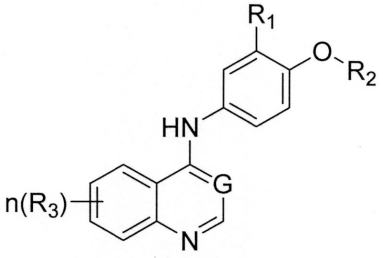
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和6年4月11日(2024.4.11)

【国際公開番号】WO2022/206929
【公表番号】特表2024-514098(P2024-514098A)
【公表日】令和6年3月28日(2024.3.28)
【年通号数】公開公報(特許)2024-057
【出願番号】特願2023-560644(P2023-560644)
【国際特許分類】
*C07D471/04(2006.01)*
*C07D487/04(2006.01)*
*A61K31/506(2006.01)*
*A61K31/5377(2006.01)*
*A61K45/00(2006.01)*
*A61P35/04(2006.01)*
*A61P35/00(2006.01)*
【ＦＩ】
C07D471/04 101
C07D471/04 CSP
C07D487/04 144
C07D471/04 107E
C07D487/04 142
C07D487/04 146
A61K 31/506
A61K 31/5377
A61K 45/00
A61P 35/04
A61P 35/00

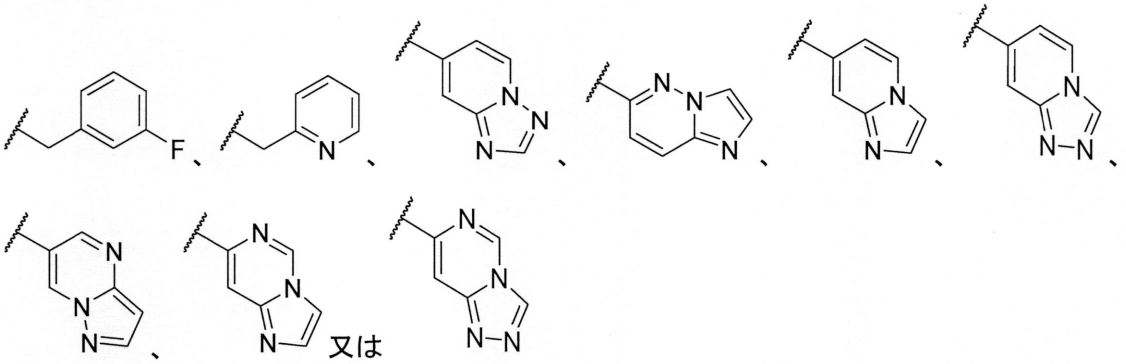
【手続補正書】
【提出日】令和6年3月29日(2024.3.29)
【手続補正１】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】
【請求項１】
ＥｒｂＢ２突然変異体を標的とする阻害薬の調製における、化学式１で表される構造を含む化合物、その薬学的に許容される塩、その溶媒和物、その薬学的に許容される塩の溶媒和物、又は、その結晶を含有する医薬組成物の使用。

