

【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28年3月10日 (2016.3.10)

【公表番号】特表2015-508085(P2015-508085A)

【公表日】平成27年3月16日 (2015.3.16)

【年通号数】公開・登録公報2015-017

【出願番号】特願2014-558027(P2014-558027)

【国際特許分類】

C 0 7 D 491/048 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4355 (2006.01)
 A 6 1 K 31/4545 (2006.01)
 A 6 1 K 31/444 (2006.01)
 A 6 1 P 29/00 (2006.01)
 A 6 1 P 37/00 (2006.01)
 A 6 1 P 37/06 (2006.01)
 A 6 1 P 37/08 (2006.01)
 A 6 1 P 7/02 (2006.01)
 A 6 1 P 35/00 (2006.01)
 A 6 1 P 31/00 (2006.01)
 A 6 1 P 25/28 (2006.01)
 A 6 1 P 25/00 (2006.01)
 A 6 1 P 9/00 (2006.01)
 A 6 1 P 3/00 (2006.01)
 A 6 1 P 35/02 (2006.01)
 A 6 1 P 19/02 (2006.01)
 A 6 1 P 17/06 (2006.01)
 A 6 1 P 11/06 (2006.01)
 A 6 1 P 9/10 (2006.01)
 A 6 1 P 1/04 (2006.01)
 A 6 1 P 3/10 (2006.01)
 A 6 1 P 43/00 (2006.01)
 A 6 1 P 25/14 (2006.01)
 A 6 1 P 25/16 (2006.01)
 A 6 1 P 33/02 (2006.01)
 A 6 1 P 31/04 (2006.01)
 A 6 1 P 31/18 (2006.01)
 A 6 1 P 31/12 (2006.01)
 A 6 1 P 31/20 (2006.01)
 A 6 1 P 1/16 (2006.01)
 A 6 1 P 31/08 (2006.01)
 A 6 1 P 31/06 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 491/048 C S P
 A 6 1 K 31/4355
 A 6 1 K 31/4545
 A 6 1 K 31/444
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 37/00
 A 6 1 P 37/06

A 6 1 P	37/08	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	7/02	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	31/00	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	3/00	
A 6 1 P	35/02	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	17/06	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	9/10	
A 6 1 P	1/04	
A 6 1 P	3/10	
A 6 1 P	43/00	1 0 5
A 6 1 P	25/14	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	33/02	
A 6 1 P	31/04	
A 6 1 P	31/18	
A 6 1 P	31/12	
A 6 1 P	31/20	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 P	31/08	
A 6 1 P	31/06	

【手続補正書】

【提出日】平成28年1月21日(2016.1.21)

【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

【化 1】



式中、

 R^1 は、 Ar^1 または Het^1 を示し、 R^2 は、 Ar^2 、 Het^2 、 $NH(CH_2)_n Ar^2$ 、 $O(CH_2)_n Ar^2$ 、 $NH(C$

$H_2)_n Het^2$ 、 $NHCONHA$ 、 $CONH_2$ または N_3 を示し、

R^4 は、 H または F を示し、

Ar^1 は、非置換であるか、あるいは、 Hal 、 A 、 $[C(R^3)_2]_n CN$ 、 $(CH_2)_n OH$ 、 $(CH_2)_n OA$ 、 $(CH_2)_n COOH$ 、 $(CH_2)_n COOA$ 、 $S(O)_m A$ 、 $(CH_2)_n Het^3$ 、 $CON(R^3)_2$ 、 $CONH(CH_2)_n C(R^3)_2 N(R^3)_2$ および / または $CONH(CH_2)_p CH[(CH_2)_n OR^3](CH_2)_p OR^3$ で、単置換、二置換または三置換されたフェニルを示し、

