

【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29年11月16日(2017.11.16)

【公表番号】特表2016-501254(P2016-501254A)

【公表日】平成28年1月18日(2016.1.18)

【年通号数】公開・登録公報2016-004

【出願番号】特願2015-546026(P2015-546026)

【国際特許分類】

C 0 7 D 209/30 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/12 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

C 0 7 D 401/06 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

A 6 1 K 31/4045 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 209/30

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 31/18

A 6 1 P 11/00

A 6 1 P 9/12

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 43/00 1 2 1

C 0 7 D 401/06 C S P

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 405/14

A 6 1 K 31/4439

A 6 1 K 31/4045

【誤訳訂正書】

【提出日】平成29年10月5日(2017.10.5)

【誤訳訂正1】

【訂正対象書類名】特許請求の範囲

【訂正対象項目名】全文

【訂正方法】変更

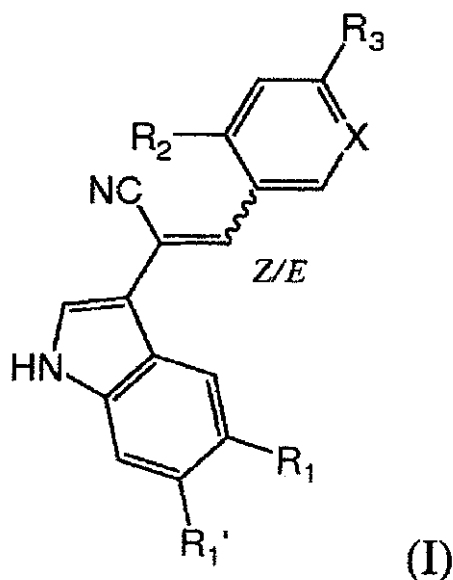
【訂正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物:

【化 1】



[式中、

- Xは、窒素原子、C-CN単位又は N^+-O^- 単位であり、
 - R_1 及び R_1' は、一方がHであり、他方が、ハロゲン、又はカルボキシ基若しくは1つの-N $R_{11}R_{12}$ 単位(式中、 R_{11} 及び R_{12} は、H、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル基であるか、又は R_{11} 及び R_{12} は一緒になって、1個又はいくつかのヘテロ原子で場合によって中断されている3~7員の環を形成する)で場合によって置換されている $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ基であり、

- R_2 は、

・ $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、 $(C_3 \sim C_6)$ シクロアルコキシ、アリールオキシ、ヘテロアリールオキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル-アリールオキシ、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル-ヘテロアリールオキシ基(前記の基は、少なくとも1つのハロゲンで場合によって置換されている)、又はチオ- $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、チオ-アリール、チオ-ヘテロアリール、チオ- $(C_1 \sim C_6)$ アルキル-アリール若しくはチオ- $(C_1 \sim C_6)$ -アルキル-ヘテロアリール基(前記の基は、少なくとも1つのハロゲン又は $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ基で場合によって置換されている)、

・-NR $_4$ R $_5$ 単位、O- $(C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR $_4$ R $_5$ 単位又はS- $(C_1 \sim C_6)$ アルキル-NR $_4$ R $_5$ 単位(式中、 R_4 及び R_5 は、H、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキル基であるか、又は R_4 及び R_5 は一緒になって、1個若しくはいくつかのヘテロ原子で場合によって中断されている3~7員の環を形成し、ただし、 R_4 及び R_5 の中の少なくとも1つはHでない)、

・NHCOR $_6$ 単位(式中、 R_6 は $(C_1 \sim C_6)$ アルキル基である)、

・少なくとも1つのハロゲン、トリフルオロメチル基、若しくは $(C_1 \sim C_3)$ アルコキシ基で場合によって置換されているアリール若しくはヘテロアリール基、又は

