

【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2年8月13日(2020.8.13)

【公表番号】特表2019-519593(P2019-519593A)

【公表日】令和1年7月11日(2019.7.11)

【年通号数】公開・登録公報2019-027

【出願番号】特願2018-568930(P2018-568930)

【国際特許分類】

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

A 6 1 K 45/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/498 (2006.01)

A 6 1 K 31/519 (2006.01)

A 6 1 K 31/4184 (2006.01)

A 6 1 K 31/52 (2006.01)

A 6 1 K 31/436 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/08 (2006.01)

A 6 1 P 1/04 (2006.01)

A 6 1 P 9/00 (2006.01)

A 6 1 P 17/06 (2006.01)

A 6 1 P 17/00 (2006.01)

A 6 1 P 11/06 (2006.01)

A 6 1 P 11/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 37/06 (2006.01)

A 6 1 P 9/10 (2006.01)

A 6 1 P 15/00 (2006.01)

A 6 1 P 1/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/00 (2006.01)

A 6 1 P 25/20 (2006.01)

A 6 1 P 13/12 (2006.01)

A 6 1 P 31/18 (2006.01)

C 0 7 D 401/12 (2006.01)

A 6 1 K 41/00 (2020.01)

A 6 1 K 47/55 (2017.01)

【 F I 】

C 0 7 D 403/04 C S P

C 0 7 D 401/04

A 6 1 K 45/00

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 35/00

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/498

A 6 1 K 31/519
 A 6 1 K 31/4184
 A 6 1 K 31/52
 A 6 1 K 31/436
 A 6 1 P 35/02
 A 6 1 P 29/00
 A 6 1 P 37/08
 A 6 1 P 1/04
 A 6 1 P 9/00
 A 6 1 P 17/06
 A 6 1 P 17/00
 A 6 1 P 11/06
 A 6 1 P 11/00
 A 6 1 P 37/02
 A 6 1 P 37/06
 A 6 1 P 9/10
 A 6 1 P 43/00 1 0 5
 A 6 1 P 15/00
 A 6 1 P 1/00
 A 6 1 P 25/00
 A 6 1 P 25/20
 A 6 1 P 13/12
 A 6 1 P 31/18
 C 0 7 D 401/12
 A 6 1 K 41/00
 A 6 1 K 47/55

【手続補正書】

【提出日】令和2年7月3日(2020.7.3)

【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

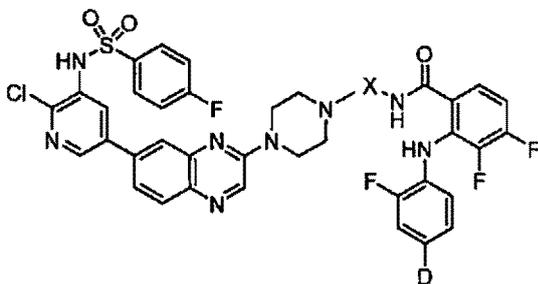
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

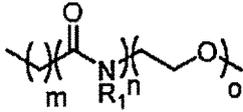
下記構造

【化1】



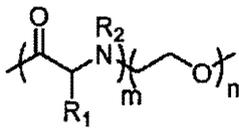
(式中、DはI、-C₁H₃又はC₂H₅-Rであり、R = アルキル又はアリールであり、

【化 7】



(R₁ は独立に H、アルキル又はアリールであり、式中、独立に m = 0 ~ 6 であり、 n = 1 ~ 6 であり、 o = 2 ~ 6 である)

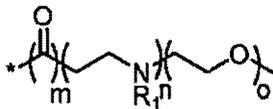
【化 8】



(R₁、R₂ は独立に H、アルキル又はアリールであり、式中、独立に m = 1 ~ 6 であり、 n = 2 ~ 6 である)

及び

【化 9】



(R₁ は独立に H、アルキル又はアリールであり、式中、独立に m = 0、1 であり、 n = 1 ~ 6 であり、 o = 2 ~ 6 である))

