

【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7月14日 (2016.7.14)

【公表番号】特表2015-516464(P2015-516464A)

【公表日】平成27年6月11日 (2015.6.11)

【年通号数】公開・登録公報2015-038

【出願番号】特願2015-512620(P2015-512620)

【国際特許分類】

C 0 7 D 239/48 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 487/04 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/505 (2006.01)

A 6 1 K 31/506 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 3/00 (2006.01)

A 6 1 P 5/00 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/14 (2006.01)

A 6 1 P 21/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 19/02 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/02 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 239/48 C S P

C 0 7 D 401/12

C 0 7 D 487/04 1 4 0

C 0 7 D 487/04 1 4 4

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 405/14

A 6 1 K 31/505

A 6 1 K	31/506	
A 6 1 K	31/519	
A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 K	45/00	
A 6 1 P	43/00	1 0 5
A 6 1 P	43/00	1 2 1
A 6 1 P	37/06	
A 6 1 P	29/00	
A 6 1 P	25/00	
A 6 1 P	31/00	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	9/00	
A 6 1 P	11/06	
A 6 1 P	37/08	
A 6 1 P	35/02	
A 6 1 P	3/00	
A 6 1 P	5/00	
A 6 1 P	27/02	
A 6 1 P	25/16	
A 6 1 P	25/28	
A 6 1 P	25/14	
A 6 1 P	21/00	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	13/12	
A 6 1 P	11/00	
A 6 1 P	17/02	

【手続補正書】

【提出日】平成28年5月16日(2016.5.16)

【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

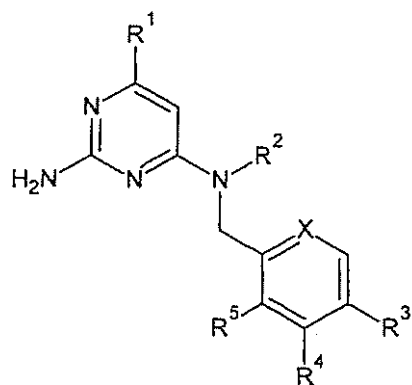
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式