Ar^2 は、非置換であるか、あるいは、 A 、 Hal 、 $(CH_2)_n OH$ 、 $(CH_2)_n OA$ 、 $(CH_2)_n NH_2$ 、 $(CH_2)_n NHA$ 、 $(CH_2)_n NA_2$ 、 $SO_2 NH_2$ 、 $SO_2 NHA$ 、 $SO_2 NA_2$ 、 $(CH_2)_n CONH_2$ 、 $(CH_2)_n CONHA$ 、 $(CH_2)_n CONA_2$ 、 $[C(R^3)_2]_n N(R^3)_2$ 、 $CONH(CH_2)_p CH[(CH_2)_n N(R^3)_2](CH_2)_p OR^3$ 、 $CONH(CH_2)_p CH[(CH_2)_n OR^3]NH SO_2 A$ 、 $CONH(CH_2)_p CH[(CH_2)_n OR^3]OR^3$ 、 $CONH(CH_2)_p [(CH_2)_p CH_2 OR^3]$ 、 $CONHR^4$ 、 $CONH(CH_2)_p CH[(CH_2)_n N(R^3)_2]Cyc$ 、 $CONH(CH_2)_n C(R^3)_2 N(R^3)_2$ および / または $CONHC(R^3)_2 (CH_2)_p OR^3$ で、単置換、二置換または三置換されたフェニルを示し、

Het^1 は、ベンゾ - 1, 3 - ジオキソリルまたはインダゾリルを示し、その各々は、非置換であるか、または、 A で単置換されており、

Het^2 は、ペペリジニル、ペペラジニル、ピロリジニル、モルホリニル、フリル、チエニル、ピロリル、イミダゾリル、ピラゾリル、オキサゾリル、イソオキサゾリル、チアゾリル、イソチアゾリル、ピリジル、ピリミジニル、トリアゾリル、テトラゾリル、オキサジアゾリル、チアジアゾリル、ピリダジニル、ピラジニル、キノリル、イソキノリル、ベンズイミダゾリル、フロピリジニルまたはインダゾリルを示し、その各々が、非置換であるか、あるいは、 Hal 、 $NH(CH_2)_n Het^4$ 、 A 、 $(CH_2)_n OH$ 、 $(CH_2)_n OA$ 、 $(CH_2)_n NH_2$ 、 $(CH_2)_n NHA$ 、 $(CH_2)_n NA_2$ および / または $=O$ で単置換、二置換または三置換されており、

Het^3 は、テトラゾリルまたはオキサジアゾリルを示し、その各々が、非置換であるか、あるいは、 A 、 $(CH_2)_n NH_2$ 、 $(CH_2)_n NHA$ 、 $(CH_2)_n NA_2$ および / または $=O$ で単置換または二置換されており、

Het^4 は、ペペリジニルまたはテトラヒドロフラニルを示し、その各々が、非置換であるか、あるいは、 A または NH_2 で単置換されており、

R^3 は、 H 、または、1 個、2 個、3 個もしくは 4 個の C 原子を有するアルキルを示し、 A は、1 ~ 10 個の C 原子を有する非分岐または分岐のアルキル、ここで 1 ~ 7 個の H 原子が F および / または Cl で交換されていても、および / または、1 個もしくは 2 個の非隣接の CH_2 基が O および / または NH で交換されていてもよい、

