

【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 21 年 7 月 9 日 (2009.7.9)

【公表番号】特表 2008-545803 (P2008-545803A)

【公表日】平成 20 年 12 月 18 日 (2008.12.18)

【年通号数】公開・登録公報 2008-050

【出願番号】特願 2008-516155 (P2008-516155)

【国際特許分類】

C 07 D 401/04 (2006.01)

C 07 D 491/052 (2006.01)

A 61 K 31/4741 (2006.01)

C 07 D 491/048 (2006.01)

C 07 D 471/04 (2006.01)

A 61 K 31/4745 (2006.01)

A 61 K 31/4709 (2006.01)

A 61 K 31/496 (2006.01)

A 61 K 31/5377 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 9/00 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 9/10 (2006.01)

A 61 P 27/02 (2006.01)

A 61 P 29/00 (2006.01)

A 61 P 3/10 (2006.01)

A 61 P 17/02 (2006.01)

A 61 P 37/06 (2006.01)

A 61 P 35/02 (2006.01)

A 61 P 19/02 (2006.01)

A 61 P 25/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 401/04 C S P

C 07 D 491/052

A 61 K 31/4741

C 07 D 491/048

C 07 D 471/04 1 1 2 A

A 61 K 31/4745

A 61 K 31/4709

A 61 K 31/496

A 61 K 31/5377

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 9/00

A 61 P 35/00

A 61 P 9/10 1 0 1

A 61 P 27/02

A 61 P 29/00

A 61 P 3/10

A 61 P 9/10

A 61 P 17/02

A 61 P 37/06

【手續補正書】

【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

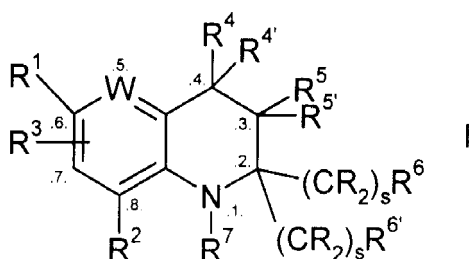
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I の化合物、およびあらゆる割合のその混合物を含む医薬として使用可能なその誘導体、溶媒和物、互変異性体、塩および立体異性体

【化 1】



(式中、

W は、C H または N を表し、

[illegible]

$(\text{NR}_2)_n \text{CO}(\text{CH}_2)_n \text{NR}$ - ヘテロアリールを表し、 R^1 および R^3 は、一緒になって、 $-\text{N}-\text{C}(\text{CF}_3)=\text{N}-$ 、 $-\text{N}-\text{CR}=\text{N}-$ 、 $-\text{N}-\text{N}=\text{N}-$ をも表し、非隣接 CY_2 基は、 X で置換されていてもよく、

Y は、 H 、 A 、 Hal 、 OR 、 $\text{E}-\text{R}^1$ を表し、

E は、 $-\text{NR}^1\text{SO}_2-$ 、 $-\text{SO}_2\text{NR}^1-$ 、 $-\text{CONR}^1-$ 、 $-\text{NR}^1\text{CO}-$ 、 $-\text{COO}-$ 、 $\text{OOC}-$ 、 CO 、 $-\text{SO}_2-$ 、 $-\text{X}-$ 、 $\text{NR}^1\text{CONR}^1-$ 、 $-\text{OCONR}^1-$ 、 $-\text{NR}^1\text{COO}-$ 、 $-\text{CSNR}^1-$ 、 $-\text{NR}^1\text{CS}-$ 、 $-\text{NR}^1\text{CSNR}^1-$ 、 $-\text{SCONR}^1-$ 、 $-\text{NR}^1\text{COS}-$ 、 $-\text{OCSNR}^1-$ 、 $\text{NR}^1\text{CSO}-$ 、 SCSNR^1- 、 NR^1CCC または一重結合を表し、

A は、アルキルまたはシクロアルキルを表し、1つまたは複数の H 原子が、 Hal で置換されていてもよく、

Hal は、 F 、 Cl 、 Br または I を表し、

R は、 H または A を表し、ジェミナル基の場合は、 R は、一緒になって、 $-(\text{CH}_2)_5-$ 、 $-(\text{CH}_2)_4-$ または $-(\text{CH}_2)_n-\text{X}-(\text{CH}_2)_n$ 、または $-(\text{CH}_2)_n-\text{Z}-(\text{CH}_2)_n$ も表し、

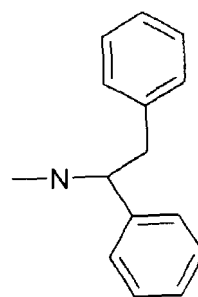
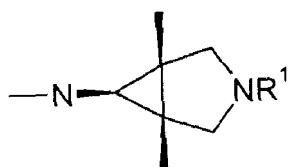
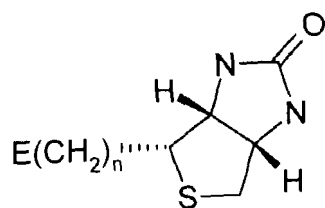
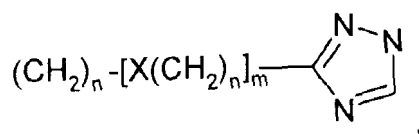
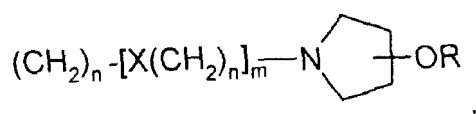
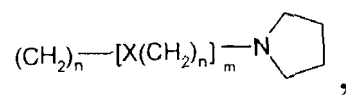
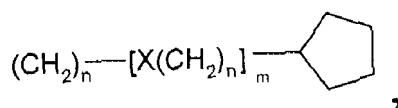
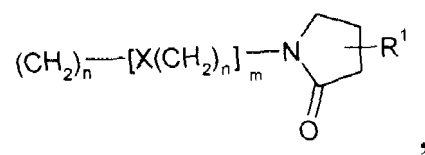
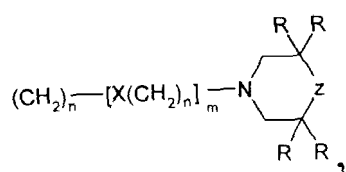
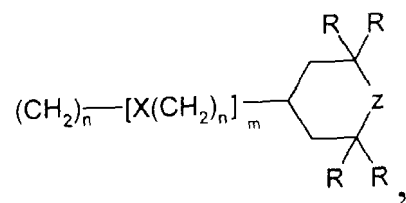
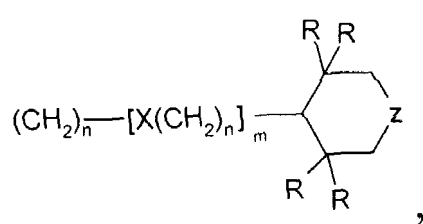
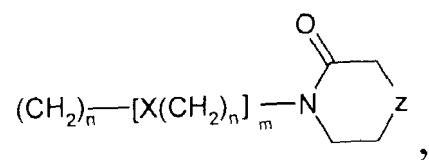
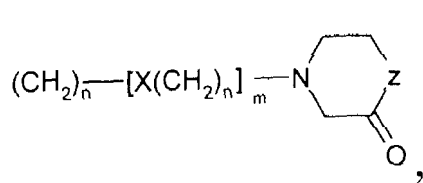
R^4 、 $\text{R}^{4'}$ 、 R^5 、 $\text{R}^{5'}$ は、互いに独立に、 H 、あるいは非置換または一もしくは多置換の $-\text{OR}-$ 、 $-\text{NO}_2-$ 、 $-\text{Hal}-$ 、 $-\text{CF}_3-$ 、 $-\text{OCF}_3-$ 、 $-\text{CN}-$ 、 $-\text{NR}_2-$ または $-\text{SR}-$ 、アリールまたはヘテロアリール置換 N -ピロリドン、 Q 、 $(\text{CY}_2)_n-\text{E}-\text{CR}_2\text{R}^1$ 、 $(\text{CY}_2)_n-\text{E}-\text{CR}_2\text{XR}^1$ 、 $(\text{CY}_2)_n-\text{E}-(\text{CY}_2)_n-\text{XR}^1$ または $(\text{CY}_2)_n-\text{E}-(\text{CY}_2)_n-\text{XR}^a$ 、 $-\text{X}-(\text{CH}_2)_2\text{OR}$ 、 $-\text{X}-\text{CO}(\text{CH}_2)_n\text{CH}_3$ 、 $-\text{X}-(\text{CH}_2)_2\text{NR}_2$ 、 R^1 、 S -アリール、 O -アリール、 $\text{CH}_2\text{Si}(\text{CH}_3)_3$ を表し、あるいは一緒になって $-\text{X}(\text{CR}_2)_2-$ 、 $-\text{X}-(\text{CR}_2)_3-$ 、 $-\text{XCHQCY}_2-$ 、 $-\text{X}-\text{CH}(\text{CH}_2\text{OR})(\text{CY}_2)_2-$ 、 $-\text{X}-\text{CH}(\text{CH}_2\text{NR}_2)(\text{CY}_2)_2-$ 、 $-\text{X}-\text{CH}=\text{CQ}-\text{CH}_2-$ 、 $\text{X}-\text{CQ}=\text{CH}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{X}(\text{CH}_2)_2\text{NR}_2$ 、 $-(\text{CR}_2)_3-$ 、 $-(\text{CR}_2)_4-$ 、 $-\text{CR}=\text{CR}-\text{CR}=\text{CR}-$ 、 $-\text{XCHQ}(\text{CY}_2)_2-$ 、 $-\text{XCHQCR}_2-$ 、 $\text{R}-\text{N}-(\text{C}=\text{X})-\text{N}-\text{R}$ 、 $-\text{XC}[(\text{CH}_2)_n\text{OR}]_2\text{CH}_2\text{CH}_2-$ 、 $-\text{X}-\text{CY}_2\text{CH}(\text{CH}_2\text{OR})\text{CY}_2-$ 、 $-\text{X}-\text{CY}_2\text{CH}(\text{CH}_2\text{NR}_2)\text{CY}_2-$ 、 $-\text{X}-\text{CY}_2\text{CHQ}-\text{CY}_2-$ 、 $-\text{XCHQCY}_2-$ 、 $-\text{XC}_2\text{CHQ}-$ 、 $-\text{XCHQ}(\text{CY}_2)_3-$ 、 $-\text{XCHQ}(\text{CY}_2)_4-$ 、 $-\text{XC}_2\text{CHQ}(\text{CY}_2)_2-$ 、 $-\text{XC}_2\text{CHQ}(\text{CY}_2)_3-$ を表し、

