

【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31年1月17日(2019.1.17)

【公開番号】特開2018-188432(P2018-188432A)

【公開日】平成30年11月29日(2018.11.29)

【年通号数】公開・登録公報2018-046

【出願番号】特願2018-86737(P2018-86737)

【国際特許分類】

C 0 7 D 515/22 (2006.01)

A 6 1 K 31/4995 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 515/22 C S P

A 6 1 K 31/4995

A 6 1 P 35/00

【手続補正書】

【提出日】平成30年11月9日(2018.11.9)

【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

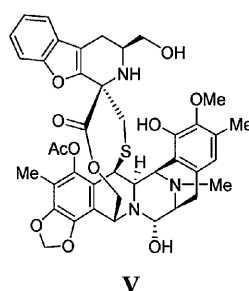
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式Vの化合物、又はその薬学的に許容可能な塩若しくはエステル。

【化 1】



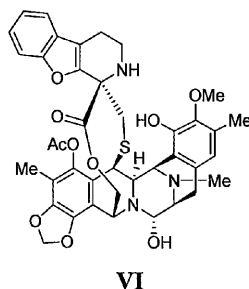
【請求項 2】

前記塩が、塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、硫酸塩、硝酸塩、リン酸塩、酢酸塩、トリフルオロ酢酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、クエン酸塩、シュウ酸塩、コハク酸塩、酒石酸塩、リンゴ酸塩、マンデル酸塩、メタンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩、ナトリウム、カリウム、カルシウム、アンモニウム、エチレンジアミン、エタノールアミン、N,N-ジアルキレンエタノールアミン、トリエタノールアミン及び塩基性アミノ酸から選択される、請求項1に記載の化合物。

【請求項 3】

式VIの化合物、又はその薬学的に許容可能な塩若しくはエステル。

## 【化 2】



## 【請求項 4】

前記塩が、塩酸塩、臭化水素酸塩、ヨウ化水素酸塩、硫酸塩、硝酸塩、リン酸塩、酢酸塩、トリフルオロ酢酸塩、マレイン酸塩、フマル酸塩、クエン酸塩、シュウ酸塩、コハク酸塩、酒石酸塩、リンゴ酸塩、マンデル酸塩、メタンスルホン酸塩、p-トルエンスルホン酸塩、ナトリウム、カリウム、カルシウム、アンモニウム、エチレンジアミン、エタノールアミン、N,N-ジアルキレンエタノールアミン、トリエタノールアミン及び塩基性アミノ酸から選択される、請求項3に記載の化合物。

## 【請求項 5】

請求項1から4のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩若しくはエステル、及び薬学的に許容可能な担体を含む、医薬組成物。

## 【請求項 6】

請求項5に記載の医薬組成物を含む剤形。

## 【請求項 7】

請求項1から4のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩若しくはエステル、請求項5に記載の組成物、又は請求項6に記載の剤形を含む医薬。

## 【請求項 8】

がんの治療用の、請求項 7 に記載の医薬。

## 【請求項 9】

前記がんが、非小細胞肺がん及び小細胞肺がんを含む肺がん、結腸がん、乳がん、膵臓がん、肉腫、卵巣がん、前立腺がん並びに胃がんから選択される、請求項8に記載の医薬。

## 【請求項 10】

前記がんが、非小細胞肺がん及び小細胞肺がんを含む肺がん、乳がん、膵臓がん並びに大腸がんから選択される、請求項9に記載の医薬。

## 【請求項 11】

がんの治療用の医薬の製造における、請求項1から4のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容可能な塩若しくはエステル、請求項5に記載の組成物、又は請求項6に記載の剤形の使用。

## 【請求項 12】

前記がんが、非小細胞肺がん及び小細胞肺がんを含む肺がん、結腸がん、乳がん、膵臓がん、肉腫、卵巣がん、前立腺がん並びに胃がんから選択される、請求項11に記載の使用。

