

【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4年3月1日(2022.3.1)

【国際公開番号】WO2019/161345

【公表番号】特表2021-513963(P2021-513963A)

【公表日】令和3年6月3日(2021.6.3)

【出願番号】特願2020-543209(P2020-543209)

【国際特許分類】

C 0 7 D 3 0 7 / 9 3 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

10

A 6 1 K 3 1 / 3 4 3 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 6 6 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 3 5 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 3 5 / 0 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 1 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 3 / 1 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 2 5 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 / 1 8 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 / 1 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

20

A 6 1 P 7 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 1 5 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 2 1 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 F 9 / 6 5 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 1 2 N 1 5 / 0 9 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

【 F I 】

C 0 7 D 3 0 7 / 9 3 C S P

A 6 1 K 3 1 / 3 4 3 Z N A

A 6 1 K 3 1 / 6 6 5

A 6 1 P 3 5 / 0 0

30

A 6 1 P 3 5 / 0 2

A 6 1 P 1 1 / 0 0

A 6 1 P 1 3 / 1 2

A 6 1 P 2 5 / 0 0

A 6 1 P 1 / 1 8

A 6 1 P 1 / 1 6

A 6 1 P 1 / 0 4

A 6 1 P 7 / 0 0

A 6 1 P 1 5 / 0 0

A 6 1 P 2 1 / 0 0

40

C 0 7 F 9 / 6 5 5

C 1 2 N 1 5 / 0 9 Z

【手続補正書】

【提出日】令和4年2月18日(2022.2.18)

【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】

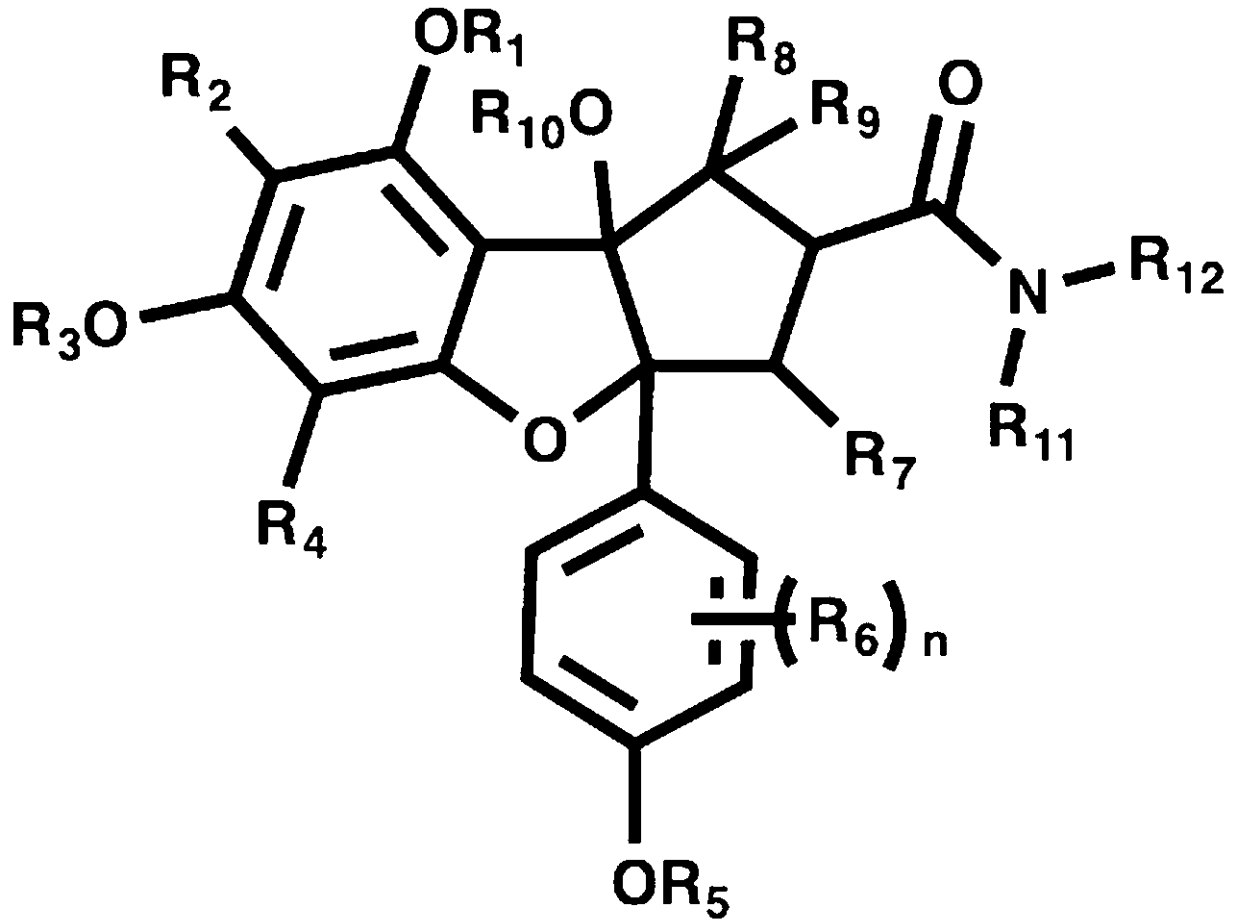
50

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) によって表される化合物であって、

【化 1】



(I)

