

【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 07 D	209/30	(2006.01)
A 61 K	45/00	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)
A 61 P	31/12	(2006.01)
A 61 P	31/18	(2006.01)
A 61 P	11/00	(2006.01)
A 61 P	9/12	(2006.01)
A 61 P	43/00	(2006.01)
C 07 D	401/06	(2006.01)
C 07 D	401/14	(2006.01)
C 07 D	405/14	(2006.01)
A 61 K	31/4439	(2006.01)
A 61 K	31/4045	(2006.01)

【F I】

C 07 D	209/30	
A 61 K	45/00	
A 61 P	35/00	
A 61 P	31/12	
A 61 P	31/18	
A 61 P	11/00	
A 61 P	9/12	
A 61 P	43/00	1 1 1
A 61 P	43/00	1 2 1
C 07 D	401/06	C S P
C 07 D	401/14	
C 07 D	405/14	
A 61 K	31/4439	
A 61 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

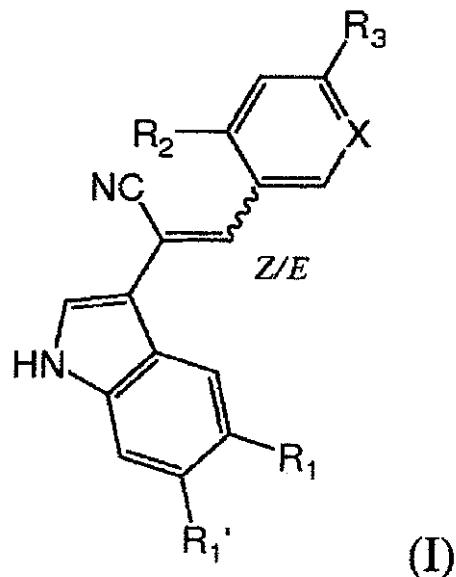
【訂正の内容】

【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<sup>+</sup>-O<sup>-</sup>単位であり、
- R<sub>1</sub>及びR<sub>1'</sub>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-NR<sub>11</sub>R<sub>12</sub>単位(式中、R<sub>11</sub>及びR<sub>12</sub>は、H、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルキル基であるか、又はR<sub>11</sub>及びR<sub>12</sub>は一緒にあって、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<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルコキシ基であり、
- R<sub>2</sub>は、
  - ・(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルコキシ、(C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>)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<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルキル-アリールオキシ、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)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<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルキル、チオ-アリール、チオ-ヘテロアリール、チオ-(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルキル-アリール若しくはチオ-(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)-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<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルコキシ基で場合によって置換されている)、
  - ・-NR<sub>4</sub>R<sub>5</sub>単位、O-(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルキル-NR<sub>4</sub>R<sub>5</sub>単位又はS-(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルキル-NR<sub>4</sub>R<sub>5</sub>単位(式中、R<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>は、H、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルキル基であるか、又はR<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>は一緒にあって、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<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>の中の少なくとも1つはHでない)、
  - ・NHCOR<sub>6</sub>単位(式中、R<sub>6</sub>は(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)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<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>)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<sub>1</sub>又はR<sub>1'</sub>が(C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>)アルコキシ基である場合、R<sub>2</sub>はハロゲンではなく、
- R<sub>3</sub>は、水素、(C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>)アルキル基、(C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>)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<sub>7</sub>及びCO<sub>2</sub>R<sub>7</sub>基からなる群から選択される基で置換されており、R<sub>7</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルキル基、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルキルオキシ基、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)<sub>n</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>)アルキルエステル、R<sub>8</sub>基、-NHCO<sub>2</sub>R<sub>8</sub>単位、COR<sub>8</sub>基、又はCO<sub>2</sub>R<sub>8</sub>基[式中、R<sub>8</sub>は、
  - (C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルキル基、
  - アリール、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルキルアリール、又はヘテロアリール、

