

【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 3 年 5 月 27 日 (2021.5.27)

【公表番号】特表 2020-519568 (P2020-519568A)

【公表日】令和 2 年 7 月 2 日 (2020.7.2)

【年通号数】公開・登録公報 2020-026

【出願番号】特願 2019-556888 (P2019-556888)

【国際特許分類】

C 0 7 D 317/54 (2006.01)

C 0 7 H 15/04 (2006.01)

C 0 7 D 405/14 (2006.01)

C 0 7 D 407/04 (2006.01)

C 0 7 D 405/12 (2006.01)

C 0 7 D 407/12 (2006.01)

C 0 7 D 405/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/7048 (2006.01)

A 6 1 K 31/401 (2006.01)

A 6 1 K 31/36 (2006.01)

A 6 1 K 31/47 (2006.01)

A 6 1 K 31/136 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

C 0 7 C 311/08 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 317/54

C 0 7 H 15/04 B

C 0 7 D 405/14

C 0 7 D 407/04

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 407/12

C 0 7 D 405/04

A 6 1 K 31/7048

A 6 1 K 31/401

A 6 1 K 31/36

A 6 1 K 31/47

A 6 1 K 31/136

A 6 1 P 35/00

C 0 7 C 311/08

【手続補正書】

【提出日】令和 3 年 4 月 13 日 (2021.4.13)

【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

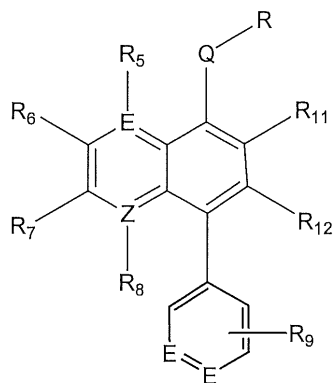
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I I I で表される化合物。

【化 1】



(式中、EとZは、C、O、N、S、並びにN・HClであるNの塩から選択され、QはO、S、 $-\text{CH}_2\text{O}-$ 、または $-\text{NY}'$ であり、Y'は-H、アルキル、 SOOC H_3 から選択され、

E及び/又はZが-Cの場合、 R^5 は-Hまたは-Clであり、

R^6 と R^7 は、各々独立して、-H、アルコキシ、アルキル、置換又は非置換芳香族基、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NO}_2$ 、 $-\text{NHCOCH}_3$ 、 $-\text{CN}$ 、 $-\text{O}-$ 、ハロゲン、 $-\text{OCF}_3$ から選択されるか、又は R^6 と R^7 が一緒になって複素環を形成し、

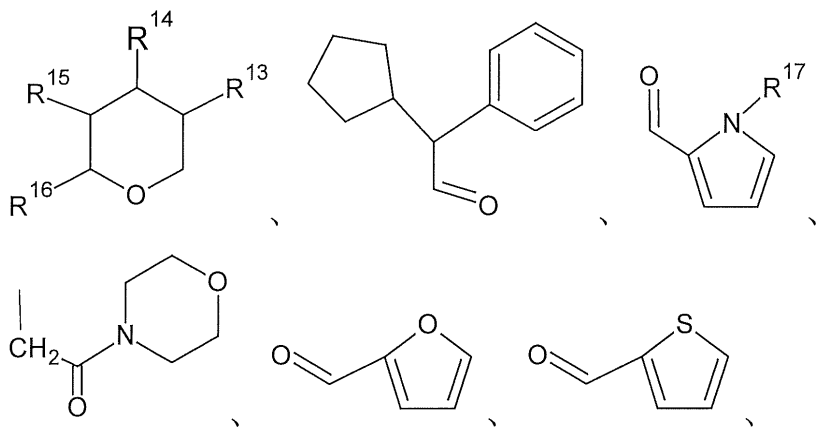
E及び/又はZが-Cの場合、 R^8 は-Hまたは-Clであり、

R_9 は $-\text{CH}_2-\text{O}-\text{CH}_2-$ 、 $-\text{COOH}$ または-Xであり、XはF、Cl、Br、 $-\text{CH}_3$ であるアルキル、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{OMe}$ であるアルコキシ、 NHCOCH_3 、H、 NH_2 とすることができ、

