

【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

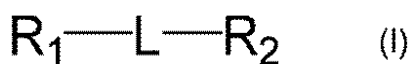
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



〔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、

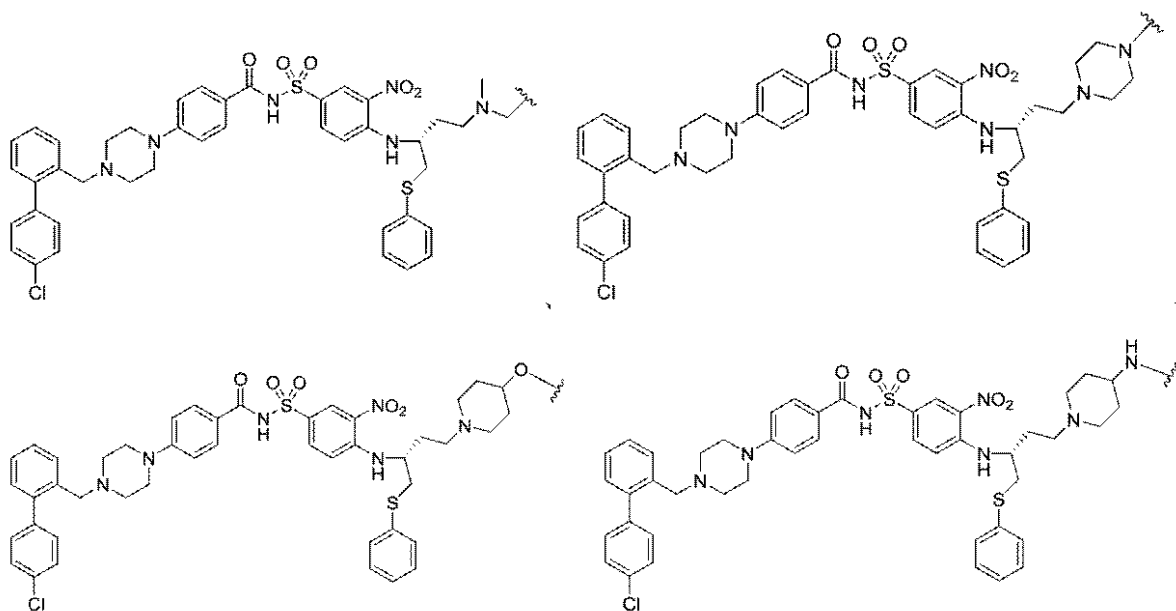
R_2 は、C R B NまたはV H L E 3 ユビキチンリガーゼに結合するE 3 ユビキチンリガーゼ結合単位であり、

