

【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】令和 3 年 7 月 26 日 (2021.7.26)

【公表番号】特表 2020-527139 (P2020-527139A)

【公表日】令和 2 年 9 月 3 日 (2020.9.3)

【年通号数】公開・登録公報 2020-036

【出願番号】特願 2020-501154 (P2020-501154)

【国際特許分類】

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 417/14 (2006.01)

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 413/14 (2006.01)

C 0 7 D 409/14 (2006.01)

A 6 1 K 31/4709 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/496 (2006.01)

A 6 1 K 31/501 (2006.01)

A 6 1 K 31/553 (2006.01)

A 6 1 K 31/541 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 K 39/395 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 401/04 C S P

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 401/14

C 0 7 D 417/14

C 0 7 D 471/04 1 1 3

C 0 7 D 413/14

C 0 7 D 409/14

A 6 1 K 31/4709

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/496

A 6 1 K 31/501

A 6 1 K 31/553

A 6 1 K 31/541

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 35/02

A 6 1 K 45/00

A 6 1 K 39/395 N

【手続補正書】

【提出日】令和 3 年 5 月 20 日 (2021.5.20)

【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

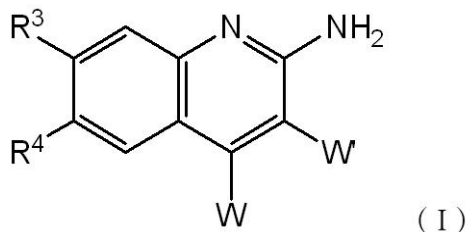
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】

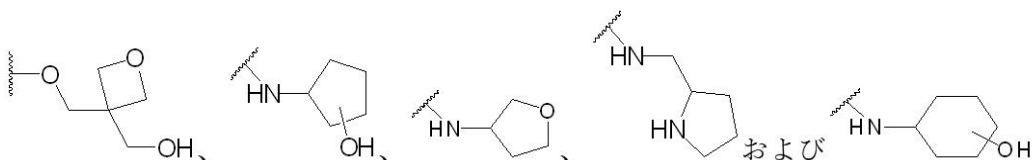


[式中、

W' は H であり ;

W は独立して - O - CH₂CH(OH)(CH₂OH)、- NH - (CH₂)₃ - 4 - OH、
- NH - (CH₂)₁ - 2 - CH(CH₃)OH、- NH - (CH₂)₁ - 2 - C(CH₃)₂OH、
- O - (CH₂)₁ - 2 - (ピラゾリル)、- NH - (CH₂)₁ - 2 - (ピラゾリル)、
- NH - (CH₂)₁ - 2 - (ピリミジニル)、- NH - (CH₂)₁ - 2 - (ピリダジニル)、
- NH - (CH₂)₁ - 2 - CF₂ (ピリジル)、

【化 2】



から選択され ;

R³ は独立して

【化 3】



であり ; そして

R⁴ は独立して H または F である]

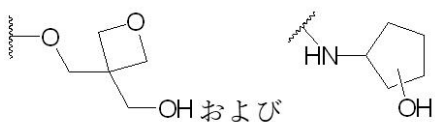
を有する化合物、またはその薬学的に許容される塩、立体異性体もしくは水和物。

【請求項 2】

W' が H であり ;

W が独立して - O - CH₂CH(OH)(CH₂OH)、- NH - (CH₂)₃ - 4 - OH、
- NH - (CH₂)₁ - 2 - CH(CH₃)OH、- NH - (CH₂)₁ - 2 - C(CH₃)₂OH、
- NH - (CH₂)₁ - 2 - (ピラゾリル) および

【化 4】



から選択され ;

R³ が独立して

【化 5】



であり；そして

R^4 が独立して H または F である、

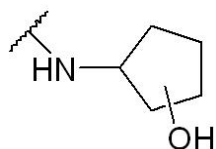
請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、立体異性体もしくは水和物。