X は、 O 、 S または NR^1 を表し、

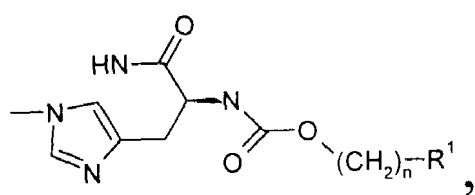
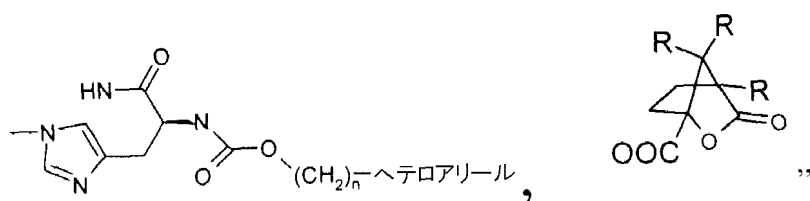
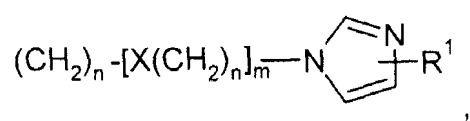
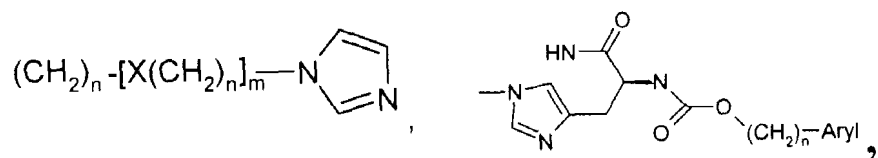
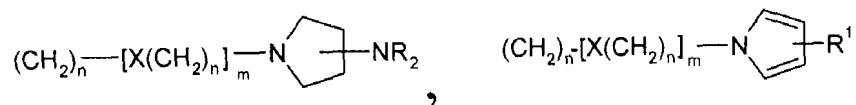
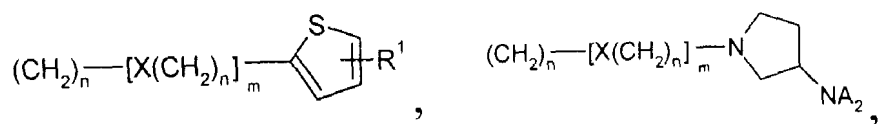
Q は、 $(\text{CH}_2)_p-\text{E}-(\text{CH}_2)_p\text{R}^1$ 、 $(\text{CH}_2)_p-\text{E}-(\text{CH}_2)_p\text{R}^a$ 、 $(\text{CH}_2)_p\text{Hal}$ 、 CHO 、 $(\text{CH}_2)_p\text{SR}^1$ 、 COR^a 、 $(\text{CH}_2)_p\text{R}^a$ 、 $(\text{CH}_2)_p\text{OCOR}^a$ 、 $(\text{CH}_2)_p\text{NCOR}^1$ 、 $(\text{CH}_2)_p\text{N}(\text{R}^1)_2$ 、 $(\text{CH}_2)_p\text{OR}^1$ 、 $(\text{CH}_2)_p\text{OCON}(\text{R}^1)_2$ 、 $(\text{CH}_2)_p\text{OCOOR}^1$ 、 $(\text{CH}_2)_p\text{NHCON}(\text{R}^1)_2$ 、 $(\text{CH}_2)_p\text{NHCOOR}^1$ 、 $(\text{CH}_2)_p\text{CN}$ 、 $(\text{CH}_2)_p\text{COOR}^1$ を表し、

R^a は、

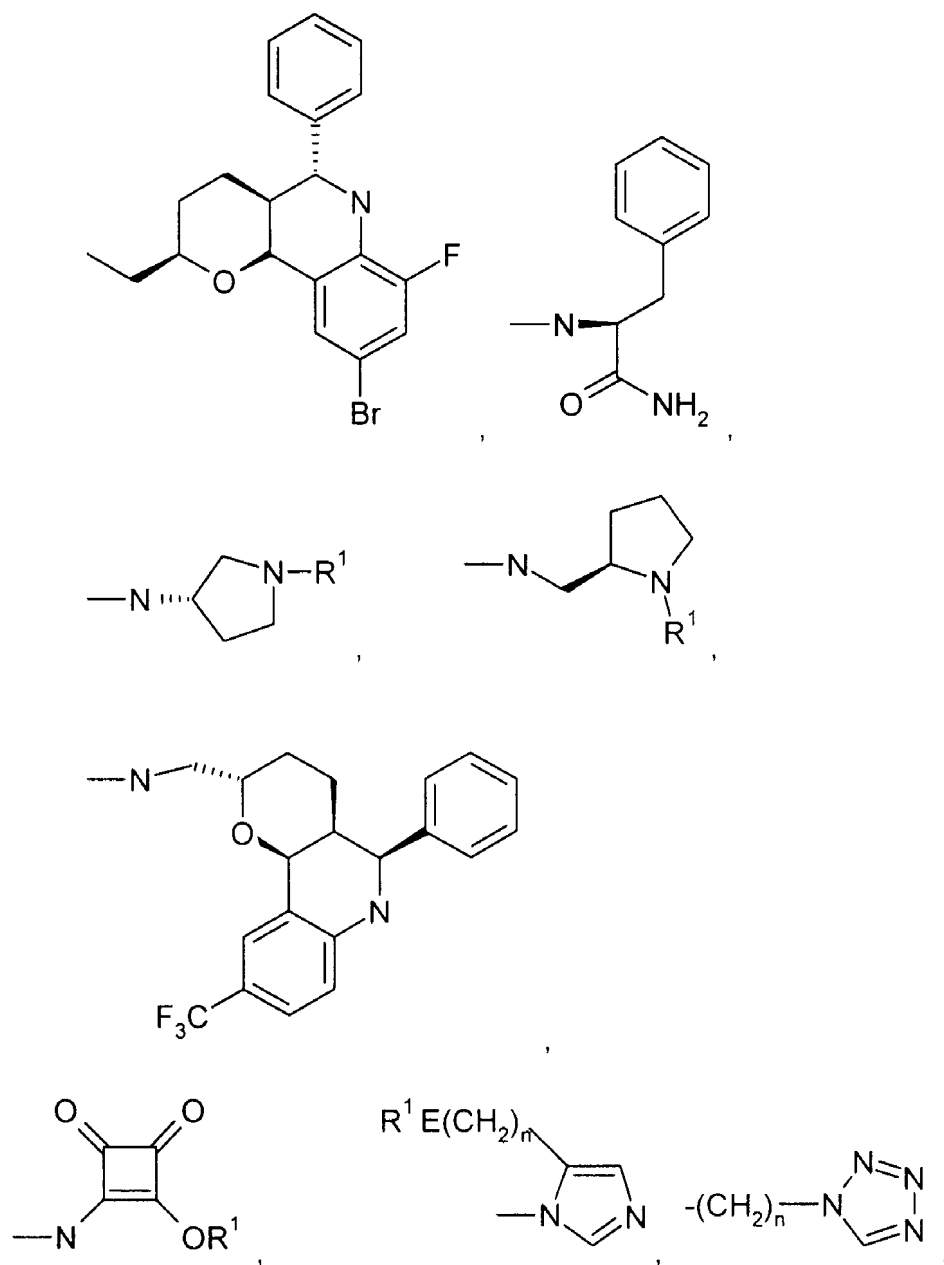
【化 2 - 1】



【化 2 - 2】



【化 2 - 3】



、 OR 、 NHR 、 NR_2 、 $NR(CH_2)_n$ -アリール、 $NR(CH_2)_nOR$ 、 $COOR$ 、 N -ピロリドン基、 $OCOR$ 、 $NR(CH_2)_nNR_2$ 、 $(CY_2)_n$ -アリール、 $(CY_2)_2$ -ヘテロアリール、 $N[(CH_2)_nNR_2]CO(CH_2)_n$ -アリール、 $N[(CH_2)_nNHCOOR]CO$ -アリール、 R^1 、 $N[CH_2(CH_2)_nOR]_2$ 、 $NR(CH_2)_nNCOOR$ 、 $X(CH_2)_nX(CH_2)_nXR$ 、 $NR(CH_2)_nX(CH_2)_nOH$ 、 $NR(CH_2)_nO(CH_2)_nOH$ 、 $(CH_2)_nCOOR$ 、 $O(CO)NR(CH_2)_nOR$ 、 $O(CO)(CH_2)_nNR_2$ 、 $NR(CH_2)_nNR_2$ 、 $N[(CH_2)_nNR_2]CO(CH_2)_n$ -アリール、 $N[(CH_2)_nXR]CO(CH_2)_n$ -アリール、 $N[(CH_2)_nXR]CO(CH_2)_n$ -ヘテロアリール、 $N[(CH_2)_nNR_2]CO(CH_2)_n$ -ヘテロアリール、 $N[(CH_2)_nNR_2]CO(CH_2)_nR^1$ 、 $N(R)(CH_2)_nN(R)COOR$ 、 $XCOO(CH_2)_nNR_2$ 、 OSO_2A 、 OSO_2CF_3 、 OSO_2Ar 、 $CONR_2$ 、 $CH_2(CH_2)_nNR_2$ 、 $CONR^1$ 、 COR^1 を表し、