【化１】

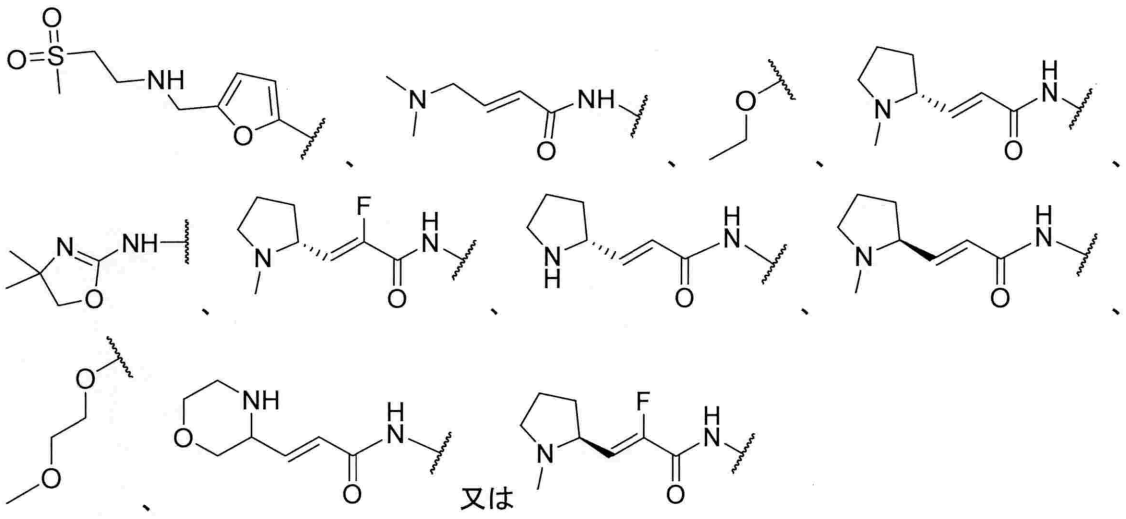


化学式１

（ただし、Ｒ１は、ハロゲン又はＣ１－Ｃ６アルカンであり、
Ｒ２は、
【化２】

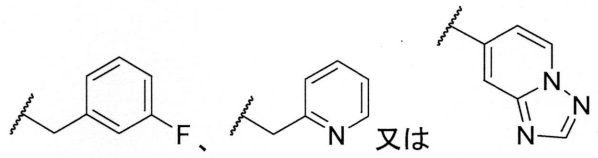


であり、
各Ｒ３は独立して、
【化３】

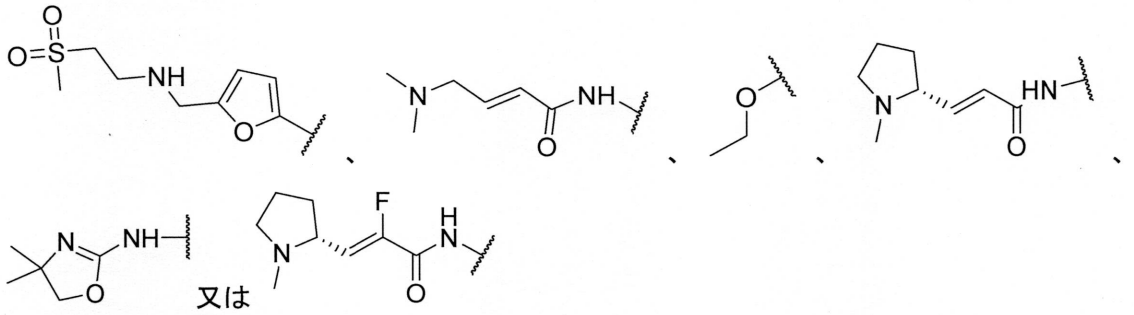


であり、
ｎは、１又は２であり、
Ｇは、Ｎ又はＣ－ＣＮである。）
【請求項２】
前記化学式１で表される構造を含む化合物、その薬学的に許容される塩、その溶媒和物

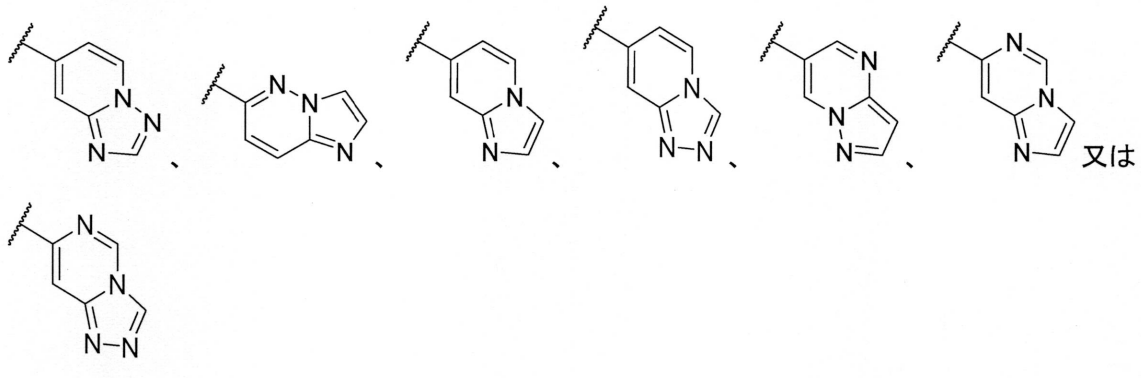
、その薬学的に許容される塩の溶媒和物、又は、その結晶において、
$R_1$は、ハロゲン又は$C_1-C_6$アルカンであり、
$R_2$は、
【化４】



であり、
各$R_3$は独立して、
【化５】

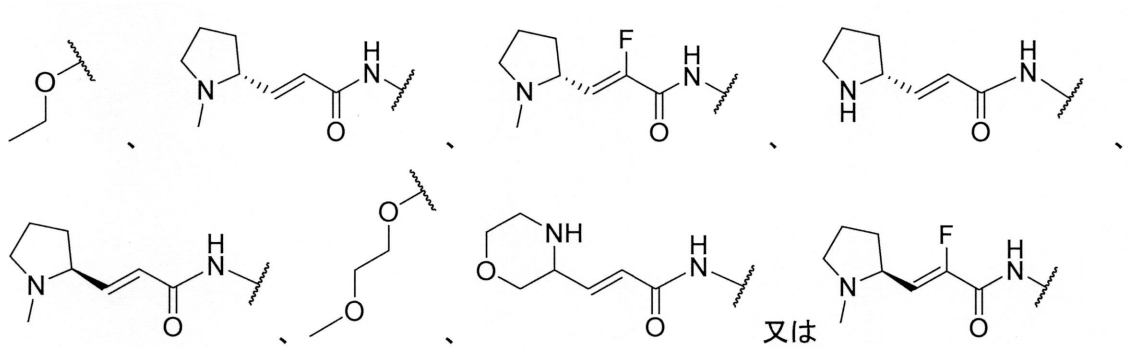


であり、
ｎは、１又は２であり、
Ｇは、Ｎ又はＣ－ＣＮであることを特徴とする、請求項１に記載の医薬組成物の使用。
【請求項３】
前記化学式１で表される構造を含む化合物、その薬学的に許容される塩、その溶媒和物、その薬学的に許容される塩の溶媒和物、又は、その結晶において、
$R_1$は、ハロゲン又は$C_1-C_6$アルカンであり、
$R_2$は、
【化６】

