

【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 12 月 23 日 (2021.12.23)

【公表番号】特表 2021-512046 (P2021-512046A)

【公表日】令和 3 年 5 月 13 日 (2021.5.13)

【年通号数】公開・登録公報 2021-022

【出願番号】特願 2020-527111 (P2020-527111)

【国際特許分類】

C 07H 9/02 (2006.01)

A 61P 43/00 (2006.01)

A 61P 35/00 (2006.01)

A 61P 35/04 (2006.01)

A 61K 39/395 (2006.01)

A 61K 31/7048 (2006.01)

【FI】

C 07H 9/02 C S P

A 61P 43/00 1 0 5

A 61P 35/00

A 61P 35/04

A 61P 43/00 1 2 1

A 61K 39/395 N

A 61K 39/395 T

A 61K 39/395 D

A 61K 39/395 E

A 61K 31/7048

【手続補正書】

【提出日】令和 3 年 11 月 15 日 (2021.11.15)

【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

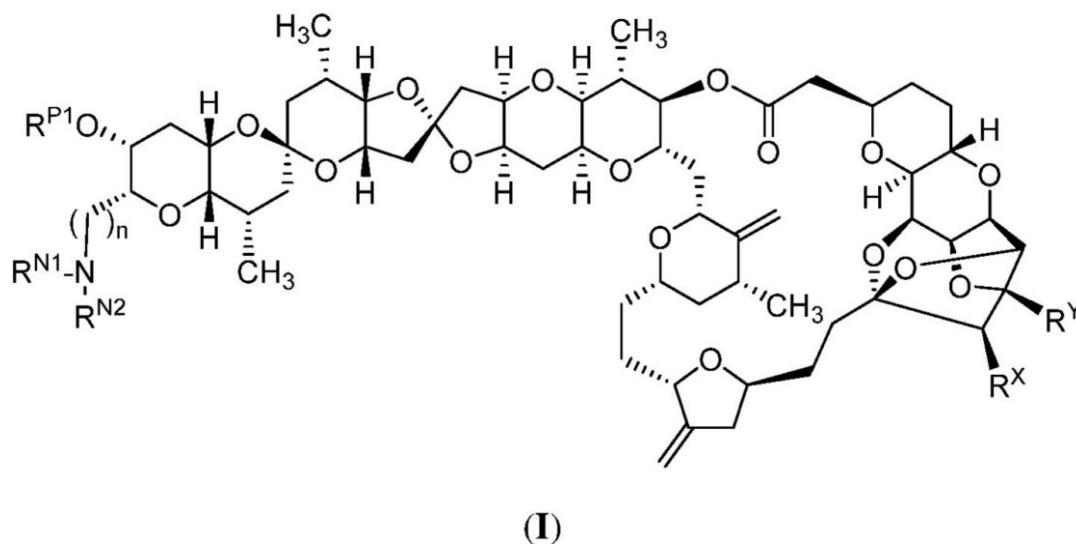
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) :

【化 1】



式中：

R^{N1} および R^{N2} は、独立して、水素、任意に置換されていてもよいアルキル、任意に置換されていてもよいアシル、または窒素保護基であるか、任意に、 R^{N1} および R^{N2} は、介在原子と一緒に連結して、任意に置換されていてもよいヘテロシクリルまたは任意に置換されていてもよいヘテロアリールを形成し；