Z は、 CH_2 、 X 、 $CHCONH_2$ 、 $CH(CH_2)_nNR^1COOR^1$ 、 $CHNR^1COOR^1$ 、 $NCHO$ 、 $CHCON(R^1)_2$ 、 $CH(CH_2)_nCOOR^1$ 、 $NCOOR^1$ 、 $CH(CH_2)_nOH$ 、 $N(CH_2)_nOH$ 、 $CHNH_2$ 、 $CH(CH_2)_nNR^1_2$ 、 $CH(CH_2)_n$

NR^1_2 、 $\text{C}(\text{OH})\text{R}^1$ 、 CHNCOR^1 、 NCOR^1 、 $\text{N}(\text{CH}_2)_n$ -アリール、 $\text{N}(\text{CH}_2)_n$ -ヘテロアリール、 CHR^1 、 NR^1 、 $\text{CH}(\text{CH}_2)_n$ -アリール、 $\text{CH}(\text{CH}_2)_n$ -ヘテロアリール、 $\text{CH}(\text{CH}_2)_n\text{R}^1$ 、 $\text{N}(\text{CH}_2)_n\text{CO}\text{OR}^1$ 、 $\text{CH}(\text{CH}_2)_n\text{X}(\text{CH}_2)_n$ -アリール、 $\text{CH}(\text{CH}_2)_n\text{X}(\text{CH}_2)_n$ -ヘテロアリール、 $\text{N}(\text{CH}_2)_n\text{CON}(\text{R}^1)_2$ 、 NSO_2R^1 、 $\text{CHSO}_2\text{N}(\text{R}^1)_2$ 、 $\text{XCONR}(\text{CH}_2)_n\text{N}(\text{R}^1)_2$ 、 $\text{NCO}(\text{CH}_2)_n$ -アリール、 $\text{NCO}(\text{CH}_2)_n\text{X}$ -アリール、 $\text{NSO}_2(\text{CH}_2)_n$ -アリール、 $\text{NCO}(\text{CH}_2)_n$ -アリール、 $\text{NCO}(\text{CH}_2)_n\text{NR}^1$ -アリール、 $\text{NCO}(\text{CH}_2)_n$ -ヘテロアリール、 $\text{NCO}(\text{CH}_2)_n\text{X}$ -ヘテロアリール、 NSO_2R 、 $\text{NSO}_2(\text{CH}_2)_n$ -ヘテロアリール、 $\text{NCO}(\text{CH}_2)_n\text{NR}^1$ -ヘテロアリール、 $\text{N}(\text{CH}_2)_n\text{NR}_2\text{CH}$ 、 $\text{CHO}(\text{CH}_2)_n\text{N}(\text{R}^1)_2$ 、 $\text{CHX}(\text{CH}_2)_n\text{N}(\text{R}^1)_2$ 、 $\text{NCO}(\text{CH}_2)_n\text{NR}_2$ 、 CHR^a 、 NR^a 、 $\text{C}(\text{OH})\text{CY}_3$ 、 $\text{C}(\text{OH})$ -アリール、 $\text{C}(\text{NR}_2)$ -アリールを表し、

R^6 は、それぞれ非置換、または(Hal、 NO_2 、 CN 、 A 、 OR 、 OCOR 、 COR 、 NR_2 、 CF_3 、 OCF_3 、 $\text{OCH}(\text{CF}_3)_2$ で置換されていてもよい)アリールまたはヘテロアリール、Hal、 NO_2 、 CN 、 OR 、 A 、 $-(\text{CY}_2)_n$ - OR 、 $-\text{OCOR}$ 、 $-(\text{CY}_2)_n$ - CO_2R 、 $-(\text{CY}_2)_n$ - CN 、 $-\text{NCO}\text{R}$ 、 $-\text{COR}$ または $-(\text{CY}_2)_n$ - NR_2 でもしくは多置換されているアリールまたはヘテロアリールを表し、

$\text{R}^{6'}$ は、Hまたは R^6 を表し、

R^7 は、 $(\text{C}=\text{O})-\text{R}$ 、 $(\text{C}=\text{O})-\text{NR}_2$ 、 $(\text{C}=\text{O})-\text{OR}$ 、HまたはAを表し、

mは、0、1または2を表し、

nは、0、1、2、3、4、5、6または7を表し、

pは、0、1、2、3、4または5、好ましくは1または2を表し、

Sは、0、1、2、3または4、特に0を表す)。

【請求項2】

R^1 が、 A 、 CF_3 、 OCF_3 、 SA 、 SCN 、 CH_2CN 、 $-\text{OCO}\text{A}$ 、Hal、 SCF_3 、t-ブチル、 $-\text{CH}(\text{CH}_3)\text{CH}_2\text{CH}_3$ 、イソプロピル、エチルまたはメチルを表す、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R^2 が、Hを表す、請求項1または2に記載の化合物。

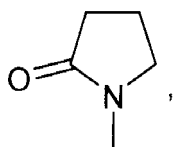
【請求項4】

R^3 が、Hを表す、請求項1から3の一項または複数項に記載の化合物。

【請求項5】

R^5 がHを表す場合に、 R^4 は、以下の基の1つを好ましくは表す、請求項1から4の一項または複数項に記載の化合物

【化3】



$-\text{X}-(\text{CH}_2)_2-\text{NR}_2$ または

$(\text{CH}_2)_p-\text{E}(\text{CH}_2)_p\text{R}^a$ または $(\text{CH}_2)_p-\text{E}-(\text{CH}_2)_p\text{R}^1$

