

【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24年4月12日 (2012.4.12)

【公表番号】特表2011-509280(P2011-509280A)

【公表日】平成23年3月24日 (2011.3.24)

【年通号数】公開・登録公報2011-012

【出願番号】特願2010-541800(P2010-541800)

【国際特許分類】

C 0 7 D 213/56 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/28 (2006.01)

A 6 1 P 25/16 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/24 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 1/18 (2006.01)

A 6 1 P 1/16 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 35/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 3/10 (2006.01)

A 6 1 P 27/02 (2006.01)

A 6 1 P 19/10 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

C 0 7 D 213/74 (2006.01)

A 6 1 K 31/444 (2006.01)

A 6 1 K 31/4406 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/4409 (2006.01)

A 6 1 K 31/4402 (2006.01)

A 6 1 K 31/166 (2006.01)

C 0 7 D 249/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/4192 (2006.01)

C 0 7 D 233/54 (2006.01)

A 6 1 K 31/4164 (2006.01)

A 6 1 K 31/4725 (2006.01)

A 6 1 K 31/167 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 213/56

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 25/28

A 6 1 P 25/16

A 6 1 P 25/00

A 6 1 P 25/24
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 15/00
A 6 1 P 1/04
A 6 1 P 1/18
A 6 1 P 1/16
A 6 1 P 13/12
A 6 1 P 35/02
A 6 1 P 35/04
A 6 1 P 9/10
A 6 1 P 3/10
A 6 1 P 27/02
A 6 1 P 19/10
A 6 1 P 17/00
A 6 1 P 31/18
C 0 7 D 213/74 C S P
A 6 1 K 31/444
A 6 1 K 31/4406
A 6 1 K 31/4439
C 0 7 D 401/12
C 0 7 D 401/14
A 6 1 K 31/4409
A 6 1 K 31/4402
A 6 1 K 31/166
C 0 7 D 249/06 5 0 2
A 6 1 K 31/4192
C 0 7 D 233/54
A 6 1 K 31/4164
A 6 1 K 31/4725
A 6 1 K 31/167

【手続補正書】

【提出日】平成24年1月11日(2012.1.11)

【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

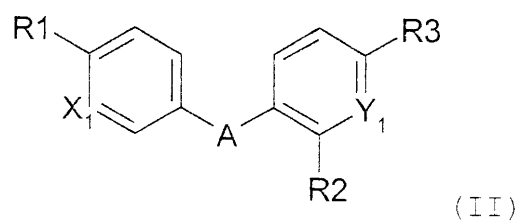
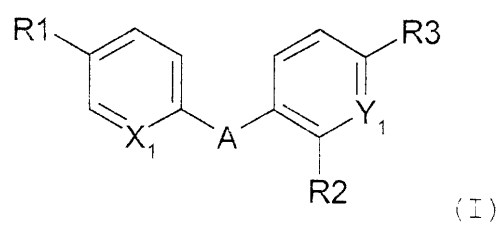
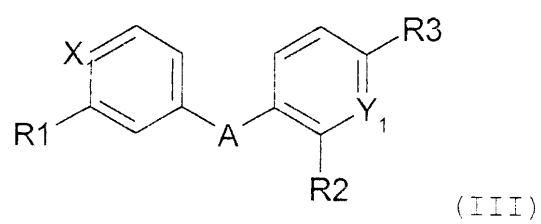
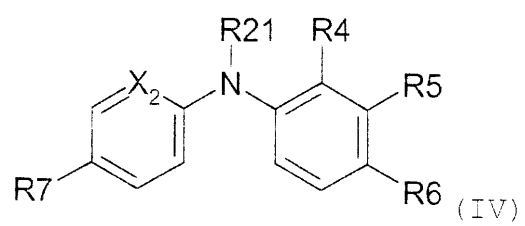
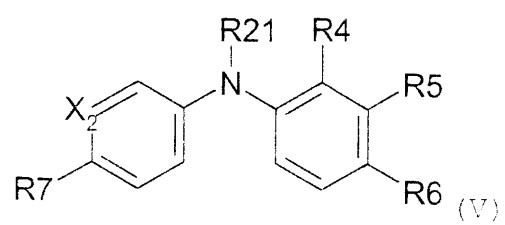
【補正方法】変更

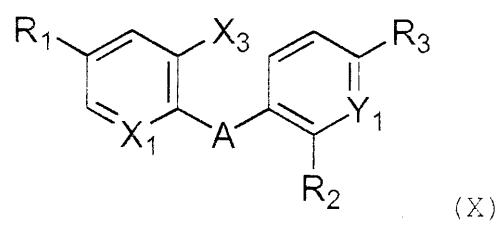
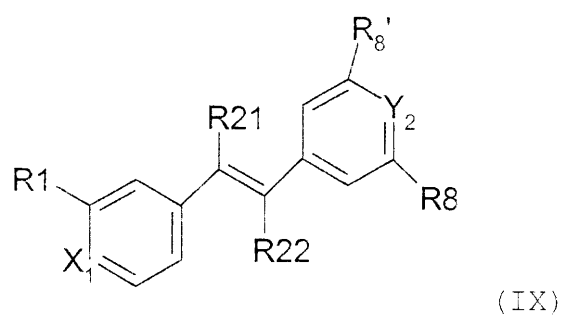
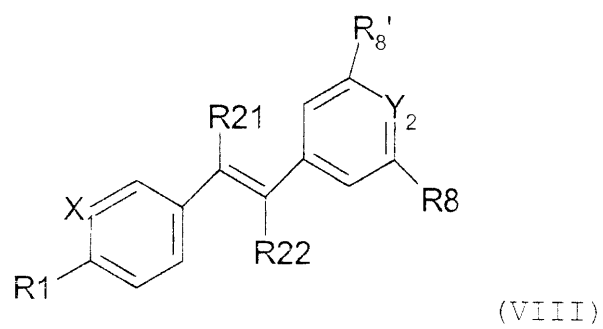
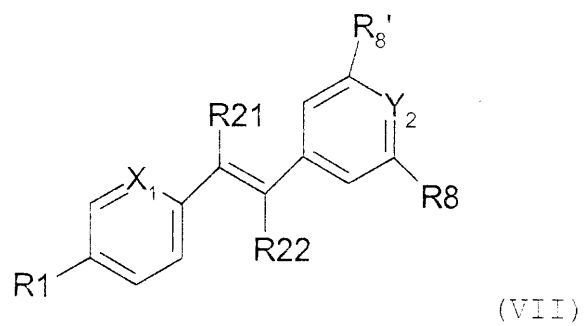
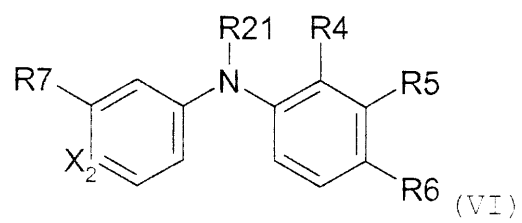
【補正の内容】