R^{P1} は、水素、任意に置換されていてもよいアルキル、任意に置換されていてもよいアシル、または酸素保護基であり；

R^X は、水素または $-OR^{Xa}$ であり；

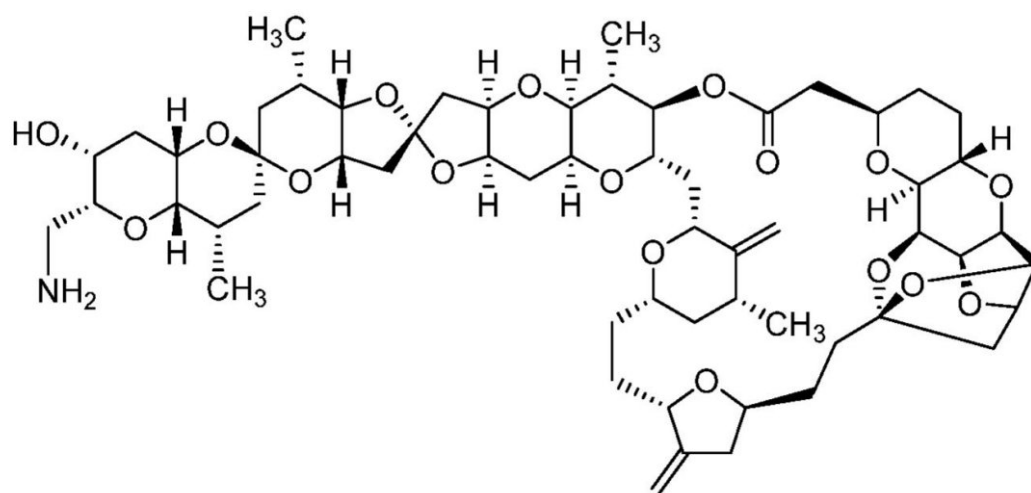
R^Y は、水素または $-OR^{Ya}$ であり；

R^{Xa} および R^{Ya} は、独立して、水素、任意に置換されていてもよいアルキル、任意に置換されていてもよいアシル、または酸素保護基であるか、任意に、 R^{Xa} および R^{Ya} は、介在原子と一緒に連結して、任意に置換されていてもよいヘテロシクリルを形成し；および

