

【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27年10月1日 (2015.10.1)

【公開番号】特開2014-5265(P2014-5265A)

【公開日】平成26年1月16日 (2014.1.16)

【年通号数】公開・登録公報2014-002

【出願番号】特願2012-195912(P2012-195912)

【国際特許分類】

C 07D 401/14 (2006.01)

A 61K 45/00 (2006.01)

A 61K 31/44 (2006.01)

A 61P 35/00 (2006.01)

A 61P 11/00 (2006.01)

A 61P 19/00 (2006.01)

A 61P 1/18 (2006.01)

A 61P 17/00 (2006.01)

A 61P 25/00 (2006.01)

A 61P 27/02 (2006.01)

A 61P 15/00 (2006.01)

A 61P 1/04 (2006.01)

A 61P 5/00 (2006.01)

A 61P 13/02 (2006.01)

A 61P 13/08 (2006.01)

A 61P 35/02 (2006.01)

A 61P 21/00 (2006.01)

A 61P 13/10 (2006.01)

A 61P 13/12 (2006.01)

A 61P 17/06 (2006.01)

A 61K 31/4545 (2006.01)

【FI】

C 07D 401/14 C S P

A 61K 45/00

A 61K 31/44

A 61P 35/00

A 61P 11/00

A 61P 19/00

A 61P 1/18

A 61P 17/00

A 61P 25/00

A 61P 27/02

A 61P 15/00

A 61P 1/04

A 61P 5/00

A 61P 13/02

A 61P 13/08

A 61P 35/02

A 61P 21/00

A 61P 13/10

A 61P 13/12

A 6 1 P 17/06

A 6 1 K 31/4545

【手続補正書】

【提出日】平成27年8月13日(2015.8.13)

【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

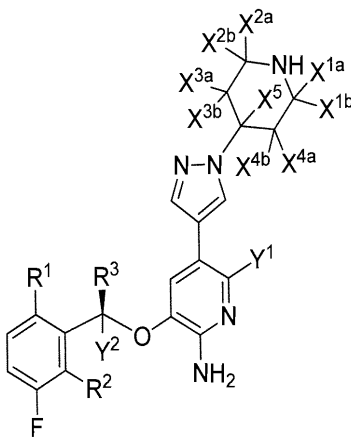
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式Iの化合物またはその薬学的に許容される塩：

【化 1】



(I)

式中：

 R^1 および R^2 はそれぞれClであり； R^3 は CH_3 または CD_3 であり； X^{1a} 、 X^{1b} 、 X^{2a} および X^{2b} は同じでありかつ水素または重水素であり； X^{3a} 、 X^{3b} 、 X^{4a} および X^{4b} は同じでありかつ水素または重水素であり； X^5 は水素または重水素であり； Y^1 は水素または重水素であり；かつ Y^2 は水素または重水素であり；

ただし X^{1a} 、 X^{1b} 、 X^{2a} および X^{2b} がそれぞれ重水素であるか、または X^{3a} 、 X^{3b} 、 X^{4a} および X^{4b} がそれぞれ重水素であるか、または X^{1a} 、 X^{1b} 、 X^{2a} 、 X^{2b} 、 X^{3a} 、 X^{3b} 、 X^{4a} および X^{4b} がそれぞれ重水素である。

【請求項 2】

各 X^1 、各 X^2 、各 X^3 および各 X^4 が重水素である、請求項1記載の化合物。

【請求項 3】

各 X^1 および各 X^2 が水素であり；かつ各 X^3 および各 X^4 が重水素である、請求項1記載の化合物。

【請求項 4】

各 X^1 および各 X^2 が重水素であり；かつ各 X^3 および各 X^4 が水素である、請求項1記載の化合物。

【請求項 5】

X^5 が水素であり、 Y^1 が水素であり、かつ Y^2 が水素である；または
 X^5 が水素であり、 Y^1 が重水素であり、かつ Y^2 が水素である；または
 X^5 が水素であり、 Y^1 が水素であり、かつ Y^2 が重水素である；または
 X^5 が水素であり、 Y^1 が重水素であり、かつ Y^2 が重水素である；または

X^5 が重水素であり、 Y^1 が水素であり、かつ Y^2 が水素である；または
 X^5 が重水素であり、 Y^1 が重水素であり、かつ Y^2 が水素である；または
 X^5 が重水素であり、 Y^1 が水素であり、かつ Y^2 が重水素である；または
 X^5 が重水素であり、 Y^1 が重水素であり、かつ Y^2 が重水素である、