式中、

R<sub>1</sub>、R<sub>3</sub>、およびR<sub>5</sub>は、各々独立してH、アルキル、-P(O)(OH)(OH)、  
 -CH<sub>2</sub>-P(O)(OH)(OH)、-P(O)(OH)(O-アルキル)、-CH<sub>2</sub>-  
 -P(O)(OH)(O-アルキル)、-P(O)(O-アルキル)(O-アルキル)、  
 -CH<sub>2</sub>-P(O)(O-アルキル)(O-アルキル)、もしくは(CO)-アルキル、  
 または-P(O)(OH)(OH)、-CH<sub>2</sub>-P(O)(OH)(OH)、-P(O)  
 (OH)(O-アルキル)、もしくは-CH<sub>2</sub>-P(O)(OH)(O-アルキル)の薬  
 学的に許容される塩であり、R<sub>1</sub>、R<sub>3</sub>、およびR<sub>5</sub>のうち少なくとも1つは、H、-P  
 (O)(OH)(OH)、-CH<sub>2</sub>-P(O)(OH)(OH)、-P(O)(OH)(  
 O-アルキル)、-CH<sub>2</sub>-P(O)(OH)(O-アルキル)、-P(O)(O-アル  
 キル)(O-アルキル)、-CH<sub>2</sub>-P(O)(O-アルキル)(O-アルキル)、また  
 は-P(O)(OH)(OH)、-CH<sub>2</sub>-P(O)(OH)(OH)、-P(O)(O  
 H)(O-アルキル)、もしくは-CH<sub>2</sub>-P(O)(OH)(O-アルキル)の薬学的  
 に許容される塩であるか、

R<sub>2</sub>およびR<sub>4</sub>は、各々独立して、H、アルキル、ハロ、ニトロ、OH、O-アルキル、  
 SH、S-アルキル、CN、ハロアルキル、O-ハロアルキル、NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub>、(CO)-

10

20

30

40

50

アルキル、(CO)OH、(CO)O-アルキル、SO<sub>2</sub>NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub>、(CO)NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub>、NH(CO)-アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、またはヘテロアリールであり、アリールおよびヘテロアリールは、任意選択で、アルキル、ハロ、ニトロ、OH、O-アルキル、SH、S-アルキル、CN、ハロアルキル、O-ハロアルキル、およびNR<sub>a</sub>R<sub>b</sub>で置換され、

R<sub>6</sub>は、アルキル、ハロ、ニトロ、OH、O-アルキル、SH、S-アルキル、CN、ハロアルキル、O-ハロアルキル、NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub>、(CO)-アルキル、(CO)OH、(CO)O-アルキル、SO<sub>2</sub>NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub>、(CO)NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub>、NH(CO)-アルキル、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アリール、またはヘテロアリールであり、アリールおよびヘテロアリールは、任意選択で、アルキル、ハロ、ニトロ、OH、O-アルキル、SH、S-アルキル、CN、ハロアルキル、O-ハロアルキル、およびNR<sub>a</sub>R<sub>b</sub>で置換され、

R<sub>7</sub>は、アリールまたはヘテロアリールであり、アリールおよびヘテロアリールは、任意選択で、アルキル、ハロ、ニトロ、OH、O-アルキル、SH、S-アルキル、CN、ハロアルキル、O-ハロアルキル、およびNR<sub>a</sub>R<sub>b</sub>で置換され、

R<sub>8</sub>およびR<sub>9</sub>は、各々独立して、H、OH、アルキル、ハロ、O-アルキル、SH、S-アルキル、CN、ハロアルキル、O-ハロアルキル、NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub>、(CO)OH、(CO)O-アルキル、SO<sub>2</sub>NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub>、(CO)NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub>、またはNH(CO)-アルキルであり、

R<sub>10</sub>は、H、アルキル、(CO)-アルキル、または(CO)NR<sub>a</sub>R<sub>b</sub>であり、

R<sub>11</sub>およびR<sub>12</sub>は、各々独立して、H、OH、アルキルオキシ、シクロアルキルオキシ、ヘテロシクロアルキルオキシ、シクロアルキルアルキルオキシ、ヘテロシクロアルキルアルキルオキシ、アリールアルキルオキシ、ヘテロアリールアルキルオキシ、アリールオキシ、またはヘテロアリールオキシであり、

