

【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20年7月10日(2008.7.10)

【公表番号】特表2007-527408(P2007-527408A)

【公表日】平成19年9月27日(2007.9.27)

【年通号数】公開・登録公報2007-037

【出願番号】特願2006-534245(P2006-534245)

【国際特許分類】

C 0 7 D 231/12 (2006.01)

C 0 7 D 403/10 (2006.01)

C 0 7 D 403/06 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 K 31/415 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 231/12 C S P C

C 0 7 D 231/12 E

C 0 7 D 403/10

C 0 7 D 403/06

A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 9/10

A 6 1 K 31/415

【手続補正書】

【提出日】平成20年5月20日(2008.5.20)

【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

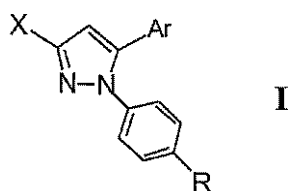
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I の化合物

【化 1】



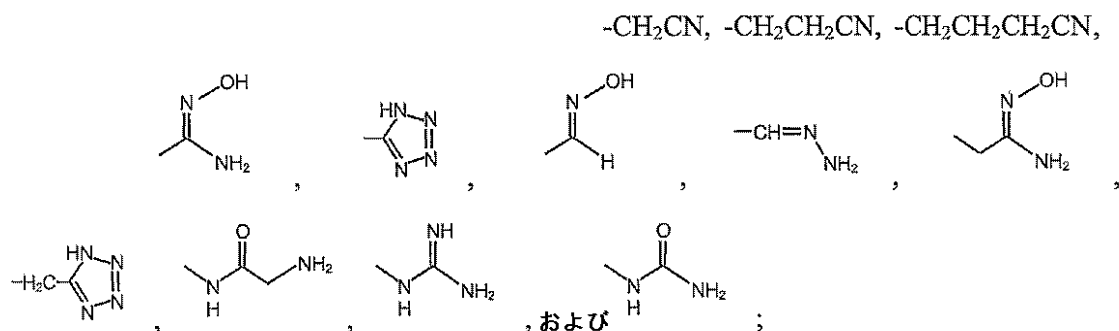
またはそれらの代謝産物もしくは薬学的に受容可能な塩であって、
ここで、

Xはアルキルおよびハロアルキルからなる群より選択され；

A r は、フェニル、ビフェニル、ナフチル、アントリル、フェナントレニル、およびフルオレニルからなる群より選択され、A r は、1 個以上の置換基で、任意の適切な位置において必要に応じて置換されており；

R は、

【化 2】



からなる群より選択される、化合物またはそれらの代謝産物もしくは薬学的に受容可能な塩。

【請求項 2】

請求項 1 に記載の化合物であって、ここで X は C₁ ~ C₄ ハロアルキルである、化合物。

【請求項 3】

請求項 2 に記載の化合物であって、ここで X は CF₃ である、化合物。

【請求項 4】

請求項 1 に記載の化合物であって、ここで A r はハロ、C₁ ~ C₄ アルキル、C₁ ~ C₄ ハロアルキル、アジド、C₁ ~ C₄ アジドアルキル、アリール、アリールアルキル、ハロアリール、ハロアルキルアリール、およびそれらの組み合わせからなる群より選択される 1 個以上のラジカルで、任意の置換され得る位置において置換されている、化合物。