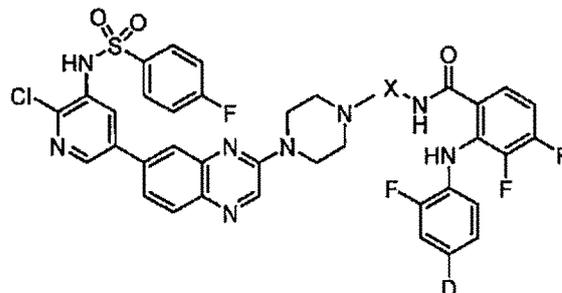
を有する化合物あるいはその医薬的に許容される塩。

【請求項 2】

下記構造

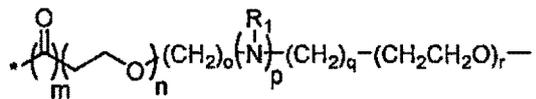
【化 10】

(a)



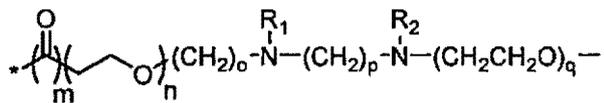
(式中、D は I、-C-CH₂ 又は C-C-R であり、R = アルキル又はアリールであり、及び X は以下からなる群から選択される :

【化 1 1】



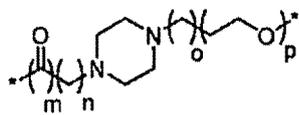
(R₁ は独立に、H、アルキル又はアリールであり、式中、独立に m = 0、1 であり、n = 0 ~ 6 であり、o = 0 ~ 6 であり、p = 0、1 であり、q = 0 ~ 6 であり、r = 2 ~ 6 である)

【化 1 2】



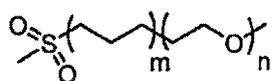
(式中、独立に m = 0、1 であり、n = 0 ~ 6 であり、o = 0 ~ 6 であり、p = 1 ~ 6 であり、q = 2 ~ 6 であり、及び R₁、R₂ は独立に H、アルキル又はアリールである)

【化 1 3】



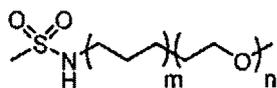
(式中、独立に m = 0、1 であり、n = 0 ~ 6 であり、o = 0 ~ 6 であり、p = 2 ~ 6 である)

【化 1 4】



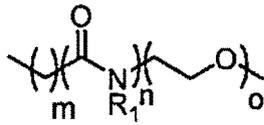
(式中、独立に m = 0 ~ 6 であり、n = 2 ~ 6 である)

【化 1 5】



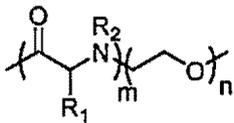
(式中、独立に m = 0 ~ 6 であり、n = 2 ~ 6 である)

【化 1 6】



(R_1 は独立に H、アルキル又はアリールであり、式中、独立に $m = 0 \sim 6$ であり、 $n = 1 \sim 6$ であり、 $o = 2 \sim 6$ である)

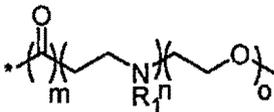
【化 1 7】



(R_1 、 R_2 は独立に H、アルキル又はアリールであり、式中、独立に $m = 1 \sim 6$ であり、 $n = 2 \sim 6$ である)

及び

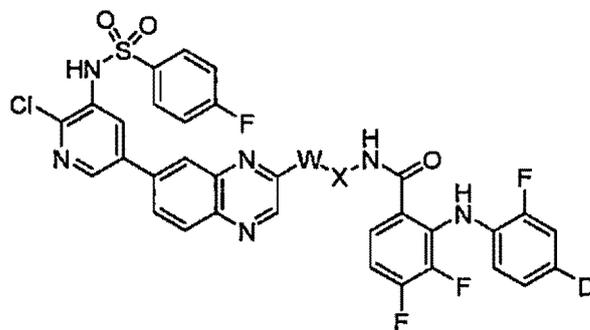
【化 1 8】



(R_1 は独立に H、アルキル又はアリールであり、式中、独立に $m = 0$ 、 1 であり、 $n = 1 \sim 6$ であり、 $o = 2 \sim 6$ である)) 並びに、