R<sub>a</sub>およびR<sub>b</sub>は、各々、Hもしくはアルキルであるか、またはR<sub>a</sub>およびR<sub>b</sub>は、それらが結合している窒素原子と一緒にあって、ヘテロシクロアルキル基を形成し、

nは0~4の整数である、化合物、

あるいはその薬学的に許容される塩。

【請求項2】

R<sub>11</sub>がHであるか、

R<sub>11</sub>およびR<sub>12</sub>の両方がHであるか、

R<sub>11</sub>がHであり、R<sub>12</sub>がアルキルオキシまたはシクロアルキルオキシであるか、

R<sub>11</sub>がHであり、R<sub>12</sub>がOMeであるか、

R<sub>3</sub>がHであるか、

R<sub>5</sub>がHであるか、

R<sub>1</sub>がHであるか、

R<sub>1</sub>がメチルのようなアルキルであるか、

R<sub>2</sub>およびR<sub>4</sub>がHであり、nが0であるか、

R<sub>10</sub>がHであるか、または

R<sub>8</sub>がHであり、R<sub>9</sub>がOHである、請求項1に記載の化合物。

【請求項3】

R<sub>3</sub>が、H、-P(O)(OH)(OH)、-CH<sub>2</sub>-P(O)(OH)(OH)、-P(O)(OH)(O-アルキル)、-CH<sub>2</sub>-P(O)(OH)(O-アルキル)、-P(O)(O-アルキル)(O-アルキル)、-CH<sub>2</sub>-P(O)(O-アルキル)(O-アルキル)、または-P(O)(OH)(OH)、-CH<sub>2</sub>-P(O)(OH)(OH)、-P(O)(OH)(O-アルキル)、もしくは-CH<sub>2</sub>-P(O)(OH)(O-アルキル)の薬学的に許容される塩であるか、

R<sub>5</sub>が、H、-P(O)(OH)(OH)、-CH<sub>2</sub>-P(O)(OH)(OH)、-P(O)(OH)(O-アルキル)、-CH<sub>2</sub>-P(O)(OH)(O-アルキル)、-P(O)(O-アルキル)(O-アルキル)、-CH<sub>2</sub>-P(O)(O-アルキル)(O-

10

20

30

40

50

アルキル)、または  $-P(O)(OH)(OH)$ 、 $-CH_2-P(O)(OH)(OH)$ 、 $-P(O)(OH)(O-アルキル)$ 、もしくは  $-CH_2-P(O)(OH)(O-アルキル)$  の薬学的に許容される塩であるか、または  $R_5$  が  $-P(O)(OH)(OH)$  もしくは  $-CH_2-P(O)(OH)(OH)$ 、またはそれらの薬学的に許容される塩である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