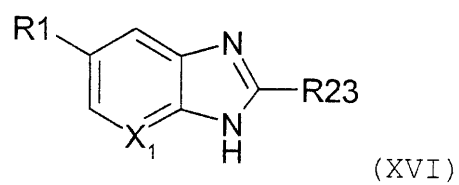
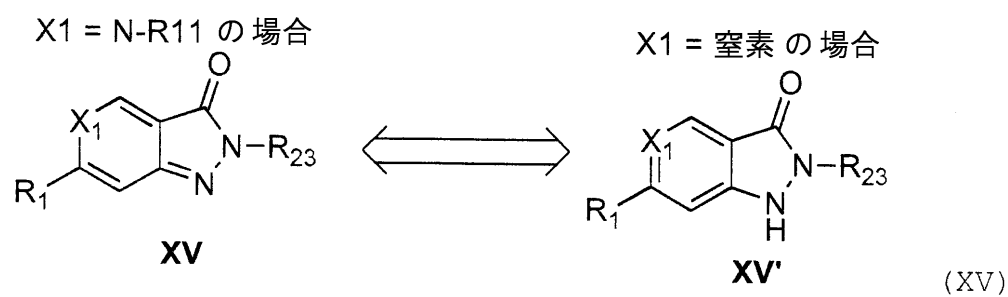
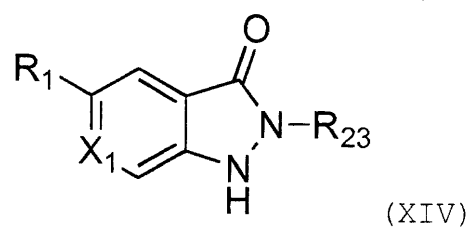
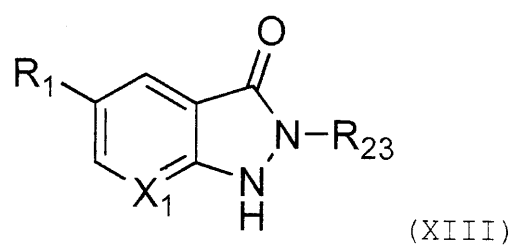
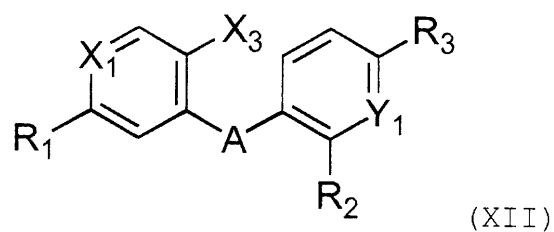
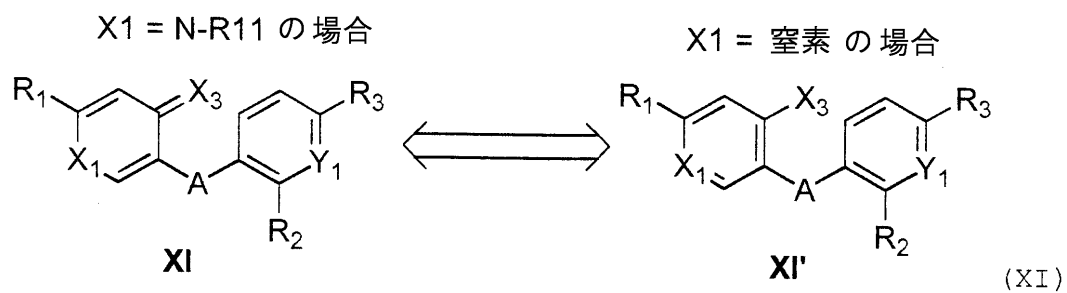
【特許請求の範囲】

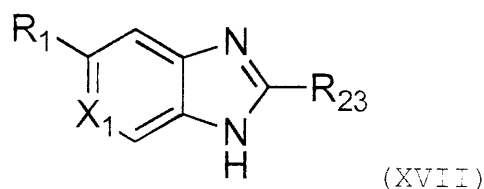
【請求項1】

以下の式（I）～（XXI）の一つを有する化合物、該化合物の医薬的に許容できる塩、それらの異性体、及び／又はそれらの混合物、

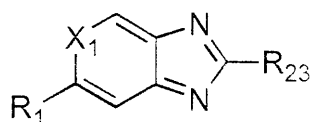




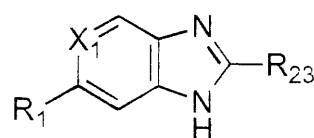




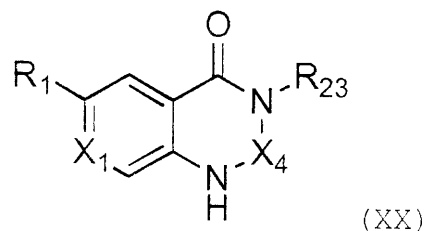
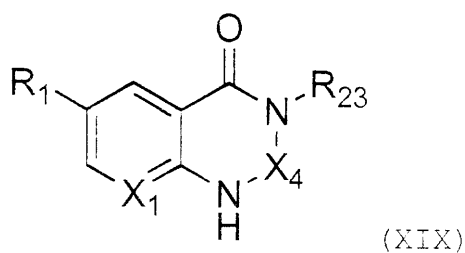
X1 = N-R11の場合



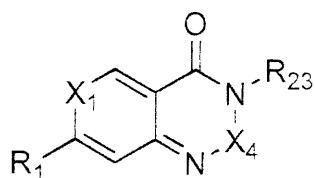
X1 = 窒素の場合



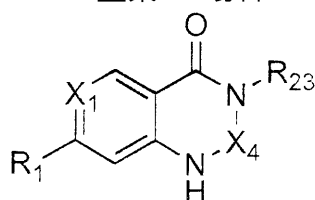
(XVIII)



X1 = N-R11の場合



X1 = 窒素の場合



(XXI)

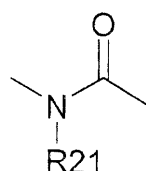
ここで、

X1は、窒素原子、NR11基又はCR10基を表し、R10は、水素原子又はNR11R12基若しくはOR11基を含む群のうちから選ばれ、R11及びR12は、互に独立に、水素原子、C1～C3アルキル基を表す；