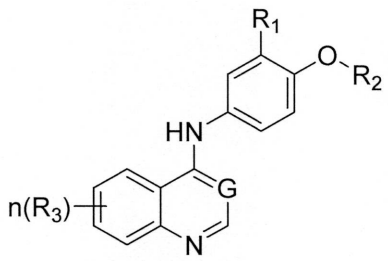


であり、
各$R_3$は独立して、

【化７】

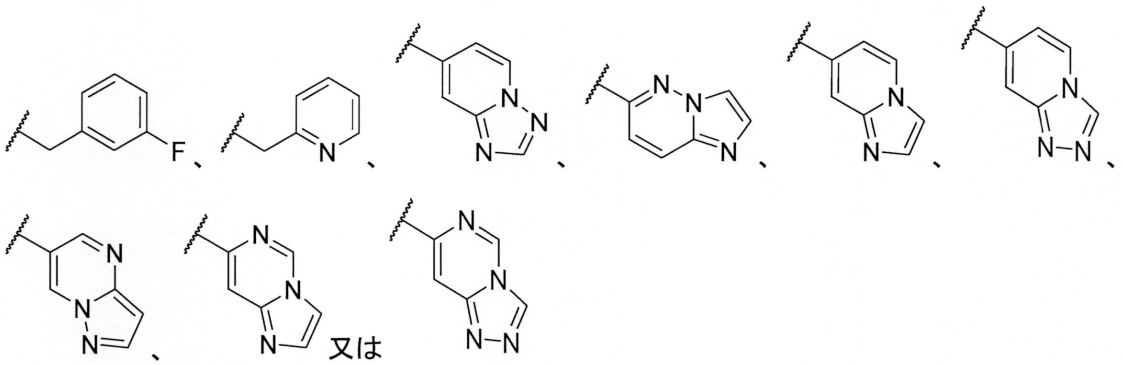


であり、
ｎは、１又は２であり、
Ｇは、Ｎ又はＣ－ＣＮであることを特徴とする、請求項１に記載の医薬組成物の使用。
【請求項４】
ＥｒｂＢ２突然変異体関連疾患を治療又は予防するための医薬の調製における、化学式１で表される構造を含む化合物、その薬学的に許容される塩、その溶媒和物、その薬学的に許容される塩の溶媒和物、又は、その結晶を含有する医薬組成物の使用。
【化８】