・ハロゲン

を表し、

ただし、 R_1 又は R_1' が $(C_1 \sim C_3)$ アルコキシ基である場合、 R_2 はハロゲンではなく、

- R_3 は、水素、 $(C_1 \sim C_3)$ アルキル基、 $(C_1 \sim C_3)$ アルコキシ基又はハロゲンである]、

並びに、インドールコアの窒素原子がCOR $_7$ 及びCO $_2$ R $_7$ 基からなる群から選択される基で置換されており、 R_7 が、

- 少なくともヒドロキシ基で場合によって置換されている $(C_1 \sim C_6)$ アルキル基、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルオキシ基、 $(C_1 \sim C_6)_n$ ポリアルキルオキシ基(式中、 n は $1 < n < 6$ である)、ホスフェート又はピロホスフェート基及び塩、又はその $(C_1 \sim C_3)$ アルキルエステル、 R_8 基、-NHCO $_2$ R $_8$ 単位、COR $_8$ 基、又はCO $_2$ R $_8$ 基[式中、 R_8 は、

- $(C_1 \sim C_6)$ アルキル基、

- アリール、 $(C_1 \sim C_6)$ アルキルアリール、又はヘテロアリール、

- $\text{-NR}_9\text{R}_{10}$ 単位 (式中、 R_9 及び R_{10} は、水素、 $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル基であるか、又は R_9 及び R_{10} は一緒になって、1個若しくはいくつかのヘテロ原子で場合によって中断されている3~7員の環を形成し、場合によって環は少なくとも1つの $(\text{C}_1 \sim \text{C}_6)$ アルキル基で置換されている) である]、

- $\text{NH-NR}_9\text{R}_{10}$ 単位 (式中、 R_9 及び R_{10} は、上で定義されたものである)、又は

- 飽和した複素環若しくはヘテロアリアル

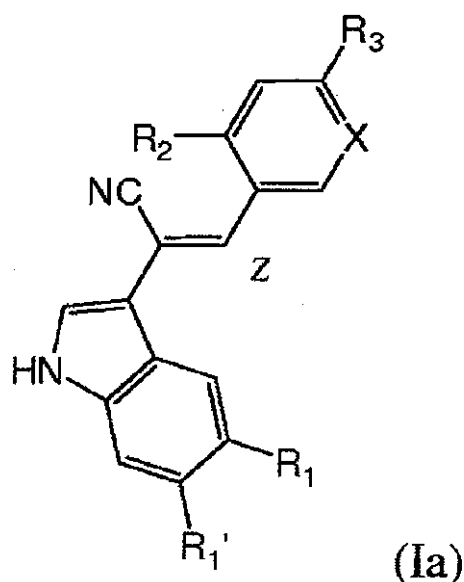
であるそのプロドラッグ、又は薬学的に許容される塩のうちの1つ

(ただし、化合物は、(Z)-3-(4-エトキシピリジン-3-イル)-2-(5-メトキシ-1H-インドール-3-イル)-アクリロニトリルではない)。

【請求項2】

式 (Ia):

【化2】

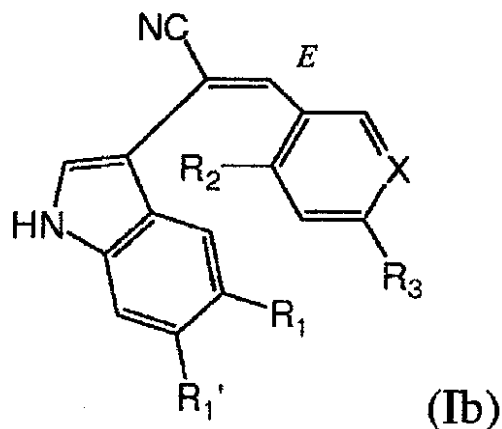


(式中、 X 、 R_1 、 R_1' 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 及び R_6 は、請求項1に規定されたものである) を有する、請求項1に記載の化合物又は請求項1に記載のそのプロドラッグ。

【請求項3】

式 (Ib):

【化3】



(式中、 X 、 R_1 、 R_1' 、 R_2 、 R_3 、 R_4 、 R_5 及び R_6 は、請求項1で規定されたものである) を有する、請求項1に記載の化合物又は請求項1に記載のそのプロドラッグ。

【請求項 4】

R_1' が H である、請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5】

R_1 が、臭素及び塩素からなる群から選択されるハロゲンである、請求項 1 から 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 6】