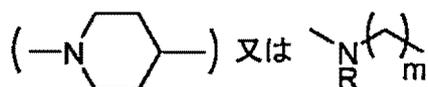
【化 1 9】

(b)

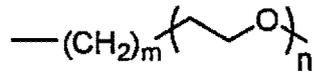


(式中、Wは

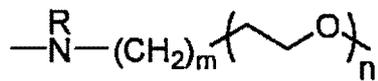
【化 2 0】



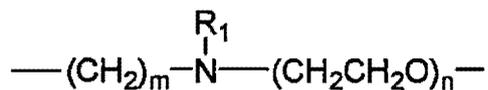
であり、及び R は H、アルキル又はアリールであり、及び m = 0、1 ~ 6 であり；
 D = I、- C CH、- C C - R であり、式中、R = アルキル又はアリールであり、式
 中、X は以下からなる群から選択される：
 【化 2 1】



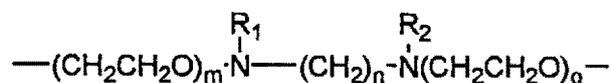
(式中、m = 0、1 ~ 6 であり、n = 1 ~ 6 であり、あるいは m 及び n の任意の組み合わせを含む)
 【化 2 2】



(式中、R は H、アルキル又はアリールであり、及び m = 0、1 ~ 6 であり、n = 1 ~ 6 であり、あるいは m 及び n の任意の組み合わせを含む)
 【化 2 3】



(R₁ = H、アルキル又はアリールであり、式中、m、n は独立に 1 ~ 6 である)
 【化 2 4】

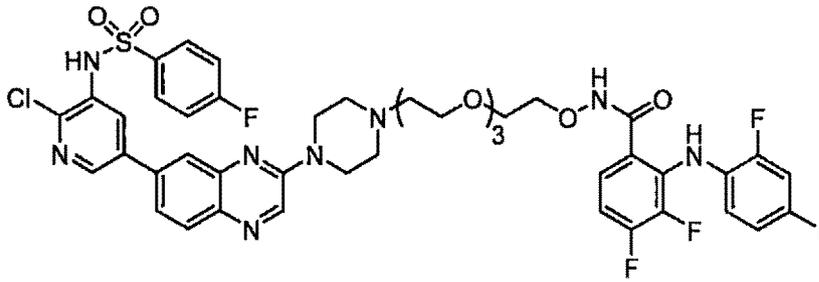


(R₁、R₂ は独立に H、アルキル又はアリールであり、及び m、n、o は独立に 1 ~ 6 である)