L は、 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。

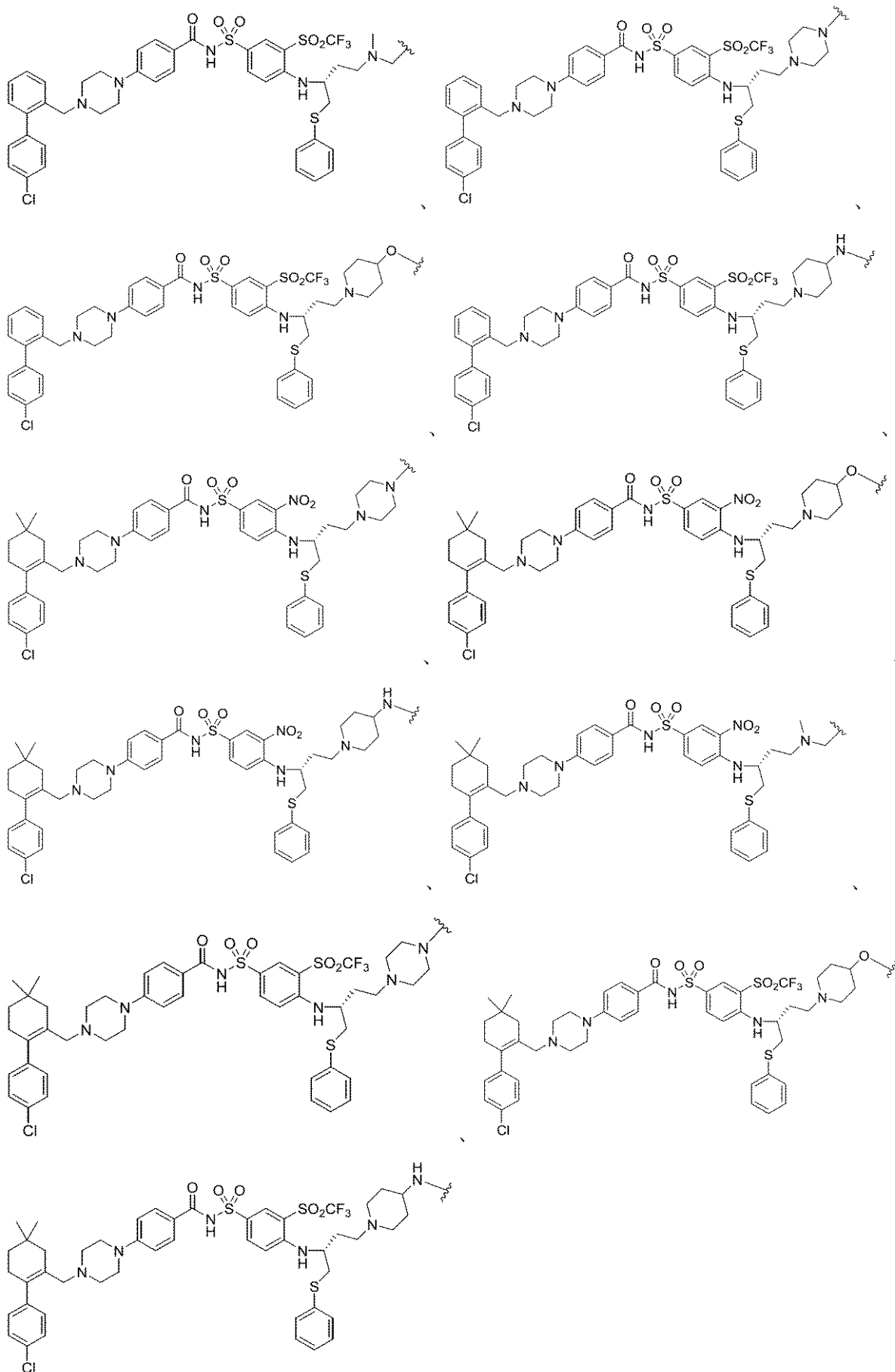
【請求項2】

R_1 が：

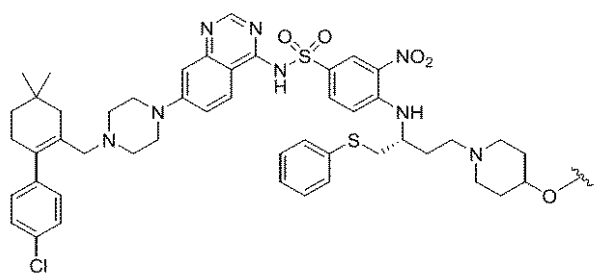
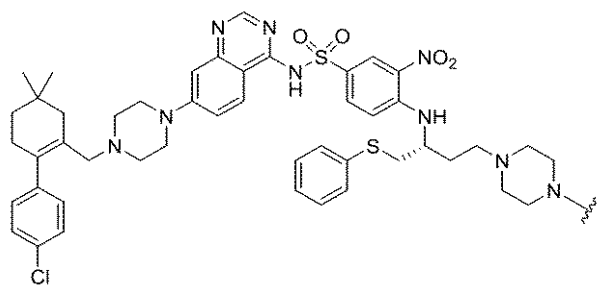
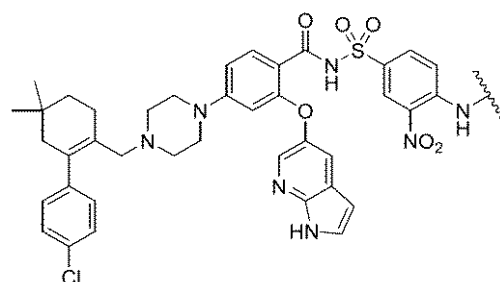
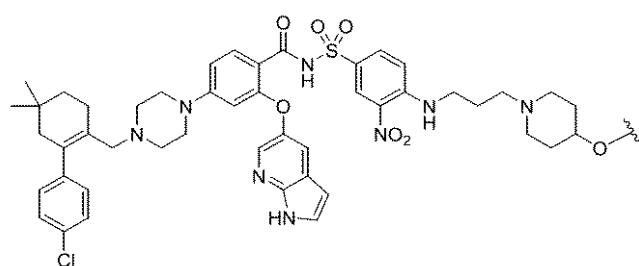
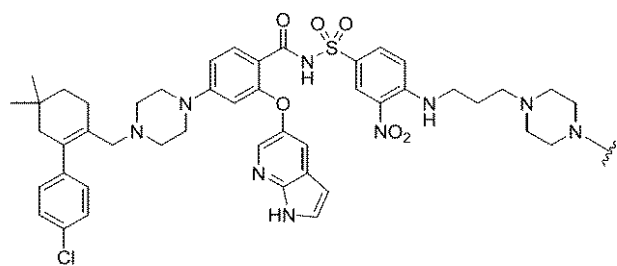
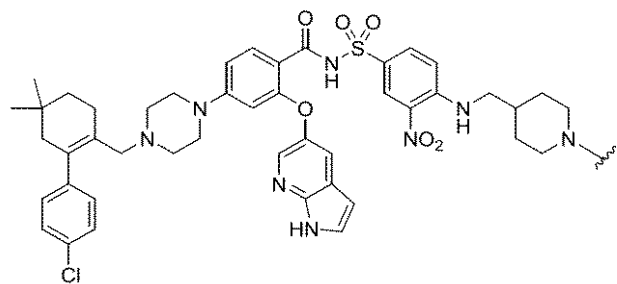
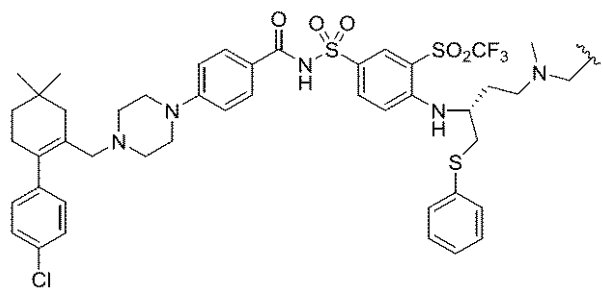
【化2】