【化 1】



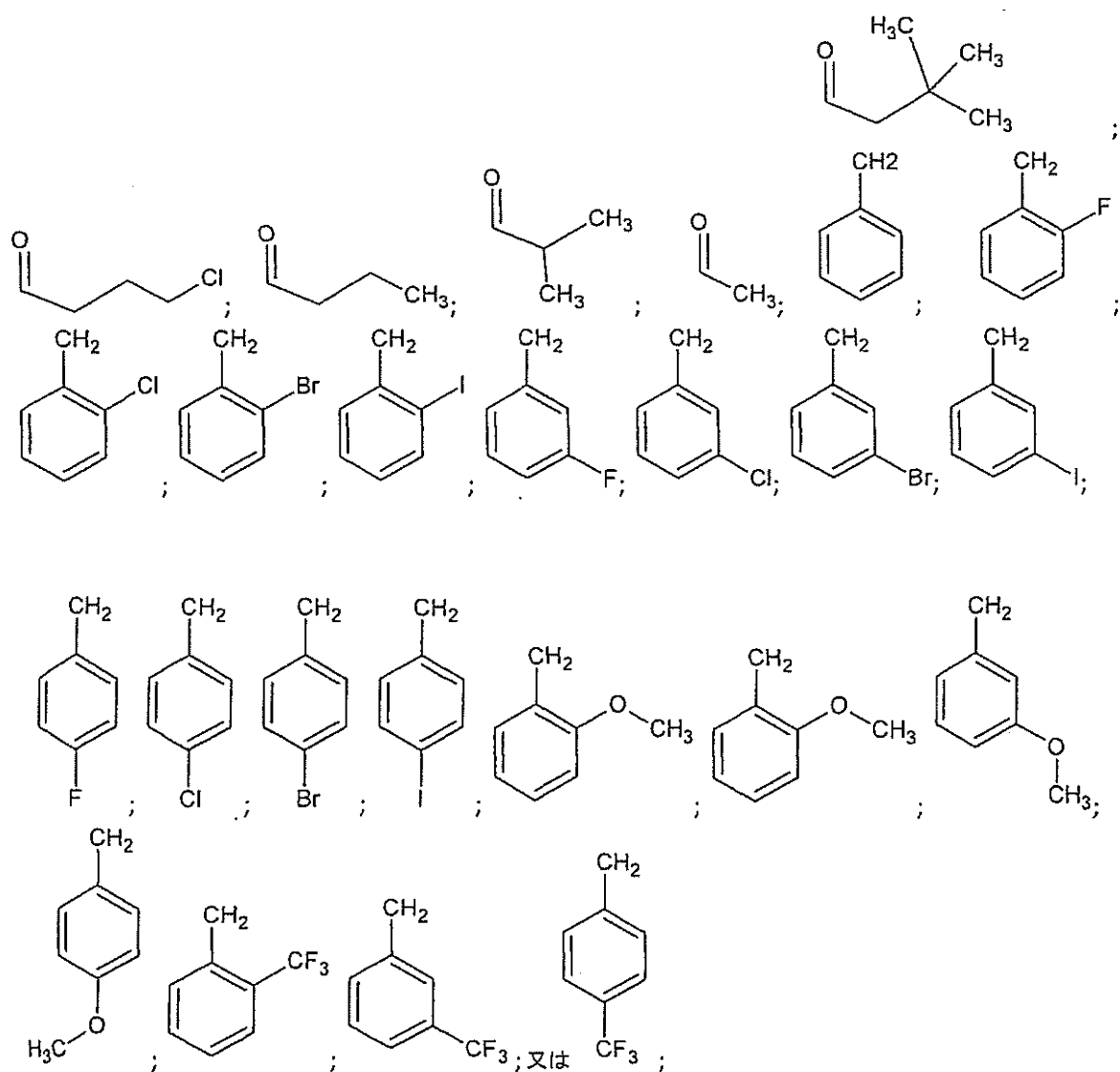
(式中、

R¹は、H、CH₃、OCH₃、CF₃、F、Cl、Br又はIであり；

Xは、C又はNであり；

R²はH、CH₃、CH₂CH₃、CH(CH₃)₂、C(CH₃)₃、CH₂CH₂CH₃；CH₂CH₂CH₂OH、CH₂CH₂CH₂CH₃、CH₂C
H₂CH₂CH₃、CH₂CHCH₂、CH₂CH₂CH₂CH₂CH₂CH₃；

【化 2】



であり；

R³はH、CH₃、OCH₃、F、Cl、Br、I又はCF₃であり；

R⁴はH、CH₃、OCH₃、F、Cl、Br、I又はCF₃であり；

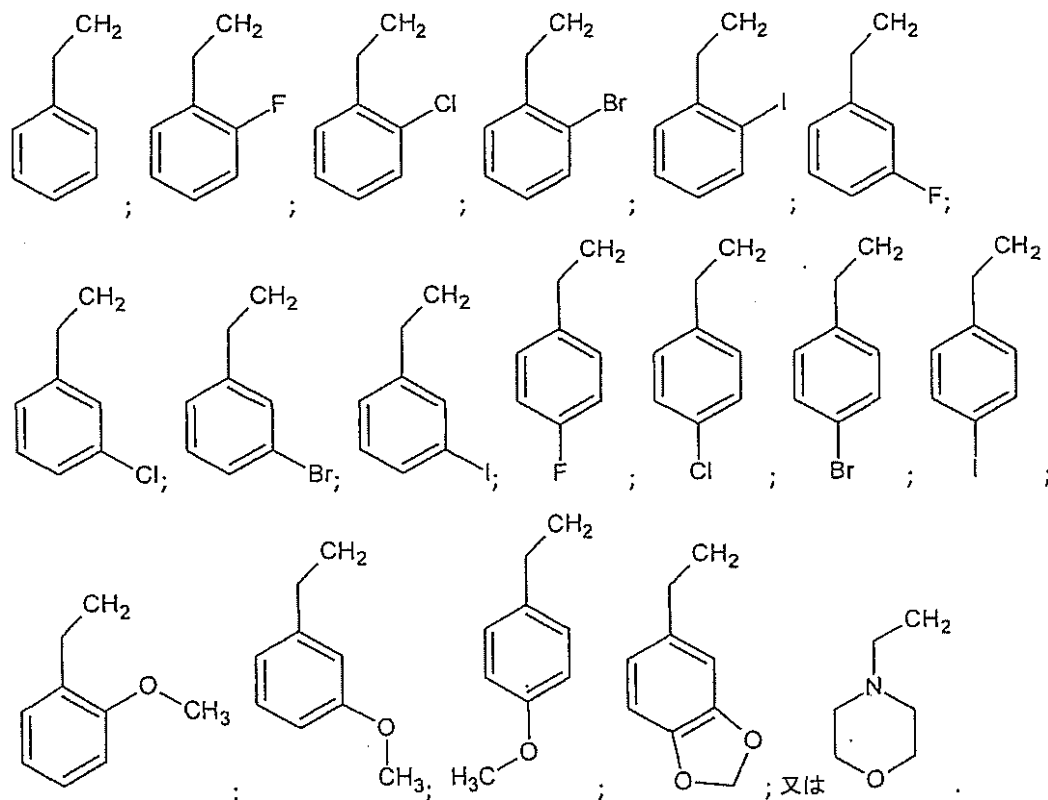
R⁵はH、CH₃、OCH₃、F、Cl、Br、I又はCF₃である）

の化合物又はそれらの塩、水和物若しくは溶媒和物。

【請求項2】

R²が、

【化3】



である、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

請求項1に記載の少なくとも1種の化合物を、1種以上の薬学的に許容される担体又は賦形剤と共に含む医薬組成物。

【請求項4】

病状又は状態が対象におけるHsp90活性の阻害に応答する、対象における病状又は状態の予防又は治療方法であって、それらを必要とする対象に、請求項1に記載の少なくとも1種の化合物の、Hsp90活性を阻害するために有効な量を投与することを含む方法。

【請求項5】