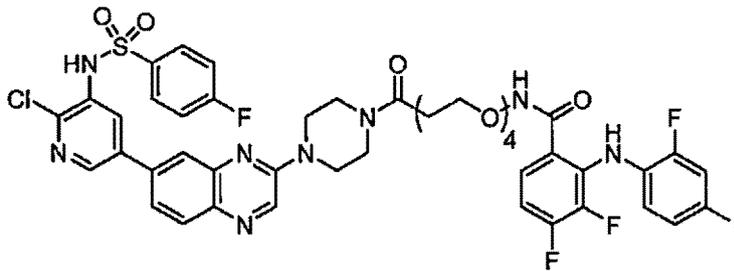
を有する化合物あるいはその医薬的に許容される塩。

【請求項 3】

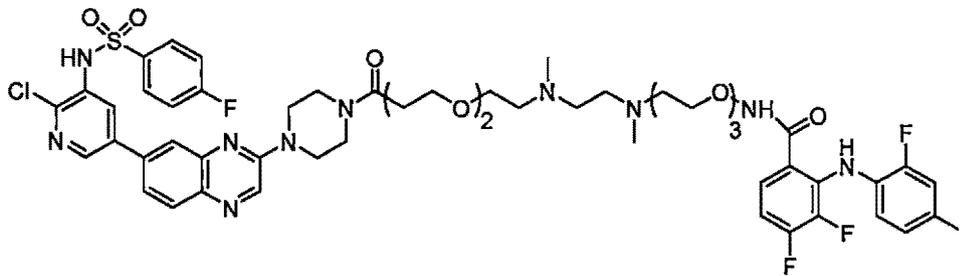
【化 2 5】



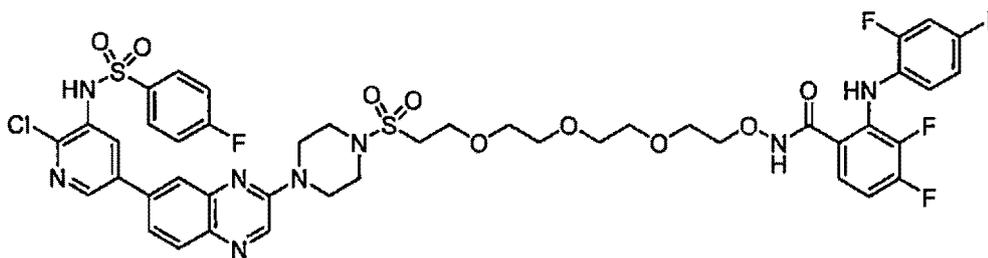
【化 2 6】



【化 2 7】

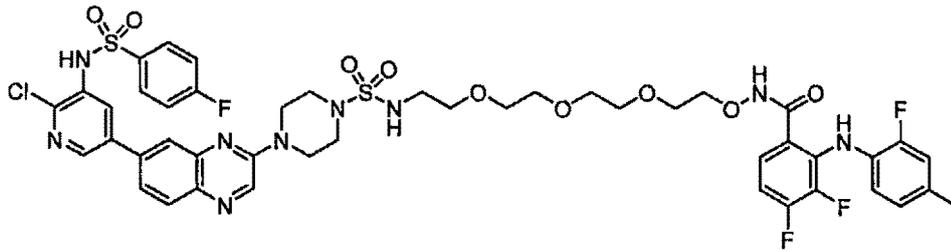


【化 2 8】



及び、

【化 2 9】



からなる群から選択される、化合物。

【請求項 4】

請求項 1 に記載の化合物と、医薬的に許容される担体又はビヒクルとを含む医薬組成物。

【請求項 5】

mTOR、MEK 及び PI3K のうちの少なくとも 1 つを阻害することによって奏効が得られる、疾患又は病態を治療する方法であって、治療有効量の請求項 1 に記載の化合物を、それを必要とする個体に投与することを含む、方法。

【請求項 6】

前記疾患又は病態が、段落番号 [0095] から [0097] 及び [0099] 中に開示されている疾患及び病態から選択される、請求項 5 に記載の方法。

【請求項 7】

前記疾患又は病態が癌である、請求項 6 に記載の方法。

【請求項 8】

【化 3 0】



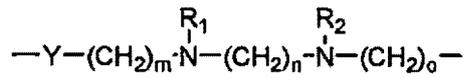
R₁、R₂ は独立に H、アルキル又はアリアルであり、m、n、o = 1、2、3、4 又は 5 である)

【化 3 1】



R₁、R₂ は独立に H、アルキル又はアリアルであり、m、n、o = 1、2、3、4 又は 5 である) 及び

【化 3 2】



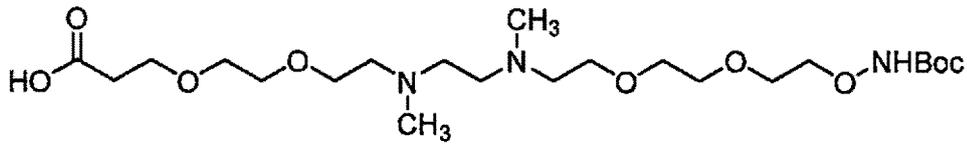
(Y = $-\overset{\text{O}}{\parallel}{C}-$ 又は無置換であり、