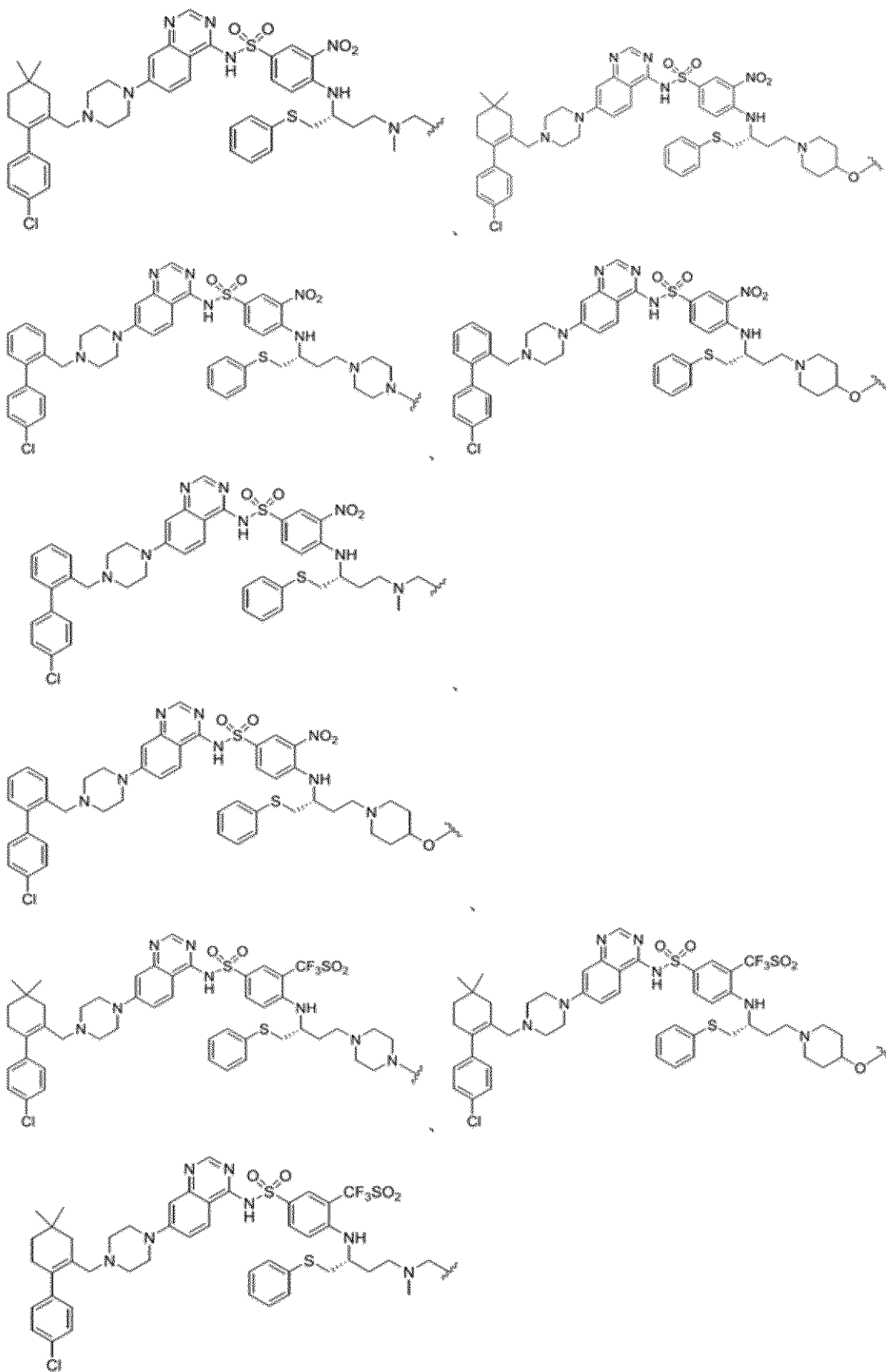
【化 3】



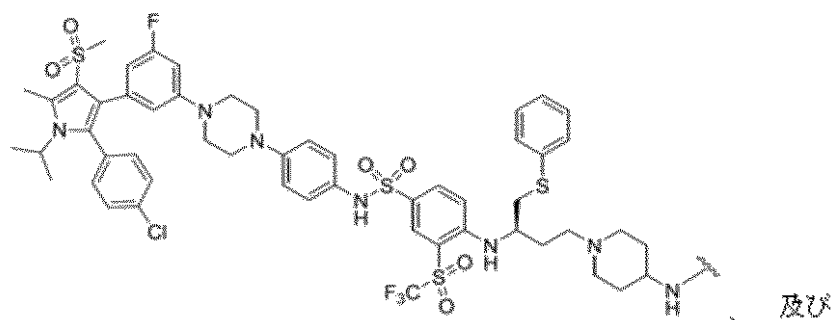
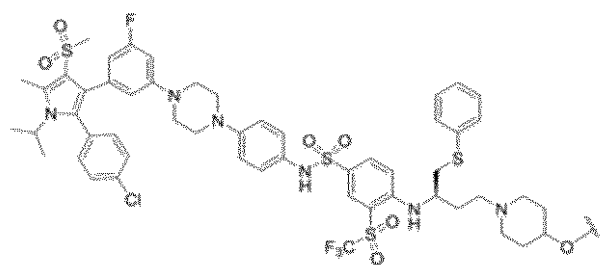
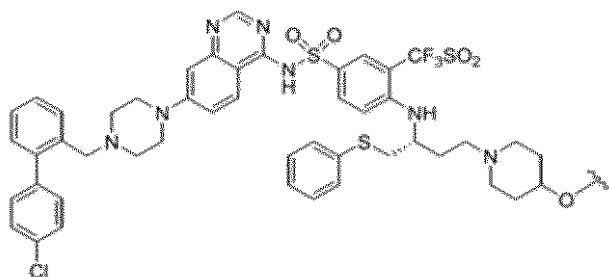
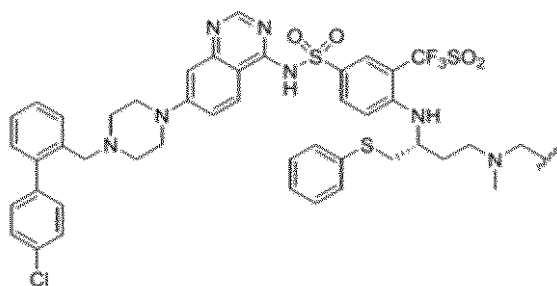
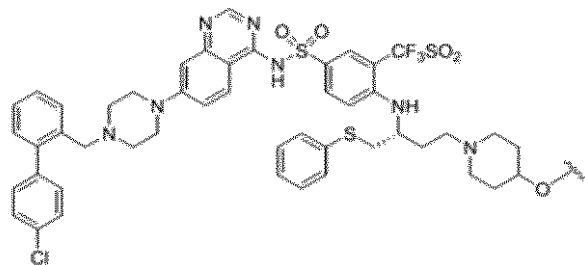
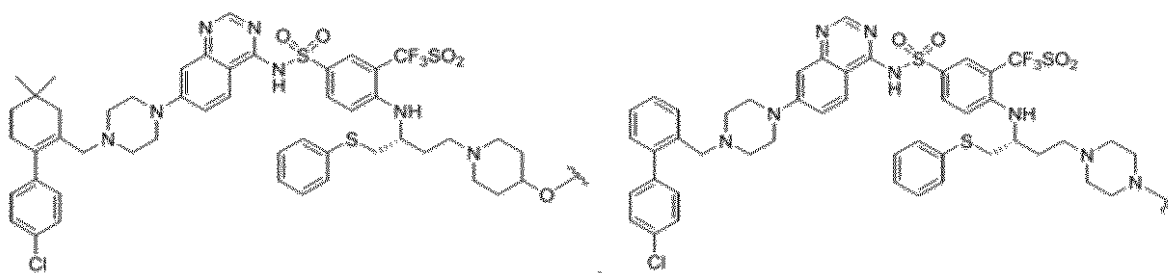
【化 4】