R_1 が H である、請求項 1 から 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 7】

R_1' が、臭素、塩素、又はフッ素の中から選ばれるハロゲンである、請求項 1 から 3 及び 6 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 8】

R_2 が、

- ・ $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ、又はフェノキシ基(前記の基は、少なくとも1つのハロゲンで場合によって置換されている)、
- ・ ハロゲン、
- ・ R_4-N-R_5 単位若しくは $S-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- NR_4R_5 単位(式中、 R_4 及び R_5 は、H 又は $(C_1 \sim C_6)$ アルキル基であり、ただし R_4 及び R_5 のうちの少なくとも1つは H でない)、
- ・ $NHCOR_6$ 単位(式中、 R_6 は $(C_1 \sim C_6)$ アルキル基である)、
- ・ チオ- $(C_1 \sim C_6)$ アルキル、チオ-アリール、チオ-ヘテロアリール、チオ- $(C_1 \sim C_6)$ アルキル-アリール基(前記の基は、少なくとも1つのハロゲンで、又は $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ基で場合によって置換されている)；
- ・ 少なくとも1つのハロゲン若しくはトリフルオロメチル基で場合によって置換されているアリール基、又は
- ・ ヘテロアリール基

である、請求項 1 から 7 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9】

R_2 が、

- ・ メトキシ基、エトキシ基、及びイソプロポキシ基からなる群から選択される $(C_1 \sim C_6)$ アルコキシ基、若しくはフッ素で場合によって置換されているフェノキシ基、
- ・ フッ素及び塩素からなる群から選択されるハロゲン、
- ・ R_4-N-R_5 単位若しくは $S-(C_1 \sim C_6)$ アルキル- NR_4R_5 単位(式中、 R_4 及び R_5 はメチル又はエチル基である)、
- ・ $NHCOR_6$ 単位(式中、 R_6 は tert-ブチル基である)、
- ・ 少なくとも1つのフッ素又はトリフルオロメチル基で場合によって置換されている、チオ-メチル基、チオ-エチル基、チオ-ベンジル基、チオ-ピリジニル基及びチオ-フェニル基からなる群から選択される基、
- ・ 少なくとも1つの臭素若しくはトリフルオロメチル基で場合によって置換されているフェニル基、又は
- ・ フラン若しくはトリアゾールからなる群から選択されるヘテロアリール基

である、請求項 1 から 8 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 10】

- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-クロロピリジン-3-イル)-アクリロニトリル；
- (Z)-2-(5-ブロモ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-クロロピリジン-3-イル)-アクリロニトリル；
- (Z)-2-(5-ブロモ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル；
- (E)-2-(5-ブロモ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル；
- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(ジメチルアミノ)ピリジン-3-イル)-

アクリロニトリル;

- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-ジメチルアミノ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル、塩酸塩;

- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(ジメチルアミノ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;

- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;

- (E)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;

- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-フェノキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;

- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-フェノキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;

- (Z)-2-(5-メトキシ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;

- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-エトキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;

- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-イソプロポキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;

- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(メチルチオ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;

- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(エチルチオ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;

- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(3-ブromoフェニル)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;

- (Z)-3-(4-(3-ブromoフェニル)ピリジン-3-イル)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-アクリロニトリル;

- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(フェニルチオ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;

- (Z)-3-(4-(ベンジルチオ)ピリジン-3-イル)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-アクリロニトリル;

- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(3,4-ジメトキシ)チオ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;

- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(4-フルオロフェノキシ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;

- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(4-フルオロフェノキシ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;

- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(ジエチルアミノ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;

- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;

- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;

- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-((4-フルオロフェニル)チオ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;

- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-((4-フルオロフェニル)チオ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;

- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(フラン-3-イル)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;

- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(ピリジン-2-イルチオ)ピリジン-3-イ

- ル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(ピリジン-2-イルチオ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
 - (Z)-3-(4-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ピリジン-3-イル)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-アクリロニトリル;
 - (Z)-3-(4-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ピリジン-3-イル)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-アクリロニトリル;
 - (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(フラン-3-イル)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
 - (E)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(フラン-3-イル)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
 - (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
 - (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(2-(ジメチルアミノ)エチルチオ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
 - (Z)-3-(2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-(4-フルオロフェノキシ)ベンゾニトリル;
 - (Z)-3-(2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-メトキシベンゾニトリル;
 - (E)-3-(2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-メトキシベンゾニトリル;
 - (Z)-3-(2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-(ジメチルアミノ)ベンゾニトリル;
 - (Z)-3-(2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-メトキシベンゾニトリル;
 - (Z)-3-(2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-(ジメチルアミノ)ベンゾニトリル;
 - (Z)-3-(2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-(エチルチオ)ベンゾニトリル;
 - (Z)-2-(6-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)アクリロニトリル;
 - (Z)-2-(6-フルオロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)アクリロニトリル;
 - (Z)-2-(6-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)アクリロニトリル;
 - (Z)-3-(2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-(フラン-3-イル)ピリジン-1-オキシド;
 - (Z)-3-(2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-メトキシピリジン-1-オキシド;
 - (Z)-3-(2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾニトリル;
 - (Z)-3-(2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾニトリル;
 - (Z)-3-(2-シアノ-2-(6-メトキシ-1H-インドール-3-イル)ビニル)-4-メトキシベンゾニトリル;
 - (Z)-2-(1-アセチル-5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)アクリロニトリル;
 - (Z)-3-(2-(1-アセチル-5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-メトキシベンゾニトリル;
 - (Z)-2-(5-ブromo-1-ピパロイル-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イ

ル)アクリロニトリル;

- (Z)-3-(2-(5-ブromo-1-ピバロイル-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-メトキシベンゾニトリル;
- (Z)-メチル3-(5-ブromo-3-(1-シアノ-2-(4-メトキシピリジン-3-イル)ビニル)-1H-インドール-1-イル)-3-オキソプロパノエート;
- (Z)-2-(5-ブromo-1-(2-(ジメチルアミノ)アセチル)-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)アクリロニトリル;
- (Z)-2-(4-メチルピペラジン-1-イル)エチル5-ブromo-3-(1-シアノ-2-(4-メトキシピリジン-3-イル)ビニル)-1H-インドール-1-カルボキシレート;
- ((Z)-3-(2-(5-ブromo-1-(2-(ジメチルアミノ)アセチル)-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-メトキシベンゾニトリル;
- (Z)-tert-ブチル5-ブromo-3-(1-シアノ-2-(5-シアノ-2-メトキシフェニル)ビニル)-1H-インドール-1-カルボキシレート;
- (R,Z)-ベンジル-4-(5-ブromo-3-(1-シアノ-2-(5-シアノ-2-メトキシフェニル)ビニル)-1H-インドール-1-イル)-2-(tert-ブトキシカルボニルアミノ)-4-オキソブタノエート;
- (R,Z)-tert-ブチル-5-(5-ブromo-3-(1-シアノ-2-(5-シアノ-2-メトキシフェニル)ビニル)-1H-インドール-1-イル)-2-(tert-ブトキシカルボニルアミノ)-5-オキソペンタノエート;
- (R,Z)-ベンジル-2-アミノ-4-(5-ブromo-3-(1-シアノ-2-(5-シアノ-2-メトキシフェニル)ビニル)-1H-インドール-1-イル)-4-オキソブタノエート;
- (Z)-3-(2-(5-ブromo-1-(2-(4-メチルピペラジン-1-イル)アセチル)-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-メトキシベンゾニトリル;
- (Z)-3-(2-(5-ブromo-1-(2-(4-メチルピペラジン-1-イル)アセチル)-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-メトキシベンゾニトリル塩酸塩;
- (S,Z)-3-(2-(1-(3-アミノブタノイル)-5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-メトキシベンゾニトリル塩酸塩;
- (Z)-3-(2-(1-(2-アミノアセチル)-5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-メトキシベンゾニトリル塩酸塩;
- (Z)-3-(2-(5-ブromo-1-(2-(ピペラジン-1-イル)アセチル)-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-メトキシベンゾニトリル塩酸塩;
- (Z)-3-(2-(5-ブromo-1-(2-(2-(2-メトキシエトキシ)エトキシ)アセチル)-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-メトキシベンゾニトリル;
- (S,Z)-3-(2-(1-(2-アミノ-3-ヒドロキシプロパノイル)-5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-メトキシベンゾニトリル塩酸塩;
- (Z)-3-(2-(5-ブromo-1-(5-オキソピロリジン-2-カルボニル)-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-メトキシベンゾニトリル;
- (R,Z)-3-(2-(5-ブromo-1-(2,6-ジアミノヘキサノイル)-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-メトキシベンゾニトリルジ塩酸塩;
- (Z)-3-(5-ブromo-3-(1-シアノ-2-(5-シアノ-2-メトキシフェニル)ビニル)-1H-インドール-1-イル)-3-オキソプロピル二水素ホスフェート;