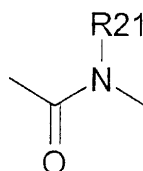
X1は、式XI、XV、XVII及びXXIを有する化合物においてNR11に対応し、そしてX1が窒素原子に対応する場合に、前記化合物は化学的に異なる異性体XI'、XV'、XVII'及びXXI'に対応する；

R1は、水素原子、NR11R12基又はOR12基を表し、R11及びR12は上記で定義されたとおりであり、X1は、R1がNR11R12基又はOR12基を表す場合に、CH基を表す；

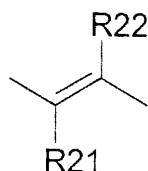
A は、



若しくは

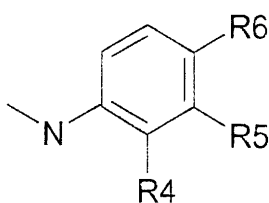


のアミド基
又は



アルケン基を表す；

Y 1 は、窒素原子又は C R 1 3 基を表し、R 1 3 は、水素原子又は

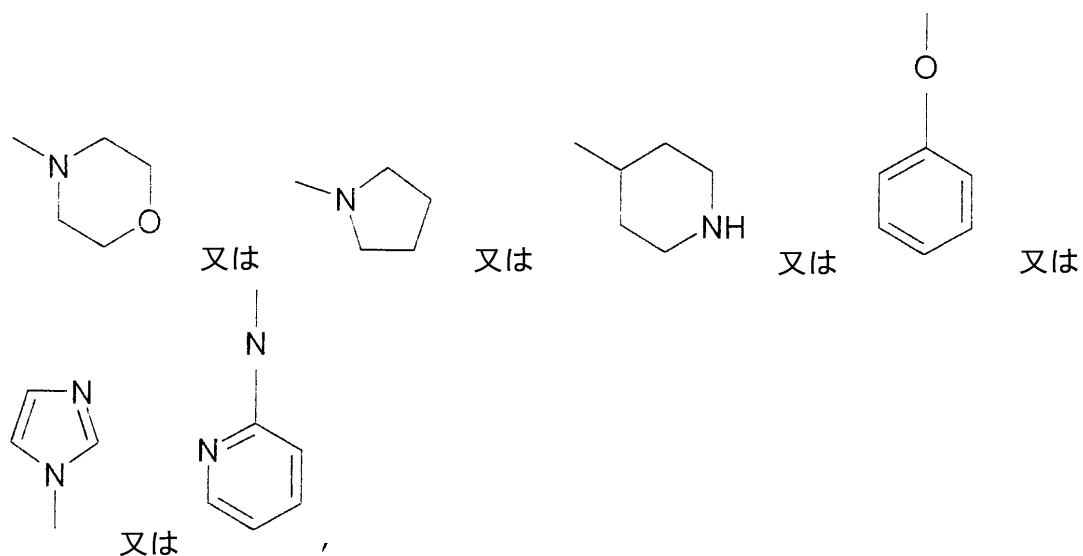


基を含む群のうちから選ばれる；

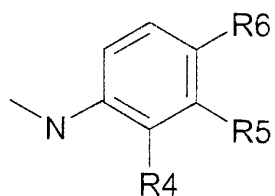
R 2 は、水素原子、ハロゲン原子又は、カルボニル基を形成する為に酸素原子、又は C 1 ~ C 3 アルキル基、N R 1 4 R 1 5 基、S O 2 R 1 4 R 1 5 基又は C (=O) N R 1 4 R 1 5 基を表し、R 1 4 及び R 1 5 は互に独立に

水素原子、又は

線状若しくは分枝状の C 1 ~ C 1 0 アルキル基を表し、ここで 1 又はそれより多い炭素原子が窒素原子により置き換えられていてもよく、該アルキル基は 1 またはそれより多い -O H 基及び / 又は = O 基により及び / 又は、置換された又は置換されていない、

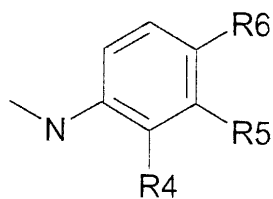


の基により置換されていてもよく、Y 1がC R 1 3を表しかつR 1 3が



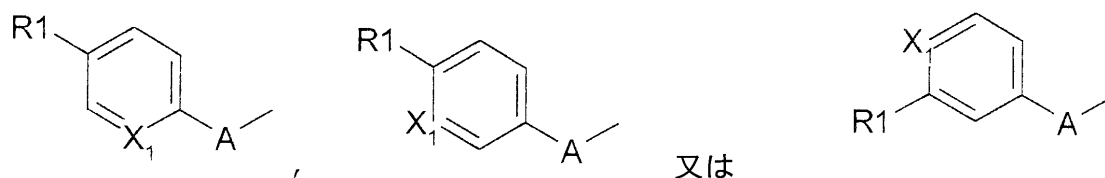
基を表す場合に、R 2は水素原子を表す；

R 3は、水素原子又は、カルボニル基を形成する為に酸素原子、又はC 1～C 3アルキル基、又は、上記で定義されたとおりのNR 1 4 R 1 5基、SO 2 R 1 4 R 1 5基又はC (=O) NR 1 4 R 1 5基を表し、ここでR 2がハロゲン原子、NR 1 4 R 1 5、SO 2 R 1 4 R 1 5又はC (=O) NR 1 4 R 1 5基を表す場合およびY 1がC R 1 3基を表しかつR 1 3が



基を表す場合に、R 3は水素原子を表す；

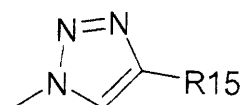
X 2は、窒素原子又はC R 1 6基を表し、ここでR 1 6は水素原子又は



基を含む群のうちから選ばれる；

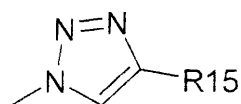
R 4 は、水素原子又は C 1 ～ C 3 アルキル基又は C (= O) N R 1 4 R 1 5 基を表し、ここで R 4 は、R 5 又は R 6 が水素原子と異なる場合に、水素原子又は C 1 ～ C 3 アルキル基を表す；

R 5 は、水素原子、C (= O) N R 1 4 R 1 5 基又は



基を表し、ここで R 5 は、R 4 又は R 6 が水素原子と異なる場合に、水素原子を表す；

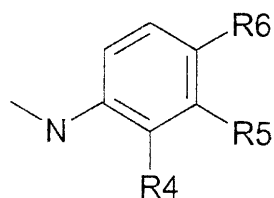
R 6 は、水素原子、又は C (= O) N R 1 4 R 1 5 基又は



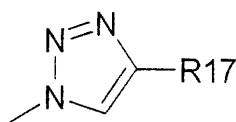
基を表し、ただし R 5 が水素原子と異なる場合又は R 4 が水素原子又は C 1 ～ C 3 アルキル基と異なる場合に、R 6 は水素原子を表す；