病状又は状態が対象におけるHsp90活性の阻害に応答する、対象における病状又は状態の予防又は治療方法であって、請求項1に記載の少なくとも1種の化合物の、Hsp90活性を阻害するのに有効な量及び追加の治療剤を、それらを必要とする対象に投与することを含む方法。

【請求項6】

治療剤を用いた治療を受けており、病状又は状態が前記治療剤に対する耐性の発生であり、病状又は状態がHsp90活性の阻害に応答する、対象における病状又は状態の予防又は治療方法であって、それらを必要とする対象に、請求項1に記載の少なくとも1種の化合物のHsp90活性を阻害するのに有効な量を投与することを含む方法。

【請求項7】

Hsp90に媒介される病状又は状態が、自己免疫疾患、炎症性疾患、神経性疾患、感染、癌、癌腫、心臓血管疾患、アレルギー、喘息、増殖性障害、代謝性疾患、白血病、新生物、ホルモン関連疾患、加齢黄斑変性、及び神経線維腫症から生じる腫瘍又は症状を含む群

から選択される、請求項4に記載の方法。

【請求項 8】

Hsp90に媒介される疾患又は状態が、パーキンソン病、アルツハイマー病、ハンチントン病、及び筋萎縮性側索硬化症を含む群から選択される神経変性性疾患である、請求項4に記載の方法。

【請求項 9】

哺乳動物における異常な細胞成長を含むか又はそれから生じる疾患若しくは状態の予防又は治療のための方法であって、哺乳動物においてHsp90活性を阻害するのに有効な量の、請求項1に記載の少なくとも1種の化合物を哺乳動物に投与することを含む方法。

