルボニル } フェニル ) アミノ ] - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2N, 4N ) - フェニル - 1, 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

(11, 14)3, 5N - { 4 - { [ 3 - ( { [ 2 - ( ジメチルアミノ ) エチル ] アミノ } カルボニル ) フェニル ] アミノ } - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2N, 4N ) - フェニル - 1, 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

(11, 14)3, 5N - { 4 - ( { 3 - [ ( 3 - ヒドロキシアゼチジン - 1 - イル ) カルボニル ] フェニル } アミノ ) - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2N, 4N ) - フェニル - 1, 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

(11, 14)3, 5N - { 4 - [ ( 3 - { [ ( 3 - ヒドロキシシクロブチル ) アミノ ] カルボニル } フェニル ) アミノ ] - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2N, 4N ) - フェニル - 1, 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

(11, 14)3, 5N - { 4 - [ ( 3 - { [ [ 2 - ( ジメチルアミノ ) エチル ] ( メチル ) アミノ ] カルボニル } フェニル ) アミノ ] - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2N, 4N ) - フェニル - 1, 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

(11, 14)3, 5N - { 4 - [ ( 3 - { [ メチル ( 1 - メチルピペリジン - 4 - イル ) アミノ ] カルボニル } フェニル ) アミノ ] - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2N, 4N ) - フェニル - 1, 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

(11, 14)3, 5N - { [ ( 3 - { [ 3 - ( ジエチルアミノ ) ピロリジン - 1 - イル ] カルボニル } フェニル ) アミノ ] - ピラゾロ [ 1, 5 - a ] [ 1, 3, 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2N, 4N ) - フェニル - 1, 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

(11, 14)3, 5N - { [(3 - { [3 - (ジエチルアミノ)アゼチジン - 1 - イル]カルボニル}フェニル)アミノ] - ピラゾロ[1, 5 - a][1, 3, 5]トリアジン - 4 - イル - アミノ} - (2N, 4N) - フェニル - 1, 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン;

(11, 14)3, 5N - { { [3 - (ピペラジン - 1 - イルカルボニル)フェニル]アミノ} - ピラゾロ[1, 5 - a][1, 3, 5]トリアジン - 4 - イル - アミノ} - (2N, 4N) - フェニル - 1, 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン; 及び

(11, 14)3, 5N - { 4 - [(3 - { [[2 - (ジエチルアミノ)エチル] (メチル)アミノ]カルボニル}フェニル)アミノ] - ピラゾロ[1, 5 - a][1, 3, 5]トリアジン - 4 - イル - アミノ} - (2N, 4N) - フェニル - 1, 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン

より成る群から選ばれる請求項1の化合物。

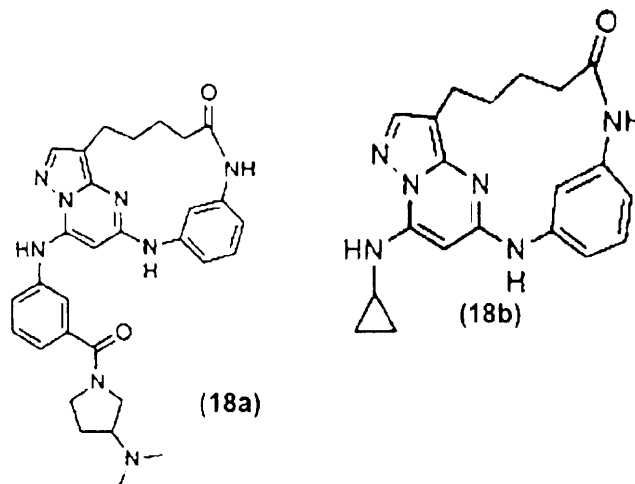
【請求項12】

XがCHである請求項1の化合物。

【請求項13】

化合物が

【化3】



より成る群から選ばれる請求項12の化合物。

【請求項14】

請求項1の化合物を有効成分として含んでなる、ガン、自己免疫疾患、ウイルス疾患、菌・カビ性疾患、神経変性障害又は心臓血管疾患の処置剤。

【請求項15】

XがNである請求項14の処置剤。

【請求項16】

化合物が

(11, 14)3, 5N - {シクロプロピル - ピラゾロ[1, 5 - a][1, 3, 5]トリアジン - 4 - イル - アミノ} - (2N, 4N) - フェニル - 1, 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン;

(11, 14)3, 5N - {イソ - プロピル - ピラゾロ[1, 5 - a][1, 3, 5]トリアジン - 4 - イル - アミノ} - (2N, 4N) - フェニル - 1, 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン;

(11, 14)3, 5N - {n - プロピル - ピラゾロ[1, 5 - a][1, 3, 5]トリアジン - 4 - イル - アミノ} - (2N, 4N) - フェニル - 1, 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン;

(11, 14)3, 5N - {ピリド - 3 - イル - ピラゾロ[1, 5 - a][1, 3, 5]トリアジン - 4 - イル - アミノ} - (2N, 4N) - フェニル - 1, 5 - ジアザ - シクロ

テトラデカ - 8 - オン ;

( 1 1 , 1 4 ) 3 , 5 N - { ( 3 - エトキシフェニル ) - ピラゾロ [ 1 , 5 - a ] [ 1 , 3 , 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2 N , 4 N ) - フェニル - 1 , 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

( 1 1 , 1 4 ) 3 , 5 N - { ( 3 - エトキシカルボニルフェニル ) - ピラゾロ [ 1 , 5 - a ] [ 1 , 3 , 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2 N , 4 N ) - フェニル - 1 , 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