【請求項 3】

W' が H であり；

W が独立して $-O-CH_2CH(OH)(CH_2OH)$ 、 $-NH-(CH_2)_3-OH$ 、 $-NH-(CH_2)_1-2-CH(CH_3)OH$ 、 $-NH-(CH_2)_1-2-C(CH_3)_2OH$ 、 $-NH-(CH_2)_1-2-(\text{ピラゾリル})$ および

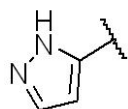
【化 6】



から選択され；

R^3 が

【化 7】



であり；そして

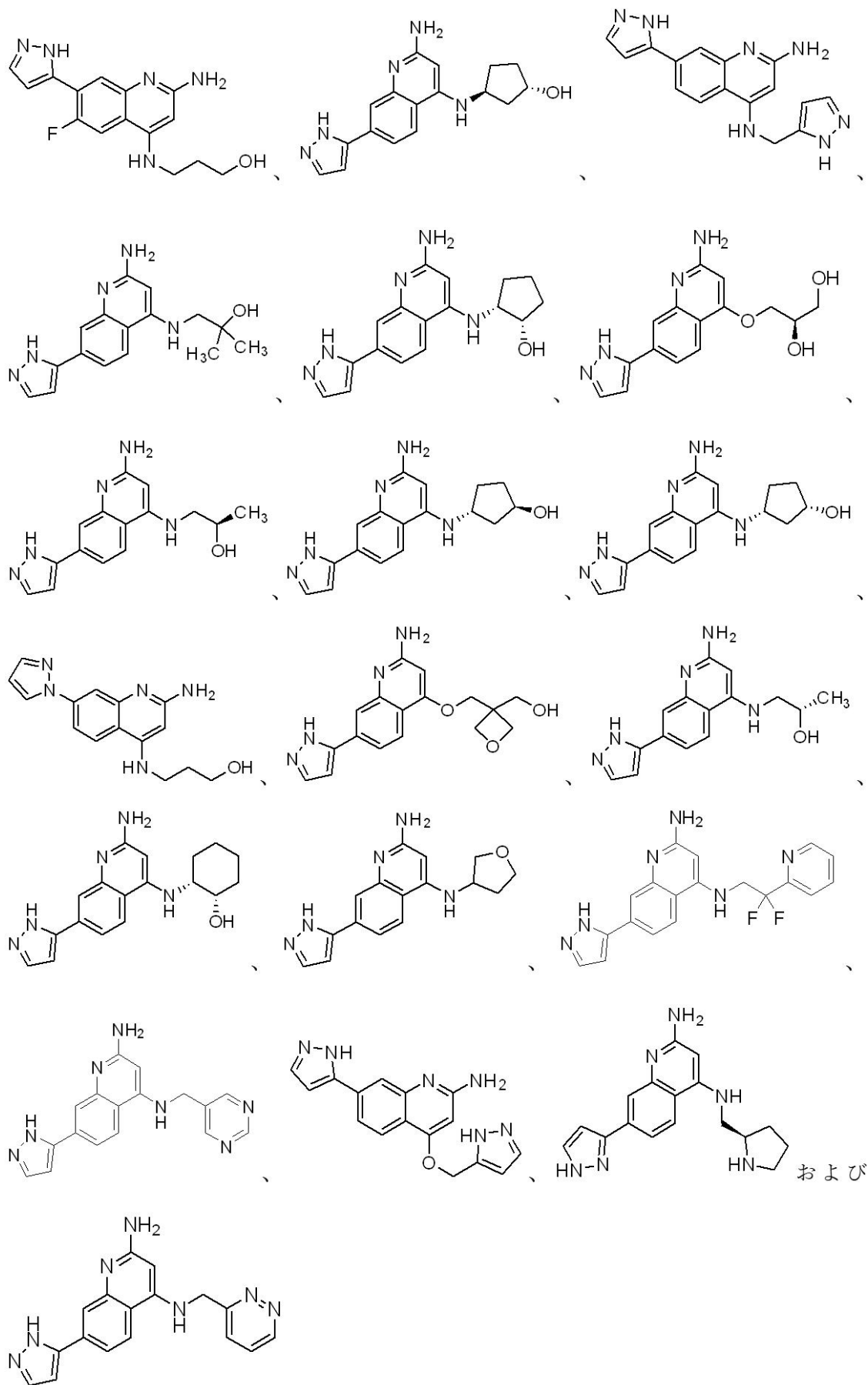
R^4 が独立して H または F である、

請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、立体異性体もしくは水和物。

【請求項 4】

化合物が次のものから選択される、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

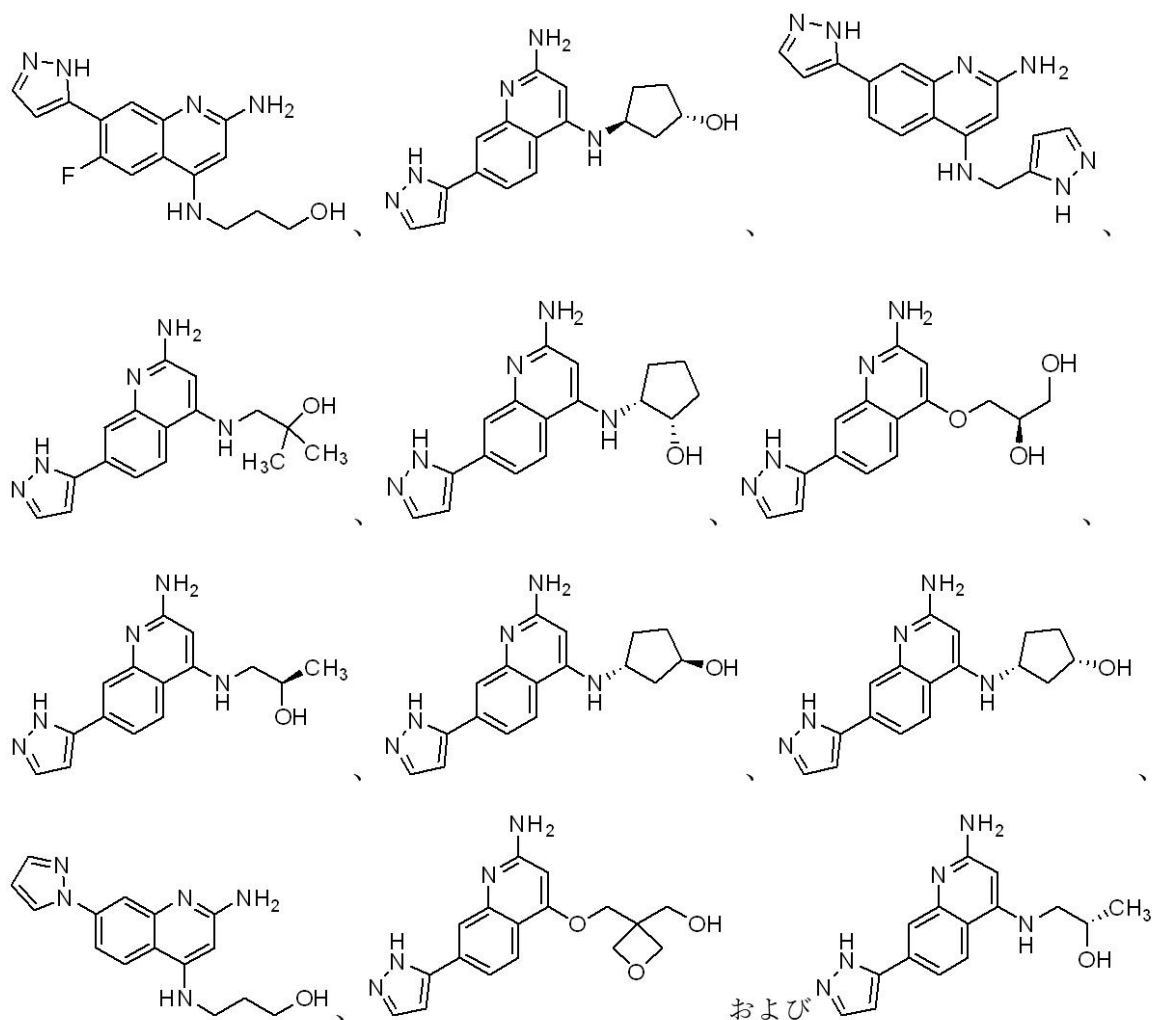
【化 8】



【請求項 5】

化合物が次のものから選択される、請求項 4 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

