

【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2年6月11日(2020.6.11)

【公表番号】特表2019-514877(P2019-514877A)

【公表日】令和1年6月6日(2019.6.6)

【年通号数】公開・登録公報2019-021

【出願番号】特願2018-555177(P2018-555177)

【国際特許分類】

C 07 D 401/04	(2006.01)
C 07 D 417/14	(2006.01)
C 07 D 401/14	(2006.01)
C 07 D 471/04	(2006.01)
A 61 K 47/55	(2017.01)
A 61 K 31/454	(2006.01)
A 61 K 31/496	(2006.01)
A 61 K 31/4725	(2006.01)
A 61 K 38/05	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
C 07 K 5/062	(2006.01)

【F I】

C 07 D 401/04	C S P
C 07 D 417/14	
C 07 D 401/14	
C 07 D 471/04	1 0 4 Z
A 61 K 47/55	
A 61 K 31/454	
A 61 K 31/496	
A 61 K 31/4725	
A 61 K 38/05	
A 61 P 43/00	1 0 5
A 61 P 35/00	
C 07 K 5/062	

【手続補正書】

【提出日】令和2年4月20日(2020.4.20)

【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】

R₁—L—R₂ (I)

[式中、

R₁は、1つ以上の抗アポトーシス性Bcl-2ファミリータンパク質に結合するタンパ

ク質標的化単位であり、

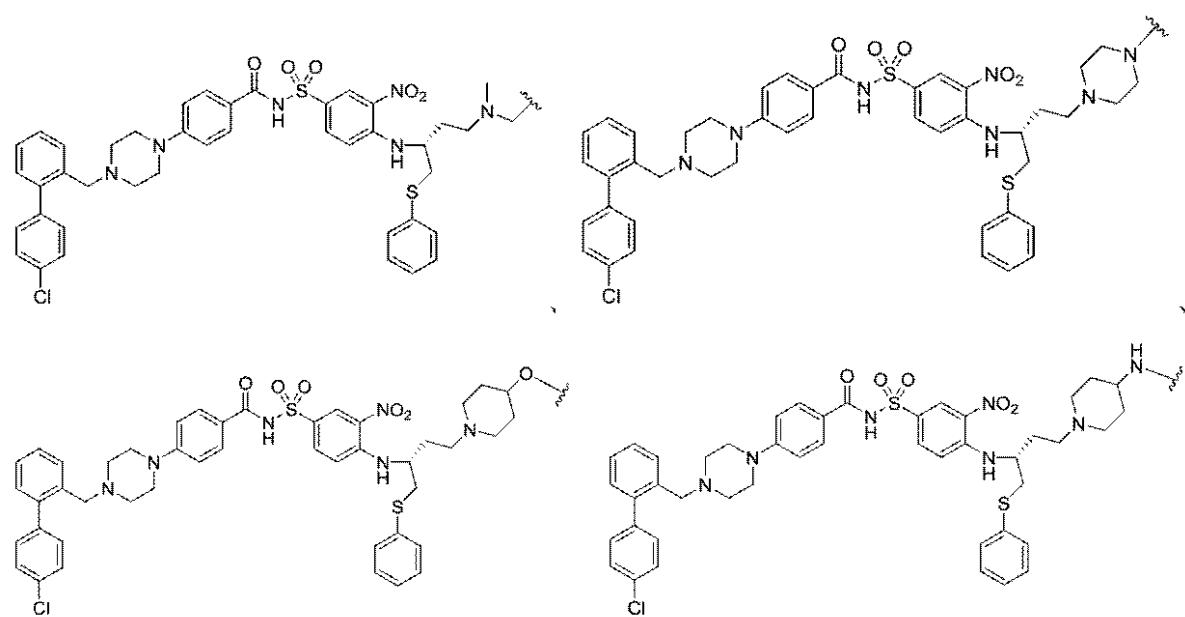
R₂は、C R B NまたはV H L E 3 ユビキチンリガーゼに結合するE 3 ユビキチンリガーゼ結合単位であり、

Lは、R₁及びR₂をアルキル、分岐アルキル、エーテル、チオエーテル、エステル、アミン、アミド、カルバメート、カルバミド、スルホン、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、またはヘテロ環基を介して共有結合で連結するリンカー単位であり、両端は同じでも異なっていてもよく、該リンカー単位は、アルキル、分岐アルキル、エーテル、チオエーテル、エステル、アミン、アミド、カルバメート、カルバミド、スルホン、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、及びヘテロ環基の中の2つ以上の基の組み合わせを含むことができ、該リンカー単位は、最短の長さで1～30原子の長さからなる]の化合物。