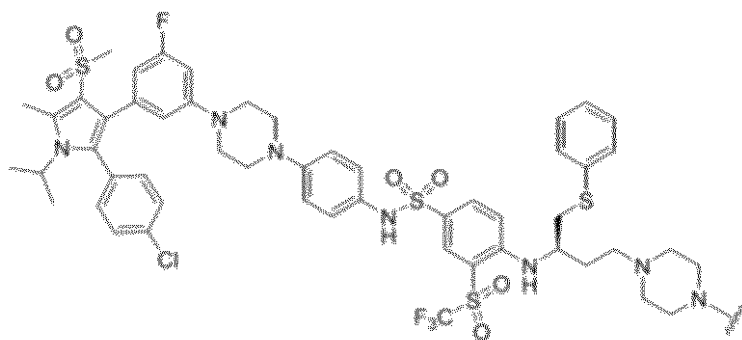
【化 5】



【化 6】



【化 7】

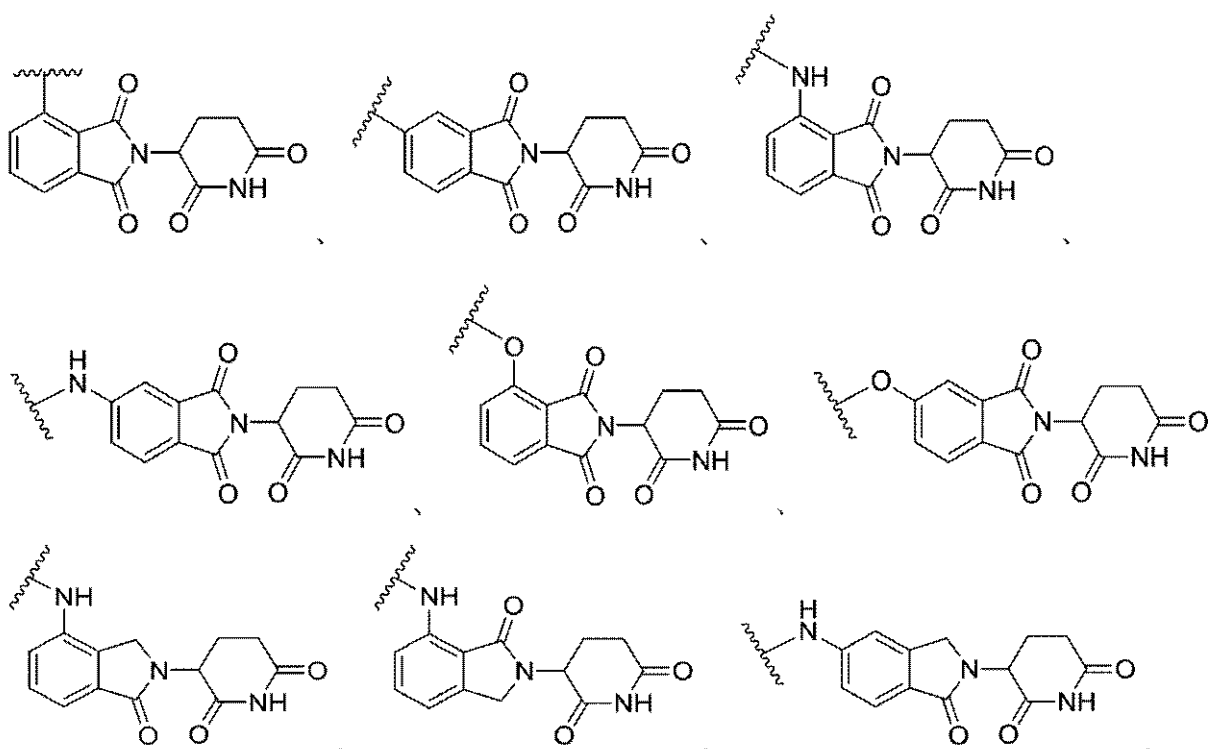


からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

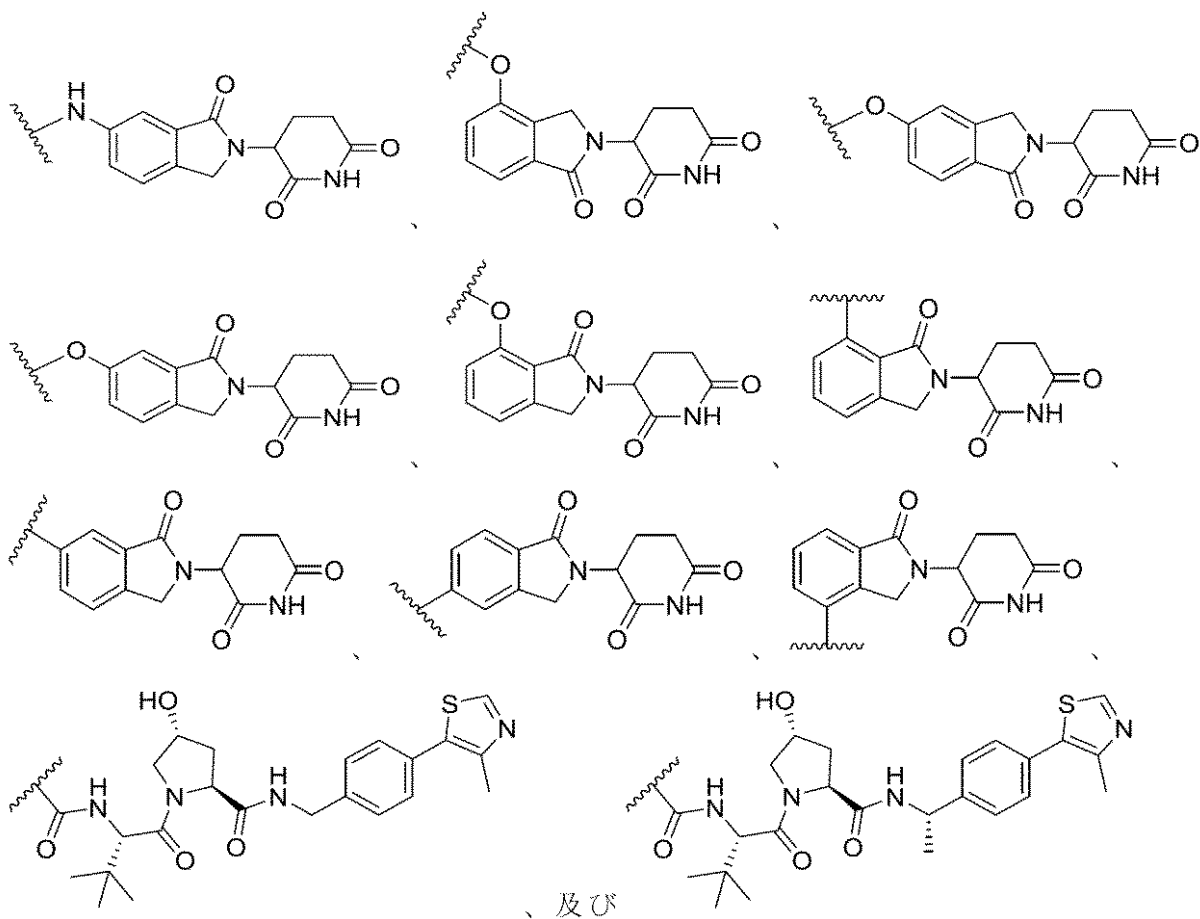
【請求項 3】

R₂ が：

【化 8】



【化 9】

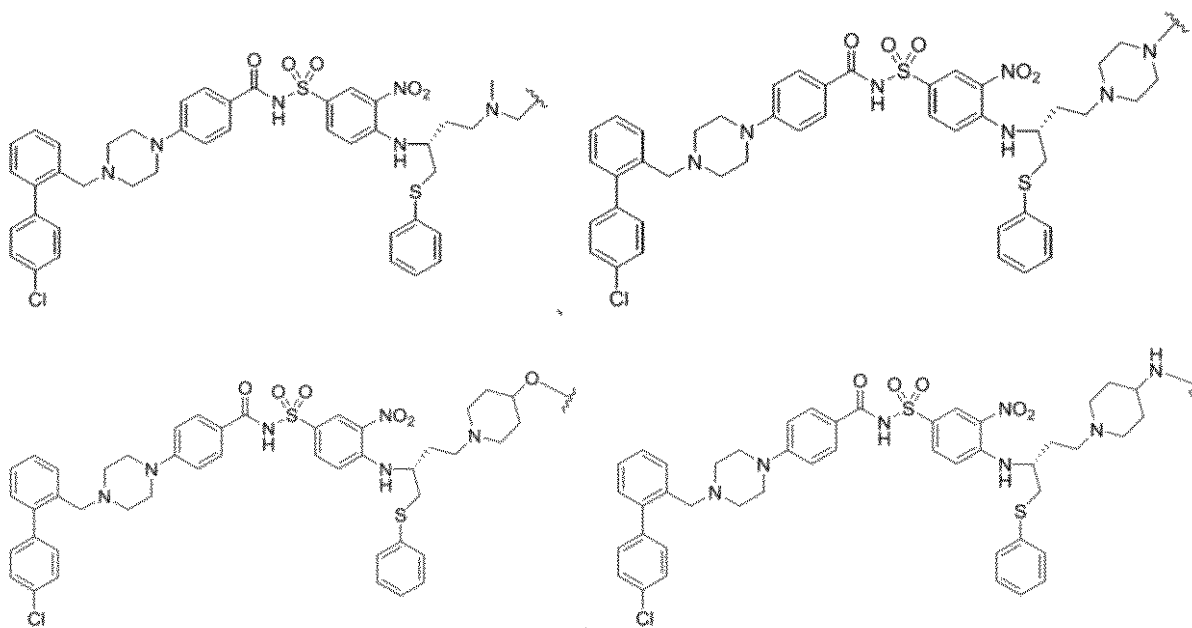