【化 9】



【請求項 6】

化合物が次のものから選択される、請求項 4 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

および

化合物が次のものである、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

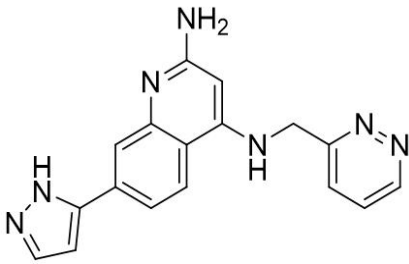
Nc1cc(N[C@@H]2CCCC[C@H]2O)nc3ccc(cc13)c4c[nH]n4

化合物が次のものである、請求項 1 に記載の化合物。

Nc1nc2cc(ccc2c1N[C@H]3CCCC[C@@H]3O)c4c[nH]cn4

化合物が次のものである、請求項 1 に記載の化合物またはその薬学的に許容される塩。

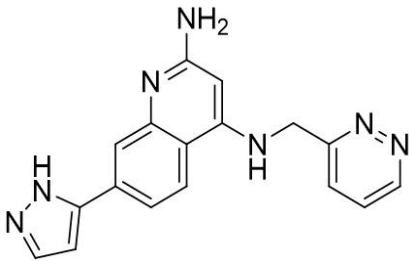
【化 1 3】



【請求項 1 0】

化合物が次のものである、請求項 1 に記載の化合物。

【化 1 4】



【請求項 1 1】

請求項 1～10 の何れかに記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩、立体異性体もしくは水和物を含む、医薬組成物。