R 7 は、水素原子、上記で定義されたとおりの R 1 1 及び R 1 2 を有する N R 1 1 R 1 2 基又は O R 1 2 基を表し、且つ X 2 は、R 7 が N R 1 1 R 1 2 又は O R 1 2 基を表す場合に C H 基を表す；

Y 2 は、窒素原子又は C R 1 1 基を表し、ここで R 1 1 は、水素原子、



基又は



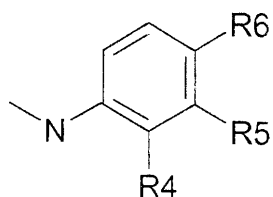
基を含む群のうちから選ばれ、ここで R 1 7 は、

水素原子、又は

線状若しくは分枝状の C 1 ~ C 3 アルキル基を表し、ここで 1 又はそれより多い炭素原子は窒素原子により置き換えられていてもよく、該アルキル基は 1 又はそれより多い -OH 基及び / 又は =O 基により置換されていてもよい；

ここで、Y 2 は、窒素原子又は C R 1 1 基を表し、R 1 1 は、R 8 又は R 8 ' が窒素原子又は C H 基と異なる場合および R 8 ' が水素原子又はハロゲン原子と異なる場合に、水素原子である、

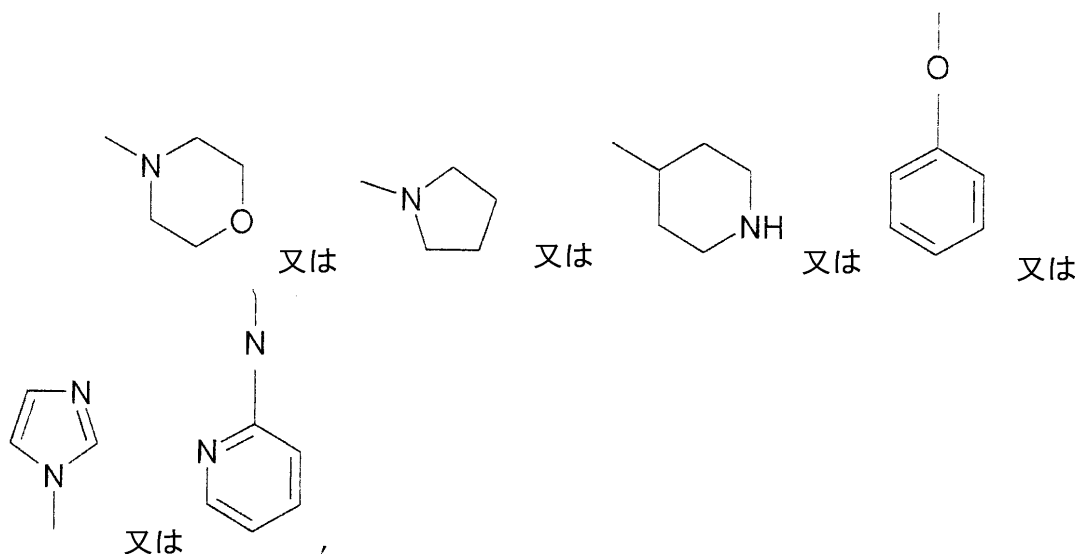
R 8 及び R 8 ' は、水素原子又はハロゲン原子、



基又は C (=O) N R 1 8 R 1 9 基を表し、ここで R 1 8 及び R 1 9 は互に独立に、

水素原子、又は

線状若しくは分枝状の C 1 ~ C 3 アルキル基を表し、ここで 1 又はそれより多い炭素原子が窒素原子により置き換えられていてもよく、該アルキル基は、1 又はそれより多い -OH 基及び / 又は =O 基により及び / 又は、置換された又は置換されていない、

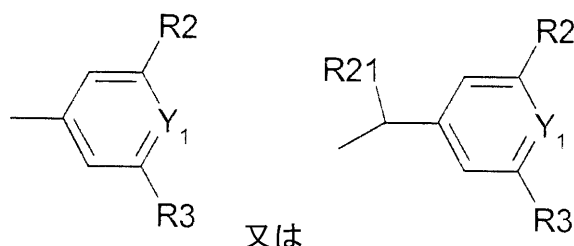


の基により置換されていてもよく、ここで、Y 2 が窒素原子又は C H 基と異なる場合および R 8 ' が水素原子又はハロゲン原子と異なる場合に、R 8 は水素原子又はハロゲン原子を表す；且つ

Y 2 が窒素原子又は C H 基と異なる場合および R 8 が水素原子又はハロゲン原子と異なる場合に、R 8 ' は水素原子又はハロゲン原子を表す；

X 3 は、酸素原子、N O R 2 0 基又は N N H R 2 0 基を表し、ここで、R 2 0 は水素原子

又は C 1 ～ C 6 アルキル基を表す；
 X 4 は、CH 2 又は CO 基を表す；
 R 2 1 および R 2 2 は互に独立に、水素原子又はメチル基を表す；
 R 2 3 は、