n は、1 または 2 である、

で表される化合物またはその薬学的に許容し得る塩または立体異性体であるが、化合物が、以下：

【化 2】

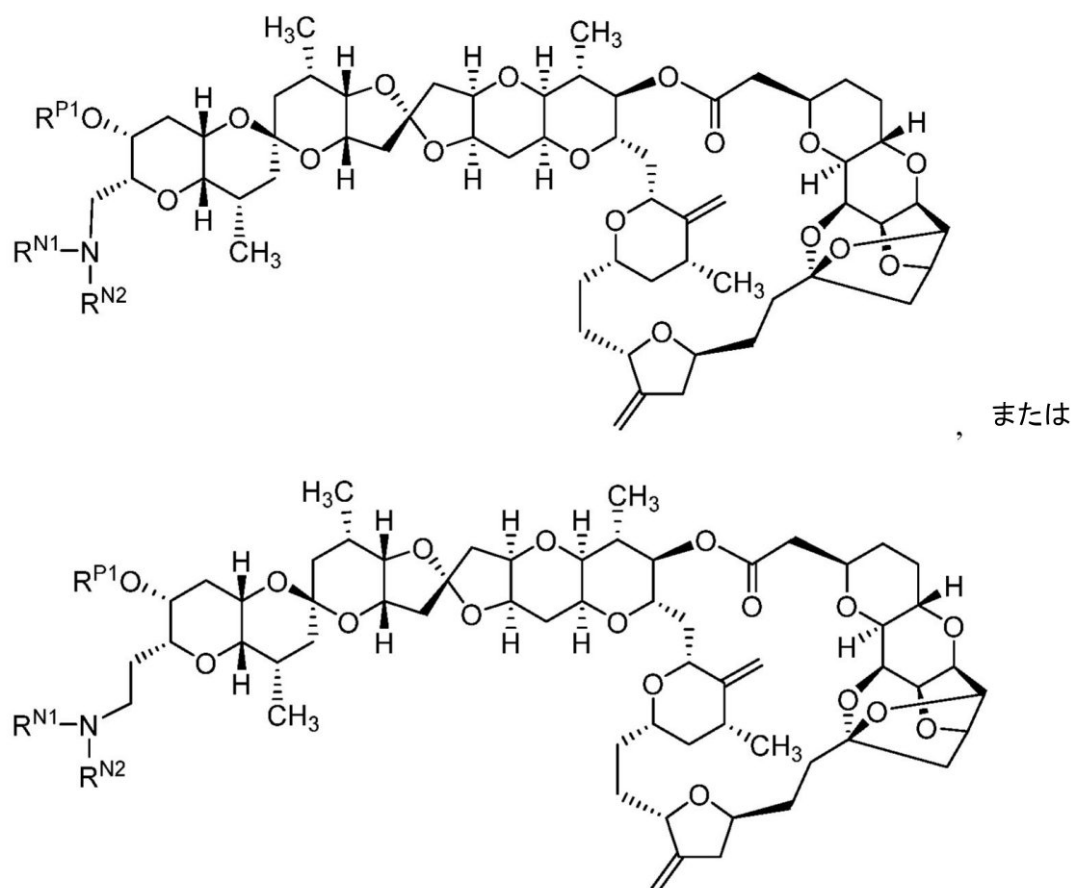


またはその薬学的に許容し得る塩でないことを条件とする、前記化合物またはその薬学的に許容し得る塩または立体異性体。

【請求項 2】

化合物が、以下の式：

【化 3】

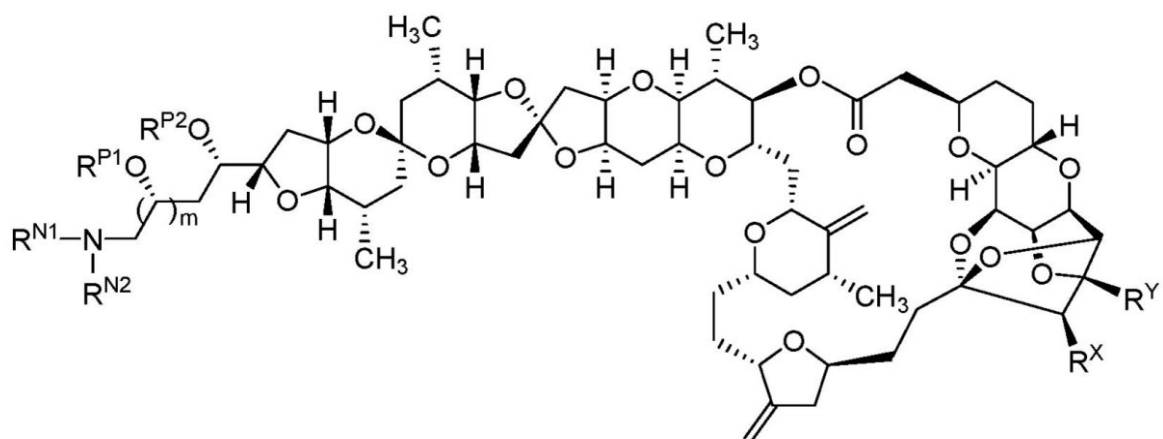


の 1 つまたはその薬学的に許容し得る塩または立体異性体である、請求項 1 に記載の化合物。

【請求項 3】

式 (II)：

【化 4】



(II)

式中：

R^{N1} および R^{N2} は、独立して、水素、任意に置換されていてもよいアルキル、任意に置換されていてもよいアシル、または窒素保護基であるか、任意に、 R^{N1} および R^{N2} は、介在原子と一緒に連結して、任意に置換されていてもよいヘテロシクリルまたは任意に置換されていてもよいヘテロアリールを形成し；

R^{P1} および R^{P2} は、独立して、水素、任意に置換されていてもよいアルキル、任意に置換されていてもよいアシル、または酸素保護基であり；

R^X は、水素または $-OR^{Xa}$ であり；

R^Y は、水素または $-OR^{Ya}$ であり；

R^{Xa} および R^{Ya} は、独立して、水素、任意に置換されていてもよいアルキル、任意に置換されていてもよいアシル、または酸素保護基であるか、任意に、 R^{Xa} および R^{Ya} は、介在原子と一緒に連結して、任意に置換されていてもよいヘテロシクリルを形成し；