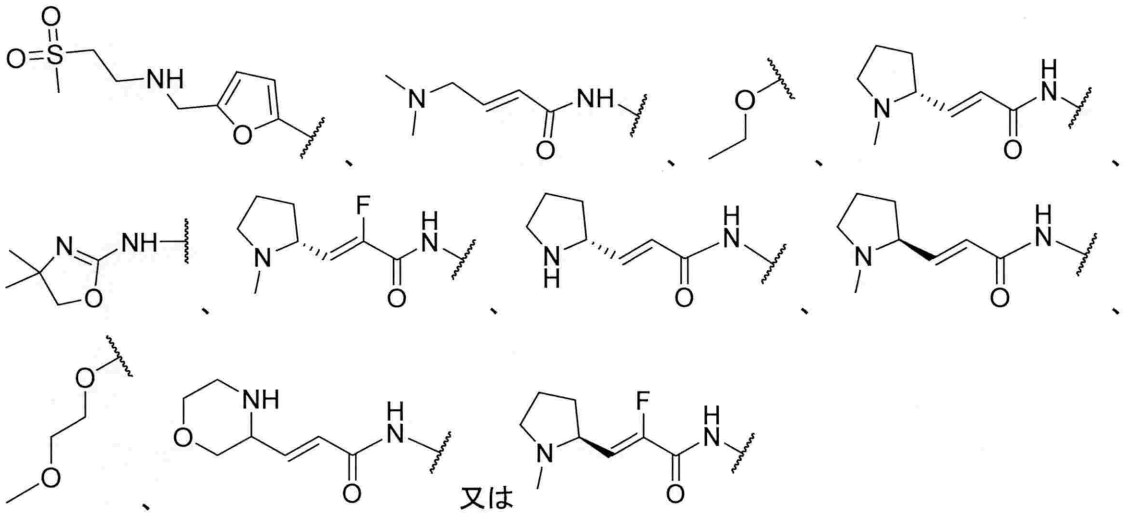
化学式１

（ただし、$R_1$は、ハロゲン又は$C_1-C_6$アルカンであり、
$R_2$は、
【化９】

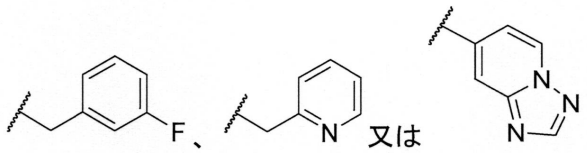


であり、
各$R_3$は独立して、

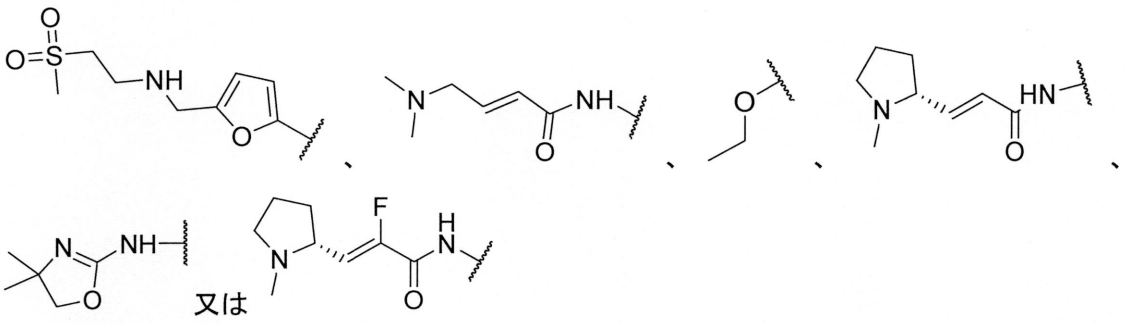
【化１０】



であり、
ｎは、１又は２であり、
Ｇは、Ｎ又はＣ－ＣＮである。）
【請求項５】
前記化学式１で表される構造を含む化合物、その薬学的に許容される塩、その溶媒和物、その薬学的に許容される塩の溶媒和物、又は、その結晶において、
$R_1$は、ハロゲン又は$C_1-C_6$アルカンであり、
$R_2$は、
【化１１】

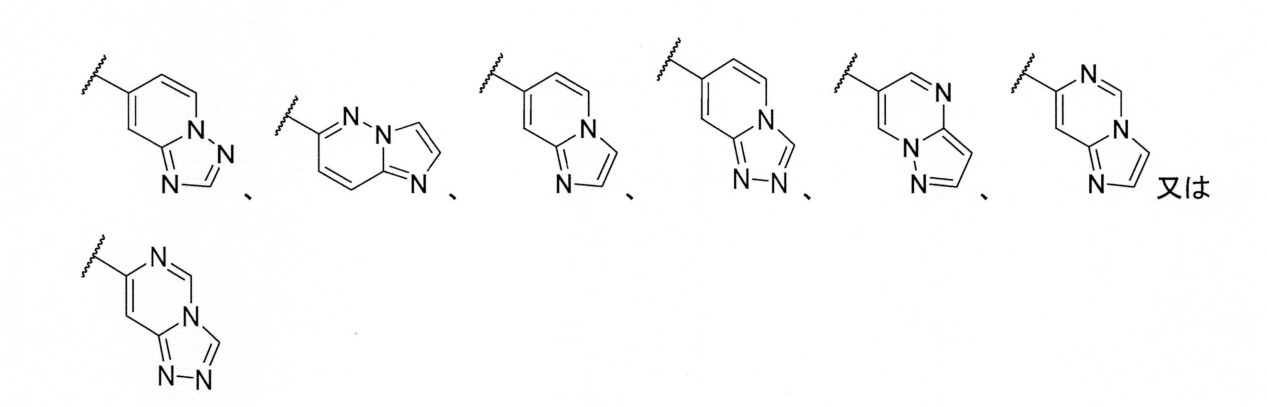


であり、
各$R_3$は独立して、
【化１２】

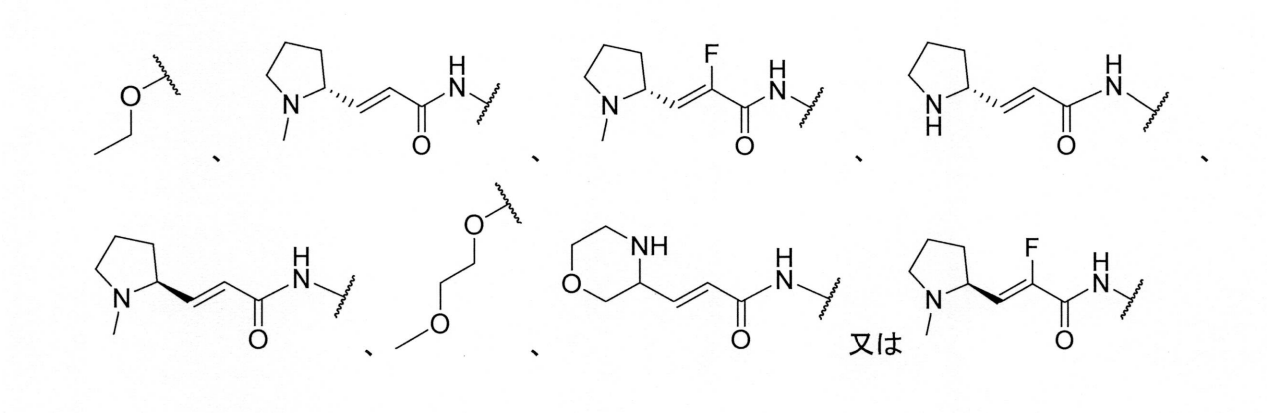


であり、
ｎは、１又は２であり、
Ｇは、Ｎ又はＣ－ＣＮであることを特徴とする、請求項４に記載の医薬組成物の使用。
【請求項６】

前記化学式１で表される構造を含む化合物、その薬学的に許容される塩、その溶媒和物、その薬学的に許容される塩の溶媒和物、又は、その結晶において、
$R_1$は、ハロゲン又は$C_1-C_6$アルカンであり、
$R_2$は、
【化１３】