(X、R、 R^a 、 p およびEは、請求項1に示された意味を有する)。

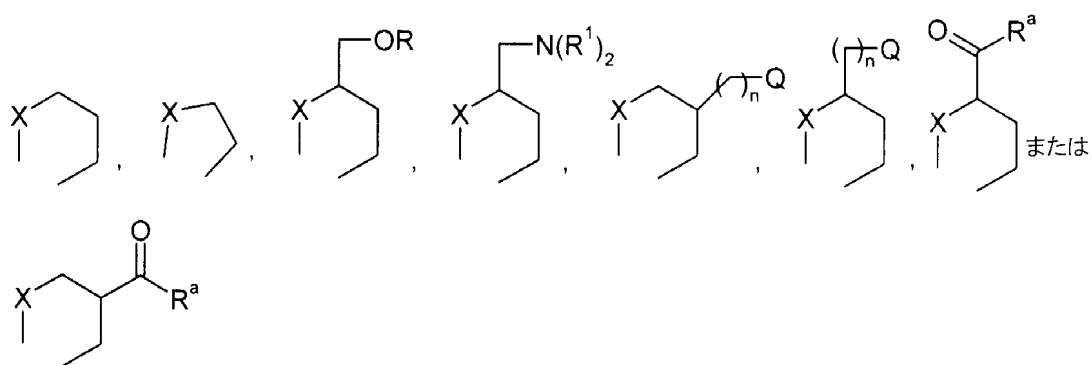
【請求項6】

R^5 が、Hを表す、請求項1から5の一項または複数項に記載の化合物。

【請求項7】

R^5 が、 R^4 と一緒に、以下の意味の1つを採用する、請求項1から6の一項または複数項に記載の化合物

【化 4】



(式中、 n 、 X 、 R および R^a は、以上に示された意味を有する)。

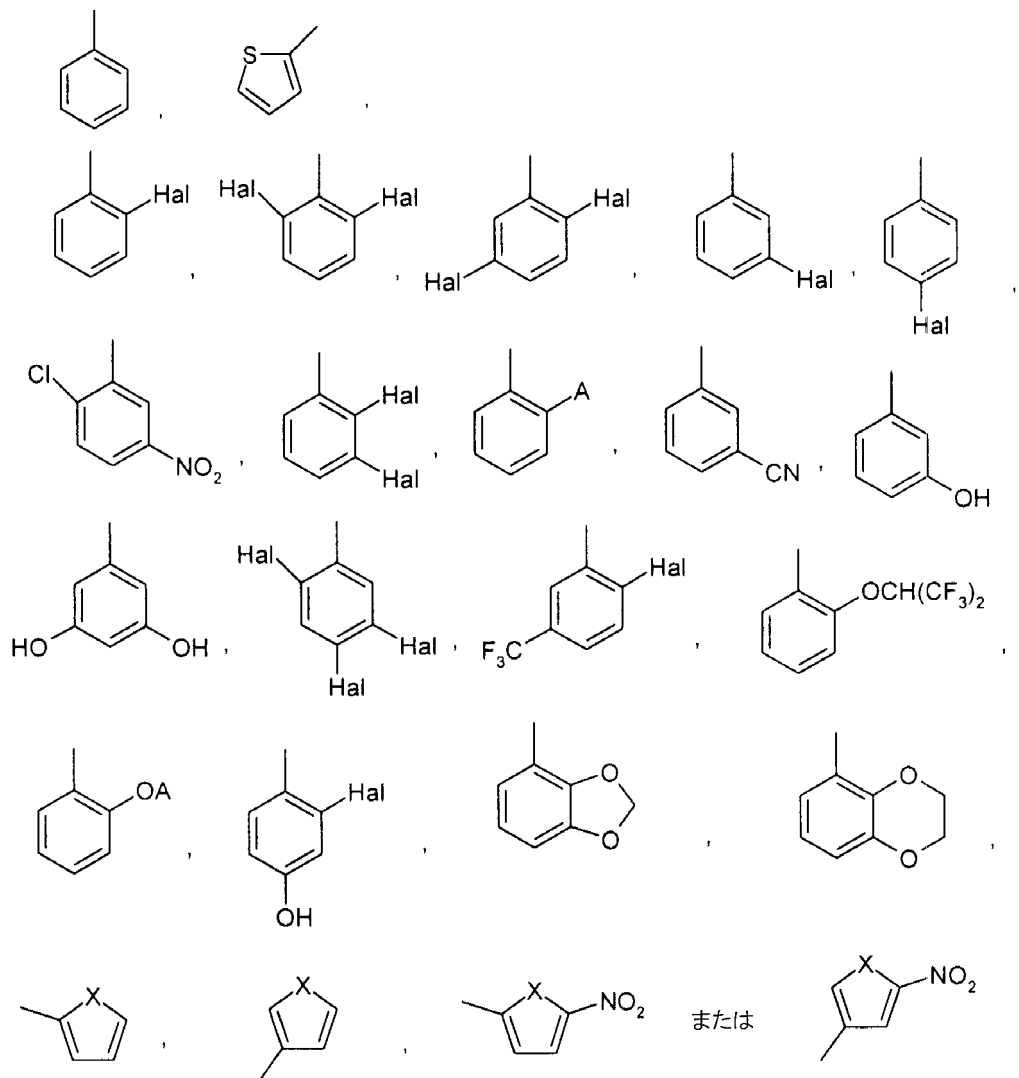
【請求項 8】

R^6 が、それぞれ非置換、あるいはHal、CN、NO₂、OH、CF₃、OCH(CF₃)₂、OCOCH₃またはAで一もしくは多置換されているフェニル、2-、3-もしくは4-ピリジル、ピリミジル、フリルまたはチエニルを表す、請求項1から7の一項または複数項に記載の化合物。

【請求項 9】

R^6 が、以下の基の1つを表す、請求項1から8の一項または複数項に記載の化合物。

【化 5】



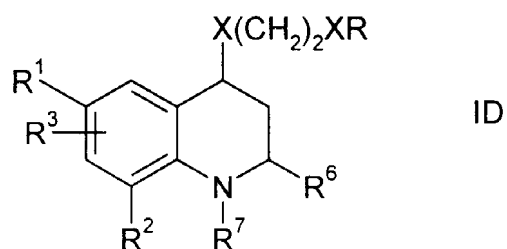
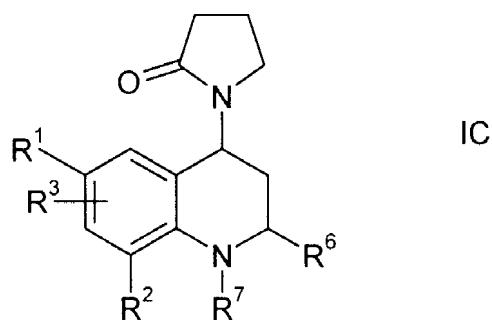
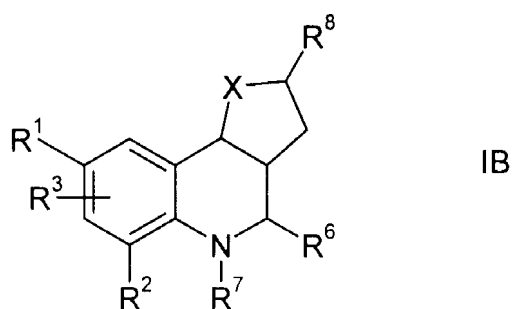
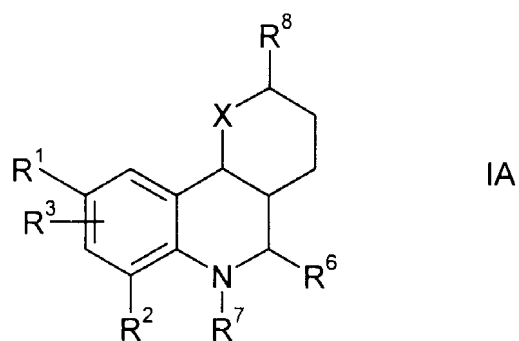
【請求項 10】

R^7 が、Hを表す、請求項 1 から 9 の一項または複数項に記載の化合物。

【請求項 11】

下位式 I A から I D の化合物

【化 6】



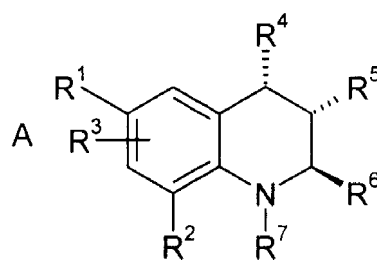
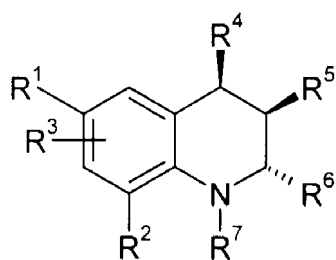
(式中、 R 、 R^1 、 R^2 、 R^3 、 R^4 、 R^5 、 R^7 および X は、請求項 1 に示された意味を有し、

R^8 は、 H 、 CH_2OR または CH_2NR_2 、 CH_2R^a 、 COR^a 、 $(CH_2)_p - E - R^1$ 、 $(CH_2)_n - E - (CH_2)_p - R^a$ を表す)。