あるいは、

3 ~ 7 個の C 原子を有する環状アルキル、ここでは非置換であっても、 OH 、 $NHCOA$ または NH_2 で単置換されていてもよい、を示し、

Cyc は、3 ~ 7 個の C 原子を有する環状アルキルを示し、

m は、0、1 または 2 を示し、

n は、0、1、2、3 または 4 を示し、

p は、1、2、3 または 4 を示す、

で表される化合物、または、その薬学的に許容し得る溶媒和物、塩、互変異性体もしくは立体異性体、あるいは、あらゆる比率でのそれらの混合物。

【請求項 2】

以下の群

【表 1】

番号	名称
"A1"	3-[7-[5-((R)-1-アミノ-エチル)-2-メトキシ-フェニル]-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-4-メトキシ-ベンズアミド
"A2"	ピペリジン-3-イルメチル-[2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-アミン
"A3"	2-[5-[2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンゾイミダゾール-1-イル]-エチルアミン
"A4"	N1-[4-メトキシ-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンジル]-エタン-1, 2-ジアミン
"A5"	N-((R)-2-アミノ-3-メトキシ-プロピル)-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A6"	1-(2-アミノ-エチル)-6-[2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-1, 3-ジヒドロ-ベンゾイミダゾール-2-オン
"A7"	(R)-1-ピペリジン-3-イルメチル-[4-[2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ピリジン-2-イル]-アミン
"A8"	2-[6-[2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンゾイミダゾール-1-イル]-エチルアミン
"A9"	3-[7-(1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-4-メトキシ-ベンズアミド
"A10"	N-((R)-2-メタンスルホニルアミノ-3-メトキシ-プロピル)-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A11"	N-((1S, 2R)-2-ヒドロキシ-シクロヘキシル)-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A12"	N-((1R, 2R)-2-ヒドロキシ-シクロペンチル)-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A13"	7-(6-メチル-1H-インダゾール-5-イル)-2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン
"A14"	4-[7-(1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-3-メトキシ-フェノール

【表 2】

"A15"	N-((1R, 2S)-2-アミノ-シクロヘキシル)-3-[2-(4-ヒドロキシ-2-メトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A16"	N-(2-ヒドロキシ-3-メトキシ-プロピル)-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A17"	N-((R)-2, 3-ジヒドロキシ-プロピル)-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A18"	2-[4-[7-(1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-3-メトキシ-フェノキシ]-エチルアミン
"A19"	N-((1R, 2R)-2-ヒドロキシ-シクロヘキシル)-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A20"	N-(2, 3-ジヒドロキシ-プロピル)-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A21"	1-[4-メトキシ-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-フェニル]-エタノール
"A22"	N-((1R, 2S)-2-ヒドロキシ-シクロペンチル)-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A23"	N-(2-アミノ-2-シクロプロピル-エチル)-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A24"	N-(3-アミノ-シクロブチル)-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A25"	N-((1R, 2S)-2-アミノ-シクロヘキシル)-3-[2-(2-クロロ-5-メトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A26"	N-((S)-2-アミノ-3-メトキシ-プロピル)-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A27"	N-(3-アミノ-シクロブチル)-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A28"	N-((2S, 3R, 4R, 5R)-2, 3, 4, 5, 6-ペンタヒドロキシ-ヘキシル)-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A29"	3-[2-[4-(2-アミノ-エトキシ)-2-メトキシ-フェニル]-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-N-(2-ヒドロキシ-エチル)-ベンズアミド

【表 3】

"A30"	2, 7-ビス-(5-エチル-2-メトキシフェニル)-フロ [3, 2-b]ピリジン
"A31"	3-[2-(5-カルバモイル-2-メトキシフェニル)フロ [3, 2-b]ピリジン-7-イル]-4-メトキシベンズアミド
"A32"	N-(2-アミノ-2-メチル-プロピル)-3-[2-(3, 4, 5- トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イ ル]-ベンズアミド
"A33"	N-((1R, 2S)-2-メタンスルホニルアミノシクロヘキシ ル)-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A34"	N-((1R, 2S)-2-アセチルアミノシクロヘキシル)-3- [2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b] ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A35"	N-((1R, 2S)-2-アミノシクロヘキシル)-3-フルオ ロ-5-[2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2- b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A36"	7-(1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-2-(2-エチル -5-メトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン
"A37"	1-(2-アミノエチル)-5-[2-(3, 4, 5-トリメトキシ フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-1, 3-ジ ヒドロベンゾイミダゾール-2-オン
"A38"	5-[2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b] ピリジン-7-イル]-ピリジン-2-オール
"A39"	4-[2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b] ピリジン-7-イル]-ピリジン-2-オール
"A40"	N-(2-ヒドロキシ-1, 1-ジメチル-エチル)-3-[2- (3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン -7-イル]-ベンズアミド
"A41"	7-(1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-2-(5-エチル -2-メトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン
"A42"	N-((1R, 2S)-2-アミノシクロヘキシル)-3-[2-(2- エチル-5-メトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン -7-イル]-ベンズアミド
"A43"	N-((1R, 2S)-2-アミノシクロヘキシル)-3-[2-(5- エチル-2-メトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン -7-イル]-ベンズアミド
"A44"	2-[4-フルオロ-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニ ル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-フェノキシ]-エチ ルアミン