基を表す。

【請求項 2】

式 (I V) を有する、請求項 1 の化合物。

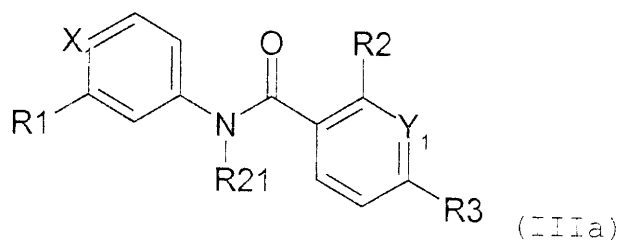
【請求項 3】

N-(3-ジメチルアミノ-プロピル)-3-(4-トリフルオロメトキシ-フェニルアミノ)-ベンズアミド；
 4-(4-メトキシ-フェニルアミノ)-3-メチル-N-(3-メチル-ブチル)-ベンズアミド；
 3-メチル-N-(3-メチル-ブチル)-4-(4-トリフルオロメトキシ-フェニルアミノ)-ベンズアミド；
 N-(2-ジメチルアミノ-エチル)-2-(4-トリフルオロメトキシ-フェニルアミノ)-ベンズアミド；
 N-(2-ジエチルアミノ-エチル)-2-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)-ベンズアミド；
 N-(2-ジエチルアミノ-プロピル)-2-(4-トリフルオロメトキシ-フェニルアミノ)-ベンズアミド；
 (N-ジエチルアミノ)-{1-[4-(4-メトキシ-フェニルアミノ)-フェニル]-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル}-メチルアミン；
 (N-ジエチルアミノ)-{1-[4-(4-トリフルオロメトキシフェニルアミノ)-フェニル]-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル}-メチルアミン；
 (N-ジエチルアミノ)-{1-[4-(4-N-ジメチルアミノ-フェニルアミノ)-フェニル]-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル}-メチルアミン；
 N-(3-イミダゾール-1-イル-プロピル)-2-(4-メトキシ-フェニルアミノ)-ベンズアミド；
 N-(3-イミダゾール-1-イル-プロピル)-2-(4-トリフルオロメトキシ-フェニルアミノ)-ベンズアミド；
 2-(4-ジメチルアミノ-フェニルアミノ)-N-(3-イミダゾール-1-イル-プロピル)-ベンズアミド；
 N-(4-ジエチルアミノ-1-メチル-ブチル)-2-(4-ジメチルアミノフェニルアミノ)-ベンズアミド；
 N-(2-ジメチルアミノ-エチル)-4-(4-トリフルオロメトキシ-フェニルアミノ)-ベンズアミド；
 N-(2-ジメチルアミノ-エチル)-4-(4-ジメチルアミノ-フェニルアミノ)-ベンズアミド；
 N-(2-ジメチルアミノ-エチル)-4-(4-メトキシ-フェニルアミノ)-3-メチル-ベンズアミド；
 N-(3-ジエチルアミノ-プロピル)-4-(4-メトキシ-フェニルアミノ)-ベンズアミド；
 N-(3-ジエチルアミノ-プロピル)-4-(4-メトキシ-フェニルアミノ)-3-メチル-ベンズアミド；
 N-(3-ジエチルアミノ-プロピル)-3-メチル-4-(4-トリフルオロメトキシ-フェニルアミノ)-ベンズアミド；

N-(3-ジエチルアミノ-プロピル)-4-(4-ジメチルアミノ-フェニルアミノ)-3-メチル-ベンズアミド;
 N-(2-ジメチルアミノ-エチル)-3-メチル-4-(4-トリフルオロメトキシ-フェニルアミノ)-ベンズアミド;
 3-{1-[4-(4-メトキシ-フェニルアミノ)-フェニル]-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル}-プロパン-1-オール;
 (N-ジエチルアミノ)-{1-[3-(4-メトキシ-フェニルアミノ)-フェニル]-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル}-メチルアミン;
 [4-(5-クロロ-1H-イミダゾール-2-イル)-2-メチル-フェニル]-(4-メトキシ-フェニル)-アミン;
 N-(2-ジエチルアミノ-エチル)-4-(4-メトキシ-フェニルアミノ)-ベンズアミド;
 N-(2-ジメチルアミノ-エチル)-2-(4-メトキシ-フェニルアミノ)-ベンズアミド;
 4-(4-メトキシ-フェニルアミノ)-N-(3-メチル-ブチル)-ベンズアミド;
 N-(3-イミダゾール-1-イル-プロピル)-4-(4-トリフルオロメトキシ-フェニルアミノ)-ベンズアミド;
 [3-(4-ジエチルアミノメチル-[1,2,3]トリアゾール-1-イル)-フェニル]-(4-ジメチルアミノ)-フェニルアミン;
 N-(2-ジエチルアミノ-エチル)-2-(4-メトキシ-フェニルアミノ)-ベンズアミド;
 3-{1-[3-(4-トリフルオロメトキシ-フェニルアミノ)-フェニル]-1H-[1,2,3]トリアゾール-4-イル}-プロパン-1-オール; 及び
 3-{1-[3-(4-ジメチルアミノ-フェニルアミノ)-フェニル]-1H-[1,2,3]トリアゾール-4-イル}-プロパン-1-オール
 を含む群のうちから選ばれるものである、請求項 2 の化合物。

【請求項 4】

以下の式 (IIIa)



を有する、請求項 1 の化合物。

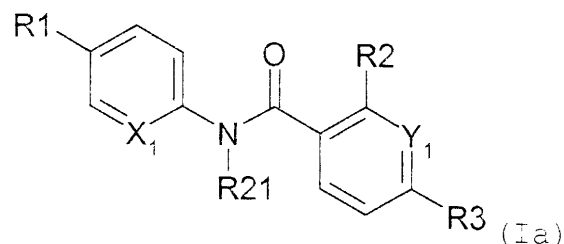
【請求項 5】

N-(4-ピリジル)-2-[6-(N'-(4-ピリジルベンズアミド)-フェニルアミノ)-1-ヒドロキシブチルアミノ]-ベンズアミド;
 2-(3-ジエチルアミノ-プロピルアミノ)-N-ピリジン-4-イル-ニコチンアミド;
 2-(3-イミダゾール-1-イル-プロピルアミノ)-N-ピリジン-4-イル-ニコチンアミド;
 N-(3-ジエチルアミノ-プロピル)-3-[3-(3-メトキシベンズアミド)-フェニルアミノ]-ベンズアミド;
 3-(1-{3-[3-メトキシベンズアミド)-フェニルアミノ]-フェニル}-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)-プロパン-1-オール;
 N-(3-ジエチルアミノ-プロピル)-3-メチル-4-[3-(3-メトキシベンズアミド)-フェニルアミノ]-ベンズアミド;
 N-(3-メチル-ブチル)-4-[3-(3-メトキシベンズアミド)-フェニルアミノ]-ベンズアミド;
 3-(1-{4-[3-メトキシベンズアミド)-フェニルアミノ]-フェニル}-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)-プロパン-1-オール;