R^{11} と R^{12} は、各々独立して、-Hから選択されるか、又は R^{11} と R^{12} とが一緒になってラクトン類および $-\text{C}(\text{O})\text{OC}_2\text{H}_5$ である $-\text{C}(\text{O})\text{O}-$ アルキルから選択される置換又は非置換の5員環又は6員環を形成し、

Rは、下記から選択され：

【化 2】



-H、 $-\text{C}(\text{O})\text{CH}_2\text{Cl}$ 、 $-\text{SOO}-\text{CH}_3$ 、 $-\text{SOOPh}$ 、 $-\text{CH}_2\text{C}(\text{O})\text{N}(\text{CH}_3)_2$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NHPh}$ 、 $-\text{C}(\text{O})\text{NHPhOH}$ 、 $-\text{C}(\text{S})\text{NHPh}$ 、 $-\text{CH}_2\text{Ph}$ 、 $-\text{COAr}$ 、 $-\text{SOOAr}$ 、 $-\text{CONHAr}$ 、 $-\text{CH}_2\text{Ar}$ 、 $-\text{CSNHAr}$ 、

R^{13} は $-\text{OH}$ 、 $-\text{NH}_2$ 、 $-\text{NHCOCH}_3$ 、 $\text{X} = \text{F}$ 、Cl、Br、アルキル、アセチル、 C_3-C_8 アシル基から選択され、

R^{14} はアルコキシ、 $-\text{OMe}$ 、 $-\text{OH}$ 、 NH_2 、 $-\text{NHCOCH}_3$ 、 $\text{X} = \text{F}$ 、Cl、Br、アルキル、アセチル、 C_3-C_8 アシル基から選択され、

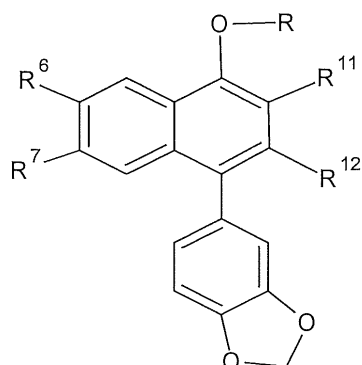
R^{15} はアルコキシ、 $-\text{OMe}$ 、 $-\text{OH}$ 、 $-\text{H}$ 、Br、 NH_2 、 $\text{X} = \text{F}$ 、Cl、Br、アルキル、アセチル、 C_3-C_8 アシル基から選択され、

R^{16} は - H、- CH_2OH 、- OH、アルキル、アルコキシから選択され、
 R^{17} はアルキルから選択される。)

【請求項 2】

式 I V で表される化合物。

【化 3】

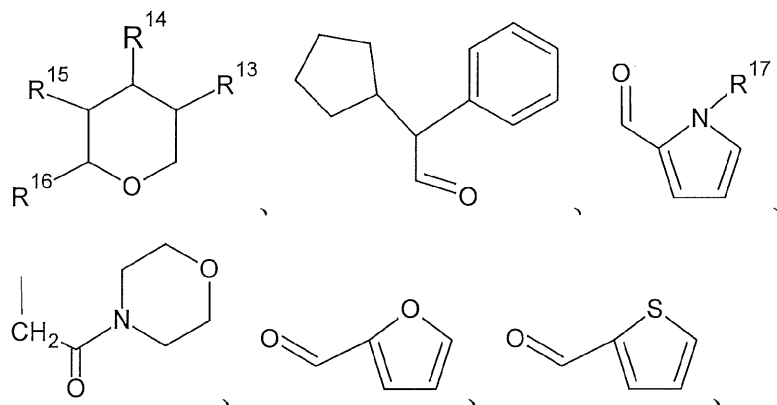


(式中、 R^6 と R^7 は、各々独立して、- H、アルコキシ、アルキル、置換又は非置換芳香族基、- NH_2 、- NO_2 、- $NHCOCH_3$ 、- CN 、- O -、ハロゲン、- OCF_3 から選択されるか、又は R^6 と R^7 が一緒になって複素環を形成し、

R^{11} と R^{12} は、各々独立して、- H から選択されるか、又は R^{11} と R^{12} とが一緒になってラクトン類および - $C(O)OC_2H_5$ である - $C(O)O$ - アルキルから選択される置換又は非置換の 5 員環又は 6 員環を形成し、