からなる群から選択される、請求項1から9のいずれか一項に記載の化合物及びこれらの薬学的に許容される塩。

【請求項 11】

- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-クロロピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-クロロピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (E)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)-アクリロ

ニトリル;

- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(ジメチルアミノ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-ジメチルアミノ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル、塩酸塩;
- (Z)-2-(5-ブロモ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(ジメチルアミノ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (E)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-フェノキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブロモ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-フェノキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-メトキシ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブロモ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-エトキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブロモ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-イソプロポキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブロモ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(メチルチオ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブロモ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(エチルチオ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブロモ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(3-ブロモフェニル)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-3-(4-(3-ブロモフェニル)ピリジン-3-イル)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブロモ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(フェニルチオ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-3-(4-(ベンジルチオ)ピリジン-3-イル)-2-(5-ブロモ-1H-インドール-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブロモ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(3,4-ジメトキシ)チオ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブロモ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(4-フルオロフェノキシ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(4-フルオロフェノキシ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブロモ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(ジエチルアミノ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブロモ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-((4-フルオロフェニル)チオ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブロモ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-((4-フルオロフェニル)チオ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(フラン-3-イル)ピリジン-3-イル)-ア

クリロニトリル；

- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(ピリジン-2-イルチオ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル；

- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(ピリジン-2-イルチオ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル；

- (Z)-3-(4-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ピリジン-3-イル)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-アクリロニトリル；

- (Z)-3-(4-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ピリジン-3-イル)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-アクリロニトリル；

- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(フラン-3-イル)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル；

- (E)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(フラン-3-イル)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル；

- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル；

- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(2-(ジメチルアミノ)エチルチオ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル；

- (Z)-3-(2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-(4-フルオロフェノキシ)ベンゾニトリル；

- (Z)-3-(2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-メトキシベンゾニトリル；

- (E)-3-(2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-メトキシベンゾニトリル；

- (Z)-3-(2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-(ジメチルアミノ)ベンゾニトリル；

- (Z)-3-(2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-メトキシベンゾニトリル；

- (Z)-3-(2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-(ジメチルアミノ)ベンゾニトリル；

- (Z)-3-(2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-(エチルチオ)ベンゾニトリル；

- (Z)-2-(6-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)アクリロニトリル；

- (Z)-2-(6-フルオロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)アクリロニトリル；

- (Z)-2-(6-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)アクリロニトリル；

- (Z)-3-(2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-(フラン-3-イル)ピリジン-1-オキシド；

- (Z)-3-(2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-メトキシピリジン-1-オキシド；

- (Z)-3-(2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾニトリル；

- (Z)-3-(2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾニトリル；

からなる群から選択される、請求項1から10のいずれか一項に記載の化合物及びこれらの薬学的に許容される塩。

【請求項 1 2】

- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-クロロピリジン-3-イル)-アクリロニトリル；

- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-クロロピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (E)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (E)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-メトキシ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-エトキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-イソプロポキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(メチルチオ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(フェニルチオ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-3-(4-(ベンジルチオ)ピリジン-3-イル)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(4-フルオロフェノキシ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(4-フルオロフェノキシ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(ジメチルアミノ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(ジエチルアミノ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(4-(トリフルオロメチル)フェニル)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-((4-フルオロフェニル)チオ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-((4-フルオロフェニル)チオ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(フラン-3-イル)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(ピリジン-2-イルチオ)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-3-(4-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ピリジン-3-イル)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-3-(4-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ピリジン-3-イル)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(フラン-3-イル)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (E)-2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(フラン-3-イル)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;
- (Z)-2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)-アクリロニトリル;