【請求項 12】

下位式 A および B の化合物

【化 7】

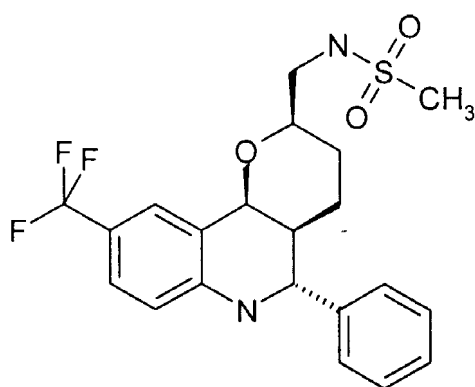


(式中、R¹、R²、R³、R⁴、R⁵、R⁶、R⁷は、請求項 1 に示された意味を有する、およびそのラセミ体、または鏡像異性体の他の混合物)。

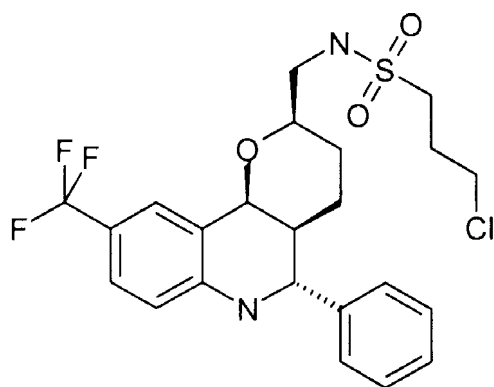
【請求項 13】

下位式 I 1 から I 59 の化合物。

【化 8 - 1】

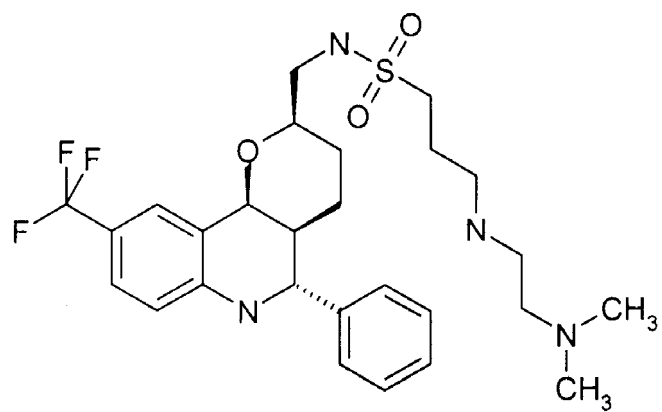


I1

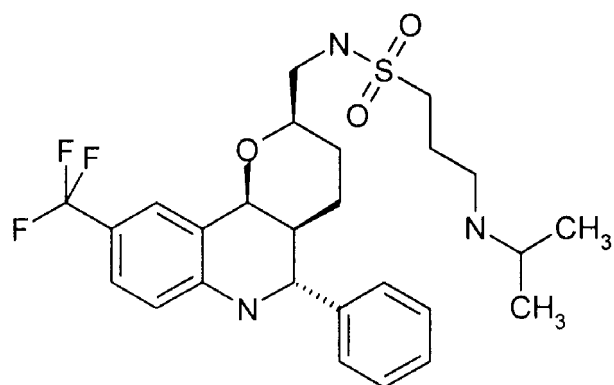


I2

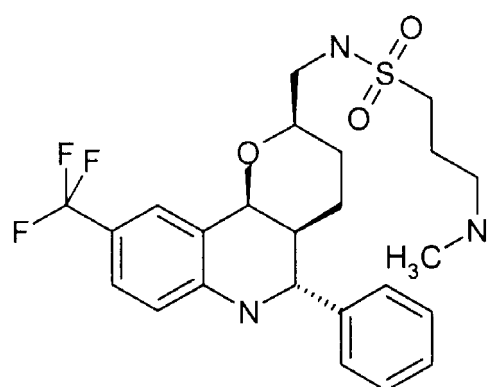
【化 8 - 2】



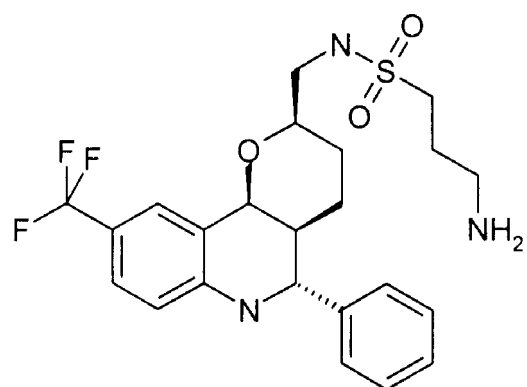
13



14

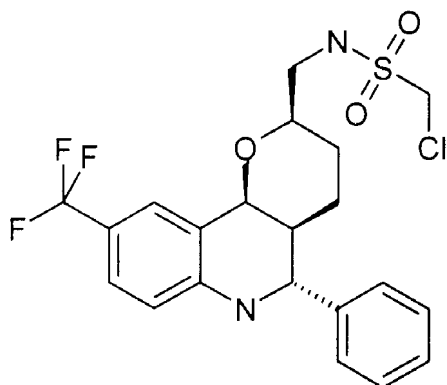


15

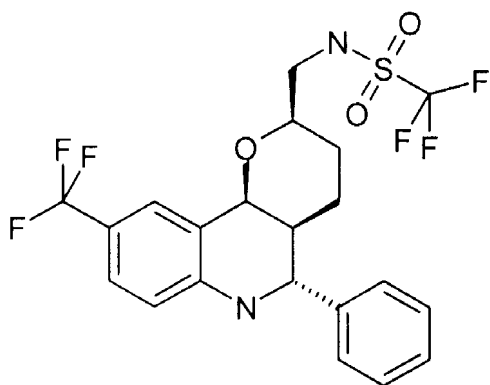


16

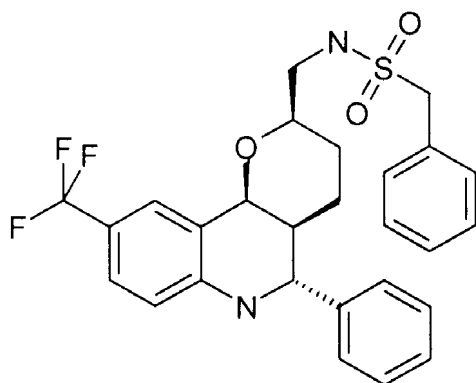
【化 8 - 3】



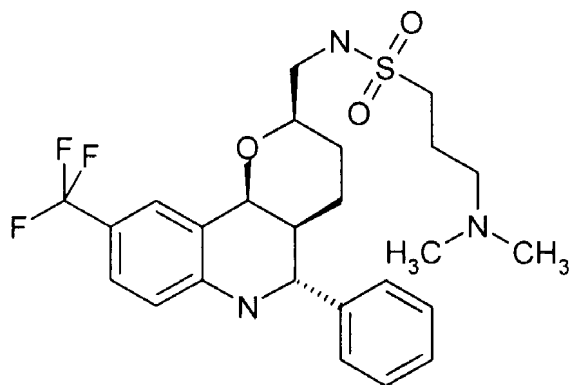
17



18

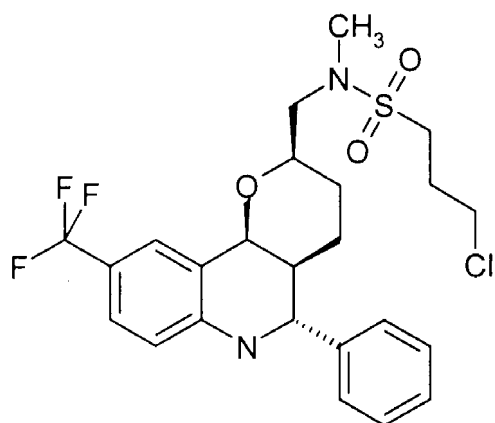


19

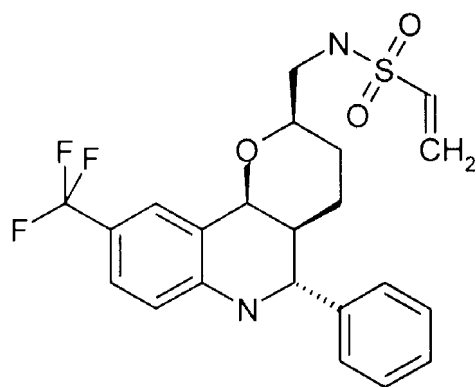


110

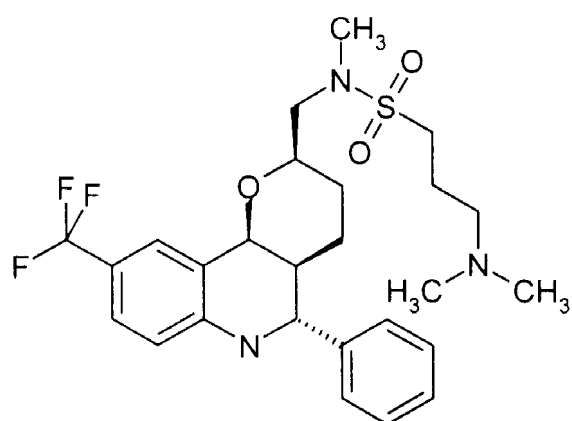
【化 8 - 4】



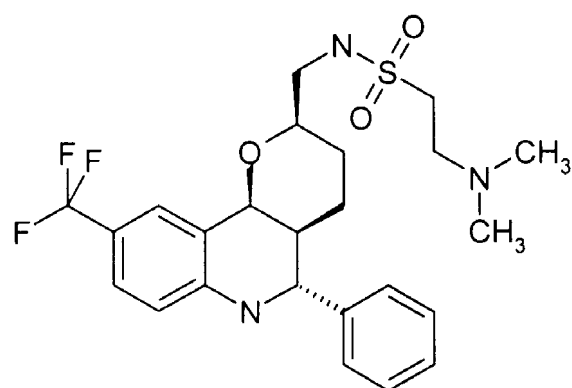
I11



I12

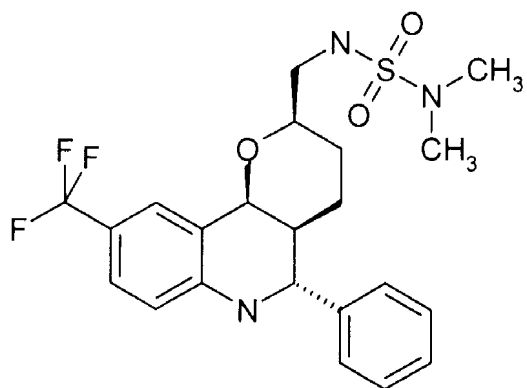


I13

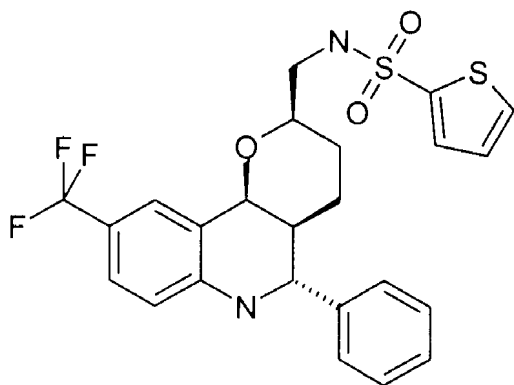


I14

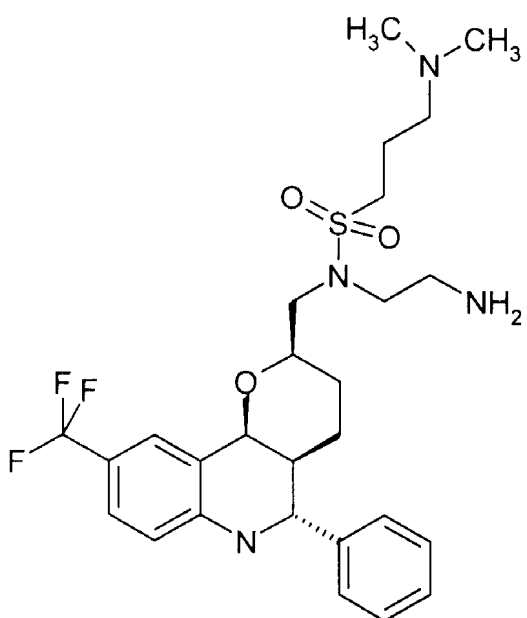
【化 8 - 5】



I15



I16

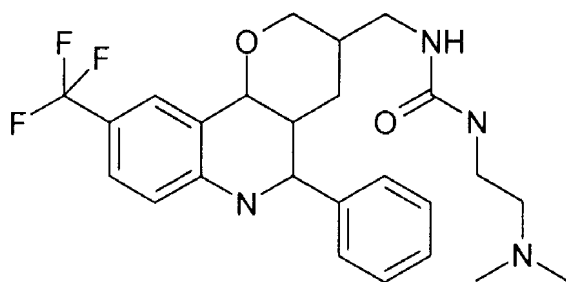


I17

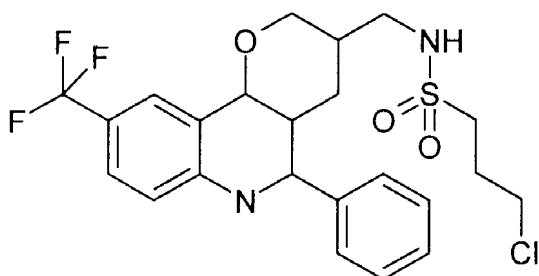
OCC1CCOC2C(C1)C(C3=CC=CC=C3)N(C2)C4=CC=C(C=C4)C(F)(F)FCOs1cc2cc3cc(F)(F)c(F)c3nc2c1Cc1ccccc1NCC1OCC2C(C1)c3ccccc3N2C(F)(F)FCNCC1OCC2C(C1)c3ccccc3N(C2)c4ccc(cc4)C(F)(F)FOCCNCCOC1=C(C2=CC=CC=C2)N(C3=CC=C(C(=C3)C(F)(F)F)C4=CC=CC=C4)C5=CC=CC=C15