からなる群から選択される、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

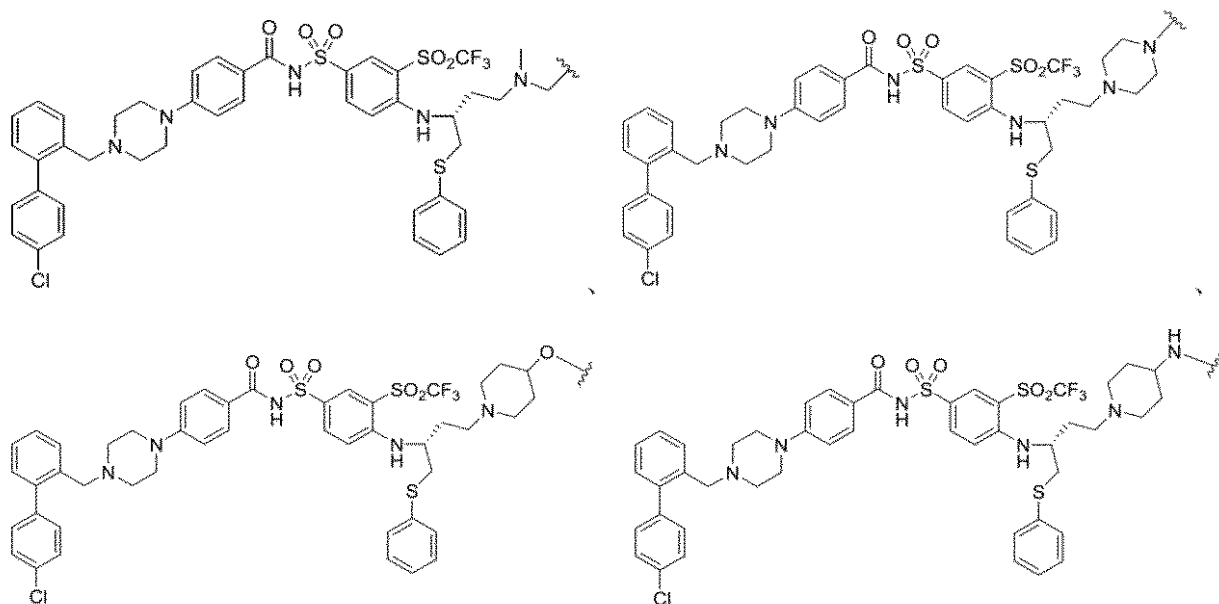
【請求項 4】

R₁ が：

【化 10】



【化 1 1】

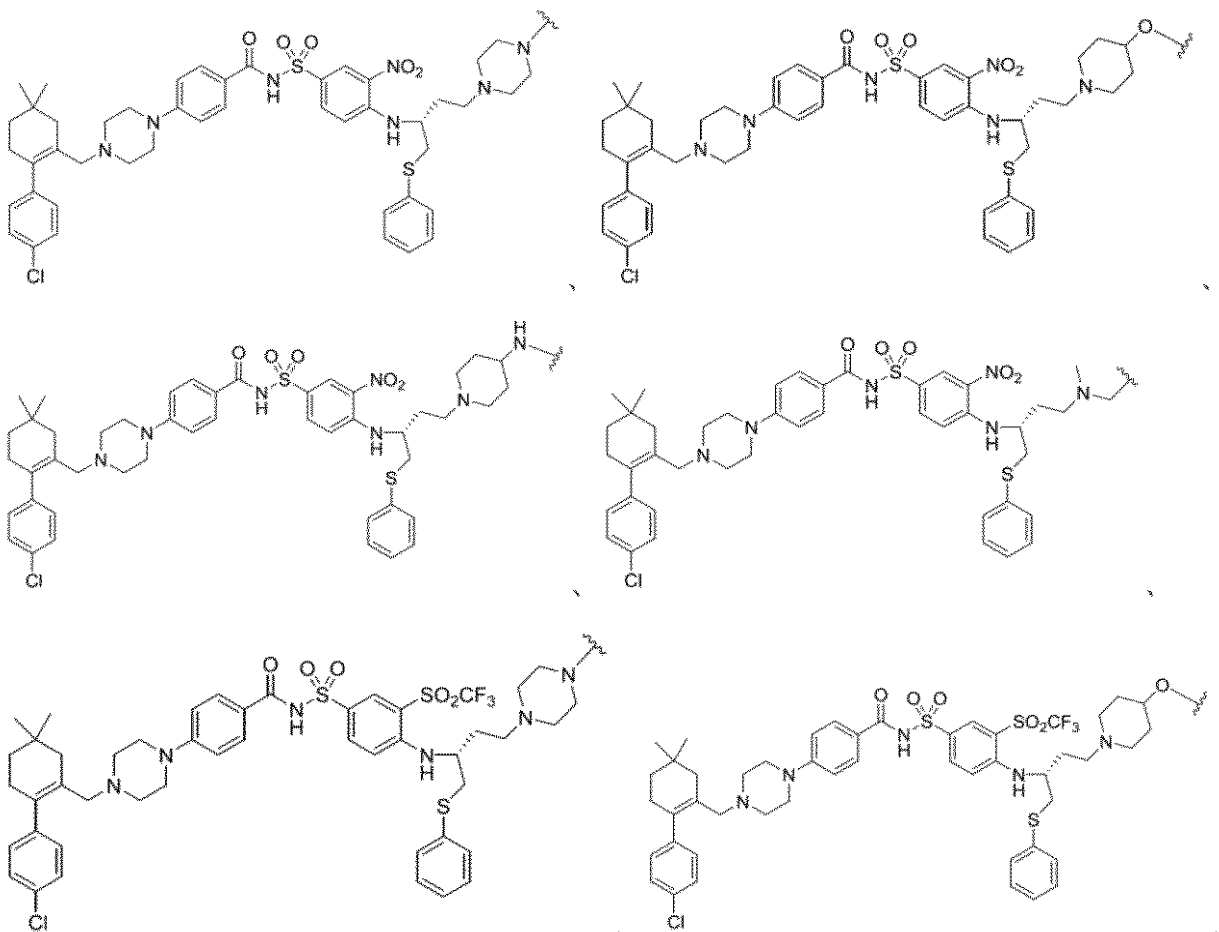


からなる群から選択される、請求項 1、2 または 3 に記載の化合物。

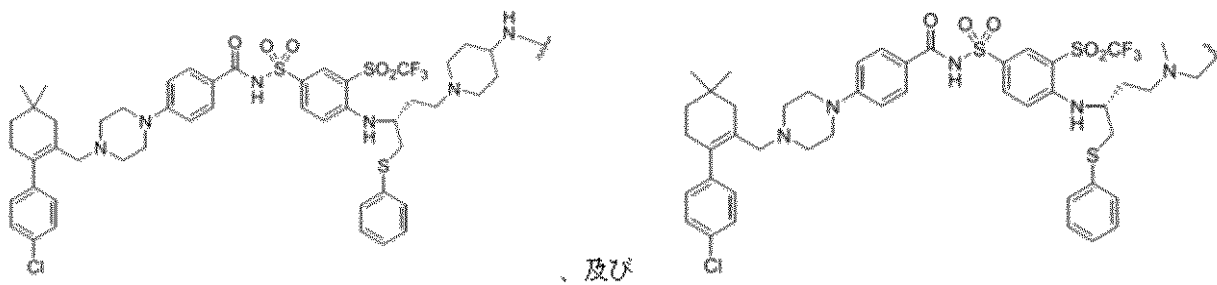
【請求項 5】

R₁ が：

【化 1 2】



【化 1 3】

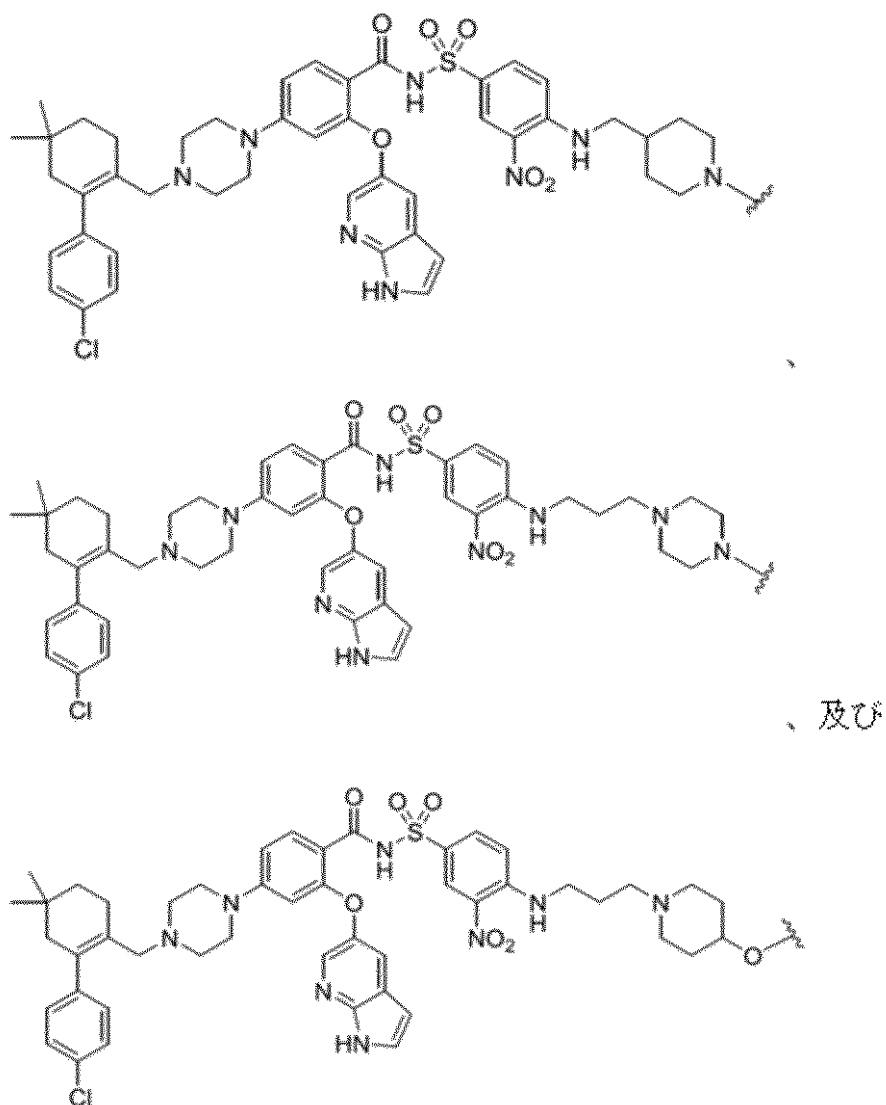