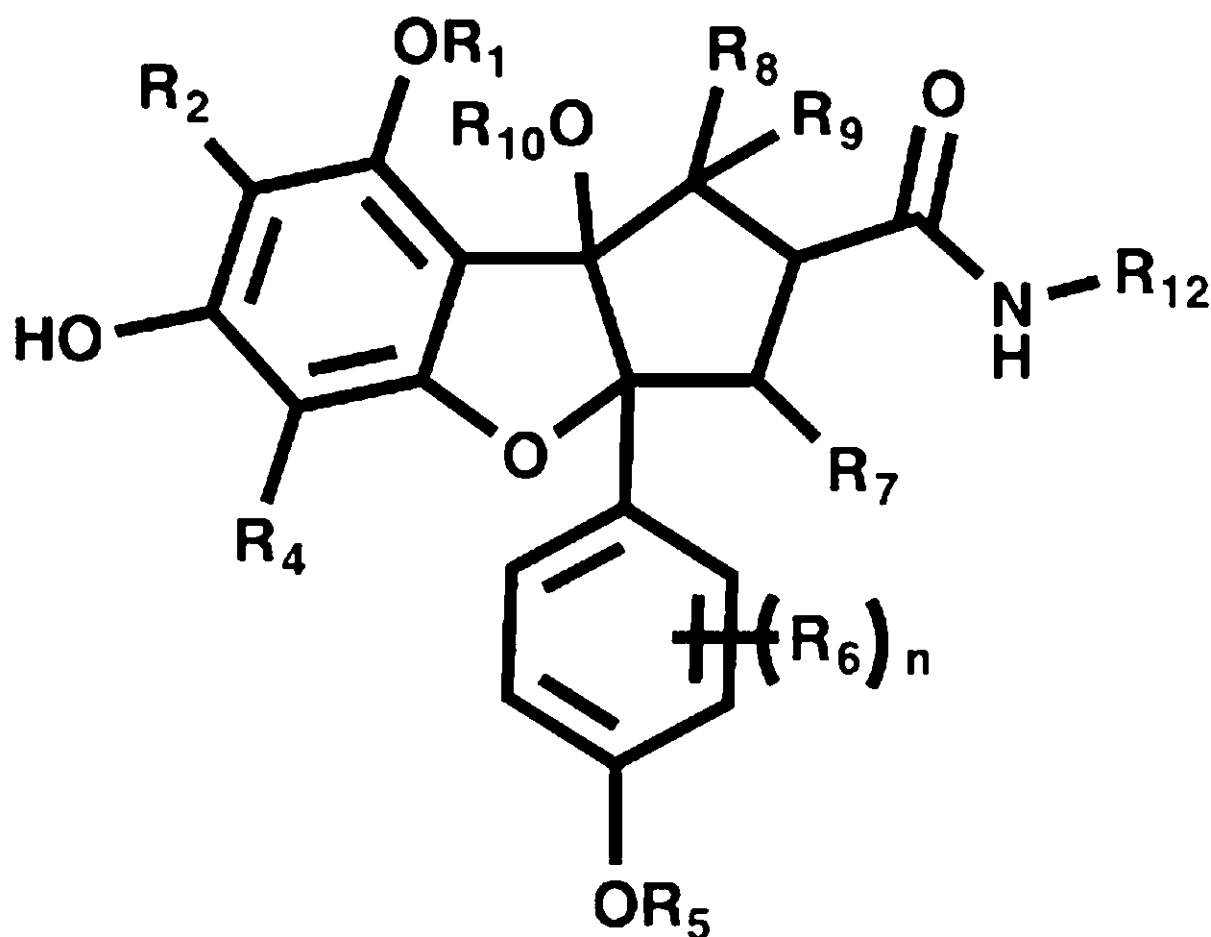
【請求項 4】

$R_1$  が、 $H$ 、 $-P(O)(OH)(OH)$ 、 $-CH_2-P(O)(OH)(OH)$ 、 $-P(O)(OH)(O-アルキル)$ 、 $-CH_2-P(O)(OH)(O-アルキル)$ 、 $-P(O)(O-アルキル)(O-アルキル)$ 、 $-CH_2-P(O)(O-アルキル)(O-アルキル)$ 、または  $-P(O)(OH)(OH)$ 、 $-CH_2-P(O)(OH)(OH)$ 、 $-P(O)(OH)(O-アルキル)$ 、もしくは  $-CH_2-P(O)(OH)(O-アルキル)$  の薬学的に許容される塩である、請求項 1 ~ 3 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 5】

前記式 (I) の化合物が、式 (II) の化合物によって表され、所望により、 $R_{12}$  が、 $H$  または  $OMe$  である、 請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【化 2】