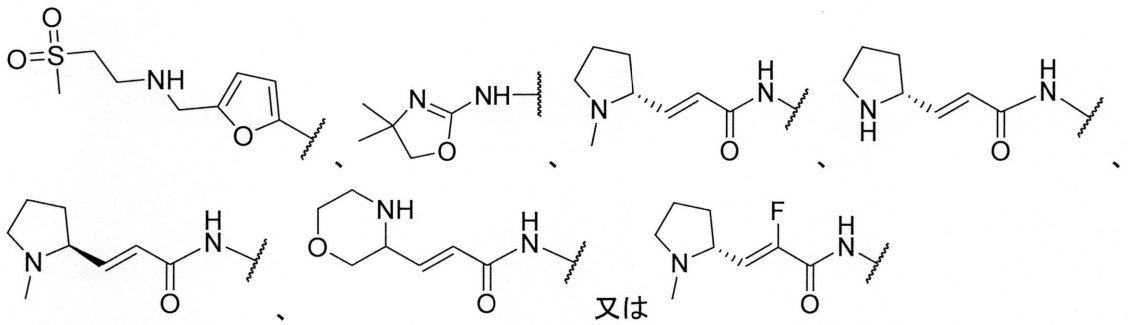


であり、
各$R_3$は独立して、
【化１４】



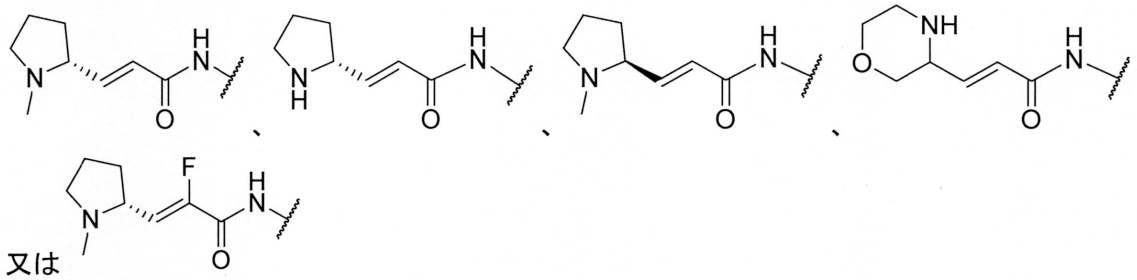
であり、
ｎは、１又は２であり、
Ｇは、Ｎ又はＣ－ＣＮであることを特徴とする、請求項４に記載の医薬組成物の使用。
【請求項７】
前記化学式１において、$R_1$がハロゲンである場合、前記ハロゲンはＣｌであり、$R_1$が$C_1-C_6$アルカンである場合、前記$C_1-C_6$アルカンはメチルであり、
及び／又は、
ｎが１である場合、$R_3$は、