および

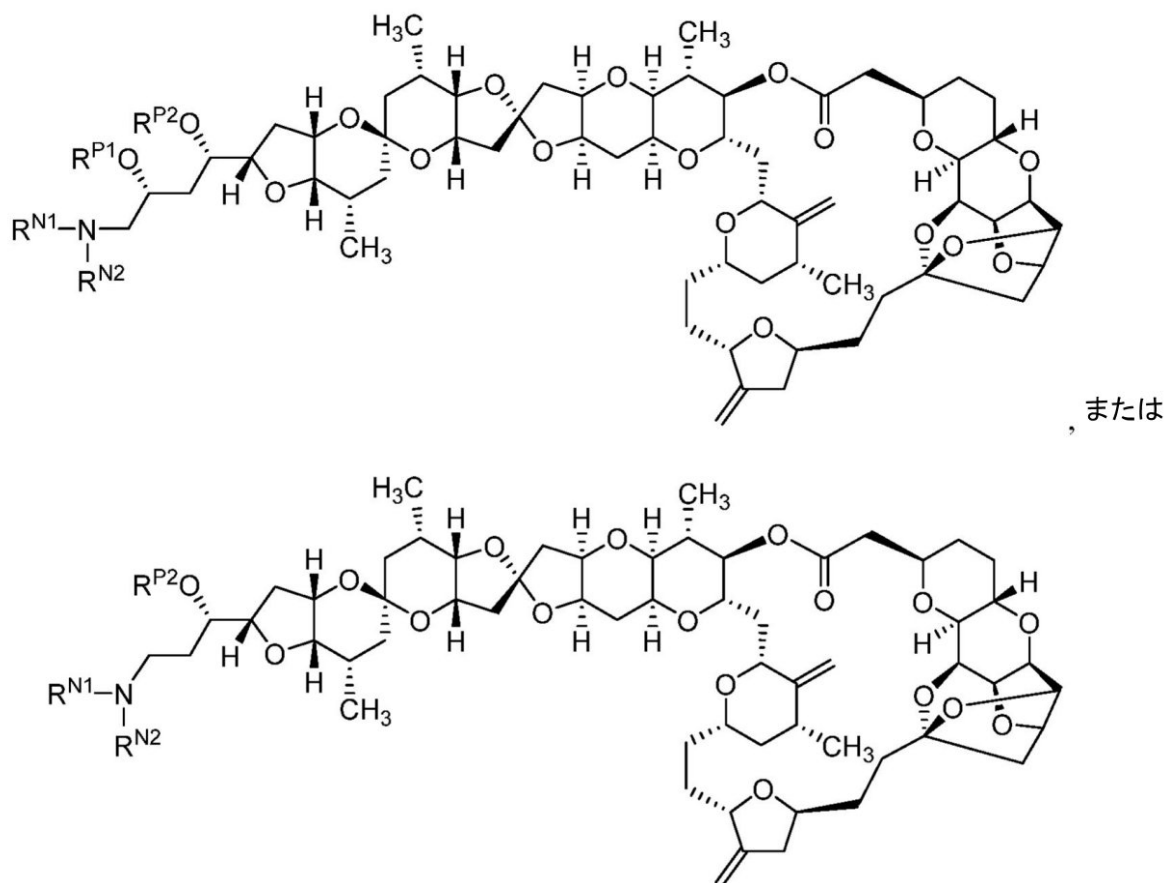
m は、0 または 1 である、

で表される化合物またはその薬学的に許容し得る塩または立体異性体。

【請求項 4】

化合物が、以下の式：

【化 5】

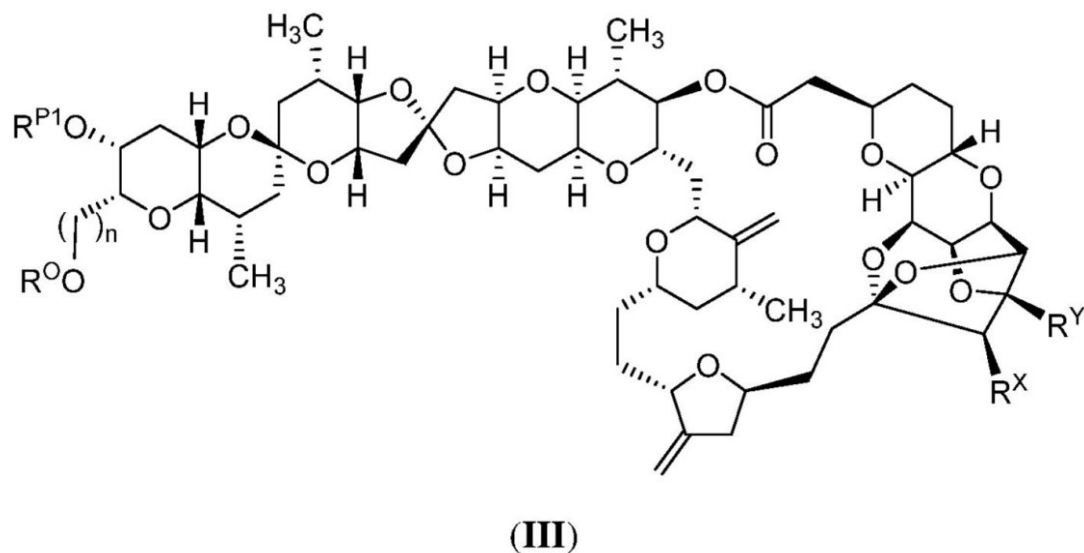


の 1 つまたはその薬学的に許容し得る塩または立体異性体である、請求項 3 に記載の化合物。

【請求項 5】

式 (III)：

【化 6】



式中：

R^O は、水素、任意に置換されていてもよいアルキル、任意に置換されていてもよいアシル、または酸素保護基であり；

R^{P1} は、水素、任意に置換されていてもよいアルキル、任意に置換されていてもよいアシル、または酸素保護基であり；

R^X は、水素または $-OR^{Xa}$ であり；

R^Y は、水素または $-OR^{Ya}$ であり；

R^{Xa} および R^{Ya} は、独立して、水素、任意に置換されていてもよいアルキル、任意に置換されていてもよいアシル、または酸素保護基であるか、任意に、 R^{Xa} および R^{Ya} は、介在原子と一緒に連結して、任意に置換されていてもよいヘテロシクリルを形成し；
および