R は、下記から選択され：

【化 4】



- H、- $C(O)CH_2Cl$ 、- $SOO-CH_3$ 、- $SOOPh$ 、- $CH_2C(O)N(CH_3)_2$ 、- $C(O)NHPh$ 、- $C(O)NHPhOH$ 、- $C(S)NHPh$ 、- CH_2Ph 、- $COAr$ 、- $SOOAr$ 、- $CONHAr$ 、- CH_2Ar 、- $CSNHAr$ 、

R^{13} は - OH、- NH_2 、- $NHCOCH_3$ 、 $X = F, Cl, Br$ 、アルキル、アセチル、 $C_3 - C_8$ アシル基から選択され、

R^{14} はアルコキシ、- OMe、- OH、 NH_2 、- $NHCOCH_3$ 、 $X = F, Cl, Br$ 、アルキル、アセチル、 $C_3 - C_8$ アシル基から選択され、

R^{15} はアルコキシ、- OMe、- OH、- H、 Br, NH_2 、 $X = F, Cl, Br$ 、アルキル、アセチル、 $C_3 - C_8$ アシル基から選択され、

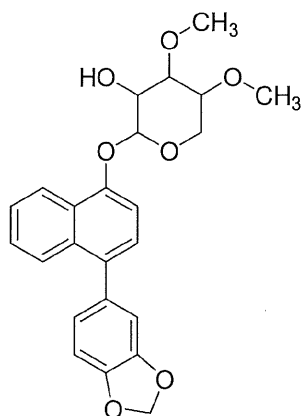
R^{16} は - H、- CH_2OH 、- OH、アルキル、アルコキシから選択され、

R^{17} はアルキルから選択される。)