R₁、R₂ は独立に H、アルキル又はアリアルであり、m、n、o = 1、2、3、4 又は 5 である)

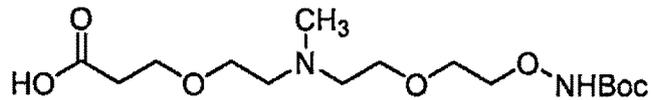
からなる群から選択される PI3K 阻害剤への MEK 阻害剤用リンカー。

【請求項 9】

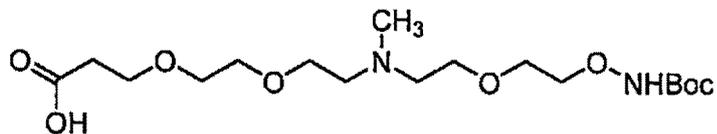
【化 3 3】



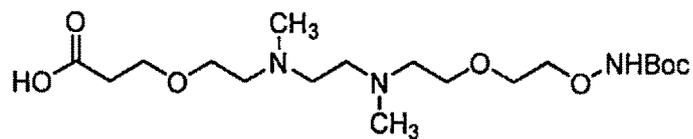
【化 3 4】



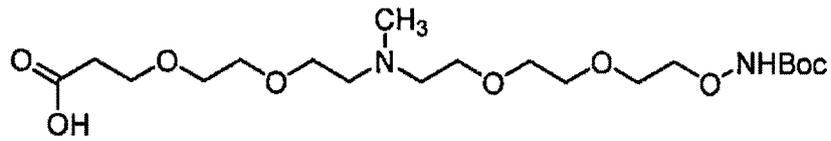
【化 3 5】



【化 3 6】



【化 3 7】



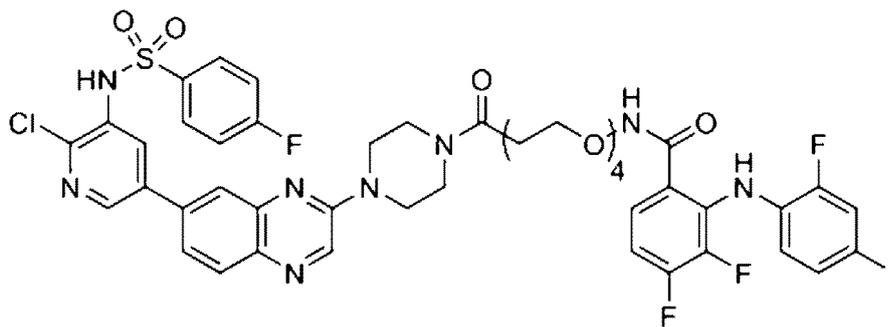
、並びに、

2 - [2 , 3 - ビス (2 - ヒドロキシエトキシ) プロポキシ] エタノール及びペンタエリスリトールからなる群から選択される、PI3K阻害剤へのMEK阻害剤用リンカー。

【請求項 1 0】

下記構造

【化 3 8】

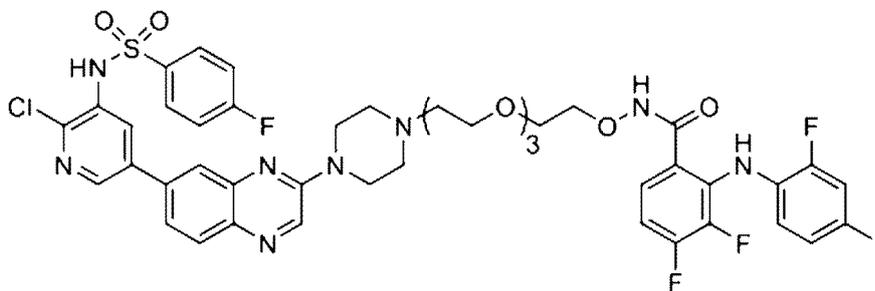


を有する請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 1 1】

下記構造

【化 3 9】



を有する請求項 3 に記載の化合物。