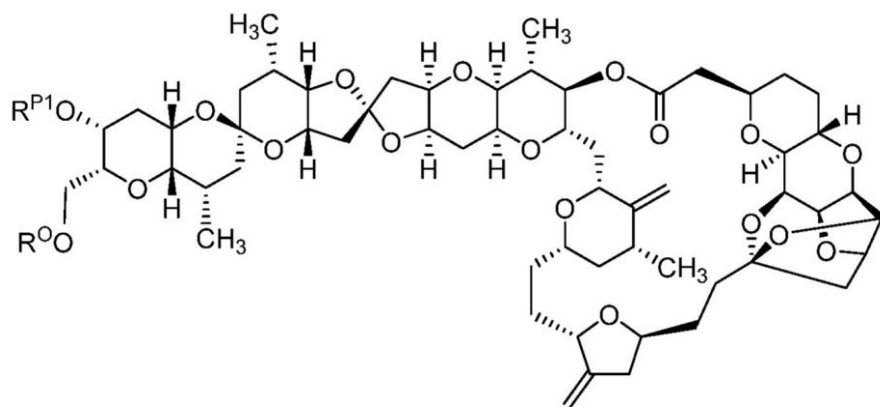
n は、1 または 2 である、

で表される化合物またはその薬学的に許容し得る塩または立体異性体。

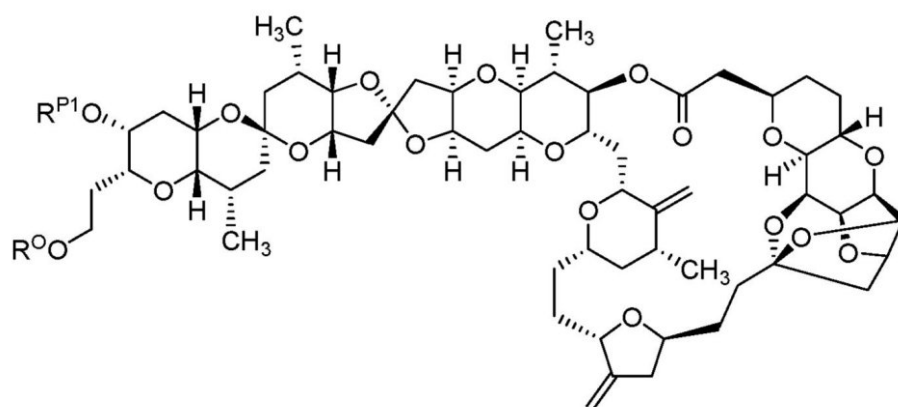
【請求項 6】

化合物が、以下の式：

【化 7】



, または



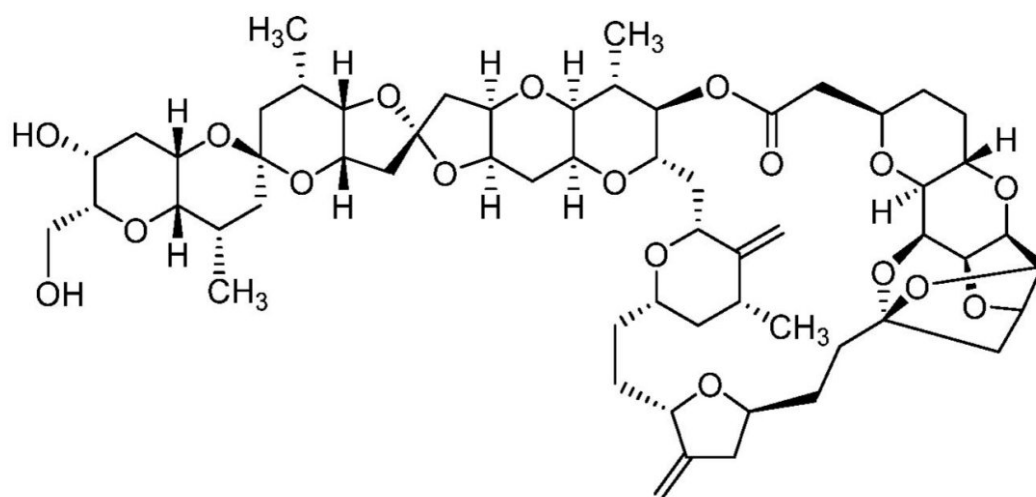
;

の 1 つまたはその薬学的に許容し得る塩または立体異性体である、請求項 5 に記載の化合物。

【請求項 7】

化合物が、以下：

【化 8】