(N-ジェチルアミノ)-3-(1-{3-[3-メトキシベンズアミド]-フェニルアミノ}-フェニル}-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)-メチルアミン；
3-(1-{4-[3-メトキシベンズアミド]-フェニルアミノ}-フェニル}-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)-プロパン-1-オール；
N-(3-ジェチルアミノ-プロピル)-4-[4-(3-メトキシベンズアミド)-フェニルアミノ]-ベンズアミド；
N-(3-ジェチルアミノ-プロピル)-3-メチル-4-[4-(3-メトキシベンズアミド)-フェニルアミノ]-ベンズアミド；
N-(3-メチル-ブチル)-3-メチル-4-[4-(3-メトキシベンズアミド)-フェニルアミノ]-ベンズアミド；
(N-ジェチルアミノ)-3-(1-{4-[4-(3-メトキシベンズアミド)-フェニルアミノ]-フェニル}-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)-メチルアミン；
3-(1-{4-[3-メトキシベンズアミド]-フェニルアミノ}-フェニル}-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)-プロパン-1-オール；
N-(3-ジェチルアミノ-プロピル)-3-[4-(3-メトキシベンズアミド)-フェニルアミノ]-ベンズアミド；
N-(3-メチル-ブチル)-3-[4-(3-メトキシベンズアミド)-フェニルアミノ]-ベンズアミド；
2-クロロ-N-(3-メトキシ-フェニル)-ニコチンアミド；
2-(3-ジメチルアミノ-プロピルアミノ)-N-(3-メトキシ-フェニル)-ニコチンアミド；
2-ブロモ-N-ピリジン-4-イル-ベンズアミド；
2-ブロモ-N-(3-メトキシ-フェニル)-ベンズアミド；
2-クロロ-N-ピリジン-4-イル-ニコチンアミド；
2-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-N-(3-メトキシ-フェニル)-ニコチンアミド；
2-(2-ジェチルアミノ-エチルアミノ)-N-(3-メトキシ-フェニル)-ニコチンアミド；
2-(3-ジェチルアミノ-プロピルアミノ)-N-(3-メトキシ-フェニル)-ニコチンアミド；
2-(4-ヒドロキシ-ブチルアミノ)-N-(3-メトキシ-フェニル)-ニコチンアミド；
2-(5-ヒドロキシ-ペンチルアミノ)-N-(3-メトキシ-フェニル)-ニコチンアミド；
2-(6-アミノ-ヘキシルアミノ)-N-(3-メトキシ-フェニル)-ニコチンアミド；
2-(3-イミダゾール-1-イル-プロピルアミノ)-N-(3-メトキシ-フェニル)-ニコチンアミド；
2-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-N-(3-メトキシ-フェニル)-ベンズアミド；
2-(2-ジェチルアミノ-エチルアミノ)-N-(3-メトキシ-フェニル)-ベンズアミド；
2-(4-ヒドロキシ-ブチルアミノ)-N-(3-メトキシ-フェニル)-ベンズアミド；
2-(4-ジェチルアミノ-1-メチル-ブチルアミノ)-N-(3-メトキシ-フェニル)-ベンズアミド；
2-(2-ジェチルアミノ-エチルアミノ)-N-ピリジン-4-イル-ベンズアミド；
2-(2-ジェチルアミノ-エチルアミノ)-N-ピリジン-4-イル-ベンズアミド；
2-(3-ジェチルアミノ-プロピルアミノ)-N-ピリジン-4-イル-ベンズアミド；
2-(3-イミダゾール-1-イル-プロピルアミノ)-N-ピリジン-4-イル-ベンズアミド；
2-(2-ジェチルアミノ-エチルアミノ)-N-ピリジン-4-イル-ニコチンアミド；及び
2-(3-ジメチルアミノ-プロピルアミノ)-N-ピリジン-4-イル-ニコチンアミド
を含む群のうちから選ばれるものである、請求項4の化合物。

【請求項6】

以下の式（I a）



を有する、請求項 1 の化合物。

【請求項 7】

- N-(4-メトキシ-フェニル)-2-[6-(N'-(4-メトキシ-フェニルニコチンアミド)-ピリジン-2-イルアミノ)-ヘキシルアミノ]-ニコチンアミド；
- 2-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-N-(4-トリフルオロメトキシ-フェニル)-ニコチンアミド；
- 2-(3-ジメチルアミノ-プロピルアミノ)-N-(4-トリフルオロメトキシ-フェニル)-ニコチンアミド；
- 2-(3-ジエチルアミノ-プロピルアミノ)-N-(4-トリフルオロメトキシ-フェニル)-ニコチンアミド；
- 2-(4-ヒドロキシ-ブチルアミノ)-N-(4-トリフルオロメトキシ-フェニル)-ニコチンアミド；
- N-(4-トリフルオロメトキシ-フェニル)-2-[6-(N'-(4-トリフルオロメトキシ-フェニルニコチンアミド)-ピリジン-2-イルアミノ)-ヘキシルアミノ]-ニコチンアミド；
- N-(3-ジエチルアミノ-プロピル)-3-[3-(3-メトキシベンズアミド)-フェニルアミノ]-ベンズアミド；
- N-(3-メチル-ブチル)-3-メチル-4-[3-(4-メトキシベンズアミド)-フェニルアミノ]-ベンズアミド；
- (N-ジエチルアミノ)-3-(1-{3-[4(4-メトキシベンズアミド)-フェニルアミノ]-フェニル}-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)-メチルアミン；
- 2-ブロモ-N-(4-ジメチルアミノ-フェニル)-ベンズアミド；
- 2-クロロ-N-(4-ジメチルアミノ-フェニル)-ニコチンアミド；
- 2-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-N-(4-メトキシ-フェニル)-ニコチンアミド；
- 2-(2-ジメチルアミノ-エチルアミノ)-N-(4-メトキシ-フェニル)-ベンズアミド；
- 2-(3-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-N-(4-メトキシ-フェニル)-ベンズアミド；
- 2-(3-ジメチルアミノ-プロピルアミノ)-N-(4-メトキシ-フェニル)-ベンズアミド；
- 2-(4-ヒドロキシ-ブチルアミノ)-N-(4-メトキシ-フェニル)-ベンズアミド；
- 2-(3-イミダゾール-1-イル-プロピルアミノ)-N-(4-メトキシ-フェニル)-ベンズアミド；
- 2-クロロ-N-(4-トリフルオロメトキシ-フェニル)-ニコチンアミド；
- 2-ブロモ-N-(4-トリフルオロメトキシ-フェニル)-ベンズアミド；
- 2-(3-イミダゾール-1-イル-プロピルアミノ)-N-(4-トリフルオロメトキシ-フェニル)-ニコチンアミド；
- 2-(2-ジエチルアミノ-エチルアミノ)-N-(4-トリフルオロメトキシ-フェニル)-ベンズアミド；
- 2-(3-ジメチルアミノ-プロピルアミノ)-N-(4-トリフルオロメトキシ-フェニル)-ベンズアミド；
- 2-(3-ジエチルアミノ-プロピルアミノ)-N-(4-トリフルオロメトキシ-フェニル)-ベンズアミド；
- 2-(4-ヒドロキシ-ブチルアミノ)-N-(4-トリフルオロメトキシ-フェニル)-ベンズアミド；
- 2-(6-アミノ-ヘキシルアミノ)-N-(4-トリフルオロメトキシ-フェニル)-ベンズアミド；
- 2-(3-イミダゾール-1-イル-プロピルアミノ)-N-(4-トリフルオロメトキシ-フェニル)-ベ