【表 4】

"A45"	N-((1R, 2S)-2-アミノシクロヘキシル)-3-[2-(6-メチル-1H-インダゾール-5-イル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A46"	3-{7-[3-((1R, 2S)-2-アミノシクロヘキシルカルバモイル)-フェニル]-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル}-4-メトキシベンズアミド
"A47"	N-((1R, 2S)-2-アミノシクロヘキシル)-3-[6-フルオロ-2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A48"	N-((1R, 2S)-2-アミノシクロヘキシル)-4-フルオロ-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A49"	N-((1R, 2S)-2-アミノシクロヘキシル)-3-[2-(2-エチルフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A50"	N-((1R, 2S)-2-アミノシクロヘキシル)-3-[2-(2-メチル-5-スルファモイルフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A51"	N-((1R, 2S)-2-アミノシクロヘキシル)-3-{2-[5-(2-アミノエトキシ)-2-メトキシフェニル]-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル}-ベンズアミド
"A52"	N-((1R, 2S)-2-アミノシクロヘキシル)-3-{2-[4-(2-アミノエトキシ)-2-メチルフェニル]-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル}-ベンズアミド
"A53"	7-ピペラジン-1-イル-2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン
"A54"	3-[7-(6-フルオロ-4-メチルピリジン-3-イル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-4-メトキシベンズアミド
"A55"	N-(2-アミノエチル)-3-フルオロ-5-[2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A56"	N-(2-アミノエチル)-3-メチル-5-[2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A57"	N-(3-アミノプロピル)-3-メチル-5-[2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A58"	N-(3-アミノプロピル)-4-メトキシ-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A59"	6-(1H-ピラゾール-4-イル)-2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン

【表 5】

"A60"	N-((1R, 2S)-2-アミノシクロヘキシル)-3-(2-ベンゾ[1, 3]ジオキソール-4-イル-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル)-ベンズアミド
"A61"	N-(3-アミノプロピル)-3-フルオロ-5-[2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A62"	3-[7-(2, 6-ジメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-4-メトキシベンズアミド
"A63"	3-[7-(1-エチル-1H-ピラゾール-4-イル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-4-メトキシベンズアミド
"A64"	N-((1R, 2S)-2-アミノシクロプロピル)-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A65"	ジメチル-[4-[2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-フェニル]-アミン
"A66"	3-[7-(2, 6-ジメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-4-メトキシ安息香酸
"A67"	N-((3S, 4R)-4-アミノテトラヒドロフラン-3-イル)-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-ベンズアミド
"A68"	N-(2-アミノ-2-メチルプロピル)-3-[7-(2, 6-ジメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-4-メトキシベンズアミド
"A69"	3-[7-(2, 6-ジメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-N-(2-ヒドロキシ-3-メトキシプロピル)-4-メトキシベンズアミド
"A70"	N-(2, 3-ジヒドロキシプロピル)-3-[7-(2, 6-ジメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-4-メトキシベンズアミド
"A71"	N-(2-アミノエチル)-3-[7-(2, 6-ジメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-4-メトキシベンズアミド
"A72"	4-メトキシ-3-[7-(1H-ピラゾール-3-イル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-ベンズアミド
"A73"	4-[7-[3-((1R, 2S)-2-アミノシクロヘキシルカルバモイル)-フェニル]-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-3-フルオロベンズアミド
"A74"	3-[7-(2, 6-ジメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-4-イソプロピルベンズアミド