【請求項 10】

異常な細胞成長を含むか又はそれから生じる疾患若しくは状態が、膀胱、乳房、大腸、腎臓、表皮、肝、肺、食道、胆嚢、卵巣、膵、胃、子宮頸部、甲状腺、前立腺、胃腸系又は皮膚の癌；リンパ系統の造血性腫瘍；骨髓腫系統の造血性腫瘍；甲状腺の濾胞性癌；間葉系起源の腫瘍；中枢又は末梢神経系の腫瘍；メラノーマ；精上皮腫；奇形癌；骨肉腫；色素性乾皮症；神経線維腫症；角化棘細胞腫；甲状腺濾胞性癌；及びカボジ肉腫を含む、請求項9に記載の方法。

【請求項 11】

抗癌剤に対する耐性の発生率を軽減又は減少させる方法であって、それらを必要とする対象に、請求項1に記載の少なくとも1種の化合物の、対象におけるHsp90活性を阻害するのに有効な量を投与することを含む方法。

【請求項 12】

請求項2に記載の少なくとも1種の化合物を、1種以上の薬学的に許容される担体又は賦形剤と共に含む医薬組成物。

【請求項 13】

病状又は状態が対象におけるHsp90活性の阻害に应答する、対象における病状又は状態の予防又は治療方法であって、それらを必要とする対象に、請求項2に記載の少なくとも1種の化合物の、Hsp90活性を阻害するために有効な量を投与することを含む方法。

【請求項 14】

病状又は状態が対象におけるHsp90活性の阻害に应答する、対象における病状又は状態の予防又は治療方法であって、請求項2に記載の少なくとも1種の化合物の、Hsp90活性を阻害するのに有効な量及び追加の治療剤を、それらを必要とする対象に投与することを含む方法。

【請求項 15】

治療剤を用いた治療を受けており、病状又は状態が前記治療剤に対する耐性の発生であり、病状又は状態がHsp90活性の阻害に应答する、対象における病状又は状態の予防又は治療方法であって、それらを必要とする対象に、請求項2に記載の少なくとも1種の化合物のHsp90活性を阻害するのに有効な量を投与することを含む方法。

【請求項 16】

Hsp90に媒介される病状又は状態が、自己免疫疾患、炎症性疾患、神経性疾患、感染、癌、癌腫、心臓血管疾患、アレルギー、喘息、増殖性障害、代謝性疾患、白血病、新生物、ホルモン関連疾患、加齢黄斑変性、及び神経線維腫症から生じる腫瘍又は症状を含む群から選択される、請求項13に記載の方法。

【請求項 17】

Hsp90に媒介される疾患又は状態が、パーキンソン病、アルツハイマー病、ハンチントン病、及び筋萎縮性側索硬化症を含む群から選択される神経変性性疾患である、請求項13に記載の方法。

【請求項 18】

哺乳動物における異常な細胞成長を含むか又はそれから生じる疾患若しくは状態の予防又は治療のための方法であって、哺乳動物においてHsp90活性を阻害するのに有効な量の、請求項2に記載の少なくとも1種の化合物を哺乳動物に投与することを含む方法。

【請求項 19】

異常な細胞成長を含むか又はそれから生じる疾患若しくは状態が、膀胱、乳房、大腸、腎臓、表皮、肝、肺、食道、胆嚢、卵巣、脾、胃、子宮頸部、甲状腺、前立腺、胃腸系又は皮膚の癌；リンパ系統の造血性腫瘍；骨髓腫系統の造血性腫瘍；甲状腺の濾胞性癌；間葉系起源の腫瘍；中枢又は末梢神経系の腫瘍；メラノーマ；精上皮腫；奇形癌；骨肉腫；色素性乾皮症；神経線維腫症；角化棘細胞腫；甲状腺濾胞性癌；及びカボジ肉腫を含む、請求項18に記載の方法。

【請求項 20】

抗癌剤に対する耐性の発生率を軽減又は減少させる方法であって、それらを必要とする対象に、請求項2に記載の少なくとも1種の化合物の、対象におけるHsp90活性を阻害するのに有効な量を投与することを含む方法。