122

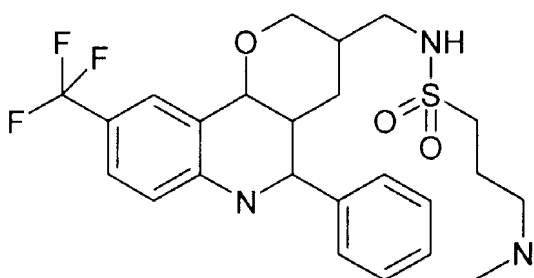
【化 8 - 7】



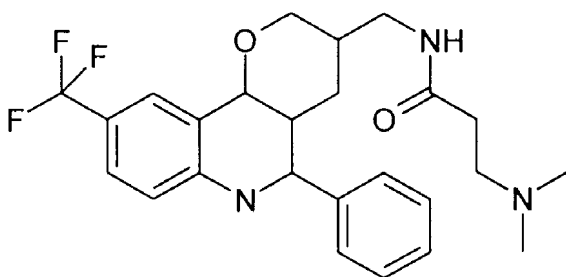
I23



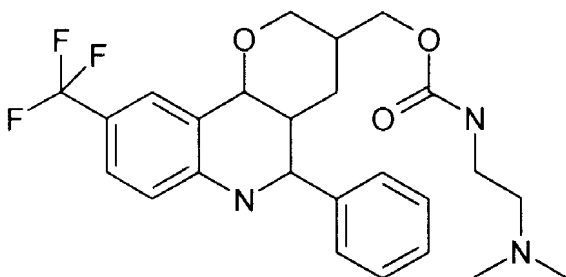
I24



I25

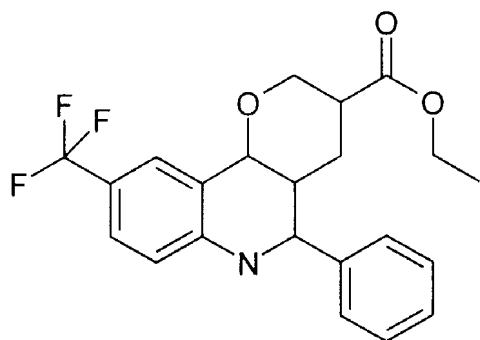


I26

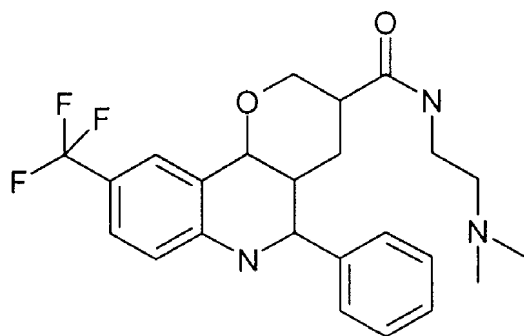


I27

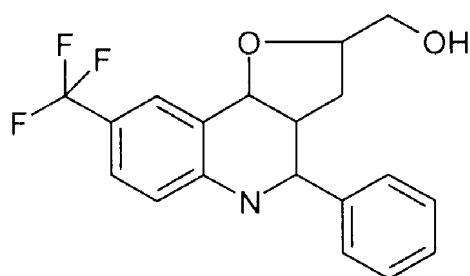
【化 8 - 8】



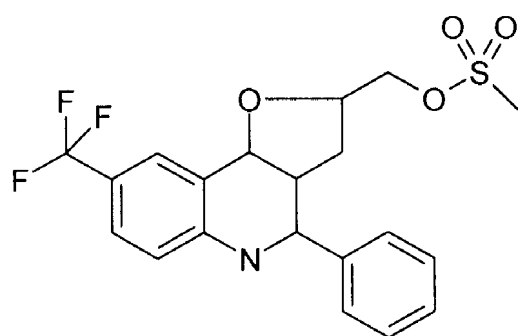
128



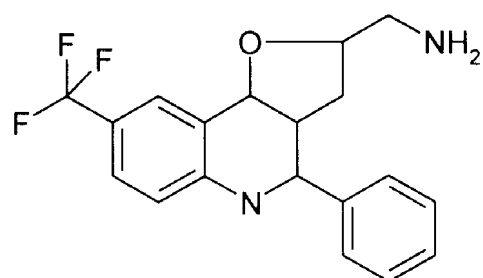
129



130

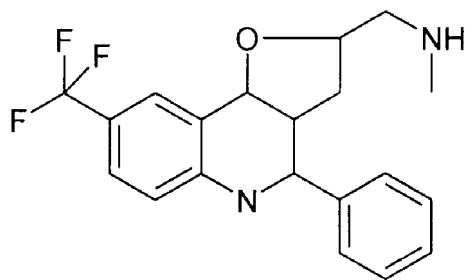


131

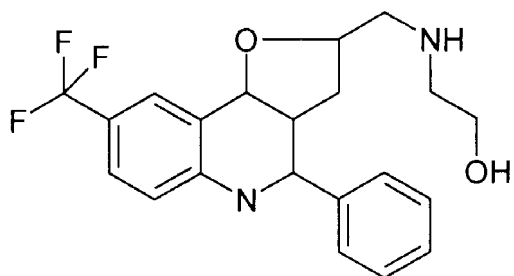


132

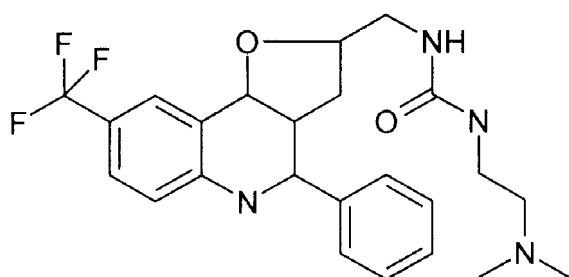
【化 8 - 9】



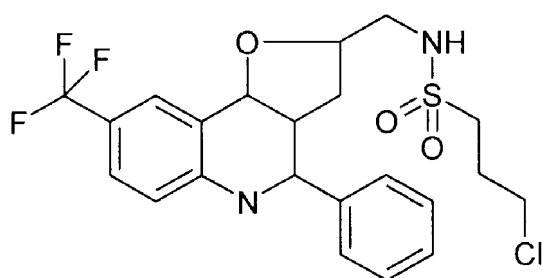
I33



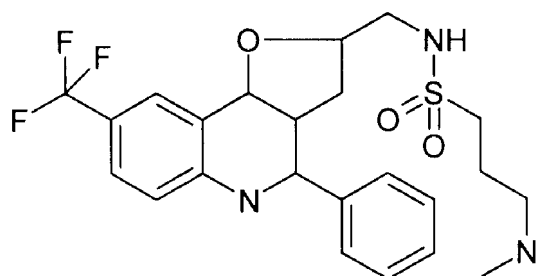
I34



I35

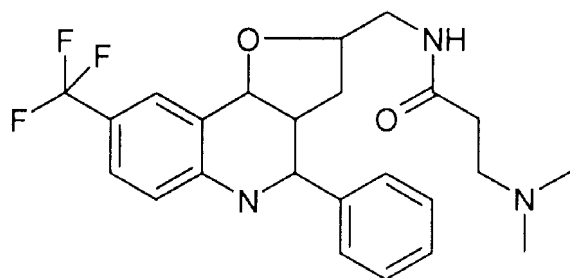


I36

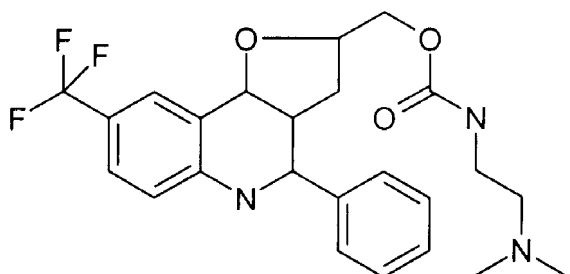


I37

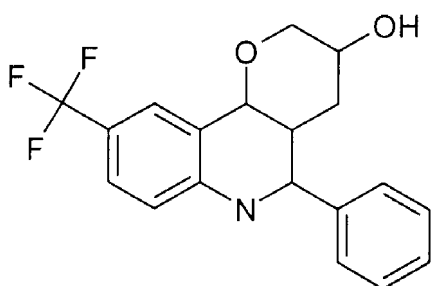
【化 8 - 1 0】



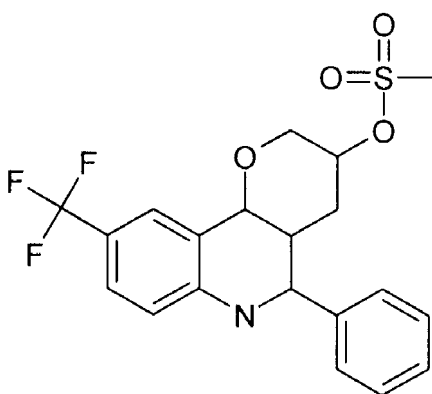
138



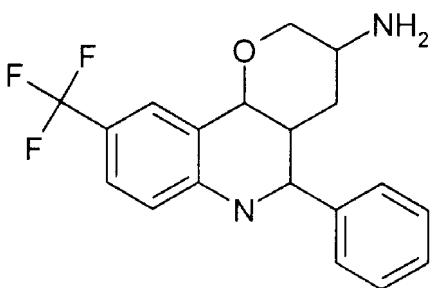
139



140

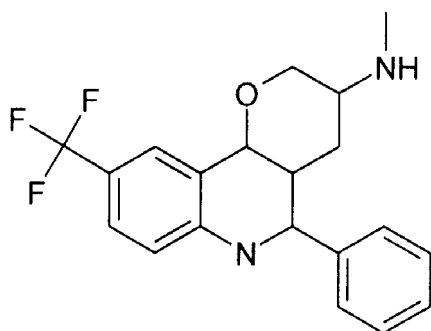


141

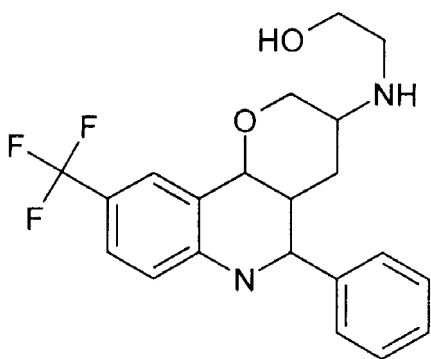


142

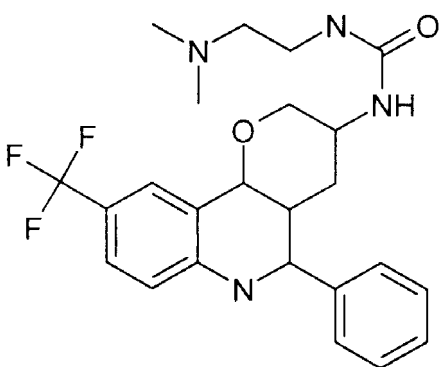
【化 8 - 1 1】



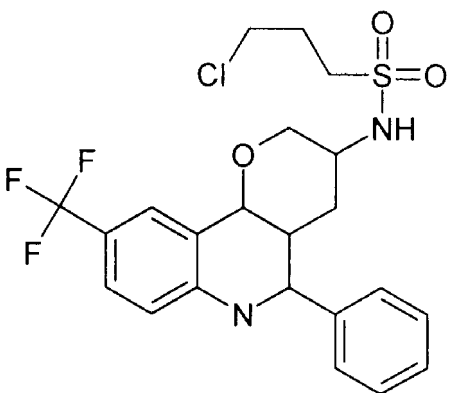
I43



I44

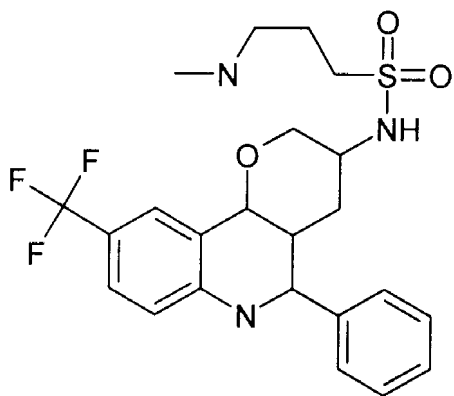


I45

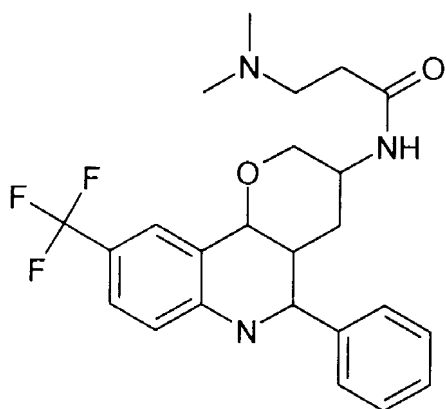


I46

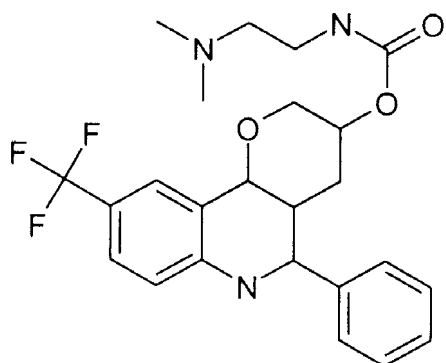
【化 8 - 1 2】



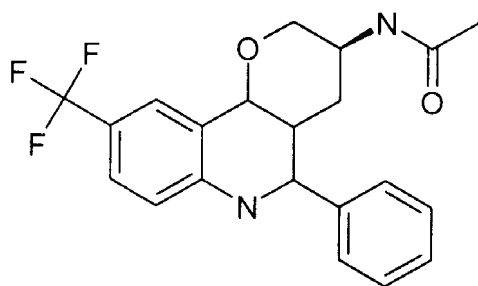