【表 6】

"A75"	1-(2-アミノ-シクロヘキシル)-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-尿素
"A76"	N-(2-アミノ-エチル)-4-[2-(5-カルバモイル-2-メトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-3, 5-ジメトキシ-ベンズアミド
"A77"	4-メトキシ-3-[7-(2-メトキシ-5-スルファモイル-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-ベンズアミド
"A78"	3-[7-(2, 6-ジメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-4-メトキシ-ベンゼンスルホンアミド
"A79"	3-[7-[5-(2-アミノエチルカルバモイル)-2-メトキシ-フェニル]フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-4-メトキシ-ベンズアミド
"A80"	3-{7-[2-(2-アミノ-エチルアミノ)-ピリジン-4-イル]-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル}-4-メトキシ-ベンズアミド
"A81"	3-{7-[2-(2-アミノ-シクロヘキシルアミノ)-ピリジン-4-イル]-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル}-4-メトキシ-ベンズアミド
"A82"	4-メトキシ-3-[7-(1H-ピラゾール-3-イル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-ベンゼンスルホンアミド
"A83"	7-(1H-ピロール-3-イル)-2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン
"A84"	7-(2, 6-ジメトキシ-フェニル)-2-[2-メトキシ-5-(1H-テトラゾール-5-イル)-フェニル]-フロ[3, 2-b]ピリジン
"A85"	7-(2, 6-ジメトキシ-フェニル)-2-(2-メトキシ-5-[1, 2, 4]オキサジアゾール-3-イル-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン
"A86"	7-アジド-2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン
"A87"	7-(6-メトキシ-1H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-2-(3, 4, 5-トリメトキシ-フェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン
"A88"	4-メトキシ-3-[7-(1H-ピラゾール-3-イル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-ベンゾニトリル
"A89"	4-メトキシ-3-[7-(6-メトキシ-3H-ベンゾイミダゾール-5-イル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-ベンズアミド
"A90"	4-メトキシ-3-(7-{2-[(S)-1-ピペリジン-3-イルメチル]-アミノ}-ピリジン-4-イル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル)-ベンズアミド

【表 7】

"A91"	7-(3H-イミダゾール-4-イル)-2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン
"A92"	2-(2-メトキシ-5-[1, 2, 4]オキサジアゾール-3-イルフェニル)-7-(1H-ピラゾール-3-イル)-フロ[3, 2-b]ピリジン
"A93"	3-[7-(3H-イミダゾール-4-イル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-4-メトキシベンズアミド
"A94"	4-メトキシ-3-[7-(1H-ピロール-3-イル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-ベンズアミド
"A95"	N-(2-アミノエチル)-4-[2-(5-カルバモイル-2-メトキシフェニル)フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-3-メトキシベンズアミド
"A96"	3-{7-[2-((1S, 2R)-2-アミノシクロヘキシルアミノ)-ピリジン-4-イル]-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル}-4-メトキシベンズアミド
"A97"	3-{7-[2-((1R, 2S)-2-アミノシクロヘキシルアミノ)-ピリジン-4-イル]-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル}-4-メトキシベンズアミド
"A98"	2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-カルボン酸アミド
"A99"	7-(5-メチル-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-イル)-2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン
"A100"	(R)-1-{4-メトキシ-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-フェニル}-エチルアミン
"A101"	(S)-1-{4-メトキシ-3-[2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-フェニル}-エチルアミン
"A102"	2-{5-[2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-[1, 3, 4]オキサジアゾール-2-イル}-エチルアミン
"A103"	7-(3, 5-ジメトキシピリジン-4-イル)-2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン
"A104"	3-[7-(3, 5-ジメトキシピリジン-4-イル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-4-メトキシベンズアミド
"A105"	3-{4-メトキシ-3-[7-(1H-ピラゾール-3-イル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-フェニル}-4H-[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-オン

