

【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23年7月14日(2011.7.14)

【公表番号】特表2010-509348(P2010-509348A)

【公表日】平成22年3月25日(2010.3.25)

【年通号数】公開・登録公報2010-012

【出願番号】特願2009-536401(P2009-536401)

【国際特許分類】

C 07 D 487/04 (2006.01)

A 61 K 31/53 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 487/04 140

C 07 D 487/04 C S P

A 61 K 31/53

A 61 P 35/00

A 61 P 43/00 111

【手続補正書】

【提出日】平成22年7月15日(2010.7.15)

【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

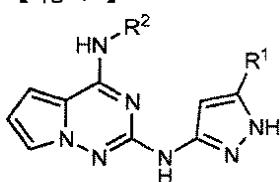
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

【化1】



(I)

[式中、

R¹は、水素、アルキル、置換アルキル、シクロアルキル、置換シクロアルキル、アリールまたは置換アリールであり；

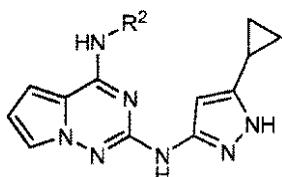
R²は、アルキル、置換アルキル、シクロアルキル、置換シクロアルキル、アリール、置換アリール、ヘテロシクリル、置換ヘテロシクリル、シクロアルキルアルキル、置換シクロアルキルアルキル、アリールアルキル、置換アリールアルキル、ヘテロシクリルアルキル、置換ヘテロシクリルアルキル、-(CH₂)_n-置換アルキル、-(CH₂)_n-アリール、-(CH₂)_n-置換アリール、-(CH₂)_n-置換ヘテロアリール、-(CH₂)_n-OH、-(CH₂)_n-NH₂、-(CH₂)_n-S-アルキルまたは-SO₂アルキルであり、そのうちの置換シクロアルキル、置換アリール、置換ヘテロシクリル、置換シクロアルキルアルキル、置換アリールアルキル、置換ヘテロシクリルアルキル、-(CH₂)_n-置換アリール、または-(CH₂)_n-置換ヘテロアリールが選択された場合、その炭素環に2つの置換基が結合してもよく；および

n は 0、1、2、3 または 4 である]

によって表される式 I の化合物、あるいはその医薬的に許容される塩、または立体異性体。

【請求項 2】

【化 2】



(II)

[式中、

R² は、アルキル、置換アルキル、シクロアルキル、置換シクロアルキル、アリール、置換アリール、ヘテロシクリル、置換ヘテロシクリル、シクロアルキルアルキル、置換シクロアルキルアルキル、アリールアルキル、置換アリールアルキル、ヘテロシクリルアルキル、置換ヘテロシクリルアルキル、- (C_H₂)_n - 置換アルキル、- (C_H₂)_n - アリール、- (C_H₂)_n - 置換アリール、- (C_H₂)_n - 置換ヘテロアリール、- (C_H₂)_n - OH、- (C_H₂)_n - NH₂、- (C_H₂)_n - S - アルキルまたは、- SO₂ アルキルであり、そのうちの置換シクロアルキル、置換アリール、置換ヘテロシクリル、置換シクロアルキルアルキル、置換アリールアルキル、置換ヘテロシクリルアルキル、- (C_H₂)_n - 置換アリール、または - (C_H₂)_n - 置換ヘテロアリールが選択された場合、その炭素環に 2 つの置換基が結合してもよく；および

n は 0、1、2、3 または 4 である]

によって表される式 I I の化合物、あるいはその医薬的に許容される塩、または立体異性体。

【請求項 3】

N² - (5 - シクロプロビル - 1H - ピラゾル - 3 - イル) - N⁴ - ((1S) - 1 - (4 - フルオロフェニル)エチル)ピロロ[2,1-f][1,2,4]トリアジン - 2,4 - ジアミン、

N² - (5 - シクロプロビル - 1H - ピラゾル - 3 - イル) - N⁴ - ((1S) - 1 - メチルペンチル)ピロロ[2,1-f][1,2,4]トリアジン - 2,4 - ジアミン、

N⁴ - (1 - ベンジル - 3 - ピロリジニル) - N² - (5 - メチル - 1H - ピラゾル - 3 - イル)ピロロ[2,1-f][1,2,4]トリアジン - 2,4 - ジアミン、

N⁴ - (3 - シクロプロビル - 1H - ピラゾル - 5 - イル) - N² - ((1S) - 1 - フェニルエチル)ピロロ[2,1-f][1,2,4]トリアジン - 2,4 - ジアミン、

N⁴ - (3 - シクロプロビル - 1H - ピラゾル - 5 - イル) - N² - ((1R) - 1 - フェニルエチル)ピロロ[2,1-f][1,2,4]トリアジン - 2,4 - ジアミン、

N⁴ - ((1S) - 1 - (4 - フルオロフェニル)エチル) - N² - (5 - メチル - 1H - ピラゾル - 3 - イル)ピロロ[2,1-f][1,2,4]トリアジン - 2,4 - ジアミン、

N⁴ - シクロヘプチル - N² - (5 - シクロプロビル - 1H - ピラゾル - 3 - イル)ピロロ[2,1-f][1,2,4]トリアジン - 2,4 - ジアミン、

N⁴ - (シクロヘキシリメチル) - N² - (5 - シクロプロビル - 1H - ピラゾル - 3 - イル)ピロロ[2,1-f][1,2,4]トリアジン - 2,4 - ジアミン、

N⁴ - ((1S) - 1 - シクロヘキシリエチル) - N² - (5 - シクロプロビル - 1H - ピラゾル - 3 - イル)ピロロ[2,1-f][1,2,4]トリアジン - 2,4 - ジアミン、

を含む群から選択される化合物、あるいはそれらの医薬的に許容される塩、または立体異性体。

【請求項 4】

請求項 1 の化合物を一以上、および医薬的に許容される担体を含む医薬組成物。

【請求項 5】

請求項 1 の化合物の一以上を、医薬的に許容される担体、および一以上の他の抗癌剤、または細胞毒性薬と組み合わせたものを含む医薬組成物。

【請求項 6】

請求項 1 の化合物の一以上の治療上の有効量を含む、増殖性疾患の治療剤。

【請求項 7】

該増殖性疾患が癌である、請求項 6 の治療剤。

【請求項 8】

該癌が、前立腺癌、膀胱腺癌、乳癌、結腸癌、肺癌、卵巣癌、肺臓癌および甲状腺癌、神経芽細胞腫、神経膠芽腫、髄芽細胞腫および黒色腫、多発性骨髄腫、並びに急性骨髄性白血病（AML）を含む群から選択される、請求項 7 の治療剤。

【請求項 9】

請求項 1 の化合物の一以上と組み合わせた、一以上の他の抗癌剤、または細胞毒性薬の治療上の有効量をさらに含む、請求項 8 の治療剤。

【請求項 10】

請求項 1 の化合物の一以上の有効量を含む、受容体チロシンキナーゼ活性の調節剤。

【請求項 11】

請求項 1 の化合物の一以上と組み合わせた、一以上の他の抗癌剤、または細胞毒性薬の治療上の有効量をさらに含む、請求項 10 の治療剤。

【請求項 12】

前記受容体チロシンキナーゼが、TrkA または TrkB、TrkC または Flt-3 である、請求項 11 の治療剤。