【化１５】




であり、好ましくは

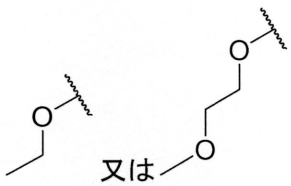
【化１６】




であり、

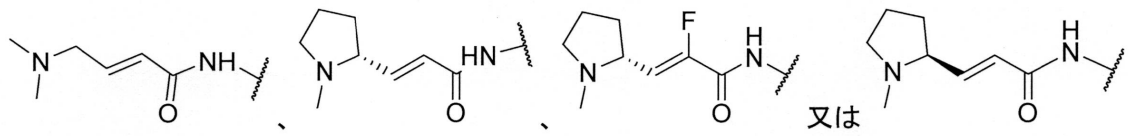
ｎが２である場合、Ｒ$_3$は２つのオルト位基であり、そのうちの１つは、

【化１７】



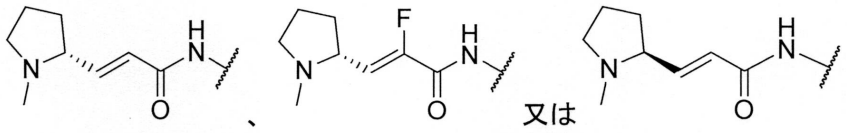

であり、もう１つの基は、

【化１８】

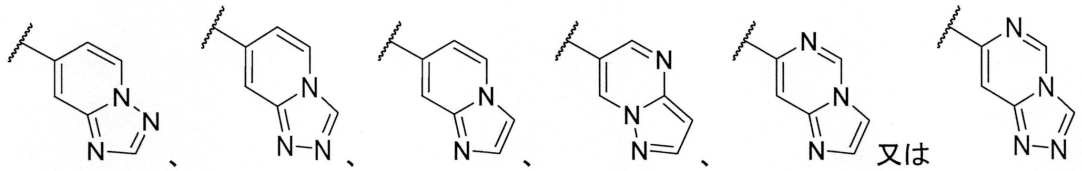



であり、好ましくは

【化１９】

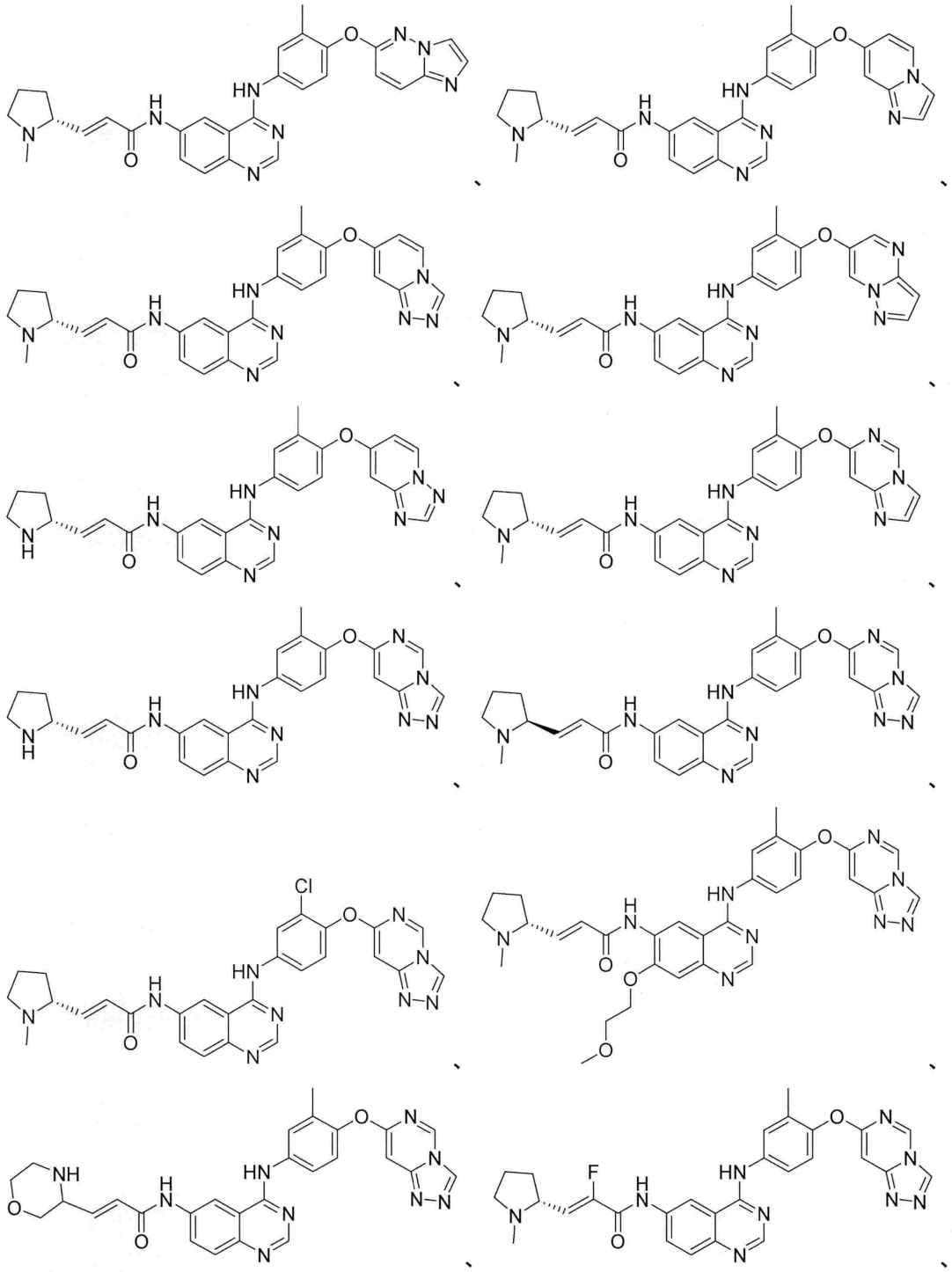


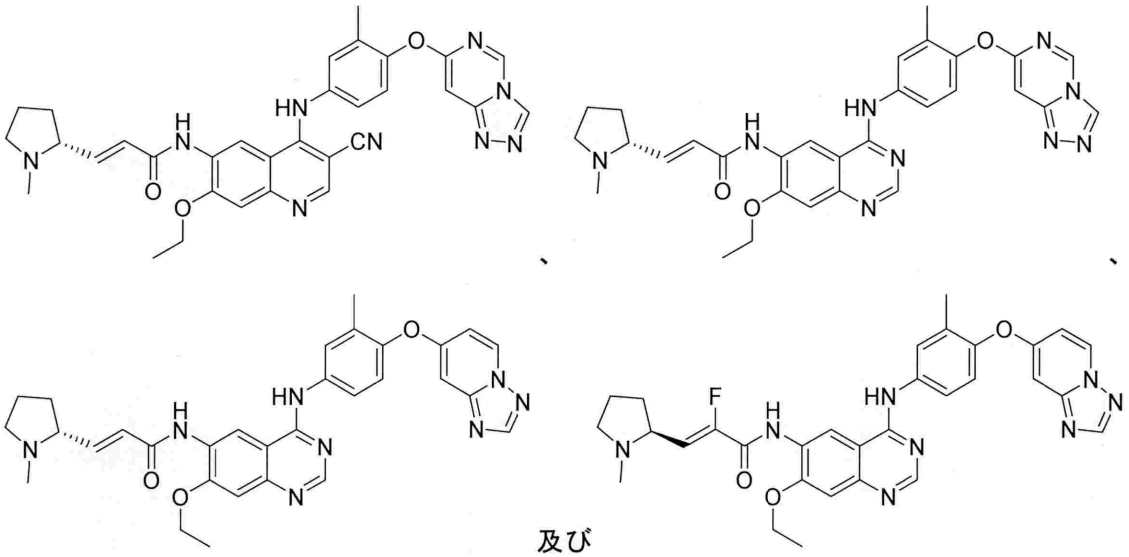
であり、
及び／又は、$R_2$は、
【化２０】



であり、
好ましくは、前記化学式１で表される構造を含む化合物は、（Ｒ，Ｚ）－Ｎ－（４－（（４－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イルオキシ）－３－メチルフェニル）アミノ）－７－エトキシキナゾリン－６－イル）－２－フルオロ－３－（１－メチルピロール－２－イル）アクリルアミド、ラパチニブ、ツカチニブ、ピロチニブ、ネラチニブ、