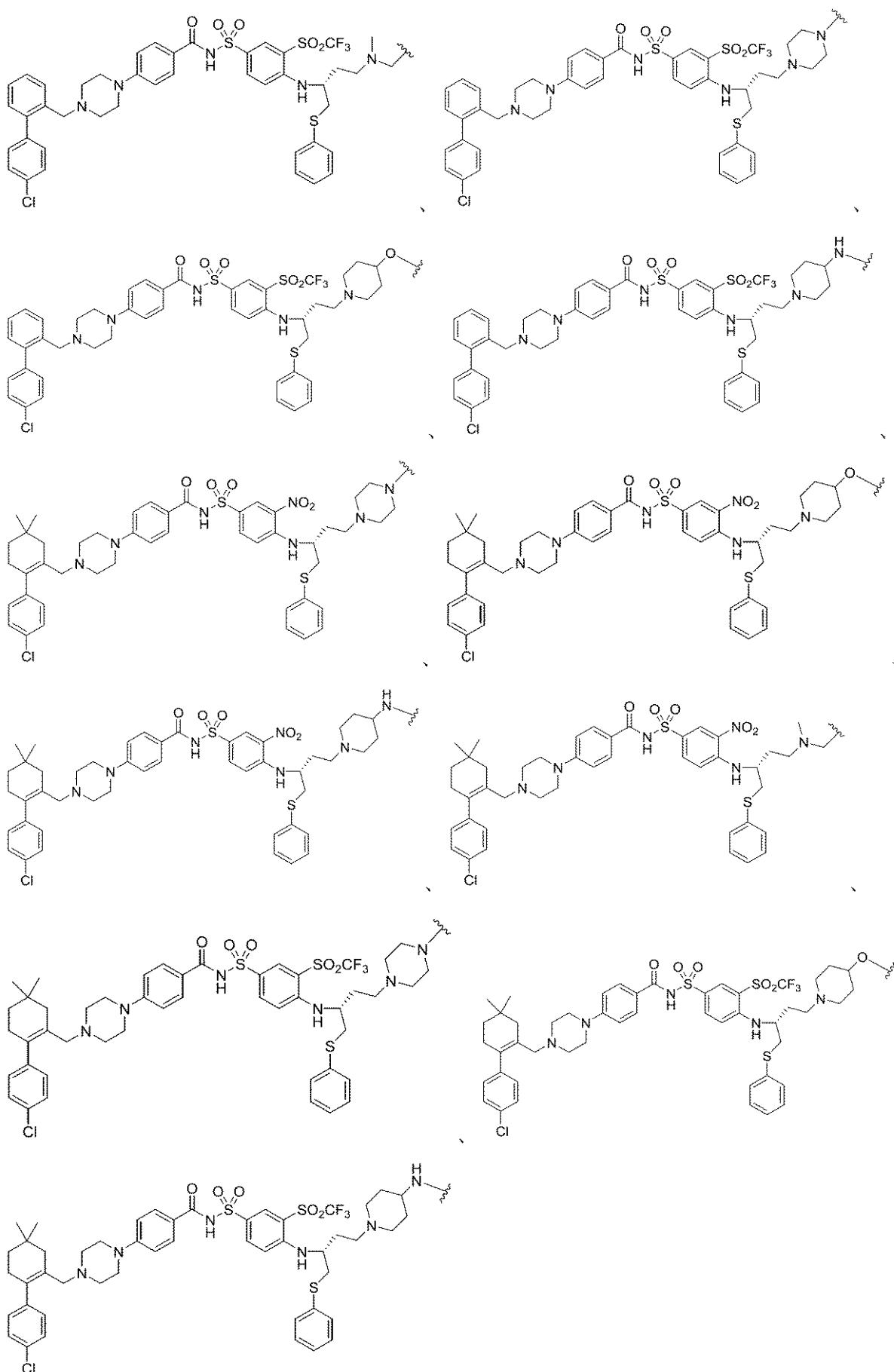
【請求項2】

R₁が：

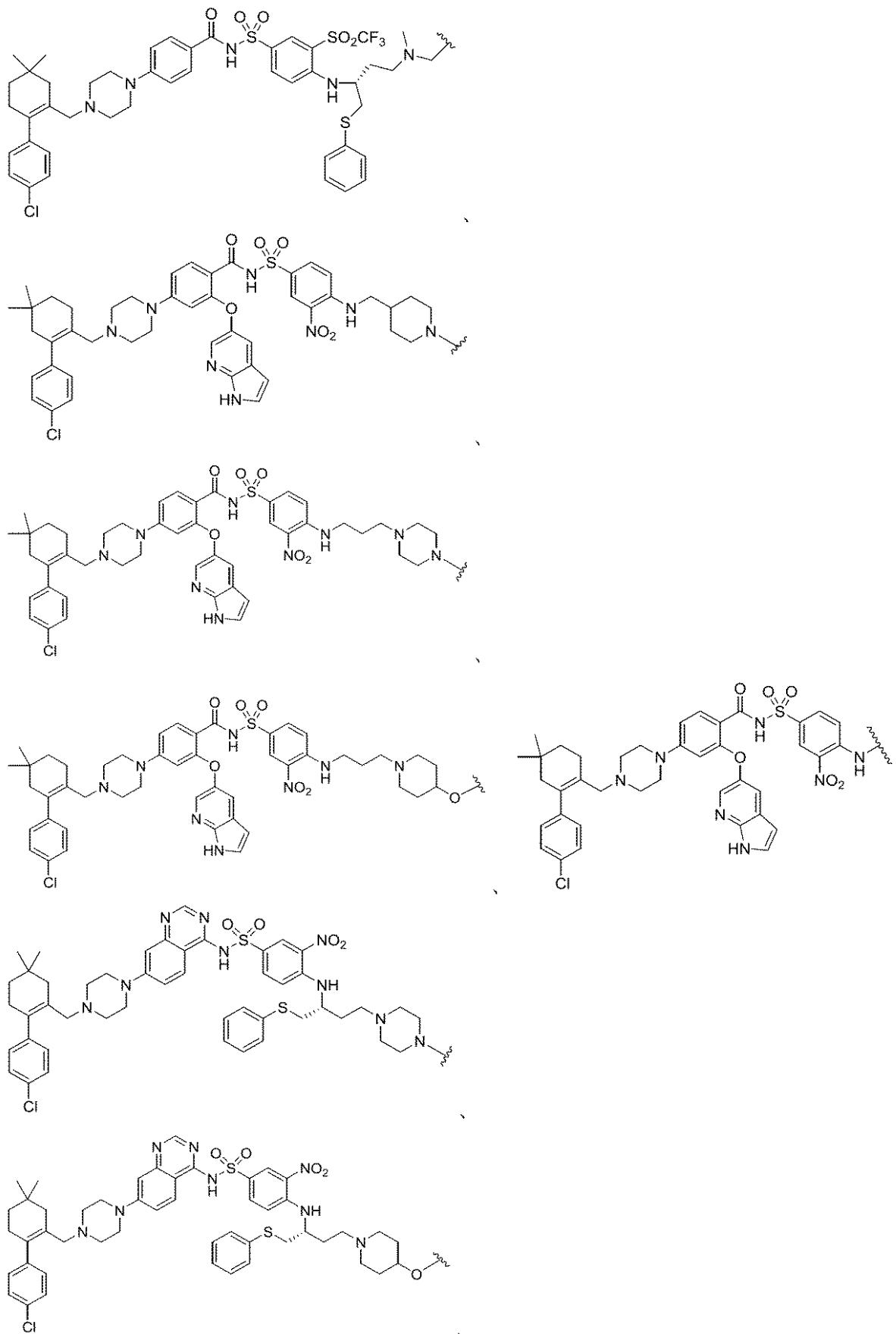
【化2】



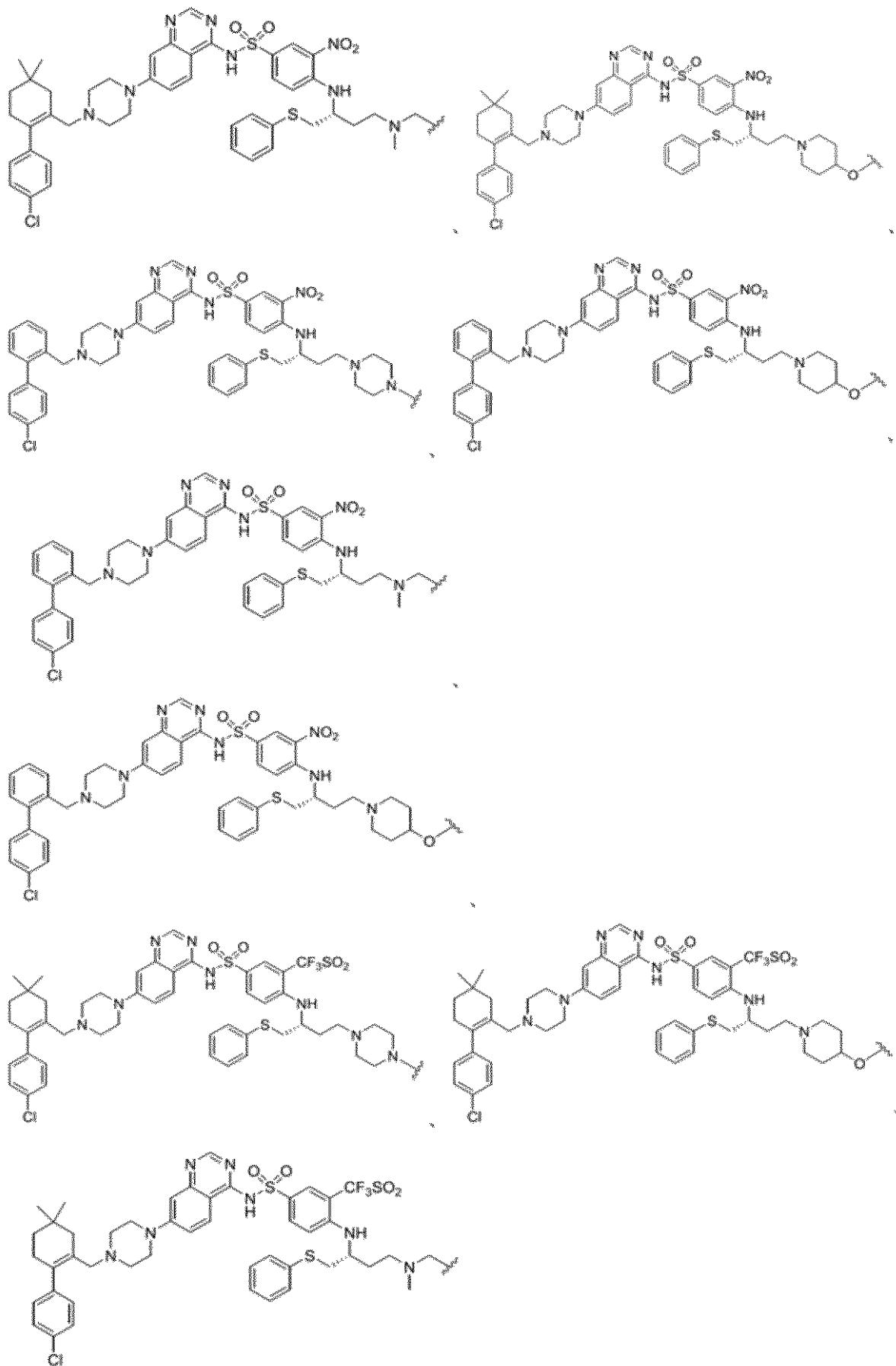
【化 3】



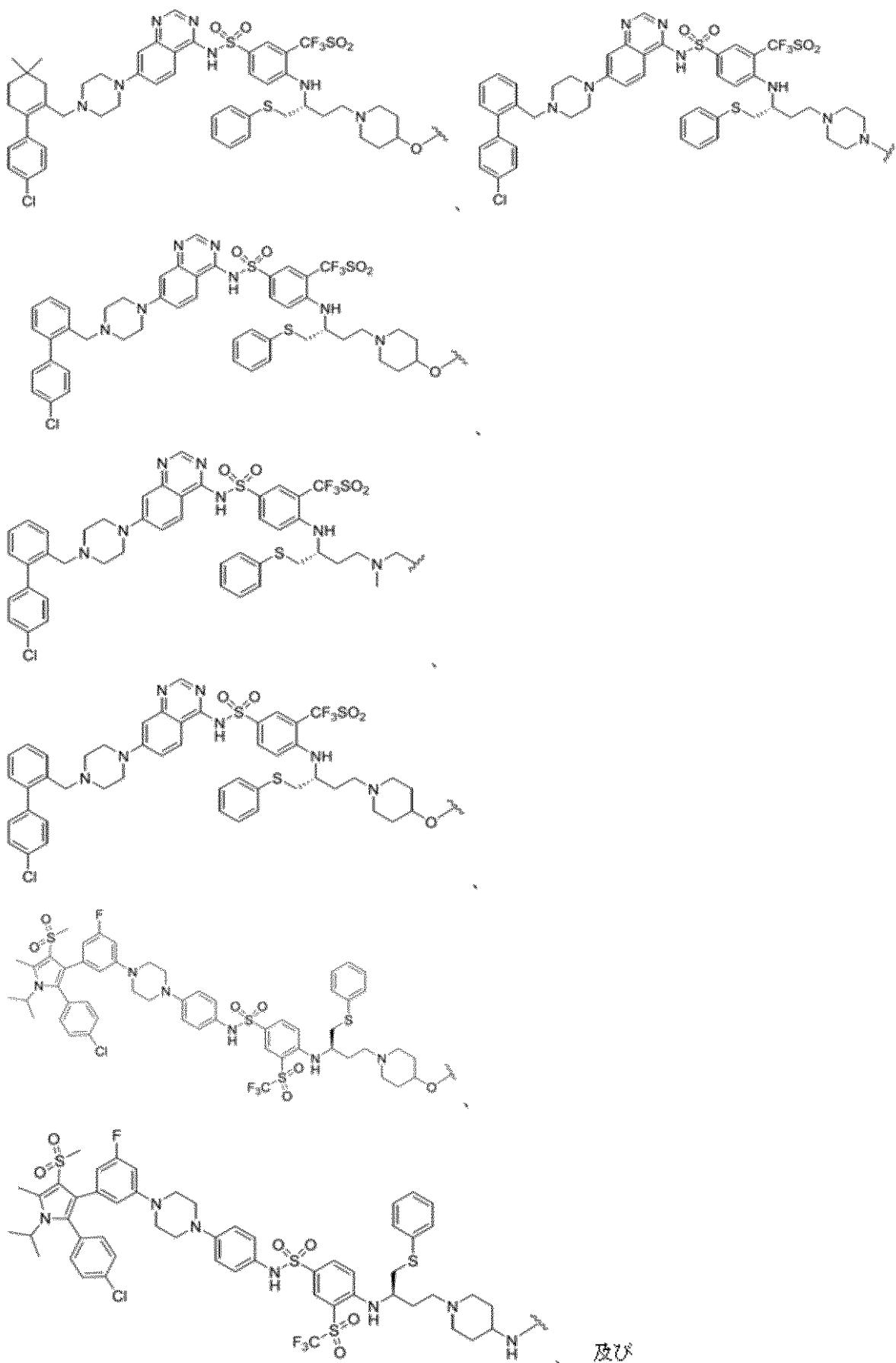
【化 4】



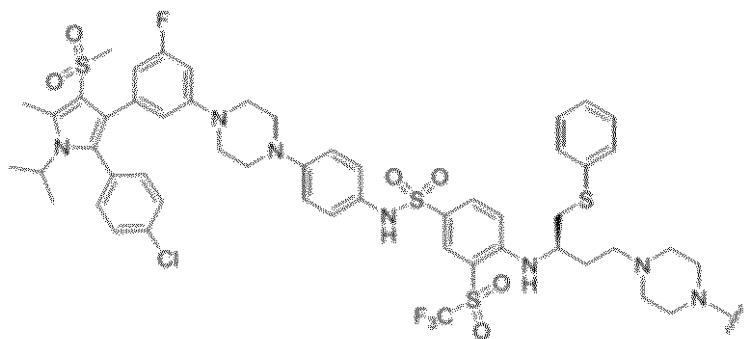
【化 5】



【化 6】



【化 7】

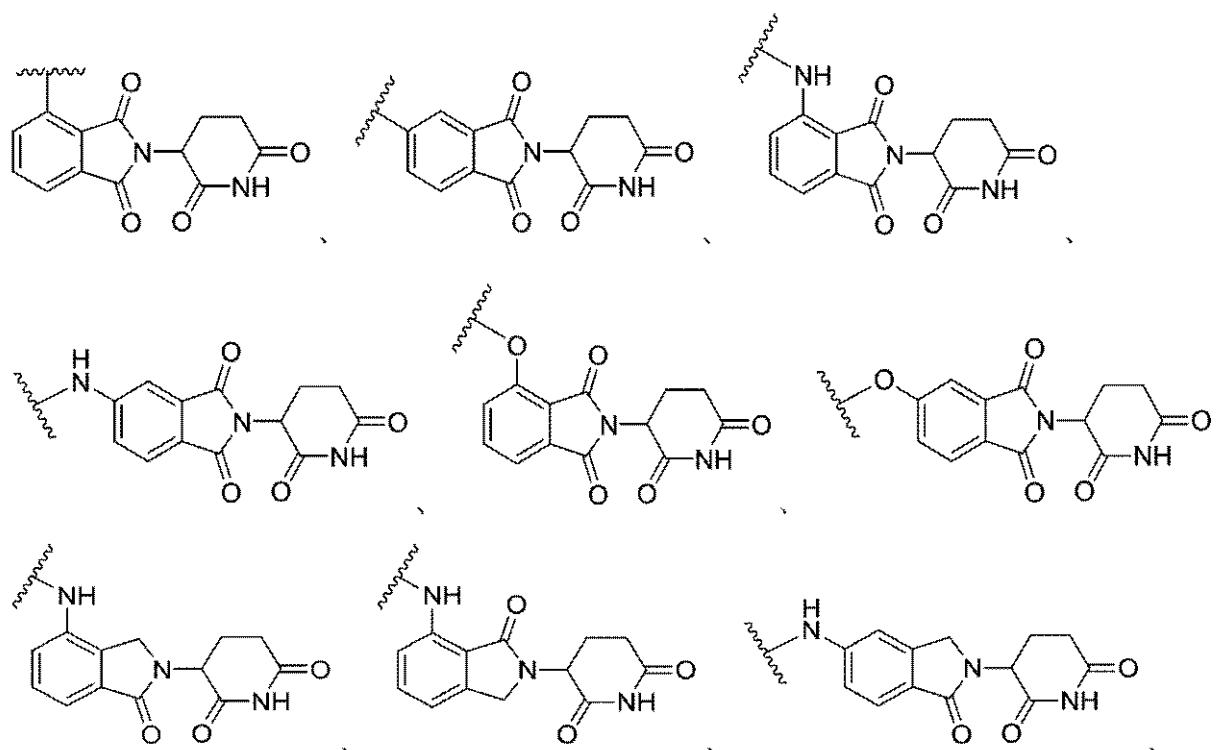


からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

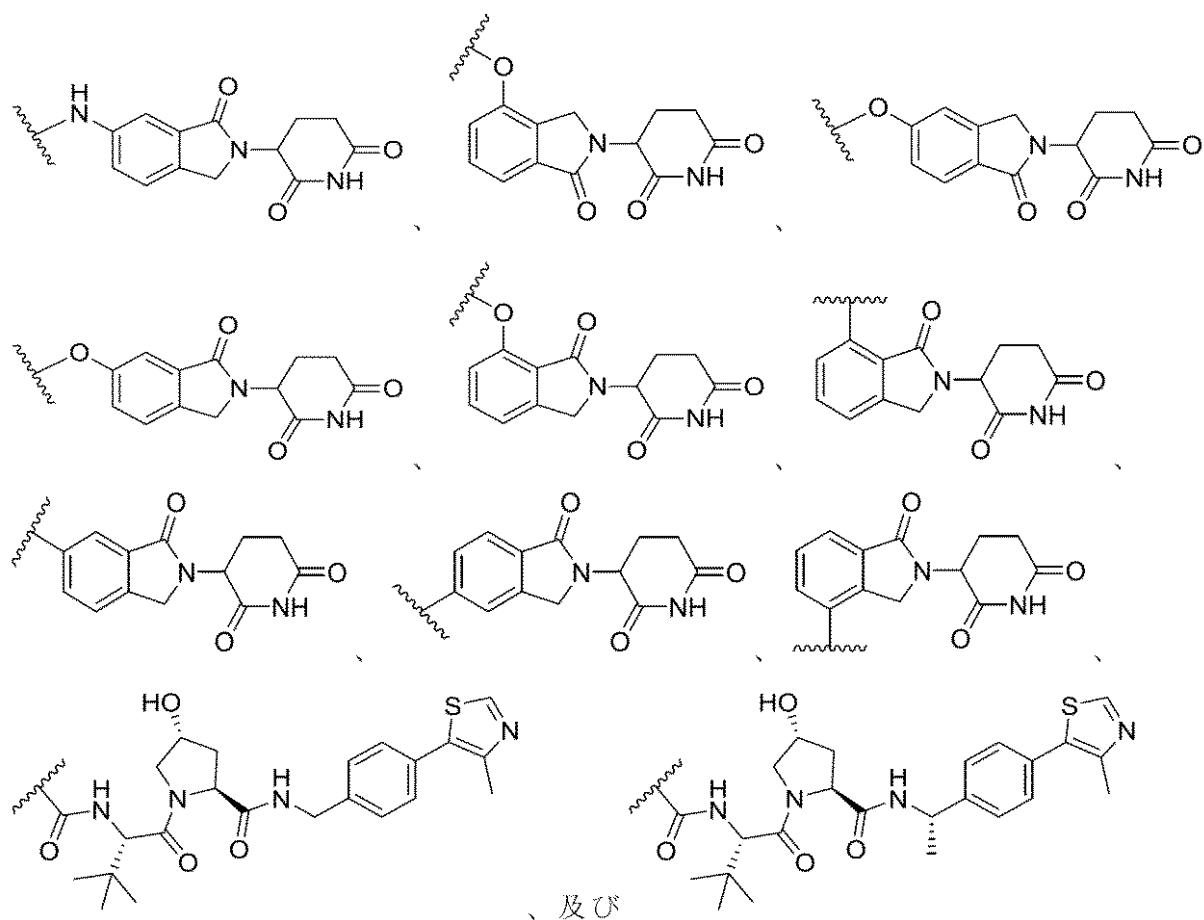
【請求項 3】

R_2 が：

【化 8】



【化9】



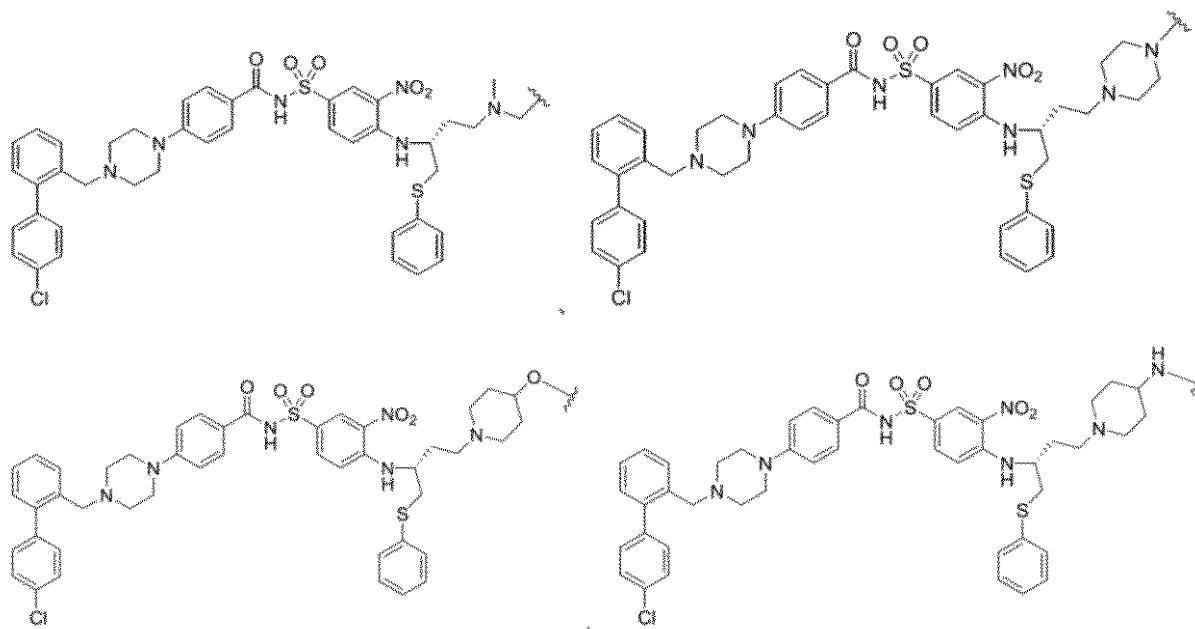
、及び

からなる群から選択される、請求項1または2に記載の化合物。

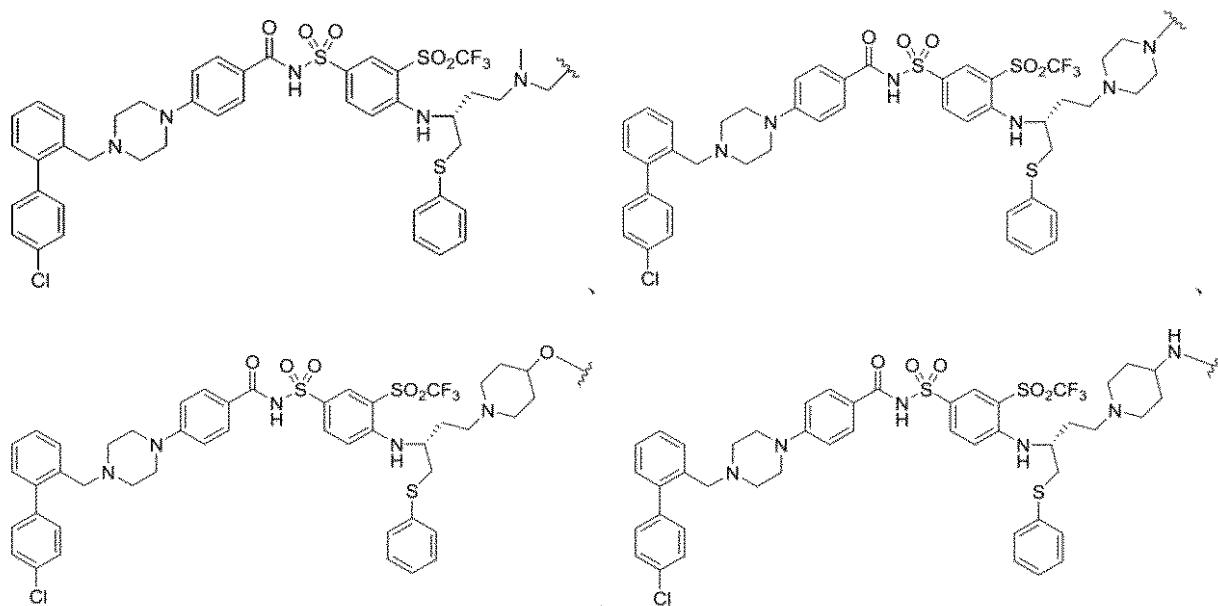
【請求項4】

R₁が：

【化10】



【化 1 1】

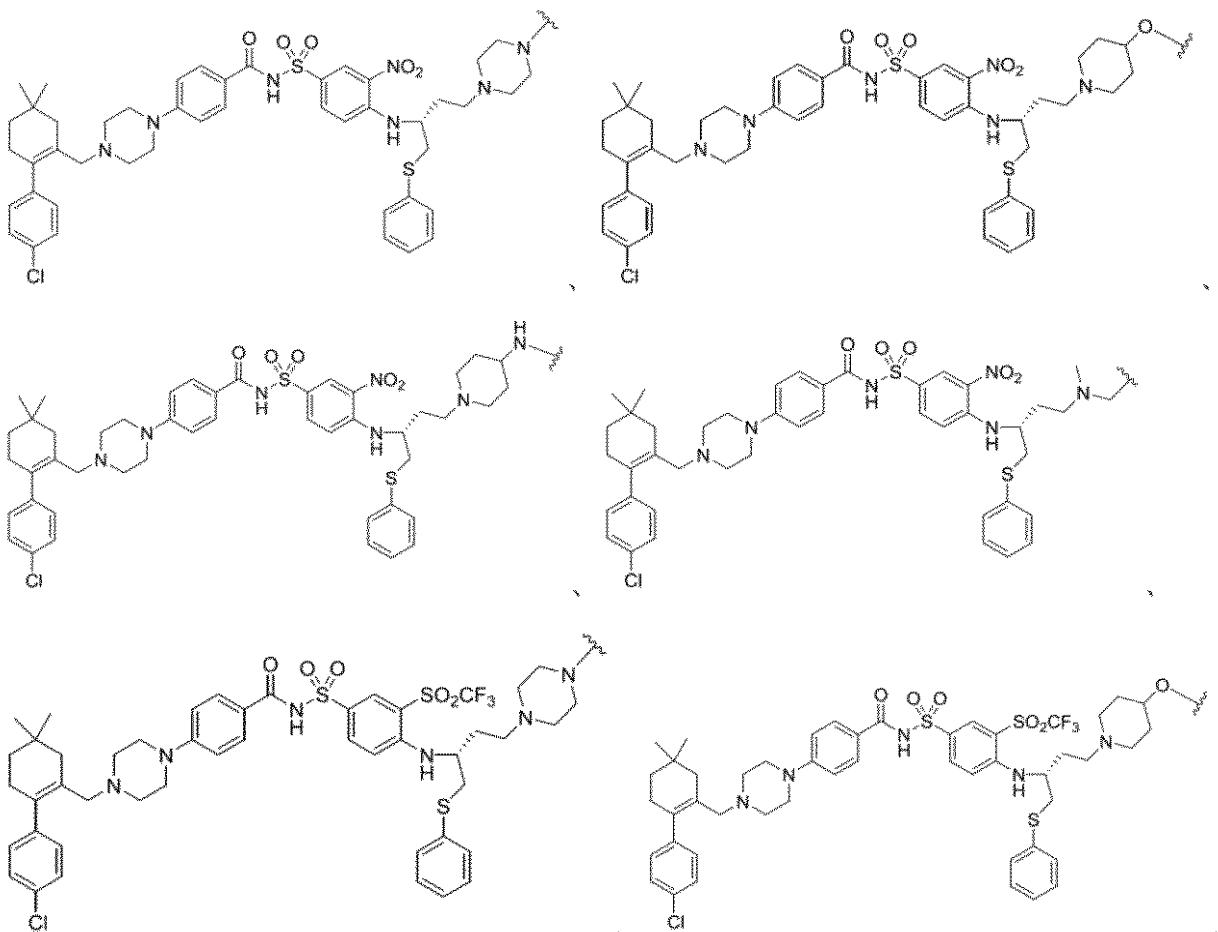