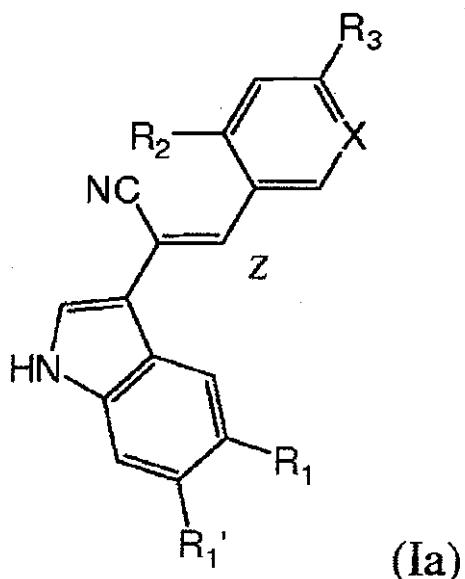
- -NR<sub>9</sub>R<sub>10</sub>単位(式中、R<sub>9</sub>及びR<sub>10</sub>は、水素、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルキル基であるか、又はR<sub>9</sub>及びR<sub>10</sub>は一緒にあって、1個若しくはいくつかのヘテロ原子で場合によって中断されている3～7員の環を形成し、場合によって環は少なくとも1つの(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルキル基で置換されている)である]、

- NH-NR<sub>9</sub>R<sub>10</sub>単位(式中、R<sub>9</sub>及びR<sub>10</sub>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ール

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】

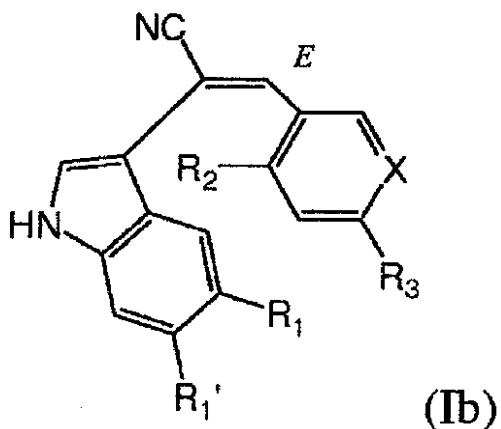
式(Ia):  
【化2】



(式中、X、R<sub>1</sub>、R<sub>1'</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>及びR<sub>6</sub>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<sub>1</sub>、R<sub>1'</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>及びR<sub>6</sub>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<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)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<sub>4</sub>-N-R<sub>5</sub>単位若しくはS-(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルキル-NR<sub>4</sub>R<sub>5</sub>単位(式中、R<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>は、H又は(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルキル基であり、ただしR<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>のうちの少なくとも1つはHでない)、
- ・NHCOR<sub>6</sub>単位(式中、R<sub>6</sub>は(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルキル基である)、
- ・チオ-(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルキル、チオ-アリール、チオ-ヘテロアリール、チオ-(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)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<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)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<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)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<sub>4</sub>-N-R<sub>5</sub>単位若しくはS-(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルキル-NR<sub>4</sub>R<sub>5</sub>単位(式中、R<sub>4</sub>及びR<sub>5</sub>はメチル又はエチル基である)、
- ・NHCOR<sub>6</sub>単位(式中、R<sub>6</sub>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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(3-プロモフェニル)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル；
- (Z)-3-(4-(3-プロモフェニル)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-プロモ-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-プロモ-1H-インドール-3-イル)-アクリロニトリル；
- (Z)-2-(5-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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；

ル)-アクリロニトリル；  
- (Z)-2-(5-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-(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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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)-3-(2-(1-アセチル-5-プロモ-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-プロモ-1-ピバロイル-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-1-(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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-オキソプロピルニ水素ホスフェート;

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 1 1】

- (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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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；
- (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-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-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(3-プロモフェニル)ピリジン-3-イル)-アクリロニトリル；
- (Z)-3-(4-(3-プロモフェニル)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-プロモ-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-プロモ-1H-インドール-3-イル)-アクリロニトリル；
- (Z)-2-(5-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-1H-インドール-3-イル)-3-(4-(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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-(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-プロモ-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-プロモ-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12】

- (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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-1H-インドール-3-イル)-アクリロニトリル；
- (Z)-2-(5-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-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-プロモ-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)-3-(4-(1H-1,2,4-トリアゾール-1-イル)ピリジン-3-イル)-2-(5-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-プロモ-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-(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-プロモ-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-プロモ-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13】

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14】

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15】

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16】

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17】

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/若しくはその後に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18】

(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とを含むキット。

#### 【請求項19】

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20】

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21】**

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22】**

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23】**

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。