( 1 1 , 1 4 ) 3 , 5 N - { 3 - ( 3 - { [ メチル ( 1 - メチルピロリジン - 3 - イル ) アミノ ] カルボニル } フェニル ) - ピラゾロ [ 1 , 5 - a ] [ 1 , 3 , 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2 N , 4 N ) - フェニル - 1 , 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

( 1 1 , 1 4 ) 3 , 5 N - { 3 - ( ピペラジン - 1 - イルカルボニル ) フェニル - ピラゾロ [ 1 , 5 - a ] [ 1 , 3 , 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2 N , 4 N ) - フェニル - 1 , 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

( 1 1 , 1 4 ) 3 , 5 N - { 3 - [ 3 - ( ジメチルアミノ ) ピロリジン - 1 - イル ] カルボニル } フェニル - ピラゾロ [ 1 , 5 - a ] [ 1 , 3 , 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2 N , 4 N ) - フェニル - 1 , 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

( 1 1 , 1 4 ) 3 , 5 N - { 4 - [ ( 3 - { [ 3 - ( ジメチルアミノ ) ピロリジン - 1 - イル ] カルボニル } フェニル ) アミノ ] - ピラゾロ [ 1 , 5 - a ] [ 1 , 3 , 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2 N , 4 N ) - フェニル - 1 , 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

( 1 1 , 1 4 ) 3 , 5 N - { 4 - { [ 3 - ( { [ 2 - ( ジメチルアミノ ) エチル ] アミノ } カルボニル ) フェニル ] アミノ } - ピラゾロ [ 1 , 5 - a ] [ 1 , 3 , 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2 N , 4 N ) - フェニル - 1 , 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

( 1 1 , 1 4 ) 3 , 5 N - { 4 - ( { 3 - [ ( 3 - ヒドロキシアゼチジン - 1 - イル ) カルボニル ] フェニル } アミノ ) - ピラゾロ [ 1 , 5 - a ] [ 1 , 3 , 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2 N , 4 N ) - フェニル - 1 , 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

( 1 1 , 1 4 ) 3 , 5 N - { 4 - [ ( 3 - { [ ( 3 - ヒドロキシシクロブチル ) アミノ ] カルボニル } フェニル ) アミノ ] - ピラゾロ [ 1 , 5 - a ] [ 1 , 3 , 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2 N , 4 N ) - フェニル - 1 , 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

( 1 1 , 1 4 ) 3 , 5 N - { 4 - [ ( 3 - { [ [ 2 - ( ジメチルアミノ ) エチル ] ( メチル ) アミノ ] カルボニル } フェニル ) アミノ ] - ピラゾロ [ 1 , 5 - a ] [ 1 , 3 , 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2 N , 4 N ) - フェニル - 1 , 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

( 1 1 , 1 4 ) 3 , 5 N - { 4 - [ ( 3 - { [ メチル ( 1 - メチルピペリジン - 4 - イル ) アミノ ] カルボニル } フェニル ) アミノ ] - ピラゾロ [ 1 , 5 - a ] [ 1 , 3 , 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2 N , 4 N ) - フェニル - 1 , 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

( 1 1 , 1 4 ) 3 , 5 N - { [ ( 3 - { [ 3 - ( ジエチルアミノ ) ピロリジン - 1 - イル ] カルボニル } フェニル ) アミノ ] - ピラゾロ [ 1 , 5 - a ] [ 1 , 3 , 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2 N , 4 N ) - フェニル - 1 , 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

( 1 1 , 1 4 ) 3 , 5 N - { [ ( 3 - { [ 3 - ( ジエチルアミノ ) アゼチジン - 1 - イル ] カルボニル } フェニル ) アミノ ] - ピラゾロ [ 1 , 5 - a ] [ 1 , 3 , 5 ] トリアジン - 4 - イル - アミノ } - ( 2 N , 4 N ) - フェニル - 1 , 5 - ジアザ - シクロテトラデカ - 8 - オン ;

( 1 1 , 1 4 ) 3 , 5 N - { { [ 3 - ( ピペラジン - 1 - イルカルボニル ) フェニル ] ア



より成る群から選ばれる請求項 1 5 の処置剤。

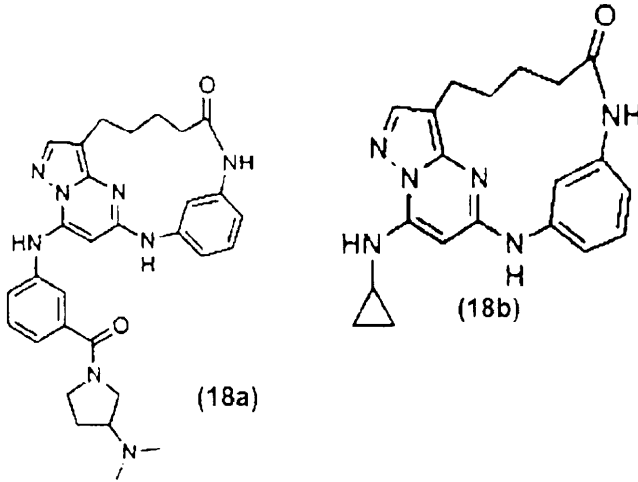
【請求項 1 8】

X が C H である請求項 1 4 の処置剤。

【請求項 1 9】

化合物が

【化 5】



より成る群から選ばれる請求項 1 8 の処置剤。

【請求項 2 0】

少なくとも 1 種の請求項 1 の化合物及び 1 種もしくはそれ以上の製薬学的に許容され得る担体を含んでなる製薬学的組成物。