【請求項 1 2】

医薬として使用するための、請求項 1 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 3】

癌の処置に使用するための、請求項 1 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 4】

癌が急性骨髄性白血病、副腎皮質癌、カボジ肉腫、リンパ腫、肛門癌、虫垂癌、奇形腫／ラブドイド腫瘍、基底細胞癌、胆管癌、膀胱癌、骨癌、脳癌、乳癌、気管支腫瘍、カルチノイド腫瘍、心臓腫瘍、子宮頸癌、脊索腫、慢性リンパ球性白血病、慢性骨髄増殖性新生物、結腸癌、結腸直腸癌、頭蓋咽頭腫、胆管癌、子宮内膜癌、上衣腫、食道癌、感覚神経芽腫、ユーイング肉腫、眼癌、卵管癌、胆嚢癌、消化器カルチノイド腫瘍、消化器間質腫瘍、生殖細胞腫瘍、ヘアリー細胞白血病、頭頸部癌、心臓癌、肝臓癌、下咽頭癌、膵臓癌、腎臓癌、喉頭癌、慢性骨髄性白血病、口唇および口腔癌、肺癌、黒色腫、メルケル細胞癌、中皮腫、口腔内癌、口腔癌、骨肉腫、卵巣癌、陰茎癌、咽頭癌、前立腺癌、直腸癌、唾液腺癌、皮膚癌、小腸癌、軟組織肉腫、精巣癌、咽喉癌、甲状腺癌、尿道癌、子宮癌、陰癌および外陰癌から選択される、請求項 1 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