I47



I48

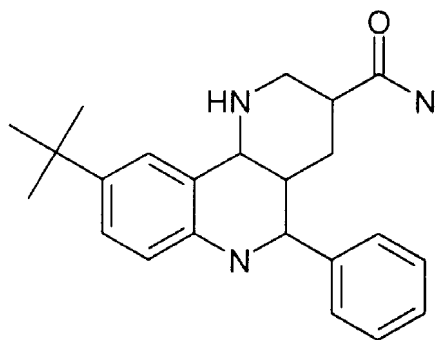


I49

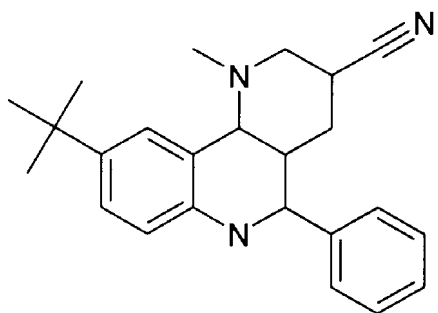


I50

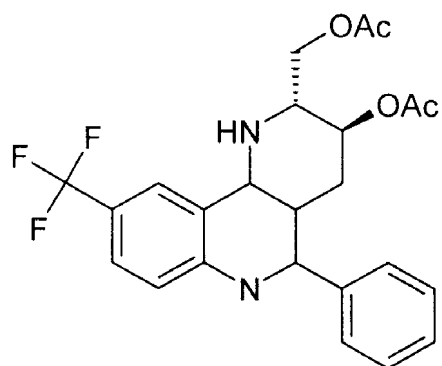
【化 8 - 1 3】



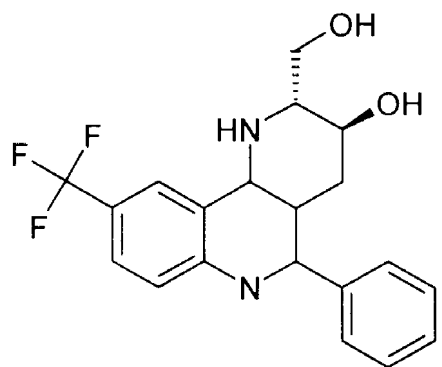
151



152

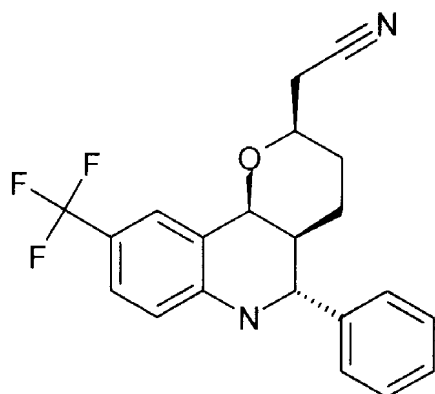


153

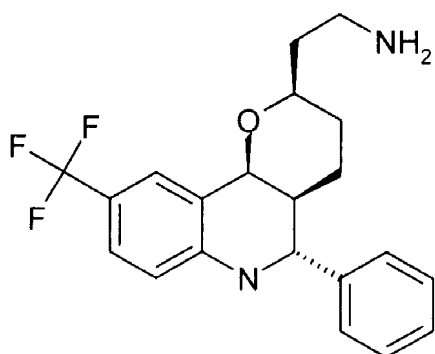


154

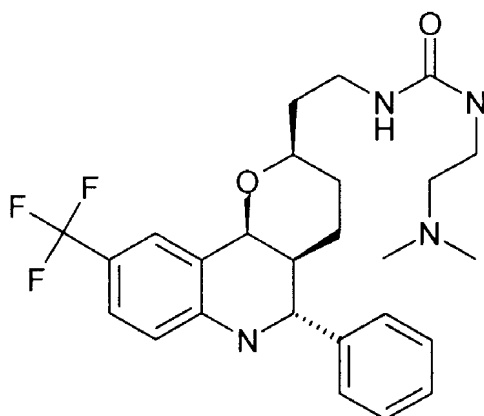
【化 8 - 1 4】



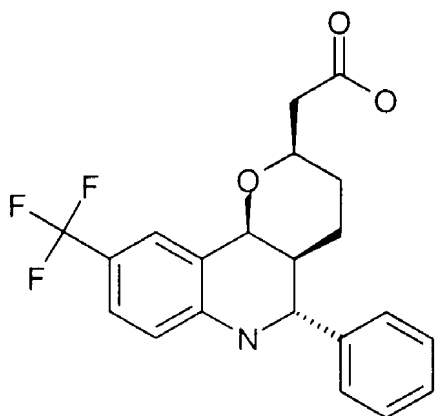
I55



I56

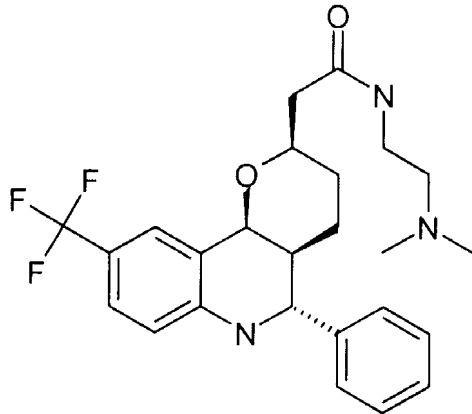


I57



I58

【化 8 - 1 5】

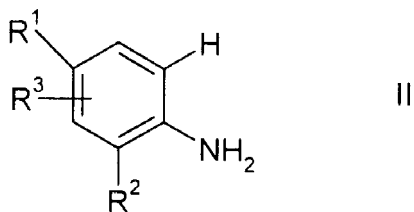


159

【請求項 1 4】

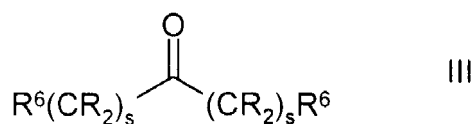
請求項 1 から 1 3 に記載の式 I の化合物、および医薬として使用可能なその誘導体、塩、溶媒和物、互変異性体および立体異性体を調製するための方法であって、式 I I :

【化 9】



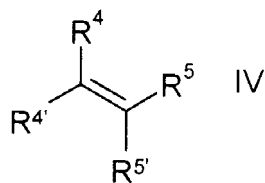
(式中、 R^1 、 R^2 および R^3 は、請求項 1 に示された意味を有する)
の化合物を式 I I I :

【化 1 0】



(式中、 R^6 および s は、請求項 1 に示された意味を有する)
の化合物、および式 I V :

【化 1 1】



(式中、 R^4 、 $R^{4'}$ 、 $R^{5'}$ および R^5 は、請求項 1 に示された意味を有する)
の化合物、その二重結合異性体 (E 異性体) またはその混合物と反応させ、
要望に応じて、H を表す基 R^7 を、H 以外の意味を有する基 R^7 に変換し、
かつ / または、要望に応じて、式 I の塩基または酸をその塩の 1 つに変換することを特

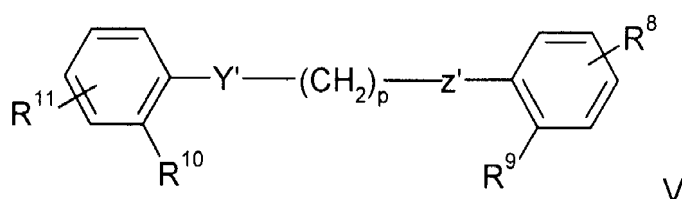
【請求項 15】

【請求項 16】

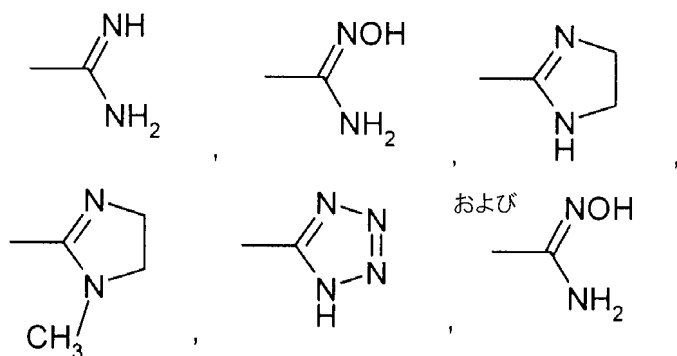
【請求項 17】

【請求項 18】

【化 1 2】



【化 1 3】



【請求項 19】

【請求項 20】

【請求項 2 1】

癌疾患の治療および予防のための医薬品を調製するための請求項 1 から 13 に記載の化合物、または請求項 18 に記載の混合物の使用。