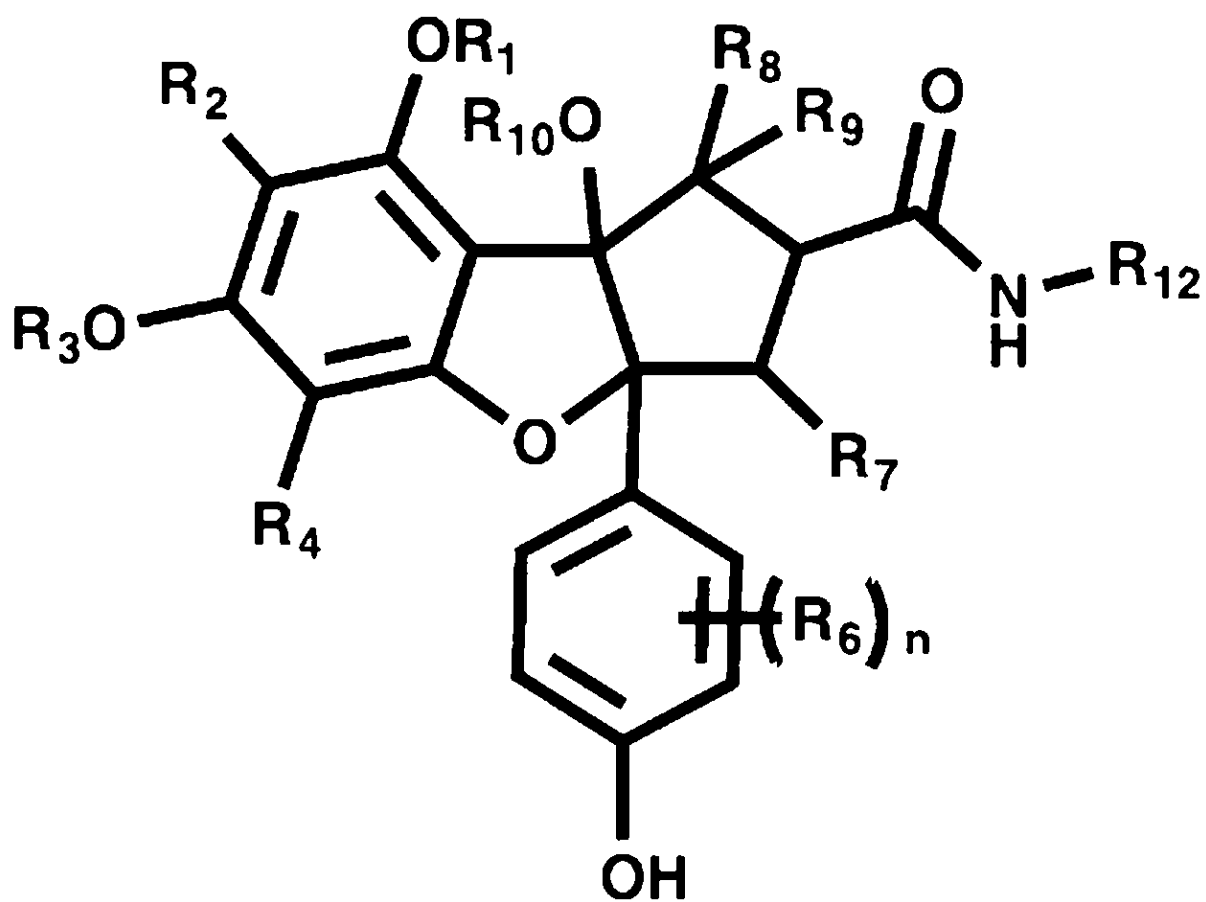


(II)

【請求項 6】

前記式 (I) の化合物が、式 (III) の化合物によって表される、請求項 1 ~ 5 のいずれか一項に記載の化合物。

【化 3】



(III)

【請求項 7】

$R_{12}$  が  $OMe$  であるか、または  $R_{12}$  が  $H$  である、請求項 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