【請求項 5】

請求項 1 に記載の化合物であって、ここで A r は 2-ナフチル、4-ビフェニル、9-アントリル、2-フルオレニル、4-アジドフェニル、4-アジドメチルフェニル、4-(2-アジドエチル)フェニル、4-(3-アジドプロピル)フェニル、4-(4-アジドブチル)フェニル、4-(4-アジドフェニル)フェニル、4-(4-アジドメチルフェニル)フェニル、4-メチルフェニル、4-エチルフェニル、4-プロピルフェニル、4-ブチルフェニル、4-(2-プロモエチル)フェニル、4-(3-プロモプロピル)フェニル、4-(4-プロモブチル)フェニル、4-(トリフルオロメチル)フェニル、4-(4-メチルフェニル)フェニル、4-(4-プロモメチルフェニル)フェニル、4-(4-ブチルフェニル)フェニル、4-(4-tert-ブチルフェニル)フェニル、2-クロロフェニル、4-クロロフェニル、2, 4-ジクロロフェニル、3, 4-ジクロロフェニル、2, 5-ジクロロフェニル、2, 4-ジメチルフェニル、2, 5-ジメチルフェニル、3, 4-ジメチルフェニル、3, 5-ジメチルフェニル、4-(4-クロロフェニル)フェニル、4-(3, 5-ジクロロフェニル)フェニル、4-(2, 3-ジクロロフェニル)フェニル、4-(3, 5-ジメチルフェニル)フェニル、4-(2, 4, 5-トリクロロフェニル)フェニル、4-(4-トリフルオロメチルフェニル)フェニル、2-フェナントレニル、3-インドリル、2-ピロリル、4-(ベンジル)フェニル、4-tert-ブチルフェニル、9H-フルオレン-2-イル、および 9-フェナントレニル からなる群より選択される、化合物。

【請求項 6】

請求項 5 に記載の化合物であって、ここで A r は、2-フェナントレニルである、化合物。

【請求項 7】

請求項 1 に記載の化合物であって、ここで R はアミノアセタミドおよびグアニジンから選択される、化合物。

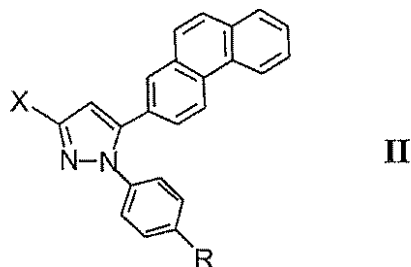
【請求項 8】

請求項 1 に記載の化合物であって、ここで X は CF_3 であり、Ar は 2-フェナントレニルであり、そして R はアミノアセタミドおよびグアニジンから選択される、化合物。

【請求項 9】

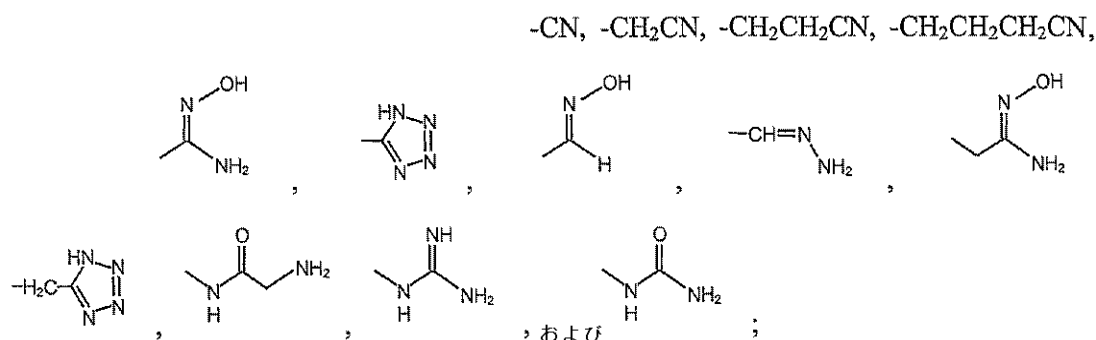
式 I I の化合物

【化 3】



またはそれらの代謝産物もしくは薬学的に受容可能な塩であって、
X はアルキルおよびハロアルキルからなる群より選択され；
R は、

【化 4】



からなる群より選択される、化合物またはそれらの代謝産物もしくは薬学的に受容可能な塩。

【請求項 10】

請求項 9 に記載の化合物であって、ここで X は $\text{C}_1 \sim \text{C}_4$ ハロアルキルである、化合物。

【請求項 11】

請求項 10 に記載の化合物であって、ここで X は CF_3 である、化合物。

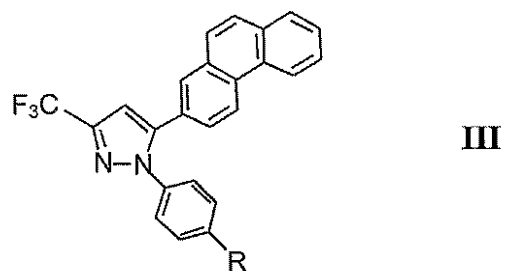
【請求項 12】

請求項 9 に記載の化合物またはそれらの薬学的に受容可能な塩であって、ここで R はアミノアセタミドおよびグアニジンから選択される、化合物またはそれらの薬学的に受容可能な塩。