ンズアミド；及び

2-(4-ジエチルアミノ-1-メチル-ブチルアミノ)-N-(4-トリフルオロメトキシ-フェニル)-ベンズアミド

を含む群のうちから選ばれるものである、請求項6の化合物。

【請求項8】

式(I X)を有する、請求項1の化合物。

【請求項9】

N-(3-ジエチルアミノ-プロピル)-3-[4-((E)-2-ピリジン-4-イル-ビニル)-フェニルアミノ]-ベンズアミド；

N-(3-メチル-ブチル)-3-[4-((E)-2-ピリジン-4-イル-ビニル)-フェニルアミノ]-ベンズアミド；

(N-ジエチルアミノ)-3-(1-{3-[4-((E)-2-ピリジン-4-イル-ビニル)-フェニルアミノ]-フェニル}-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)-メチルアミン；

3-(1-{3-[4-((E)-2-ピリジン-4-イル-ビニル)-フェニルアミノ]-フェニル}-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)-プロパン-1-オール；

N-(3-ジエチルアミノ-プロピル)-3-メチル-4-[4-((E)-2-ピリジン-4-イル-ビニル)-フェニルアミノ]-ベンズアミド；

3-メチル-N-(3-メチル-ブチル)-4-[4-((E)-2-ピリジン-4-イル-ビニル)-フェニルアミノ]-ベンズアミド；

3-(1-{4-[4-((E)-2-ピリジン-4-イル-ビニル)-フェニルアミノ]-フェニル}-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)-プロパン-1-オール；

4-メチル-N-(3-メチル-ブチル)-3-[3-((E)-2-ピリジン-4-イル-ビニル)-フェニルアミノ]-ベンズアミド；

N-(3-ジエチルアミノ-プロピル)-3-[3-((E)-2-ピリジン-4-イル-ビニル)-フェニルアミノ]-ベンズアミド；

N-(3-メチル-ブチル)-3-[3-((E)-2-ピリジン-4-イル-ビニル)-フェニルアミノ]-ベンズアミド；

(N-ジエチルアミノ)-3-(1-{3-[3-((E)-2-ピリジン-4-イル-ビニル)-フェニルアミノ]-フェニル}-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)-メチルアミン；

3-(1-{3-[3-((E)-2-ピリジン-4-イル-ビニル)-フェニルアミノ]-フェニル}-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)-プロパン-1-オール；

N-(3-ジエチルアミノ-プロピル)-3-メチル-4-[3-((E)-2-ピリジン-4-イル-ビニル)-フェニルアミノ]-ベンズアミド；

N-(3-メチル-ブチル)-4-[3-((E)-2-ピリジン-4-イル-ビニル)-フェニルアミノ]-ベンズアミド；

N-(3-ジエチルアミノール-プロピル)-3-[3-((E)-(4-メトキシ-スチリル)-フェニルアミノ)-ベンズアミド；

N-(3-メチル-ブチル)-3-[3-((E)-(4-メトキシ-スチリル)-フェニルアミノ)-ベンズアミド；

N-(3-ジエチルアミノール-プロピル)-3-メチル-4-[3-((E)-(4-メトキシ-スチリル)-フェニルアミノ)-ベンズアミド；

N-(3-メチル-ブチル)-3-メチル-4-[3-((E)-(4-メトキシ-スチリル)-フェニルアミノ)-ベンズアミド；

N-(3-メチル-ブチル)-4-[3-((E)-(4-メトキシ-スチリル)-フェニルアミノ)-ベンズアミド；

N-(3-ジエチルアミノ-プロピル)-3-[3-((E)-2-ピリジン-2-イル-ビニル)-フェニルアミノ]-ベンズアミド；

N-(3-メチル-ブチル)-3-[3-((E)-2-ピリジン-2-イル-ビニル)-フェニルアミノ]-ベンズアミド；

3-(1-{3-[4-((E)-2-ピリジン-4-イル-ビニル)-フェニルアミノ]-フェニル}-1H-1,2,3-トリ

アゾール-4-イル)-プロパン-1-オール;

N-(3-ジエチルアミノ-プロピル)-4-[3-((E)-2-ピリジン-2-イル-ビニル)-フェニルアミノ]-ベンズアミド;

N-(3-メチル-ブチル)-3-メチル-4-[3-((E)-2-ピリジン-2-イル-ビニル)-フェニルアミノ]-ベンズアミド; 及び

3-(1-{3-[3-((E)-2-ピリジン-2-イル-ビニル)-フェニルアミノ]-フェニル}-1H-1,2,3-トリアゾール-4-イル)-プロパン-1-オール

を含む群のうちから選ばれるものである、請求項 8 の化合物。

【請求項 10】

請求項 1～9 のいずれか 1 項の少なくとも 1 つの化合物を含む医薬組成物。

【請求項 11】

細胞内のプレメッセンジャー RNA をスプライシングするプロセスに関連する疾患を、対象において処置する為の剤であって、請求項 1～9 のいずれか 1 項の少なくとも 1 つの化合物を含み、該疾患が、スプライシングプロセスの変化からもたらされる遺伝子疾患であり、該疾患が F r a s i e r 症候群、17 番染色体に関係した前頭側頭型認知症（パーキンソン病の形）、L e i g h 症候群（脳症のタイプ）、非定型嚢胞性線維症、いくつかの神経病理、S M N（生存運動ニューロン）遺伝子に影響する筋萎縮症、セロトニンスプライシングの調節不全に関係したうつ、及び全体のスプライシングプロセスが影響されるいくつかの転移性ガンを含む群のうちから選ばれるものである、前記剤。

【請求項 12】

該疾患がガンであり、該ガンが、乳ガン、大腸ガン、膵臓ガン、肝臓ガン、前立腺ガン及び子宮ガンを含む群において選ばれるものである、請求項 11 の剤。

【請求項 13】

細胞内のプレメッセンジャー RNA をスプライシングするプロセスに関連する疾患を、対象において処置する為の剤であって、請求項 1～9 のいずれか 1 項の少なくとも 1 つの化合物を含み、該疾患が老化とともに現れ、該疾患がアテローム性動脈硬化症、インスリン抵抗性 I I 型糖尿病、白内障、骨粗しょう症及び皮膚の老化を含む群のうちから選ばれるものである、前記剤。

【請求項 14】

細胞内のプレメッセンジャー RNA をスプライシングするプロセスに関連する疾患を、対象において処置する為の剤であって、請求項 1～9 のいずれか 1 項の少なくとも 1 つの化合物を含み、該疾患が、ウィルス由来の疾患である、前記剤。