前記式 (I) の化合物が、式 (IV) の化合物

10

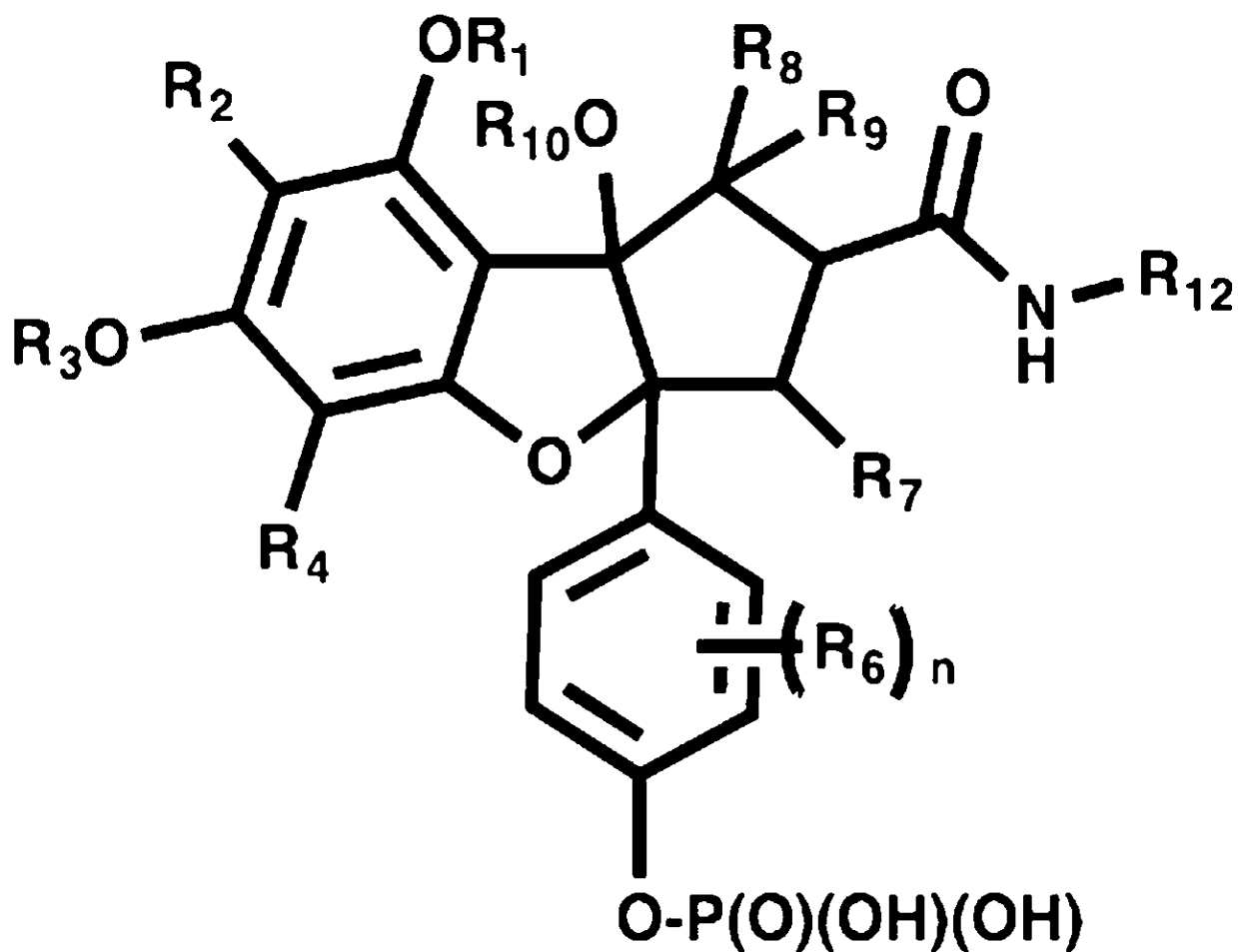
20

30

40

50

【化 4】



(IV)

、  
 またはその薬学的に許容される塩によって表される、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 9】

$R_{12}$  が、アルキルオキシまたはシクロアルキルオキシであるか、または  $R_{12}$  が  $OMe$  である、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

前記式 (I) の化合物が、式 (V) の化合物によって表される、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