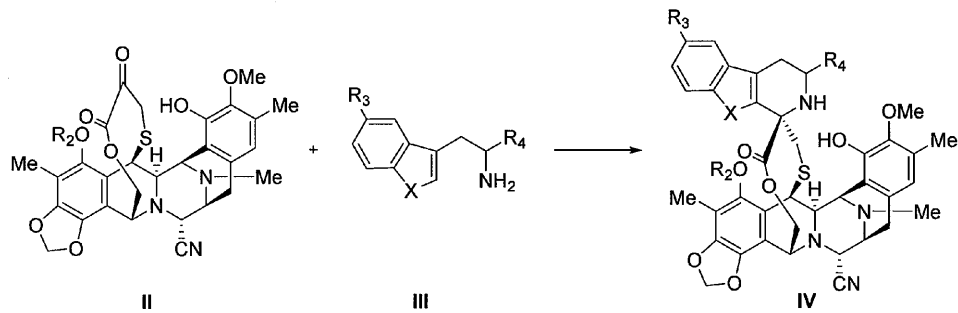
## 【請求項 13】

前記がんが、非小細胞肺がん及び小細胞肺がんを含む肺がん、乳がん、膵臓がん、並びに大腸がんから選択される、請求項12に記載の使用。

## 【請求項 14】

請求項1に記載の式Vの化合物又はその薬学的に許容可能な塩若しくはエステルを得る方法であって、  
式IIの化合物を式IIIの化合物と反応させて、式IVの化合物を生成する工程

## 【化 3】



[式中、

Xは-O-であり、

R<sub>2</sub>はアセチルであり、

R<sub>3</sub>は水素であり、

R<sub>4</sub>は-CH<sub>2</sub>OHである]

を含む方法。

## 【請求項 15】

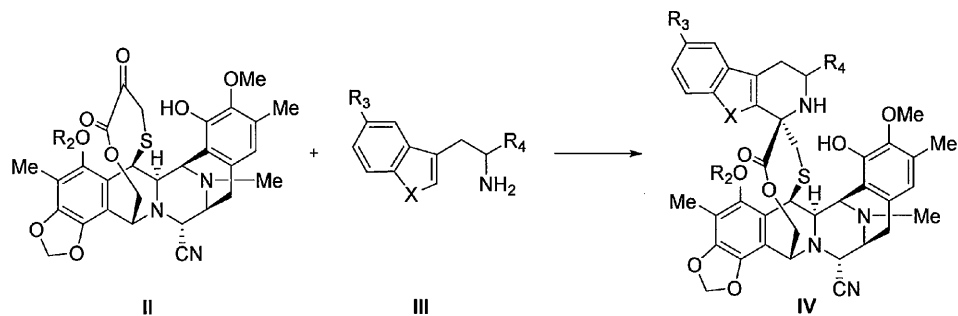
式IVの化合物中のシアノ基をヒドロキシ基で置き換えて式Vの化合物を生成する更なる工程を含む、請求項14に記載の方法。

## 【請求項 16】

請求項3に記載の式VIの化合物又はその薬学的に許容可能な塩若しくはエステルを得る方法であって、

式IIの化合物を式IIIの化合物と反応させて、式IVの化合物を生成する工程

## 【化 4】



[式中、

Xは-O-であり、

R<sub>2</sub>はアセチルであり、

R<sub>3</sub>は水素であり、

R<sub>4</sub>は水素である]

を含む方法。

## 【請求項 17】

式IVの化合物中のシアノ基をヒドロキシ基で置き換えて式VIの化合物を生成する更なる工程を含む、請求項16に記載の方法。

## 【請求項 18】

治療有効量の請求項1から4のいずれか一項に記載の化合物及び薬学的に許容可能な担体を含む、キット。

## 【請求項 19】

がん、更に好ましくは非小細胞肺癌及び小細胞肺癌を含む肺癌、結腸がん、乳がん、膵臓がん、肉腫、卵巣がん、前立腺がん並びに胃がんから選択されるがんの治療にお

ける前記化合物の使用説明書を更に含む、請求項18に記載のキット。