からなる群から選択される、請求項 1、2 または 3 に記載の化合物。

【請求項 6】

R₁ が：

【化 1 4】

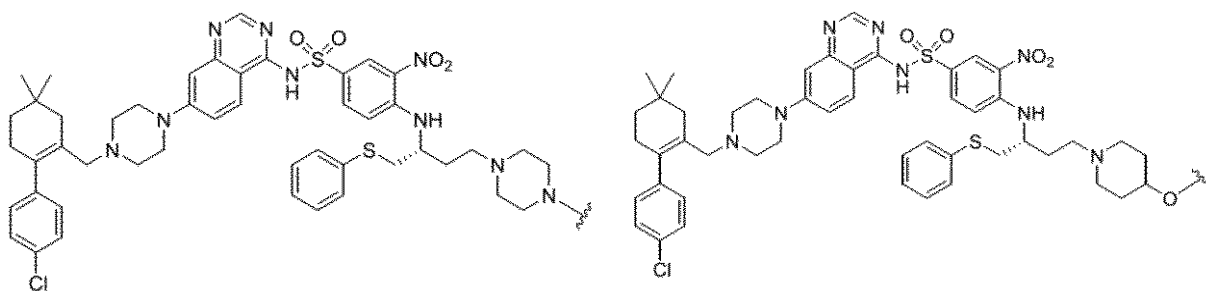


からなる群から選択される、請求項 1、2 または 3 に記載の化合物。

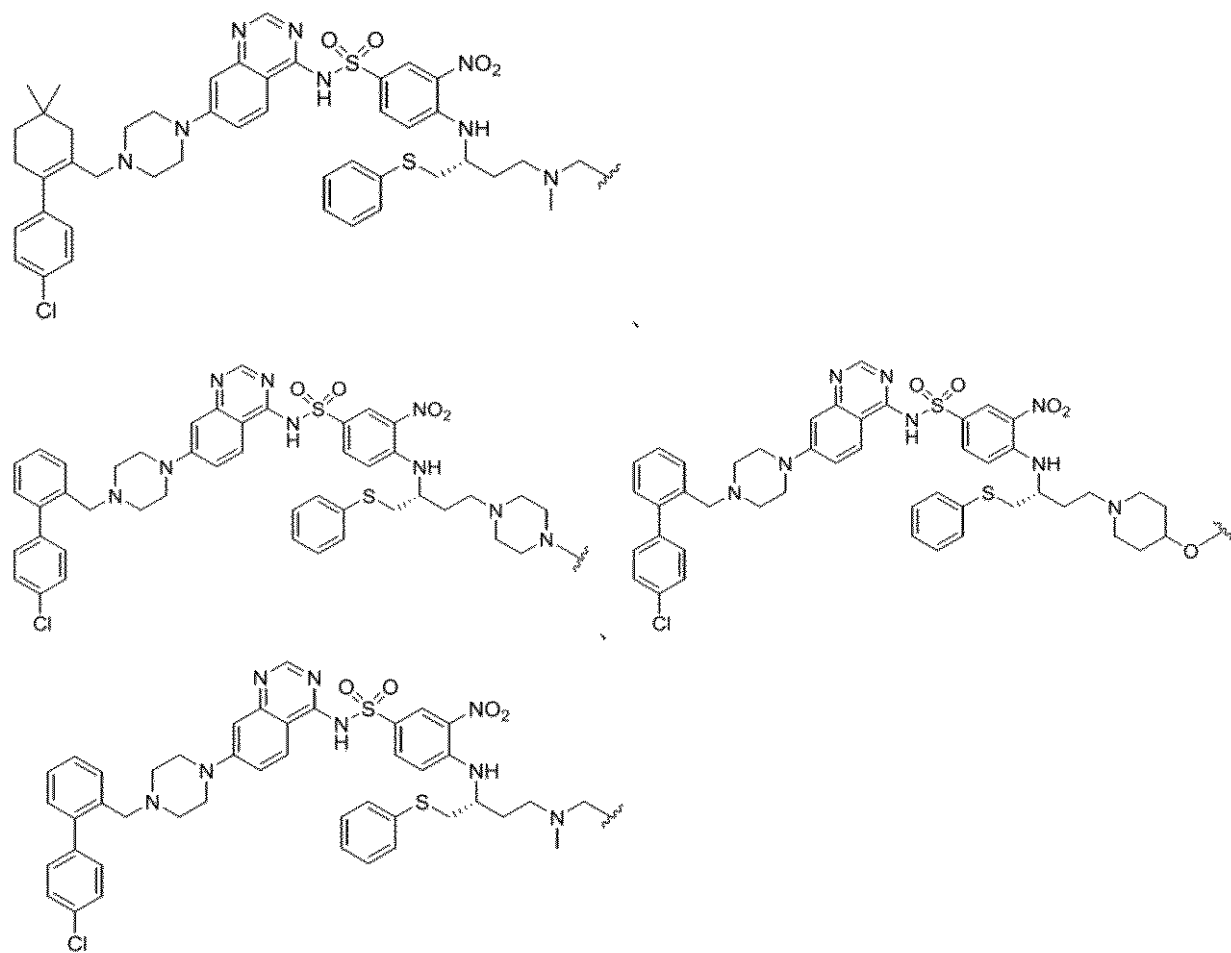
【請求項 7】

R₁ が：

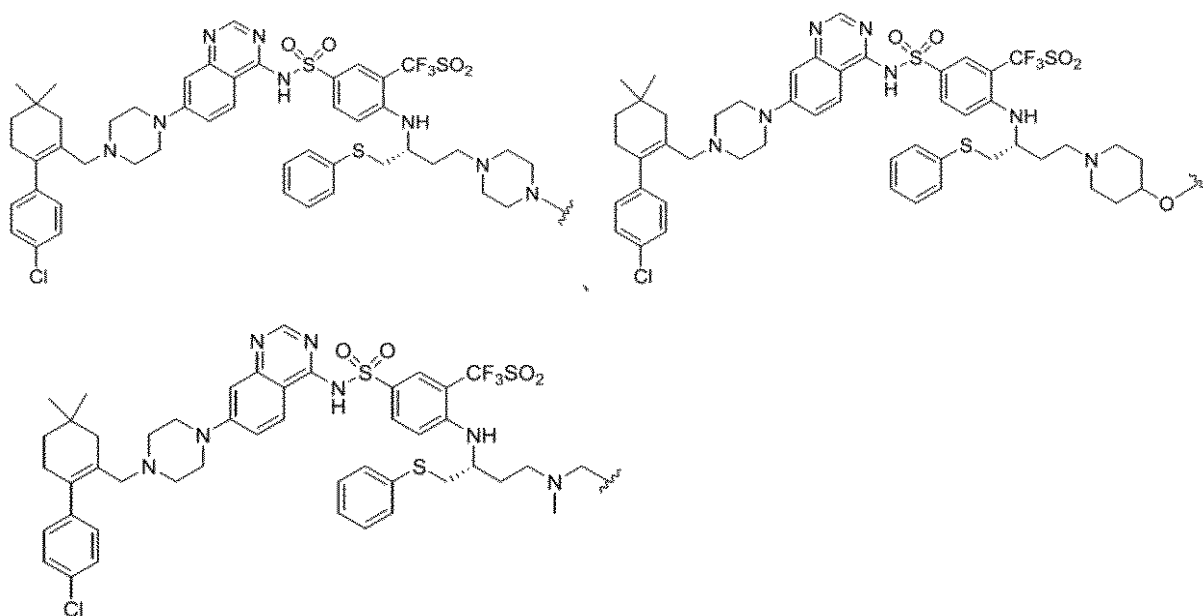
【化 1 5】



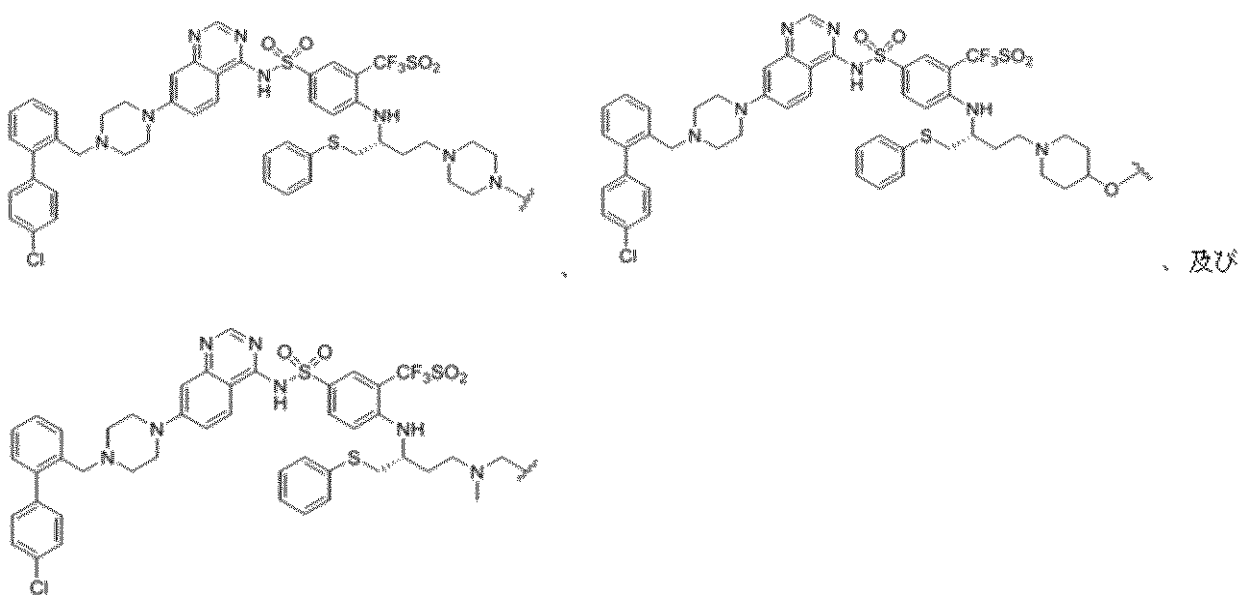
【化 1 6】



【化 1 7】



【化 1 8】