10

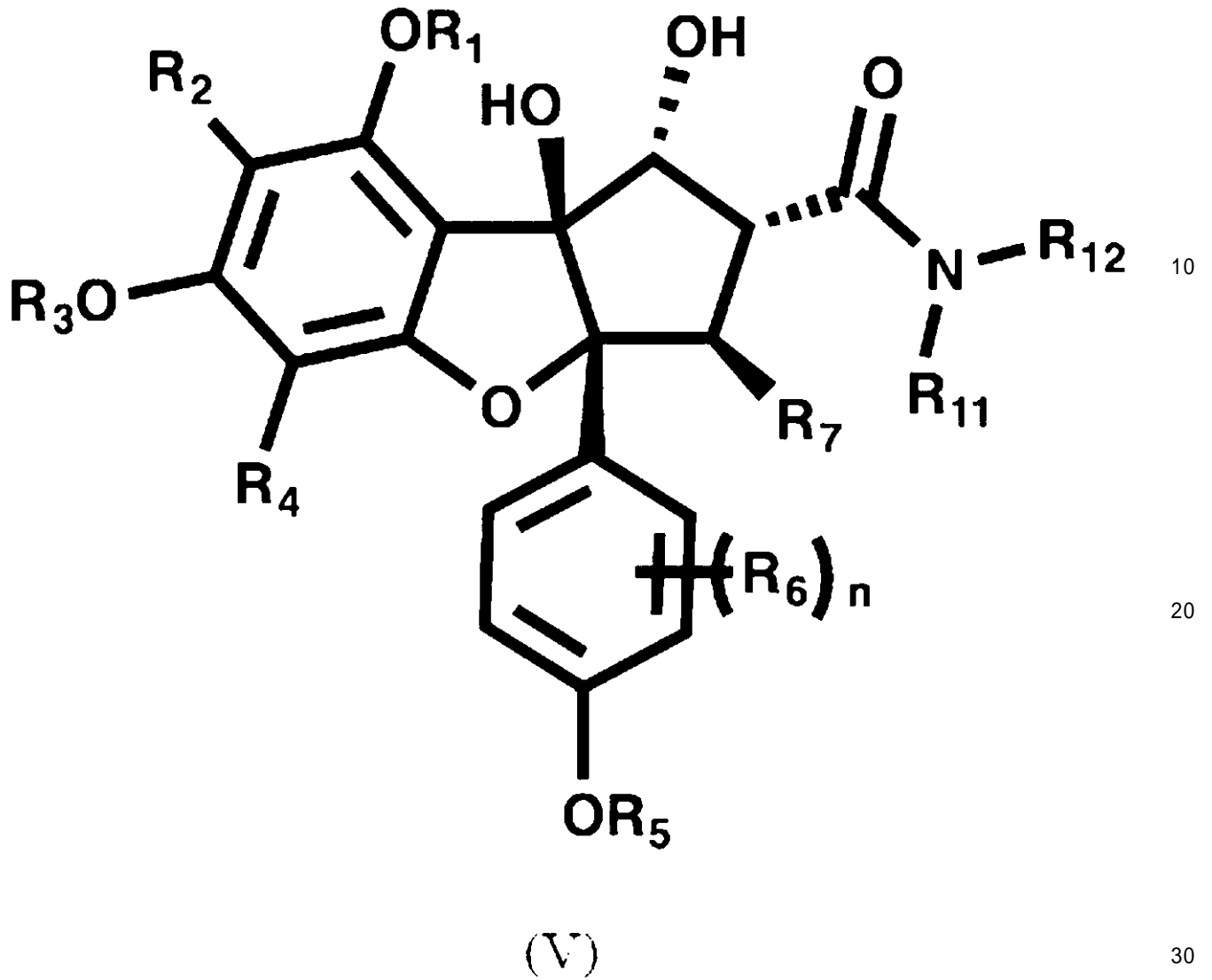
20

30

40

50

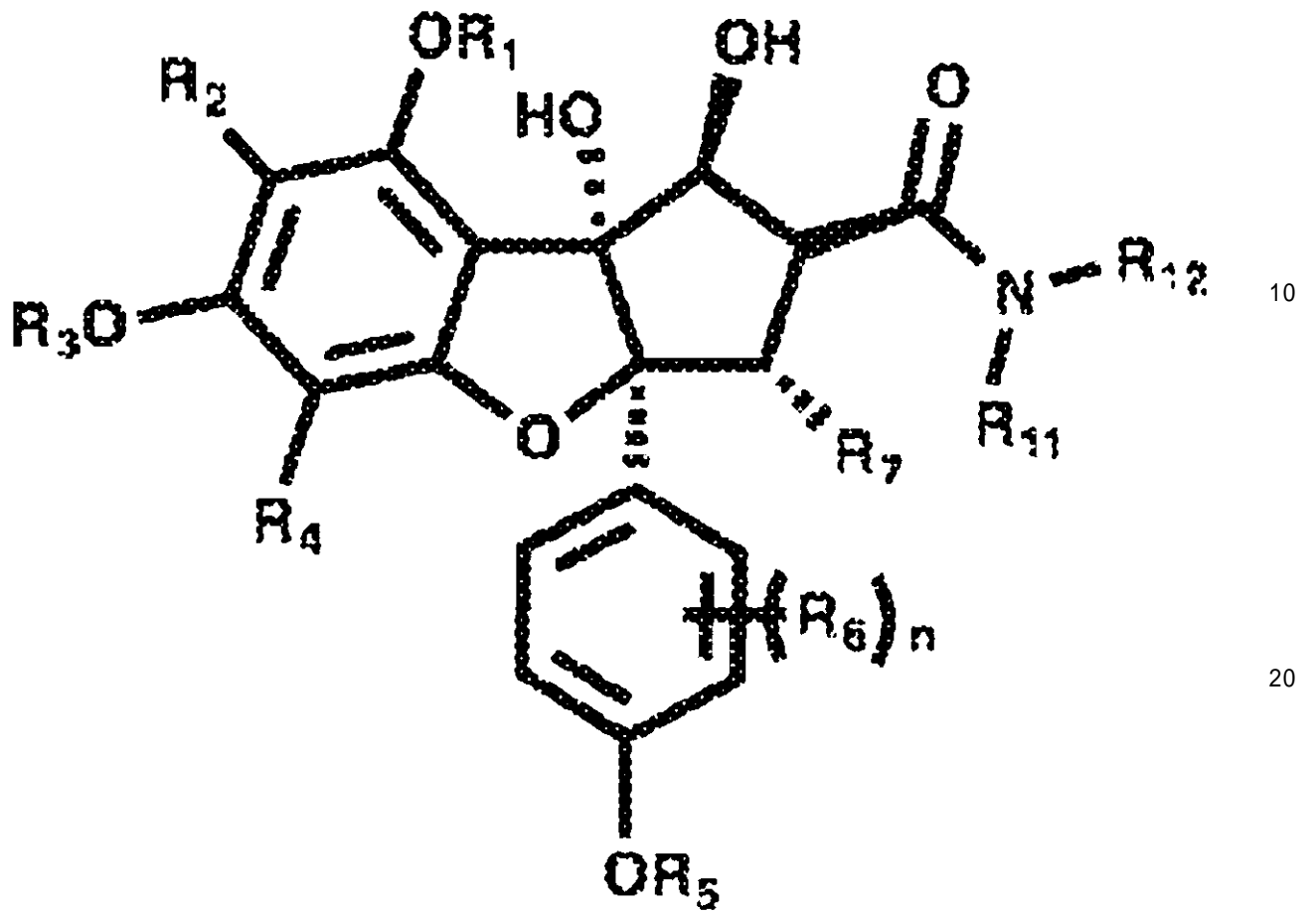
【化 5】



【請求項 1 1】

前記式 (I) の化合物が、式 (V I) の化合物によって表される、請求項 1 ~ 4 のいずれか一項に記載の化合物。

【化 6】



(VI)