【請求項 22】

前記癌疾患には、扁平上皮、膀胱、胃、腎臓、頭および首、食道、頸、甲状腺、腸、肝臓、脳、前立腺、尿生殖路、リンパ系、胃、喉頭および / または肺の腫瘍の群からの腫瘍を伴う、請求項 21 に記載の使用。

【請求項 23】

前記腫瘍が、単球性白血病、肺腺癌、小細胞肺癌、膵臓癌、グリア芽腫および乳癌および結腸癌の群から生じる請求項 22 に記載の使用。

【請求項 24】

治療される癌疾患が、血液または免疫系の腫瘍である、請求項 21 に記載の使用。

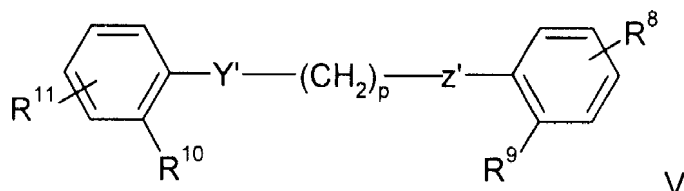
【請求項 25】

前記腫瘍が、急性単球性白血病、慢性単球性白血病、急性リンパ性白血病および / または慢性リンパ性白血病の群から生じる、請求項 24 に記載の使用。

【請求項 26】

腫瘍の治療のための医薬品を調製するための請求項 1 から 13 に記載の式 I の化合物、および / または生理的に許容可能なその塩および溶媒和物を、治療有効量の式 V :

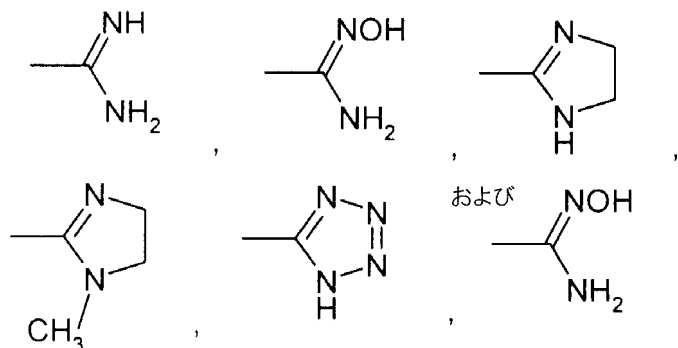
【化 14】



(式中、

Y' および Z' は、それぞれ互いに独立に、O または N を表し、R⁹ および R¹⁰ は、それぞれ互いに独立に、H、OH、ハロゲン、OC₁₋₁₀-アルキル、OCF₃、NO₂ または NH₂ を表し、n は、2 以上 6 以下の整数を表し、R⁸ および R¹¹ は、それぞれ互いに独立に、メタ位またはパラ位にあり、

【化 15】



の群から選択される)

の 1 つまたは複数の化合物、その類似体および / またはその代謝物質と組み合わせた使用において、

式 I の化合物、および式 V の化合物、その類似体および / またはその代謝物質は、腫瘍または他の過剰増殖細胞の成長を阻害するのに十分な量で同時にまたは互いに 14 日以内に投与される使用。

【請求項 27】

使用される式Ⅴの化合物が、ペントミジンまたはその塩である、請求項 26 に記載の使用。

【請求項 28】

腫瘍の治療のための医薬品を調製するための請求項 1 から 13 に記載の式Ⅰの化合物、および / または生理的に許容可能なその塩および溶媒和物の使用において、治療有効量の式Ⅰの化合物は、放射線療法、および 1) エストロゲン受容体モジュレーター、2) アンドロゲン受容体モジュレーター、3) レチノイド受容体モジュレーター、4) 細胞毒性薬、5) 抗増殖剤、6) プレニル - タンパク質転移酵素阻害剤、7) HMG - CoA 還元酵素阻害剤、8) HIV プロテアーゼ阻害剤、9) 逆転写酵素阻害剤および 10) さらなる血管新生阻害剤の群からの化合物と組み合わせて投与される使用。

【請求項 29】

式Ⅰ 118 の化合物、およびあらゆる割合のその混合物を含む医薬として使用可能なその誘導体、溶媒和物、互変異性体、塩および立体異性体。

【化 16】