請求項1記載の化合物。

【請求項6】

R^3 が CH_3 である、請求項5記載の化合物。

【請求項7】

R^3 が CD_3 である、請求項5記載の化合物。

【請求項8】

重水素と明示されていない任意の原子がその天然同位体存在度で存在する、以下の表：

化合物	X^{1a}/X^{1b}	X^{2a}/X^{2b}	X^{3a}/X^{3b}	X^{4a}/X^{4b}	X^5	Y^1	Y^2	R^1 および R^2	R^3
100	D	D	D	D	D	D	D	Cl	CD_3
101	D	D	D	D	D	H	D	Cl	CD_3
102	D	D	D	D	H	D	H	Cl	CH_3
103	D	D	H	H	D	H	D	Cl	CD_3
104	D	D	H	H	D	H	H	Cl	CH_3
105	D	D	H	H	D	D	H	Cl	CH_3
106	D	D	H	H	H	D	H	Cl	CH_3
107	D	D	H	H	H	D	D	Cl	CD_3
108	H	H	D	D	D	D	H	Cl	CD_3
109	H	H	D	D	D	H	H	Cl	CH_3
110	H	H	D	D	D	H	D	Cl	CD_3
111	H	H	D	D	D	D	H	Cl	CH_3

における化合物、またはその薬学的に許容される塩の任意の1つから選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項9】

重水素と明示されていない任意の原子がその天然同位体存在度で存在する、以下の表：

化合物	X^{1a}/X^{1b}	X^{2a}/X^{2b}	X^{3a}/X^{3b}	X^{4a}/X^{4b}	X^5	Y^1	Y^2	R^1	R^2	R^3
200	D	D	D	D	D	H	H	Cl	Cl	CD_3
201	D	D	D	D	D	H	D	Cl	Cl	CH_3

における化合物、またはその薬学的に許容される塩の任意の1つから選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項10】

重水素と明示されていない任意の原子がその天然同位体存在度で存在する、以下の表：

化合物	X ^{1a} / X ^{1b}	X ^{2a} / X ^{2b}	X ^{3a} / X ^{3b}	X ^{4a} / X ^{4b}	X ⁵	Y ¹	Y ²	R ¹	R ²	R ³
210	D	D	D	D	H	H	H	Cl	Cl	CH ₃
211	H	H	D	D	H	H	H	Cl	Cl	CH ₃
212	D	D	H	H	H	H	H	Cl	Cl	CH ₃
213	D	D	D	D	H	H	H	Cl	Cl	CD ₃
214	H	H	D	D	H	H	H	Cl	Cl	CD ₃
215	D	D	H	H	H	H	H	Cl	Cl	CD ₃
216	D	D	D	D	H	H	D	Cl	Cl	CD ₃
217	H	H	D	D	H	H	D	Cl	Cl	CD ₃
218	D	D	H	H	H	H	D	Cl	Cl	CD ₃
219	D	D	D	D	D	H	H	Cl	Cl	CH ₃
220	H	H	D	D	D	H	H	Cl	Cl	CD ₃
221	D	D	H	H	D	H	H	Cl	Cl	CD ₃

における化合物、またはその薬学的に許容される塩の任意の1つから選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項 1 1】

重水素と明示されていない任意の原子がその天然同位体存在度で存在する、請求項1記載の化合物。

【請求項 1 2】

請求項1記載の化合物またはその薬学的に許容される塩、および薬学的に許容される担体を含む、発熱物質を含まない薬学的組成物。

【請求項 1 3】

キナーゼ阻害剤から選択される第二の治療薬をさらに含む、請求項12記載の組成物。

【請求項 1 4】

キナーゼ阻害剤がエルロチニブ、d-エルロチニブ、ソラフェニブ、d-ソラフェニブ、PF-00299804および454283から選択される、請求項13記載の組成物。

【請求項 1 5】

エルロチニブまたはd-エルロチニブ、およびソラフェニブまたはd-ソラフェニブから選択される2つの第二の治療薬の組み合わせをさらに含む、請求項13記載の組成物。

【請求項 1 6】

対象におけるがん、特に肺癌、非小細胞肺癌、骨癌、膵臓癌、皮膚癌、頭頸部癌、皮膚もしくは眼内の黒色腫、子宮癌、卵巣癌、直腸癌、肛門領域の癌、胃癌、結腸直腸癌、結腸癌、胃癌、乳癌、子宮内膜癌、卵管の癌、子宮頸部の癌、膣の癌、外陰部の癌、ホジキン病、食道癌、小腸癌、内分泌系の癌、甲状腺の癌、副甲状腺の癌、副腎の癌、尿道の癌、陰茎の癌、前立腺の癌、慢性もしくは急性の白血病、リンパ腫、軟部組織の肉腫、膀胱の癌、腎臓もしくは尿管の癌、腎細胞癌、腎盤の癌、中枢神経系（CNS）の新生物、原発性CNSリンパ腫、脊髄軸腫瘍、神経膠芽腫、脳幹神経膠腫、神経芽腫、下垂体腺腫、固形腫瘍または前述のがんの1つもしくは複数の組み合わせ；乾癬、良性前立腺肥大症および再狭窄を含むが、それらに限定されるわけではない、良性増殖性疾患から選択される疾患または状態の治療における使用のための、請求項12記載の組成物。

【請求項 1 7】

疾患または状態が非小細胞肺癌（NSCLC）、固形腫瘍癌、神経芽腫およびリンパ腫から選択される、請求項16記載の組成物。

【請求項 1 8】

疾患または状態が非小細胞肺癌（NSCLC）である、請求項17記載の組成物。