からなる群から選択される、請求項 1、2 または 3 に記載の化合物。

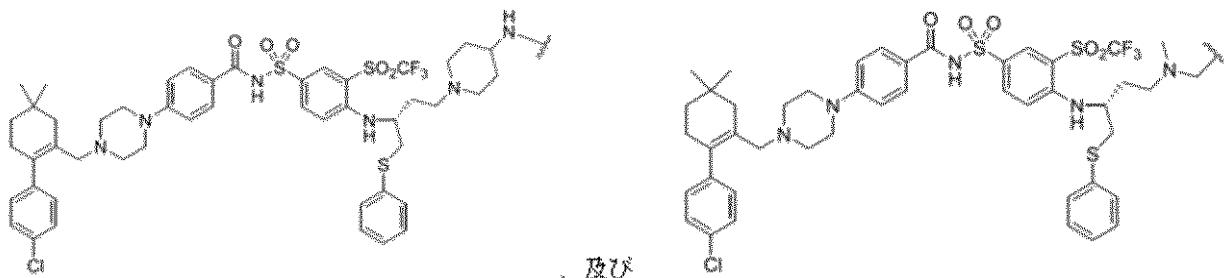
【請求項 5】

R₁ が：

【化 1 2】



【化13】

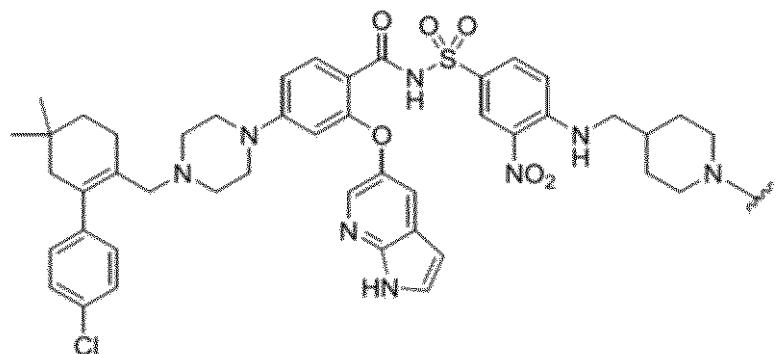


からなる群から選択される、請求項1、2または3に記載の化合物。

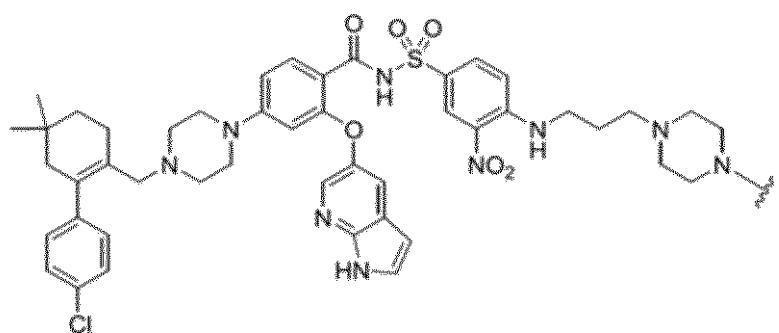
【請求項6】

R₁ が：

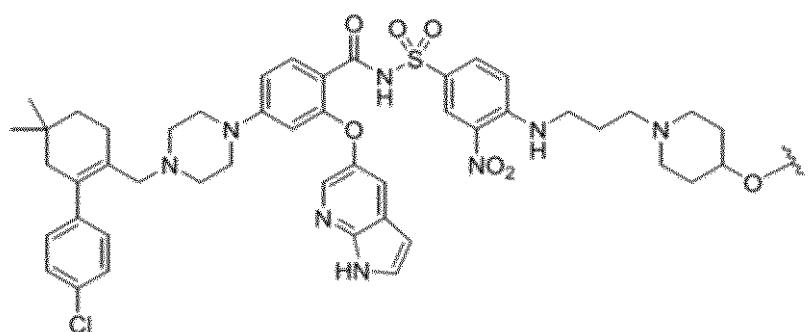