【請求項 15】

対象において、遺伝子変異に関連した疾患を処置する為の剤であって、請求項 1～9 のいずれか 1 項の少なくとも 1 つの化合物を含み、該疾患が、エキソンスキッピングにより処置されうる疾患である、前記剤。

【請求項 16】

R 1 1 及び R 1 2 が、互に独立に、メチル基又はトリフルオロメチル基を表す、請求項 1 の化合物。

【請求項 17】

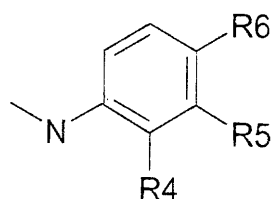
R 1 が O R 1 2 基を表す場合に、X 1 が C H 基を表す、請求項 1 の化合物。

【請求項 18】

R 1 が O C H₃ 基を表す場合に、X 1 が C H 基を表す、請求項 1 の化合物。

【請求項 19】

R 1 3 が、

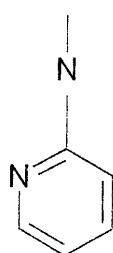
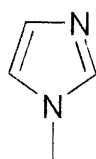
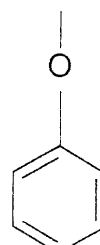
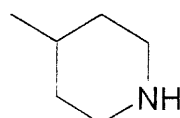
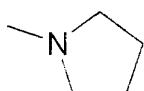
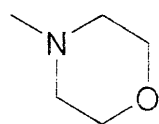


【請求項 20】

【請求項 21】

水素原子、又は

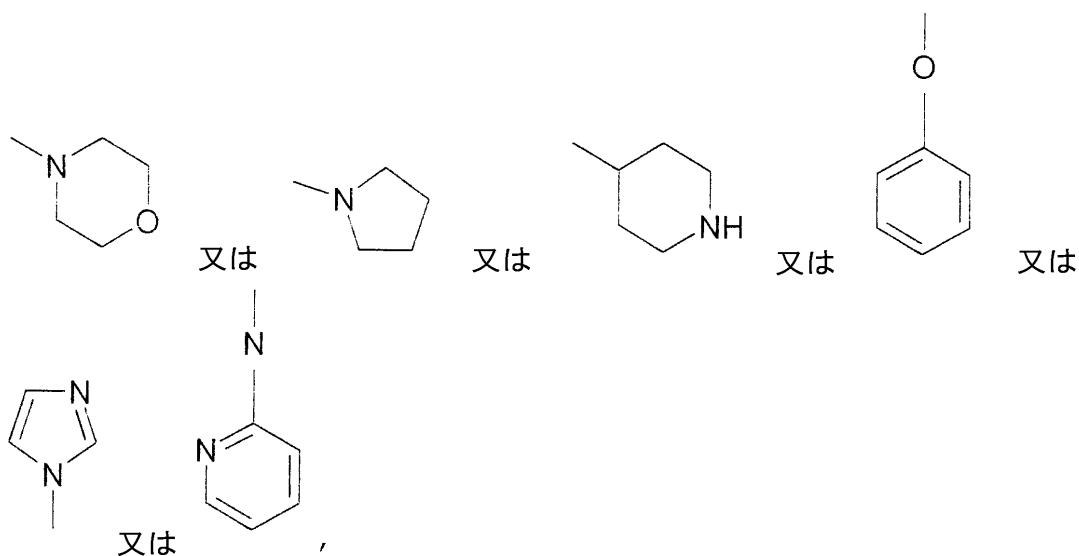

 又は
 
 又は
 
 又は
 
 又は



又は

【請求項 22】

水素原子、又は



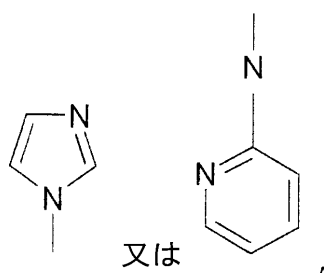
の基により置換されていてもよい、請求項 1 の化合物。

【請求項 2 3】

R 1 4 及び R 1 5 が互に独立に

水素原子、又は

線状若しくは分枝状の C 1 ～ C 1 0 アルキル基を表し、ここで 1 又はそれより多い炭素原子が窒素原子により置き換えられていてもよく、該アルキル基は 1 またはそれより多い -OH 基及び／又は =O 基により及び／又は、置換された又は置換されていない、



の基により置換されていてもよい、請求項 1 の化合物。

【請求項 2 4】

R 3 が、水素原子又は、カルボニル基を形成する為に酸素原子、又はメチル基若しくはトリフルオロメチル基、又は、上記で定義されたとおりの NR 1 4 R 1 5 基、SO 2 R 1 4 R 1 5 基又は C (=O) NR 1 4 R 1 5 基を表す、請求項 1 の化合物。

【請求項 2 5】

R 4 が、水素原子又はメチル基又は C (=O) NR 1 4 R 1 5 基を表す、請求項 1 の化合物。

物。

【請求項 26】

R 6 が C (= O) N R 1 4 R 1 5 基を表す、請求項 1 の化合物。

【請求項 27】

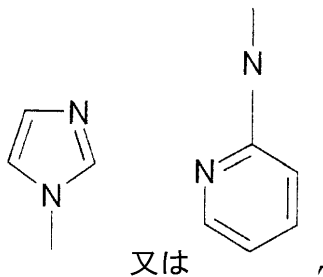
R 7 が水素原子を表す、請求項 1 の化合物。

【請求項 28】

R 1 8 及び R 1 9 が互に独立に、

水素原子、又は

線状若しくは分枝状の C 1 ~ C 3 アルキル基を表し、ここで 1 又はそれより多い炭素原子が窒素原子により置き換えられていてもよく、該アルキル基は、1 又はそれより多い - O H 基及び / 又は = O 基により及び / 又は、置換された又は置換されていない、



の基により置換されていてもよい、請求項 1 の化合物。

【請求項 29】

R 2 1 および R 2 2 が水素原子を表す、請求項 1 の化合物。

【請求項 30】

医薬的に許容できる担体を含む、請求項 10 の医薬組成物。

【請求項 31】

前記神経病理が、T a u タンパク質の変異に関係したアルツハイマー病である、請求項 1 の剤。

【請求項 32】

前記転移性ガンが、乳ガン、大腸ガン、膵臓ガン、肝臓ガン、前立腺ガン、子宮ガン及び或るリンパ腫を含む上皮ガンにおけるものである、請求項 11 の剤。

【請求項 33】

該疾患が A I D S である、請求項 14 の剤。

【請求項 34】

該疾患がデュシェンヌ型筋ジストロフィー (D M D) である、請求項 15 の剤。