

【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 07 D	401/14	(2006.01)
A 61 K	45/00	(2006.01)
A 61 K	31/44	(2006.01)
A 61 P	35/00	(2006.01)
A 61 P	11/00	(2006.01)
A 61 P	19/00	(2006.01)
A 61 P	1/18	(2006.01)
A 61 P	17/00	(2006.01)
A 61 P	25/00	(2006.01)
A 61 P	27/02	(2006.01)
A 61 P	15/00	(2006.01)
A 61 P	1/04	(2006.01)
A 61 P	5/00	(2006.01)
A 61 P	13/02	(2006.01)
A 61 P	13/08	(2006.01)
A 61 P	35/02	(2006.01)
A 61 P	21/00	(2006.01)
A 61 P	13/10	(2006.01)
A 61 P	13/12	(2006.01)
A 61 P	17/06	(2006.01)
A 61 K	31/4545	(2006.01)

【F I】

C 07 D	401/14	C S P
A 61 K	45/00	
A 61 K	31/44	
A 61 P	35/00	
A 61 P	11/00	
A 61 P	19/00	
A 61 P	1/18	
A 61 P	17/00	
A 61 P	25/00	
A 61 P	27/02	
A 61 P	15/00	
A 61 P	1/04	
A 61 P	5/00	
A 61 P	13/02	
A 61 P	13/08	
A 61 P	35/02	
A 61 P	21/00	
A 61 P	13/10	
A 61 P	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

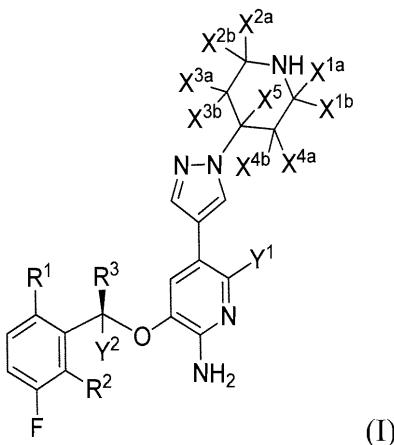
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式1の化合物またはその薬学的に許容される塩：

【化1】



式中：

R¹およびR²はそれぞれCIであり；

R³はCH₃またはCD₃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；

X⁵は水素または重水素であり；

Y¹は水素または重水素であり；かつ

Y²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X¹、各X²、各X³および各X⁴が重水素である、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

各X¹および各X²が水素であり；かつ各X³および各X⁴が重水素である、請求項1記載の化合物。

【請求項4】

各X¹および各X²が重水素であり；かつ各X³および各X⁴が水素である、請求項1記載の化合物。

【請求項5】

X⁵が水素であり、Y¹が水素であり、かつY²が水素である；または

X⁵が水素であり、Y¹が重水素であり、かつY²が水素である；または

X⁵が水素であり、Y¹が水素であり、かつY²が重水素である；または

X⁵が水素であり、Y¹が重水素であり、かつY²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11】

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12】

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13】

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14】

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15】

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16】

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17】

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18】

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。