

【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

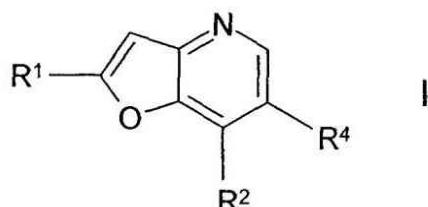
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

式 I

## 【化1】



式中、

R<sup>1</sup>は、A r<sup>1</sup>またはH e t<sup>1</sup>を示し、R<sup>2</sup>は、A r<sup>2</sup>、H e t<sup>2</sup>、N H (C H<sub>2</sub>)<sub>n</sub> A r<sup>2</sup>、O (C H<sub>2</sub>)<sub>n</sub> A r<sup>2</sup>、N H (C

$\text{H}_2$ )<sub>n</sub> Het<sup>2</sup>、NHCONHA、CONH<sub>2</sub>またはN<sub>3</sub>を示し、R<sup>4</sup>は、HまたはFを示し、

Ar<sup>1</sup>は、非置換であるか、あるいは、Hal、A、[C(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub>]<sub>n</sub>CN、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OH、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OA、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>COOH、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>COOA、S(O)<sub>m</sub>A、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>Het<sup>3</sup>、CON(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub>、CONH(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>C(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub>N(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub>および/またはCONH(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>CH[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OR<sup>3</sup>](CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OR<sup>3</sup>で、単置換、二置換または三置換されたフェニルを示し、

Ar<sup>2</sup>は、非置換であるか、あるいは、A、Hal、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OH、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OA、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NH<sub>2</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NHA、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NA<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、SO<sub>2</sub>NHA、SO<sub>2</sub>NA<sub>2</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CONH<sub>2</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CONHA、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>CONA<sub>2</sub>、[C(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub>]<sub>n</sub>N(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub>、CONH(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>CH[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>N(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub>](CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OR<sup>3</sup>、CONH(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>CH[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OR<sup>3</sup>]NHSO<sub>2</sub>A、CONH(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>CH[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OR<sup>3</sup>]OR<sup>3</sup>、CONH(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>[CH(COR<sup>3</sup>)]<sub>p</sub>CH<sub>2</sub>OR<sup>3</sup>、CONHR<sup>4</sup>、CONH(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>CH[(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>N(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub>]Cyc、CONH(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>C(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub>N(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub>および/またはCONHC(R<sup>3</sup>)<sub>2</sub>(CH<sub>2</sub>)<sub>p</sub>OR<sup>3</sup>で、単置換、二置換または三置換されたフェニルを示し、

Het<sup>1</sup>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<sup>2</sup>は、ピペリジニル、ピペラジニル、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<sub>2</sub>)<sub>n</sub>Het<sup>4</sup>、A、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OH、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>OA、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NH<sub>2</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NHA、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NA<sub>2</sub>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<sup>3</sup>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<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NH<sub>2</sub>、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NHA、(CH<sub>2</sub>)<sub>n</sub>NA<sub>2</sub>および/または=Oで単置換または二置換されており、

Het<sup>4</sup>は、ピ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<sub>2</sub>で単置換されており、

R<sup>3</sup>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<sub>2</sub>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、こでは非置換であっても、OH、NHCOAまたはNH<sub>2</sub>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-ビース-(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-ビペラジン-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-フルオロー-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-フルオロー-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-シクロヘキシリ)-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-シクロヘキシリアミノ)-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<sup>4</sup> 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

R<sup>1</sup> - L I I I a

式中、R<sup>1</sup> 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】

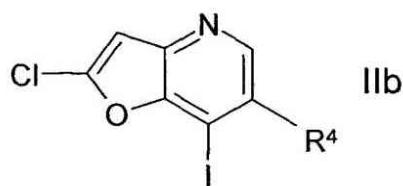


式中、R<sup>1</sup> および R<sup>4</sup> は、請求項 1 に示された意味を有する、  
で表される化合物を得、続いて、それを、式 V a

R<sup>2</sup> - L V a

式中、R<sup>2</sup> 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

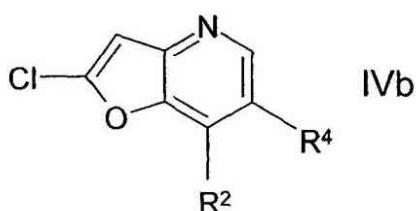
## 【化4】



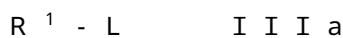
式中、 $R^4$ は、請求項1に示された意味を有する、  
で表される化合物を、式Va



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IVb  
【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IIIa



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リング肉腫を含む骨、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、肺臓癌、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、囊胞性線維症、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これらの混合物、

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<sup>3</sup>Hまたは<sup>14</sup>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(<sup>3</sup>H)および炭素14(<sup>14</sup>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(<sup>2</sup>H)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。