【請求項 1 2】  
前記化合物が、

10

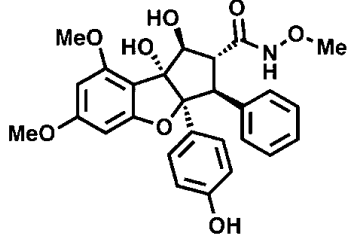
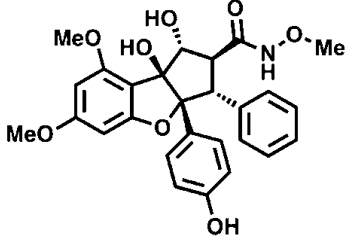
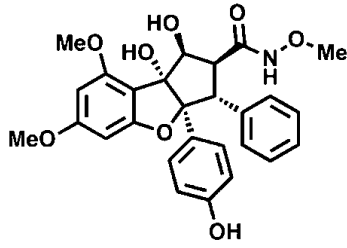
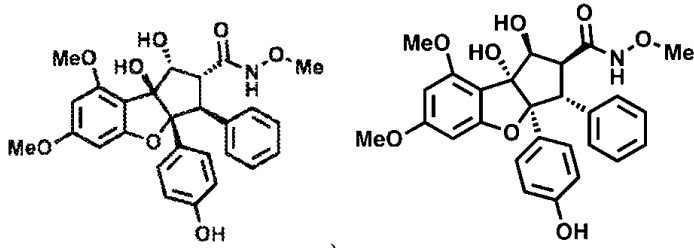
20

30

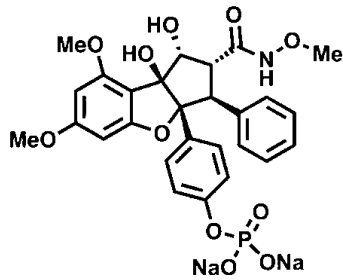
40

50

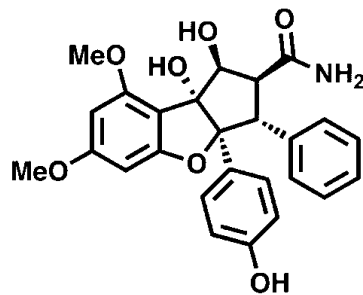
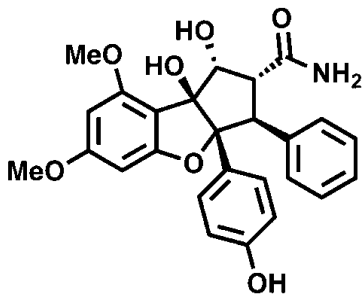
## 【化 7】



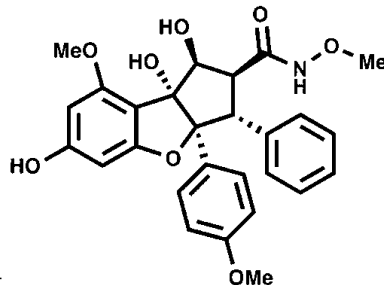
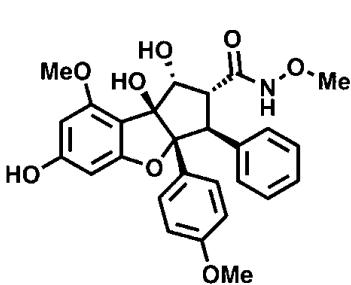
10



20



30



40

、または

である、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 1 3】

請求項 1 ~ 1.2 のいずれか一項に記載の化合物と、薬学的に許容される賦形剤、希釈剤または担体と、を含む、薬学的組成物。

## 【請求項 1 4】

対象における癌または異常増殖性疾患の再発を予防するか、治療するか、または介入する使用のための、請求項 1 ~ 1.2 のいずれか一項に記載の化合物または請求項 1.3 に記載の薬学的組成物。

## 【請求項 1 5】

50

前記癌が、T細胞急性リンパ芽球性白血病、小細胞肺癌、腎細胞癌、頭頸部の扁平上皮癌、神経芽腫、膵臓癌、形質転換濾胞性リンパ腫、マンテル細胞リンパ腫、乳癌、卵巣癌、肝細胞癌、非小細胞肺癌、胃癌、ユーイング肉腫、または肺腺癌である、請求項14に記載の使用のための化合物または薬学的組成物。

10

20

30

40

50