【請求項 3】

式 V で表される化合物である、請求項 2 に記載の化合物。

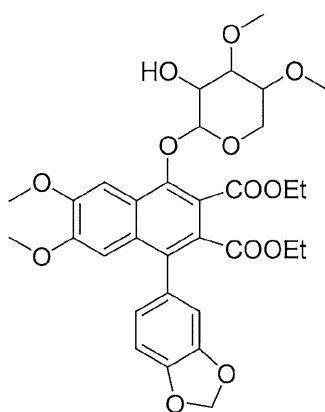
【化 5】



【請求項 4】

式 V I で表される化合物である、請求項 2 に記載の化合物。

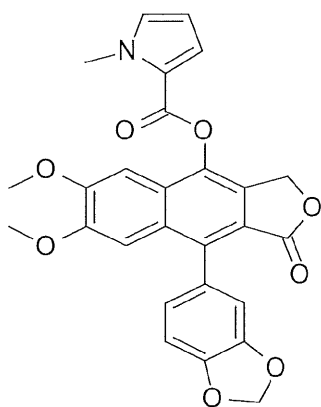
【化 6】



【請求項 5】

式 V I I で表される化合物である、請求項 2 に記載の化合物。

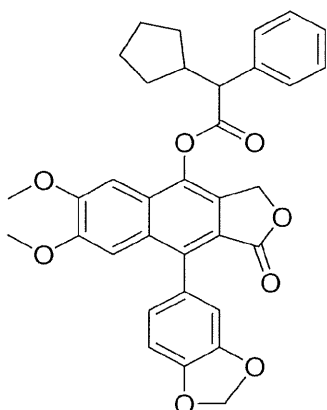
【化 7】



【請求項 6】

式 V I I I で表される化合物である、請求項 2 に記載の化合物。

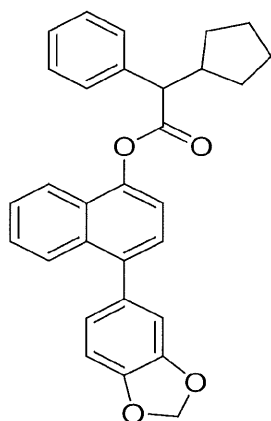
【化 8】



【請求項 7】

式 I X で表される化合物である、請求項 2 に記載の化合物。

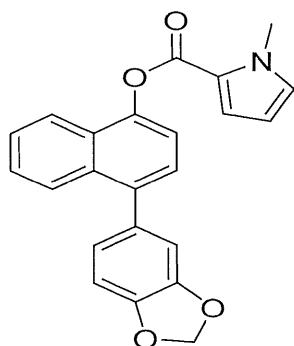
【化 9】



【請求項 8】

式 X で表される化合物である、請求項 2 に記載の化合物。

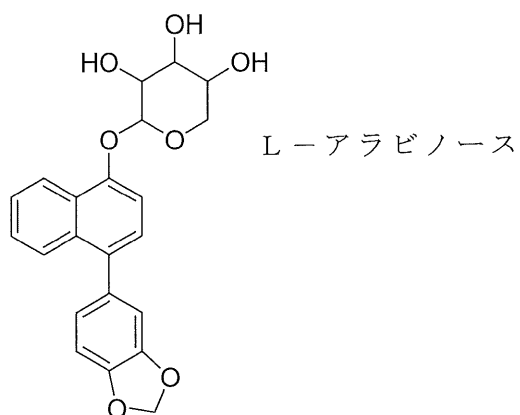
【化 10】



【請求項 9】

式 X I で表される化合物である、請求項 2 に記載の化合物。

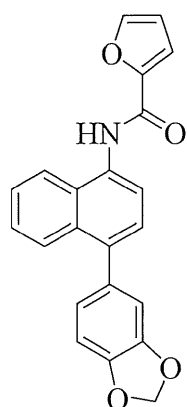
【化 1 1】



【請求項 10】

式 X I I で表される化合物である、請求項 2 に記載の化合物。

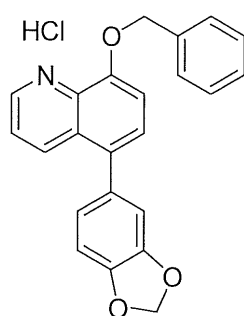
【化 1 2】



【請求項 1 1】

式ⅩⅠⅠⅠで表される化合物である、請求項２に記載の化合物。

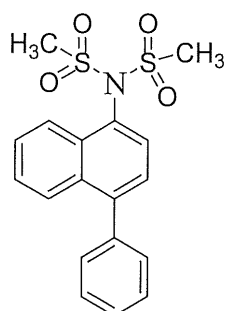
【化 1 3】



【請求項 1 2】

式 X I V で表される化合物である、請求項 1 に記載の化合物。

【化 1 4】



【請求項 13】

癌の治療用である、式Ⅴ～ⅩⅣで表される化合物。

【請求項 14】

癌の治療用である、式Ⅴ又はⅥで表される化合物。

【請求項 15】

前記癌は、乳癌、口腔癌、前立腺癌、脳癌、血液癌、骨髄癌、肝臓癌、膵臓癌、皮膚癌、腎臓癌、結腸癌、卵巣癌、肺癌、精巣癌、陰茎癌、甲状腺癌、副甲状腺癌、下垂体癌、胸腺癌、網膜癌、ブドウ膜癌、結膜癌、脾臓癌、頭部癌、頸部癌、気管癌、胆嚢癌、直腸癌、唾液腺癌、副腎癌、咽頭癌、食道癌、リンパ節癌、汗腺癌、皮脂腺癌、筋肉癌、心臓癌及び胃癌である、請求項 13 に記載の癌の治療用の式Ⅴ～ⅩⅣで表される化合物。

【請求項 16】

前記癌は、乳癌、または前立腺癌である、請求項 15 に記載の癌の治療用である式Ⅴ又はⅥで表される化合物。

【請求項 17】

式Ⅴ～式ⅩⅣで表される化合物と、担体、アジュバント、媒体又はそれらの混合物等の薬学的に許容し得る賦形剤とを含む医薬組成物。

【請求項 18】

乳癌、口腔癌、前立腺癌、脳癌、血液癌、骨髄癌、肝臓癌、膵臓癌、皮膚癌、腎臓癌、結腸癌、卵巣癌、肺癌、精巣癌、陰茎癌、甲状腺癌、副甲状腺癌、下垂体癌、胸腺癌、網膜癌、ブドウ膜癌、結膜癌、脾臓癌、頭部癌、頸部癌、気管癌、胆嚢癌、直腸癌、唾液腺癌、副腎癌、咽頭癌、食道癌、リンパ節癌、汗腺癌、皮脂腺癌、筋肉癌、心臓癌及び胃癌等の癌の治療用である請求項 17 に記載の医薬組成物。

【請求項 19】

前記癌は乳癌、前立腺癌である、請求項 17 ～ 18 に記載の医薬組成物。