【表 8】

"A106"	C-(3-[3-[7-(2, 6-ジメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-4-メトキシフェニル]-[1, 2, 4]オキサジアゾール-5-イル)-メチルアミン
"A107"	4-アミノ-3-[7-(2, 6-ジメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-2-イル]-ベンズアミド
"A108"	3-[5-[2-(3, 4, 5-トリメトキシフェニル)-フロ[3, 2-b]ピリジン-7-イル]-4H-[1, 2, 4]トリアゾール-3-イル]-プロピルアミン

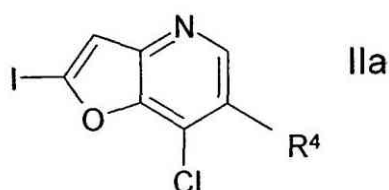
から選択される、請求項 1 に記載の化合物、または、その薬学的に許容し得る溶媒和物、塩、互変異性体もしくは立体異性体、あるいは、あらゆる比率でのそれらの混合物。

【請求項 3】

請求項 1 または 2 に記載の式 I で表される化合物またはその薬学的に許容し得る塩、溶媒和物、互変異性体あるいは立体異性体の製造方法であって、

a) 式 I I a

【化 2】



式中、 R^4 は、請求項 1 に示された意味を有する、
で表される化合物を、式 I I I a



式中、 R^1 は、請求項 1 に示された意味を有し、
および L は、ボロン酸基またはボロン酸エステル基を示す、
で表される化合物と、鈴木タイプカップリングで反応させることによって、式 I V a

【化 3】



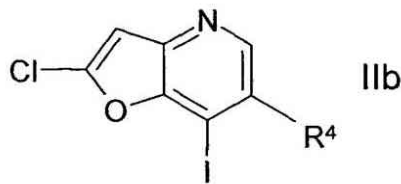
式中、 R^1 および R^4 は、請求項 1 に示された意味を有する、
で表される化合物を得、続いて、それを、式 V a



式中、 R^2 は、請求項 1 に示された意味を有し、
および L は、ボロン酸基またはボロン酸エステル基を示す、
で表される化合物と、鈴木タイプカップリングで反応させること、
あるいは、

b) 式 I I b

【化 4】

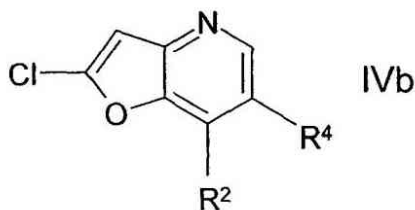


式中、 R^4 は、請求項 1 に示された意味を有する、
で表される化合物を、式 V a



式中、 R^2 は、請求項 1 に示された意味を有し、
および L は、ボロン酸基またはボロン酸エステル基を示す、
で表される化合物と、鈴木タイプカップリングで反応させることによって、式 I V b

【化 5】



式中、 R^2 および R^4 は、請求項 1 に示された意味を有する
で表される化合物を得、続いて、それを、式 I I I a



式中、 R^1 は、請求項 1 に示された意味を有し、
および L は、ボロン酸基またはボロン酸エステル基を示す
で表される化合物と、鈴木タイプカップリングで反応させること、
あるいは、

c) 式 I で表される塩基または酸を、その塩の 1 つに変換すること
を特徴とする、前記方法。

【請求項 4】

請求項 1 に記載の式 I で表される化合物、および / または、それらの薬学的に許容し得る塩、溶媒和物、互変異性体および立体異性体、ならびに、あらゆる比率でのそれらの混合物の少なくとも 1 種を含む、医薬。

【請求項 5】

さらに、薬学的に許容し得る担体、賦形剤またはビヒクルを含む、請求項 4 に記載の医薬。

【請求項 6】

炎症状態、免疫学的状態、自己免疫状態、アレルギー状態、リウマチ状態、血栓性状態、がん、感染症、神経変性疾患、神経炎症性疾患、心血管病および代謝性状態の処置および / または防止のための使用のための、式 I で表される化合物、または、その薬学的に許容し得る塩、溶媒和物、互変異性体もしくは立体異性体、あるいは、あらゆる比率でのそれらの混合物であって、該処置および / または防止が、有効量の請求項 1 に記載の化合物、それを必要とする対象に投与することを含む、請求項 4 または 5 に記載の医薬。