【化２１】





及び

から選択される一つ又は複数であることを特徴とする、請求項１又は４に記載の医薬組成物の使用。

【請求項８】

前記ＥｒｂＢ２突然変異体の突然変異型は、Ｄ７６９Ｈ、Ｄ７６９Ｙ、Ｒ８９６Ｃ、Ｖ７７７Ｌ、Ｇ７６６＞ＶＣ及びＡ７７５＿Ｇ７７６ｉｎｓＹＶＭＡのうちの一つ又は複数を含むことを特徴とする、請求項１～７の少なくとも一項に記載の医薬組成物の使用。

【請求項９】

前記ＥｒｂＢ２突然変異型は、Ｄ７６９Ｈ、Ｄ７６９Ｙ、Ｒ８９６Ｃ、Ｖ７７７Ｌ、Ｇ７６６＞ＶＣ又はＡ７７５＿Ｇ７７６ｉｎｓＹＶＭＡであり、前記化学式１で表される構造を含む化合物は、（Ｒ，Ｚ）－Ｎ－（４－（（４－（［１，２，４］トリアゾロ［１，５－ａ］ピリジン－７－イルオキシ）－３－メチルフェニル）アミノ）－７－エトキシキナゾリン－６－イル）－２－フルオロ－３－（１－メチルピロール－２－イル）アクリルアミドであり、

或いは、前記ＥｒｂＢ２突然変異型は、Ｄ７６９Ｈ、Ｄ７６９Ｙ、Ｒ８９６Ｃ、Ｖ７７７Ｌ又はＡ７７５＿Ｇ７７６ｉｎｓＹＶＭＡであり、前記化学式１で表される構造を含む化合物は、ラパチニブであり、

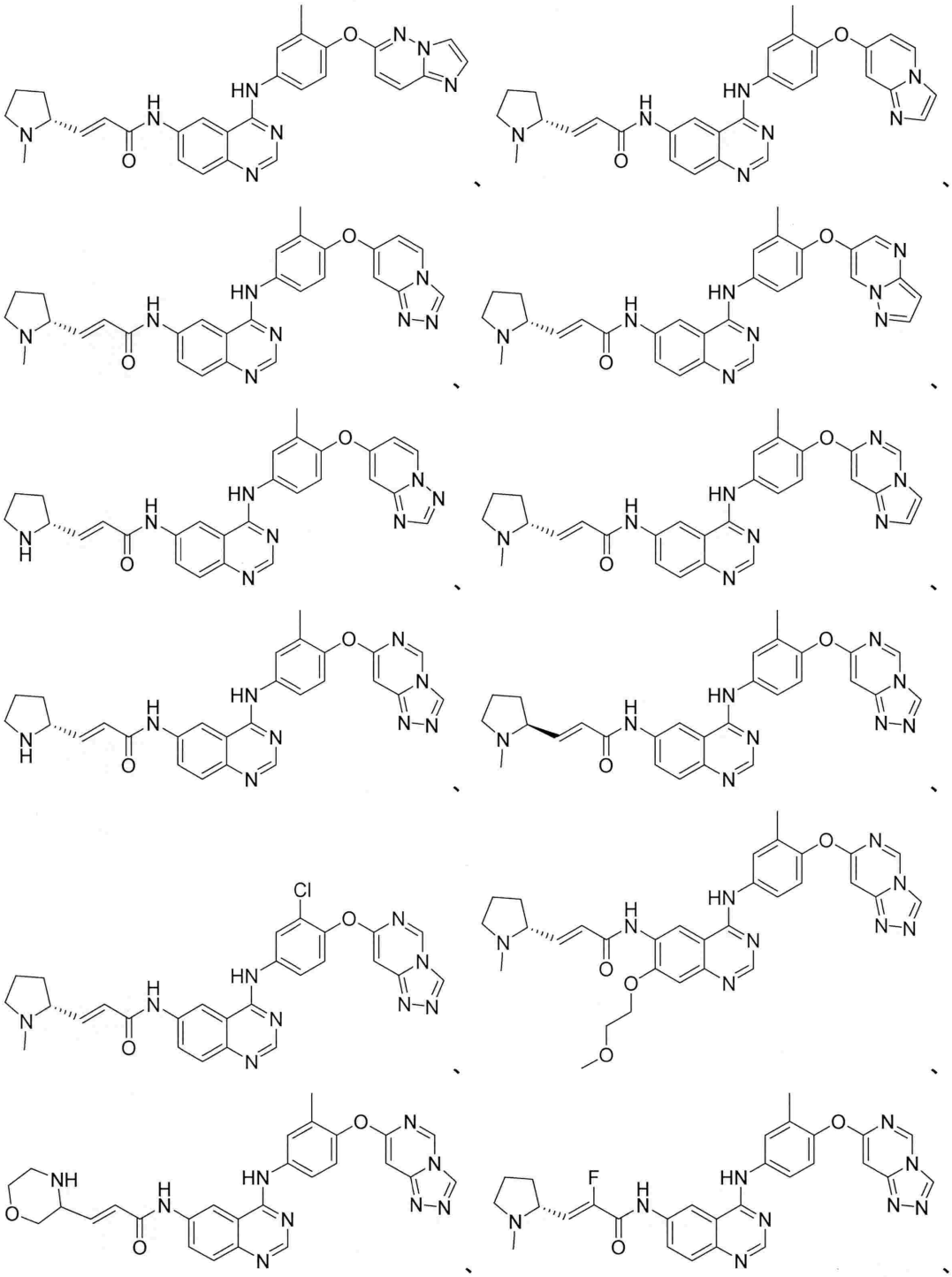
或いは、前記ＥｒｂＢ２突然変異型は、Ｄ７６９Ｈ、Ｄ７６９Ｙ、Ｒ８９６Ｃ又はＶ７７７Ｌであり、前記化学式１で表される構造を含む化合物は、ツカチニブであり、