【請求項 13】

式 I I I の化合物

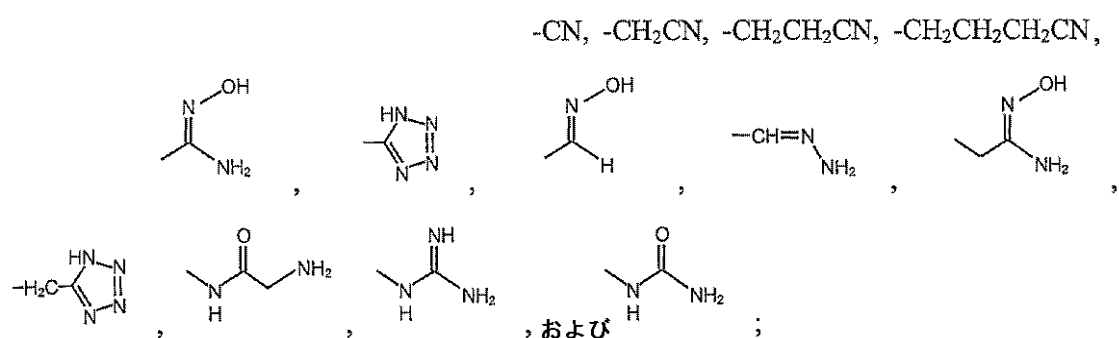
【化 5】



またはそれらの代謝産物もしくは薬学的に受容可能な塩であって、

R は、

【化 6】



からなる群より選択さる、化合物またはそれらの代謝産物もしくは薬学的に受容可能な塩。

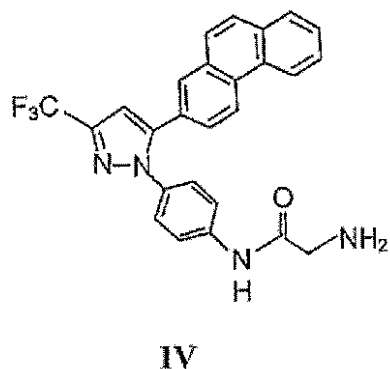
【請求項 1 4】

請求項 1 3 に記載の化合物またはそれらの薬学的に受容可能な塩であって、ここで R はアミノアセタミドおよびグアニジンから選択される、化合物またはそれらの薬学的に受容可能な塩。