【請求項 7】

処置されるべきがんが、固形腫瘍または血液系もしくは免疫系の腫瘍である、がんの処置および / または防止のための使用のための、請求項 4 ~ 6 のいずれか一項に記載の医薬。

【請求項 8】

固形腫瘍が、上皮、膀胱、胃、腎臓、頭頸部、食道、子宮頸部、甲状腺、腸、肝臓、脳、前立腺、尿 - 生殖路、リンパ系、胃、喉頭、軟骨肉腫およびユーイング肉腫を含む骨、胎児性組織腫瘍を含む生殖細胞および / または肺の腫瘍の群、単球白血病、肺腺癌、肺小細胞癌、膵臓癌、神経膠芽腫、神経線維腫、血管肉腫、乳癌および / または悪性黒色腫の群に由来する、請求項 7 に記載の医薬。

【請求項 9】

リウマチ性関節炎、全身性紅斑性狼瘡、喘息、多発性硬化症、骨関節炎、虚血傷害、巨細胞動脈炎、炎症性腸疾患、糖尿病、嚢胞性線維症、乾癬、シェーグレン症候群および移植臓器拒絶

の群から選択される疾患の処置および / または防止のための使用のための、請求項 4 ~ 6 のいずれか一項に記載の医薬。

【請求項 10】

アルツハイマー病、ダウン症候群、遺伝性アミロイド性脳出血 - オランダ型、脳アミロイド血管症、クロイツフェルト・ヤコブ病、前頭側頭型認知症、ハンチントン病、パーキンソン病

の群から選択される疾患の処置および / または防止のための使用のための、請求項 4 ~ 6 のいずれか一項に記載の医薬。

【請求項 11】

リーシュマニア属、*M. leprae*、*M. tuberculosis* および / または *M. avium* を含むマイコバクテリア、リーシュマニア属、プラスモジウム属、ヒト免疫不全ウイルス、エプスタイン・バーウイルス、単純ヘルペスウイルス、C 型肝炎ウイルス

の群から選択される疾患の処置および / または防止のための使用のための、請求項 4 ~ 6 のいずれか一項に記載の医薬。

【請求項 12】

少なくとも 1 種のさらなる医薬活性材料を含む、請求項 4 ~ 11 のいずれか一項に記載の医薬。

【請求項 13】

(a) 有効量の、請求項 1 に記載の式 I で表される化合物、および / または、それらの薬学的に許容し得る塩、溶媒和物、塩または立体異性体、あるいはあらゆる比率でのそれらの混合物、

ならびに、

(b) 有効量のさらなる医薬活性材料
の別箇のパックからなるセット (キット)。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0104

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0104】

式 I で表される同位体標識した化合物を、多数の有益な方法において使用することができる。例えば、放射性同位体、例えば ^3H または ^{14}C などが包含された式 I で表される同位体標識化合物は、医薬および / または基質組織分布アッセイに適している。これらの放射性同位体、つまりトリチウム (^3H) および炭素 14 (^{14}C) は、単純な調製および優れた検出能のために特に好ましい。より重い同位体、例えば重水素 (^2H) の式 I で表される化合物中への包含は、この同位体標識化合物のより高い代謝安定性のために治療的利点を有する。より高い代謝安定性は、増加した *in vivo* での半減期またはより低い投与量へと直接的に転換され、これは、ほとんどの状況下での本発明の好ましい態様を表す。式 I で表される同位体標識化合物は、本文中の合成スキームおよび関連する記載に、例の部に、ならびに製造の部に開示した手順を、容易に利用可能な同位体標識反応体により非同位体標識反応体を置き換えて実行することによって、製造することができる。