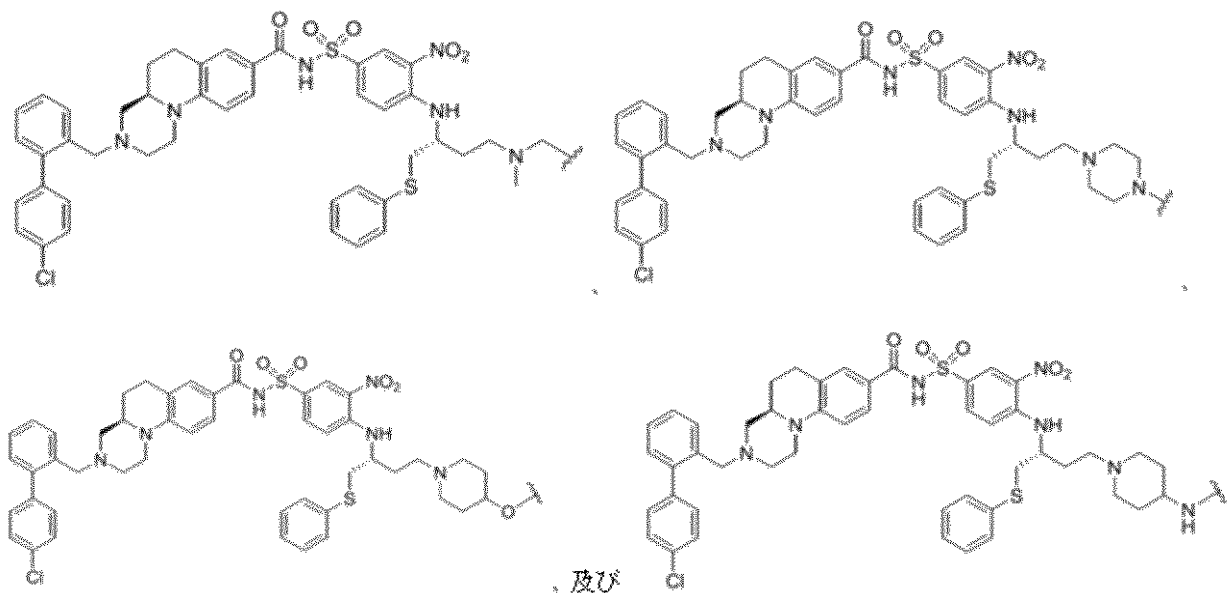


からなる群から選択される、請求項 1、2 または 3 に記載の化合物。

【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、最短の長さとで 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。

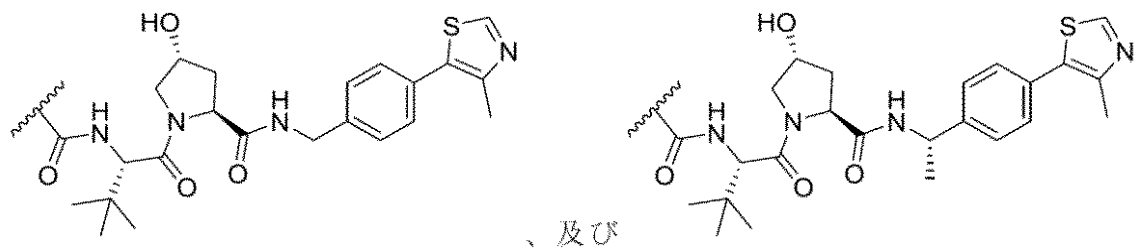
【請求項 10】

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】

R₂ 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)：

R₁ - L - R₂ (I)

を含む化合物であり、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、

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、アリアル、ヘテロアリアル、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、 R_2 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る。