【化14】



、



、及び

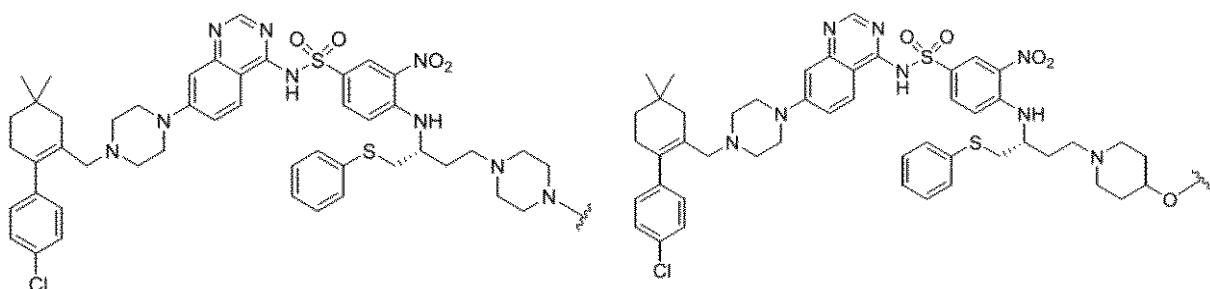


からなる群から選択される、請求項1、2または3に記載の化合物。

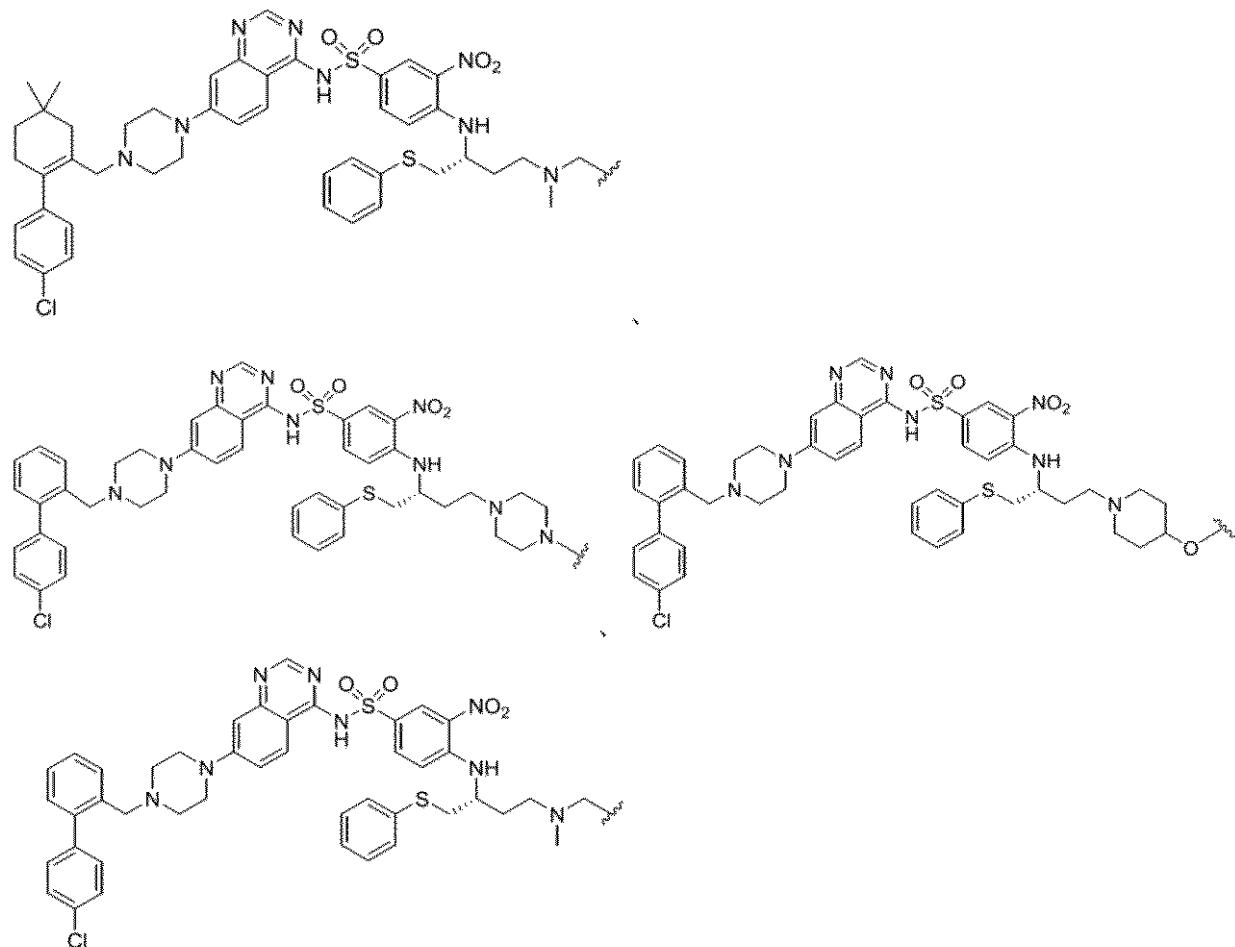
【請求項7】

R₁ が：

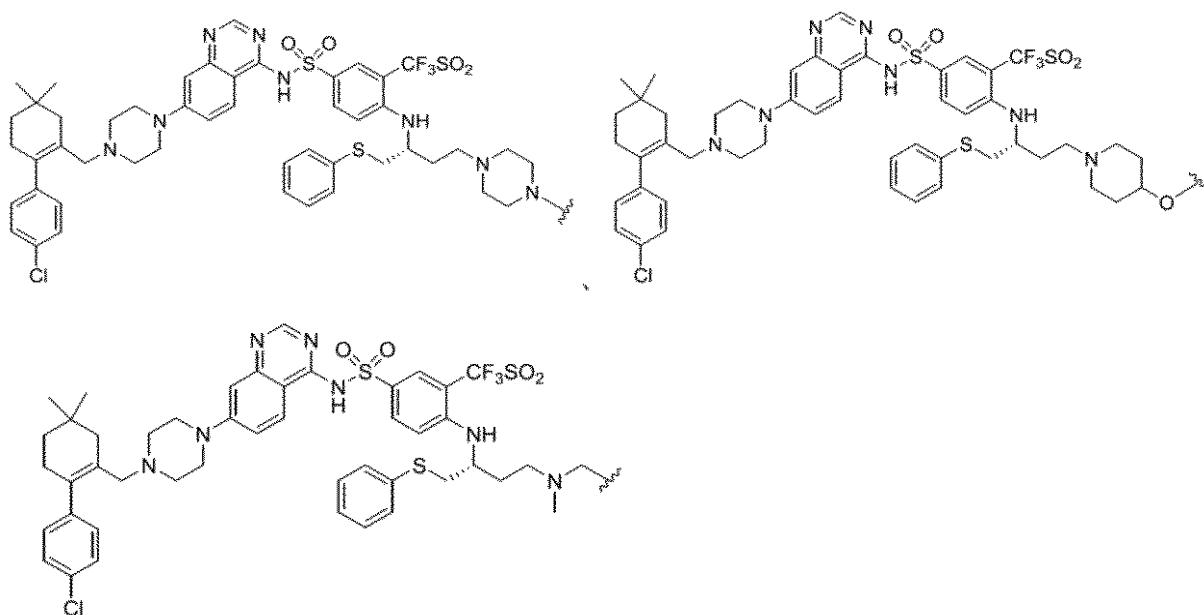
【化 15】



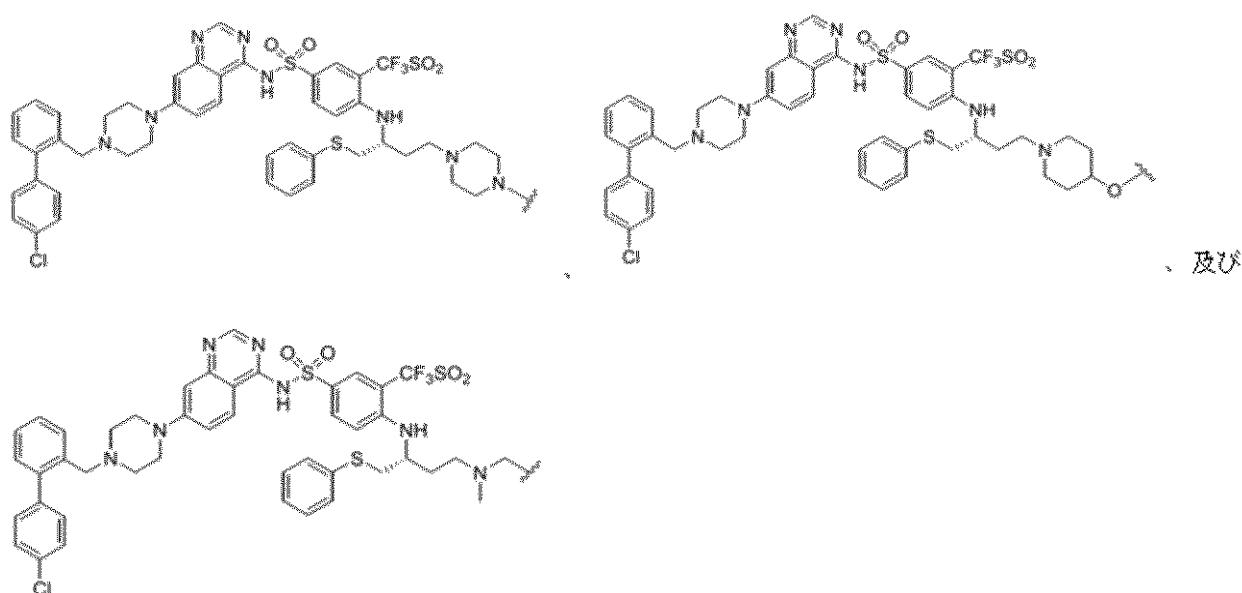
【化 16】



【化17】



【化18】

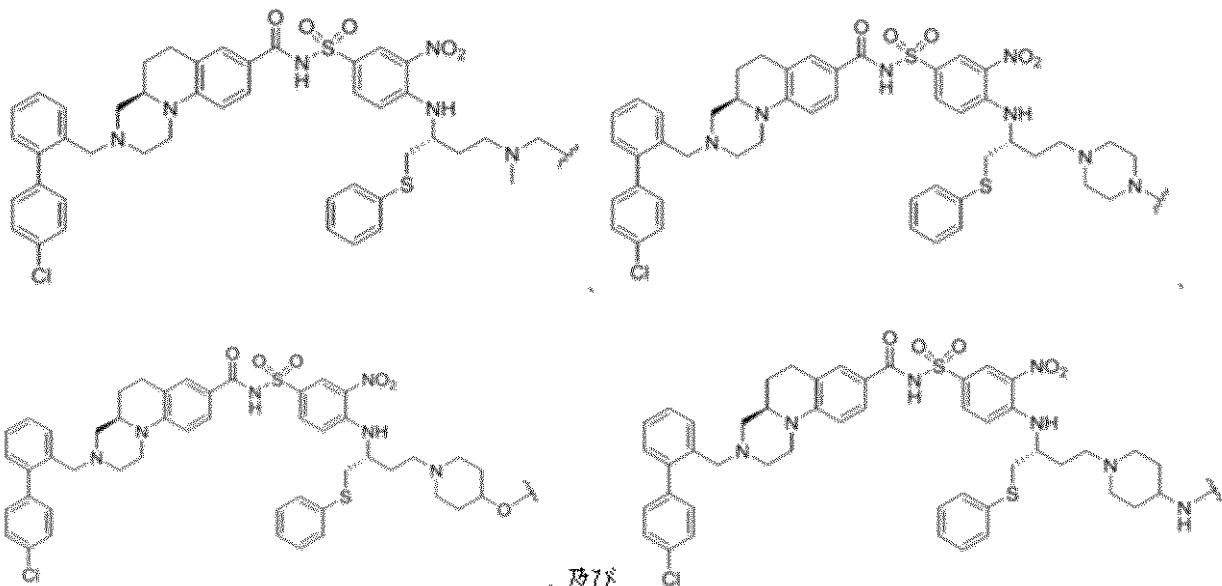