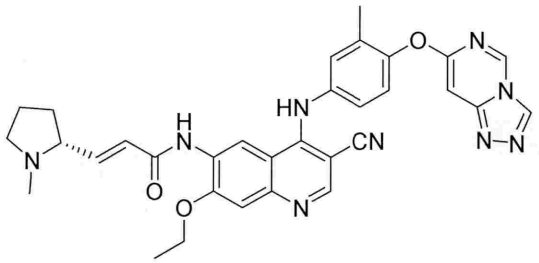
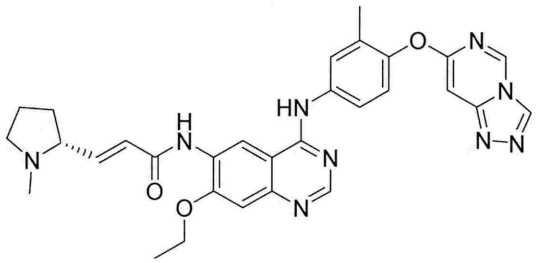
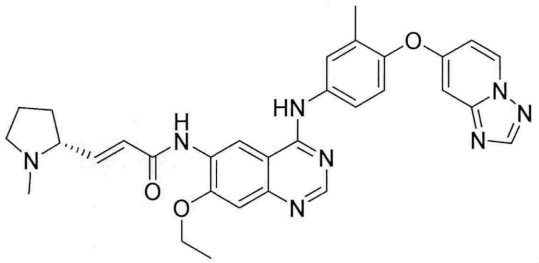
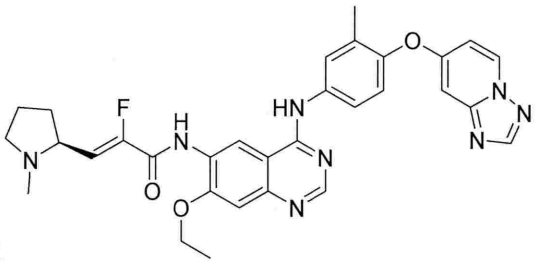
或いは、前記ＥｒｂＢ２突然変異型は、Ｄ７６９Ｈ、Ｄ７６９Ｙ、Ｒ８９６Ｃ又はＶ７７７Ｌであり、前記化学式１で表される構造を含む化合物は、ピロチニブであり、

或いは、前記ＥｒｂＢ２突然変異型は、Ｄ７６９Ｈ、Ｄ７６９Ｙ、Ｒ８９６Ｃ又はＶ７７７Ｌであり、前記化学式１で表される構造を含む化合物は、ネラチニブであり、

或いは、前記ＥｒｂＢ２突然変異型は、Ｄ７６９Ｈ、Ｄ７６９Ｙ、Ｒ８９６Ｃ又はＶ７７７Ｌであり、前記化学式１で表される構造を含む化合物は、下記の構造のいずれか一つであることを特徴とする、請求項８に記載の医薬組成物の使用。

【化２２】




、

、

又は


【請求項１０】
前記ＥｒｂＢ２突然変異関連疾患は、ＥｒｂＢ２突然変異がんであり、
前記ＥｒｂＢ２突然変異がんは、好ましくは、乳がん、結腸がん、頭頸部がん、膀胱がん、胃がん、卵巣がん、肝臓がん又は肺がんを含み、
前記肺がんは、さらに好ましくは非小細胞肺がんであることを特徴とする、請求項４～６の少なくとも一項に記載の医薬組成物の使用。
【請求項１１】
前記治療は、腫瘍の転移及び／又は増殖を阻害することであることを特徴とする、請求項４～６の少なくとも一項に記載の医薬組成物の使用。
【請求項１２】
前記医薬は、薬学的に許容される担体をさらに含むことを特徴とする、請求項１～１１の少なくとも一項に記載の医薬組成物の使用。
【請求項１３】
前記化学式１で表される構造を含む化合物は、前記医薬の唯一の有効成分であるか、或いは、他のＥｒｂＢ２突然変異阻害剤又はがん治療薬と一緒に有効成分として作用することを特徴とする、請求項１～１１の少なくとも一項に記載の医薬組成物の使用。
【請求項１４】
前記医薬における前記化学式１で表される構造を含む化合物の含有量は、治療有効量を達成する含有量であることを特徴とする、請求項１～１１の少なくとも一項に記載の医薬組成物の使用。
【手続補正２】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００６７
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００６７】
本発明のある実施形態において、前記ＥｒｂＢ２突然変異型は、Ｄ７６９Ｈ、Ｄ７６９Ｙ、Ｒ８９６Ｃ又はＶ７７７Ｌであり、前記化学式１で表される構造を含む化合物は、下記の構造のいずれか一つである：