【請求項 1 5】

式 I V の化合物

【化 7】

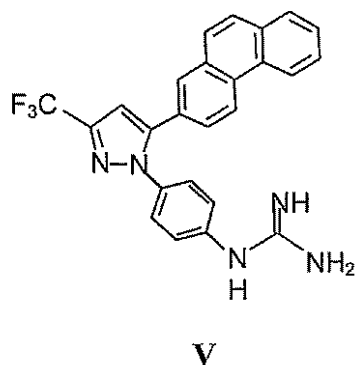


またはそれらの代謝産物もしくは薬学的に受容可能な塩。

【請求項 1 6】

式 V の化合物

【化 8】

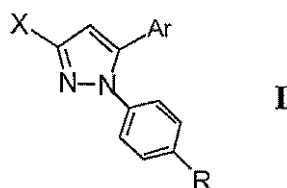


またはそれらの代謝産物もしくは薬学的に受容可能な塩。

【請求項 17】

所望されない急速に増殖する細胞においてアポトーシスを誘導するための組成物であって、該組成物は、式 I の化合物

【化 9】



またはそれらの代謝産物もしくは薬学的に受容可能な塩の治療有効量を含有し、
ここで、

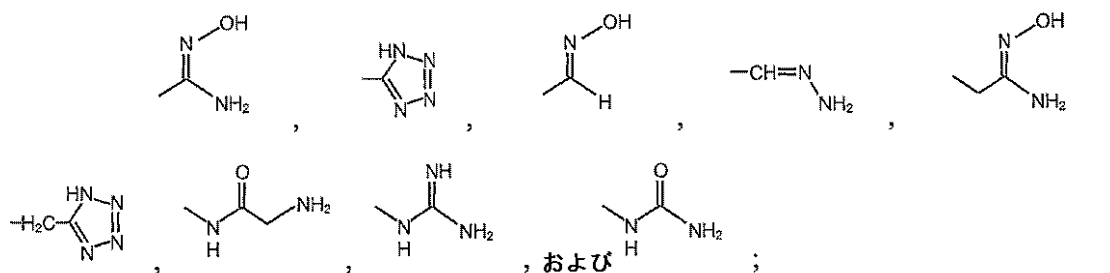
X は、アルキルおよびハロアルキルからなる群より選択され；

A r は、フェニル、ビフェニル、ナフチル、アントリル、フェナントレニル、およびフル
オレニルからなる群より選択され、A r は、1 個以上の置換基で、任意の適切な位置にお
いて必要に応じて置換されており；

R は、

【化 10】

-CN, -CH₂CN, -CH₂CH₂CN, -CH₂CH₂CH₂CN,



からなる群より選択される、組成物。

【請求項 18】

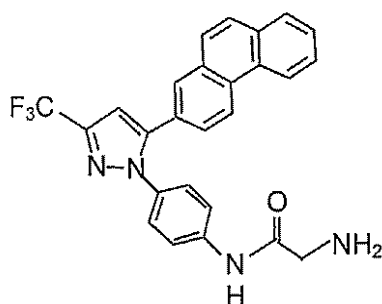
請求項 17 に記載の組成物であって、ここで、前記急速に増殖する細胞は癌細胞であり、
ここで、該癌は、白血病、非小細胞肺癌、結腸癌、中枢神経系の癌、黒色腫、卵巣癌、腎

臓癌、前立腺癌、および乳癌からなる群より選択される、組成物。

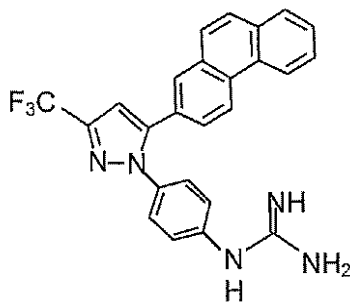
【請求項 19】

請求項 17 に記載の 組成物 であって、ここで、前記化合物は、化合物 I V および V

【化 11】



IV



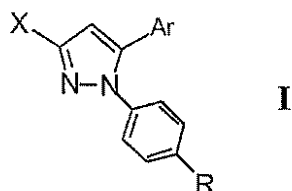
V

またはそれらの組み合わせ、またはそれらの代謝産物もしくは薬学的に受容可能な塩からなる群より選択される、組成物。

【請求項 20】

癌の発生の処置、阻止、または遅延が必要な被験体において、癌の発生を処置、阻止、または遅延するための 組成物 であって、該癌は、白血病、非小細胞肺癌、結腸癌、中枢神経系の癌、黒色腫、卵巣癌、腎臓癌、前立腺癌、および乳癌からなる群より選択され、該組成物は式 I の化合物

【化 12】



I

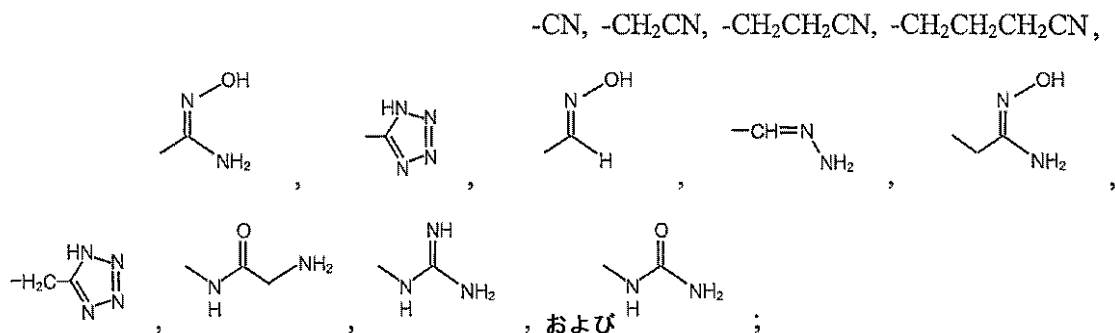
またはそれらの代謝産物もしくは薬学的に受容可能な塩の治療有効量を 含有し、
ここで、