癌が難治性癌である、請求項 1 3 または請求項 1 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 6】

癌が乳癌、結腸癌、直腸癌、結腸直腸癌、膵臓癌および前立腺癌から選択される、請求項 1 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 7】

癌がホルモン受容体陽性乳癌、マイクロサテライト安定性結腸または直腸癌、膵臓癌および前立腺癌から選択される、請求項 1 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 1 8】

医薬組成物が 1 以上のさらなる癌治療と組み合わせて投与される、請求項 1 3～1 7 の何れかに記載の医薬組成物。

【請求項 1 9】

1 以上のさらなる癌治療が手術、放射線療法、化学療法、毒素療法、免疫療法、寒冷療法または遺伝子療法またはこれらの組み合わせを含む、請求項 1 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 20】

さらなる癌治療が

シスプラチン、カルボプラチン、メクロレタミン、シクロホスファミド、クロラムブシル、イホスファミド、オキサリプラチン、アザチオプリン、メルカプトプリン、ピンクリスチン、ビンブラスチン、ビノレルビン、ビンデシン、タキソール、パクリタキセル、ドセタキセル、イリノテカン、トポテカン、アムサクリン、エトボシド、リン酸エトボシド、テニボシド、アクチノマイシン、アントラサイクリン、ドキソルビシン、ダウノルビシン、バルルビシン、イダルビシン、エピルビシン、プレオマイシン、プリカマイシン、マイトマイシン、リュープロレリン、ゴセレリン、トリプトレリン、ヒストレリン、ピカルタミド、フルタミド、ニルタミド、アブシキシマブ、アダリムマブ、アレムツズマブ、アトリズマブ、バシリキシマブ、ベリムマブ、ベバシズマブ、ブレンツキシマブ、ベドチン、カナキヌマブ、セツキシマブ、セルトリズマブ、ペゴル、ダクリズマブ、デノスマブ、エクリズマブ、エファリズマブ、ゲムツズマブ、ゴリムマブ、イブリットモマブ、チウキセタン、インフリキシマブ、イピリムマブ、ムロモナブ - CD3、ナタリズマブ、オフアツムマブ、オマリズマブ、パリビズマブ、パニツムマブ、ラニビズマブ、リツキシマブ、トシリズマブ、トシツモマブ、トラスツズマブ、インターロイキン - 2 (IL - 2)、インドールアミン 2,3 - ジオキシゲナーゼ (IDO)、IL - 10、トランスフォーミング増殖因子 - (TGF)、CD39、CD73 アデノシン - CD39 - CD73 および CXCR4 - CXCL12 から選択される 1 以上の薬剤を含む、請求項 18 に記載の医薬組成物。

【請求項 21】

さらなる癌治療がニボルマブ、ペムブロリズマブ、PDR001、MEDI - 0680、セミプリマブ、JS001、BGB - A317、INCSHR1210、TSR - 042、GLS - 010、AM - 0001、STI - 1110、AGEN2034、MGD013、IBI308、BMS - 936559、アテゾリズマブ、デュルバルマブ、アベルマブ、STI - 1014、CX - 072、LY3300054、CK - 301、ウレルマブ、PF - 05082566、MEDI6469、TRX518、バルリルマブ、CP - 870893、BMS - 986016、MGA271、リリルマブ、IPH2201、エマクツズマブ、INCB024360、ガルニセルチブ、ウロクプラマブ、BKT140、バビツキシマブ、CC - 90002、ベバシズマブ、MNRP1685A、イピリムマブ、MK - 1308、AGEN - 1884 およびトレメリムマブから選択される 1 以上の薬剤を含む、請求項 18 に記載の医薬組成物。

【請求項 22】

さらなる癌治療がニボルマブ、イピリムマブ、ペムブロリズマブ、アテゾリズマブ、デュルバルマブおよびアベルマブから選択される 1 以上の薬剤を含む、請求項 18 に記載の医薬組成物。