- (Z)-3-(2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-メトキシベンゾニトリル;
- (E)-3-(2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-メトキシベンゾニトリル;
- (Z)-3-(2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-(ジメチルアミノ)ベンゾニトリル;
- (Z)-2-(6-ブromo-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)アクリロニトリル;
- (Z)-2-(6-フルオロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)アクリロニトリル;
- (Z)-2-(6-クロロ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-メトキシピリジン-3-イル)アクリロニトリル;
- (Z)-3-(2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-(フラン-3-イル)ピリジン-1-オキシド;
- (Z)-3-(2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-メトキシピリジン-1-オキシド;
- (Z)-3-(2-(5-クロロ-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾニトリル;
- (Z)-3-(2-(5-ブromo-1H-インドール-3-イル)-2-シアノビニル)-4-(トリフルオロメトキシ)ベンゾニトリル;

からなる群から選択される、請求項1から11のいずれか一項に記載の化合物及びこれらの薬学的に許容される塩。

【請求項 1 3】

請求項1から12のいずれか一項に記載の1つの化合物又は(Z)-3-(4-エトキシピリジン-3-イル)-2-(5-メトキシ-1H-インドール-3-イル)-アクリロニトリルを活性成分として含む、がんの処置における使用のための、医薬組成物。

【請求項 1 4】

追加の抗腫瘍薬物を更に含む、請求項13に記載のがんの処置における使用のための、医薬組成物。

【請求項 1 5】

前記追加の抗腫瘍薬物が、有糸分裂阻害剤、トポイソメラーゼI又はIIの阻害剤、DNAアルキル化剤、抗代謝性薬剤、及び標的化薬剤からなる群から選択される、請求項14に記載のがんの処置における使用のための、医薬組成物。

【請求項 1 6】

前記標的化薬剤が、キナーゼ阻害剤及び/又はがん細胞に対する細胞傷害性を媒介するか、又はその主要な生物学的機能の1つを調節するように設計されている治療用抗体である、請求項15に記載のがんの処置における使用のための、医薬組成物。

【請求項 1 7】

放射線療法、発熱療法及び/若しくは他の抗腫瘍療法と組み合わせて、又は手術の前に、それと同時に及び/若しくはその後がんを処置するために使用するための、請求項13から16のいずれか一項に記載のがんの処置における使用のための、医薬組成物。

【請求項 1 8】

(a)請求項1から12のいずれか一項に記載の化合物と、(b)がんの処置における、同時の、別々の又は連続的な使用のための組み合わせた調製物としての追加の抗腫瘍薬物を含むキット。

【請求項 1 9】

請求項1から12のいずれか一項に記載の1つの化合物又は(Z)-3-(4-エトキシピリジン-3-イル)-2-(5-メトキシ-1H-インドール-3-イル)-アクリロニトリルを活性成分として含む、ウイルス感染症の処置における使用のための、医薬組成物。

【請求項 2 0】

前記ウイルス感染症が、HIV感染症、HTLV感染症又はHPV感染症である、請求項19に記載のウイルス感染症の処置における使用のための、医薬組成物。

【請求項 2 1】

請求項1から12のいずれか一項に記載の1つの化合物又は(Z)-3-(4-エトキシピリジン-3-イル)-2-(5-メトキシ-1H-インドール-3-イル)-アクリロニトリルを活性成分として含む、肺疾患の処置における使用のための、医薬組成物。

【請求項 2 2】

前記肺疾患が、肺動脈高血圧である、請求項21に記載の肺疾患の処置における使用のための、医薬組成物。

【請求項 2 3】

請求項1から12のいずれか一項に記載の1つの化合物又は(Z)-3-(4-エトキシピリジン-3-イル)-2-(5-メトキシ-1H-インドール-3-イル)-アクリロニトリルを活性成分として含む、MK1p2の調節不全に伴う病態の処置における使用のための、又はMK1p2経路が調節不全である病態の処置における使用のための、医薬組成物。