X はアルキルおよびハロアルキルからなる群より選択され；

Ar はフェニル、ビフェニル、ナフチル、アントリル、フェナントレニル、およびフルオレニルからなる群より選択され、Ar は、1 個以上の置換基で、任意の適切な位置において必要に応じて置換されており；

R は、

【化 1 3】

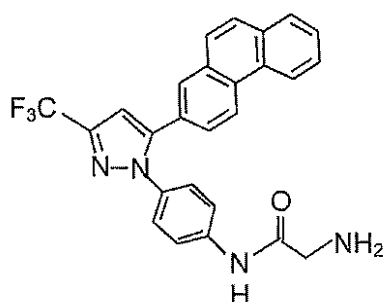


からなる群より選択される、組成物。

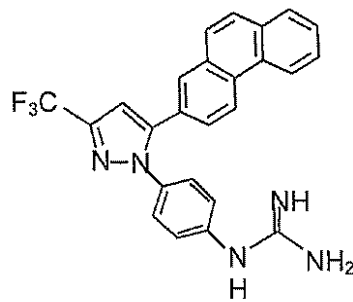
【請求項 2 1】

請求項 2 0 に記載の 組成物 であって、ここで、前記化合物は、化合物 I V および V

【化 1 4】



IV



V

またはそれらの組み合わせ、またはそれらの代謝産物もしくは薬学的に受容可能な塩から選択される、組成物。

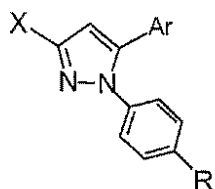
【請求項 2 2】

請求項 2 0 に記載の 組成物 であって、ここで前記被験体はヒトである、組成物。

【請求項 2 3】

血管形成術またはステント法を受けた被験体において再狭窄を予防する ための組成物 であって、該組成物 は式 I の化合物

【化 1 5】



I

またはそれらの代謝産物もしくは薬学的に受容可能な塩の治療有効量を 含有し、
ここで

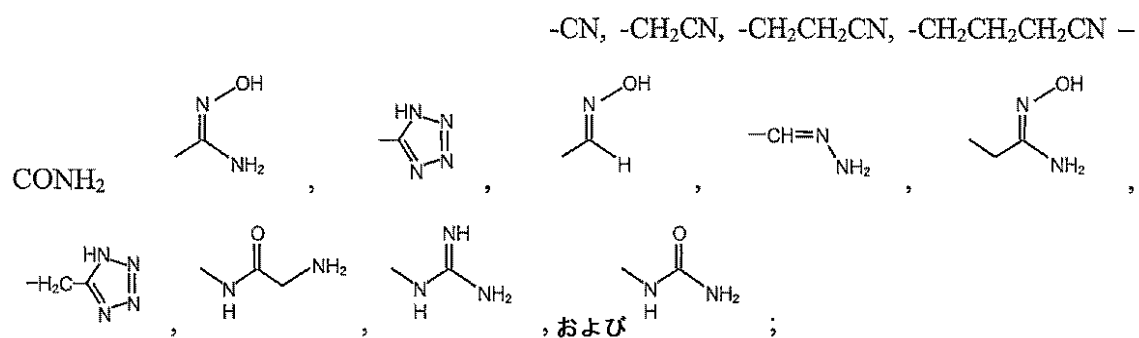
X は、アルキルおよびハロアルキルからなる群より選択され；

A r は、フェニル、ビフェニル、ナフチル、アントリル、フェナントレニル、およびフルオレニルからなる群より選択され、A r は、1 個以上の置換基で、任意の適切な位置にお

いて必要に応じて置換されており；

R は、

【化 1 6】



からなる群より選択される、組成物。