からなる群から選択される、請求項1、2または3に記載の化合物。

【請求項8】

R₁が：

【化19】



からなる群から選択される、請求項1、2または3に記載の化合物。

【請求項9】

リンカーの長さが、最短の長さで5～7原子であり、かつリンカーがアルキル、分岐アルキル、ヘテロ環、エーテルまたはアミド基のみを含む、請求項1～8のいずれか一項に記載の化合物。

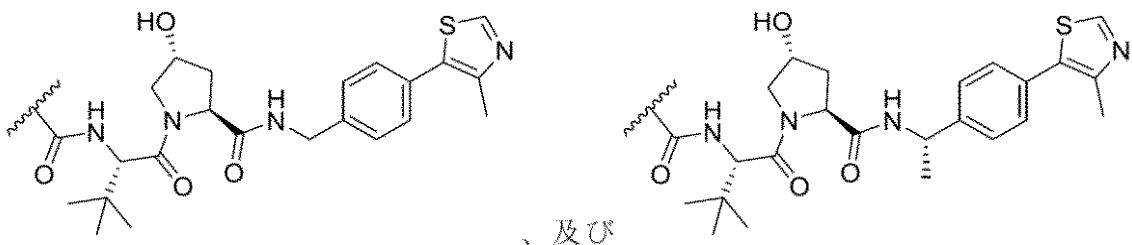
【請求項10】

リンカーが未分岐アルキル、ヘテロ環またはアミド基のみを含む、請求項9に記載の化合物。

【請求項11】

R_2 が：

【化20】



からなる群から選択される、請求項1～10のいずれか一項に記載の化合物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0017

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0017】

(a) 式(I)の化合物

本明細書に提供するのは、式(I)：

$R_1 - L - R_2 \quad (I)$

を含む化合物であり、式中

R_1 は、1つ以上の抗アポトーシス性Bcl-2ファミリータンパク質に結合するタンパク質標的化単位であり、

L は、 R_1 及び R_2 をアルキル、分岐アルキル、エーテル、チオエーテル、エステル、アミン、アミド、カルバメート、カルバミド、スルホン、アリール、ヘテロアリール、シク

ロアルキル、またはヘテロ環基を介して共有結合で連結するリンカー単位であり、両端は同じでも異なっていてもよく、該リンカー単位は、アルキル、分岐アルキル、エーテル、チオエーテル、エステル、アミン、アミド、カルバメート、カルバミド、スルホン、アリール、ヘテロアリール、シクロアルキル、及びヘテロ環基の中の2つ以上の基の組み合わせを含むことができ、該リンカー単位は、最短の長さで1～30原子の長さからなり、R₂は、CRBNまたはVHL E3ユビキチンリガーゼに結合するE3ユビキチンリガーゼ結合単位である。