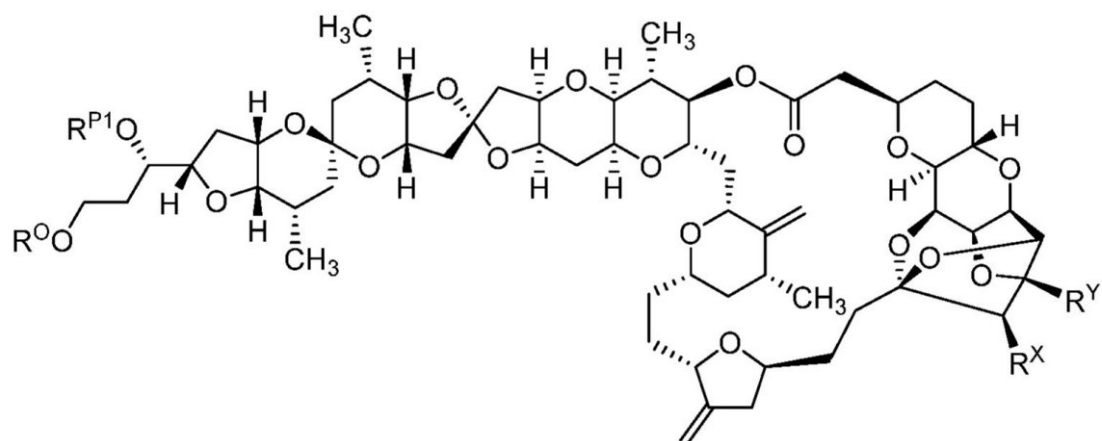


またはその薬学的に許容し得る塩でないことを条件とする、請求項 5 または 6 に記載の化合物。

【請求項 8】

式 (I V)：

【化 9】



(IV)

式中：

R⁰ は、水素、任意に置換されていてもよいアルキル、任意に置換されていてもよいアシル、または酸素保護基であり；

R^{P1} は、水素、任意に置換されていてもよいアルキル、任意に置換されていてもよいアシル、または酸素保護基であり；

R^X は、水素または -OR^{Xa} であり；

R^Y は、水素または -OR^{Ya} であり；および

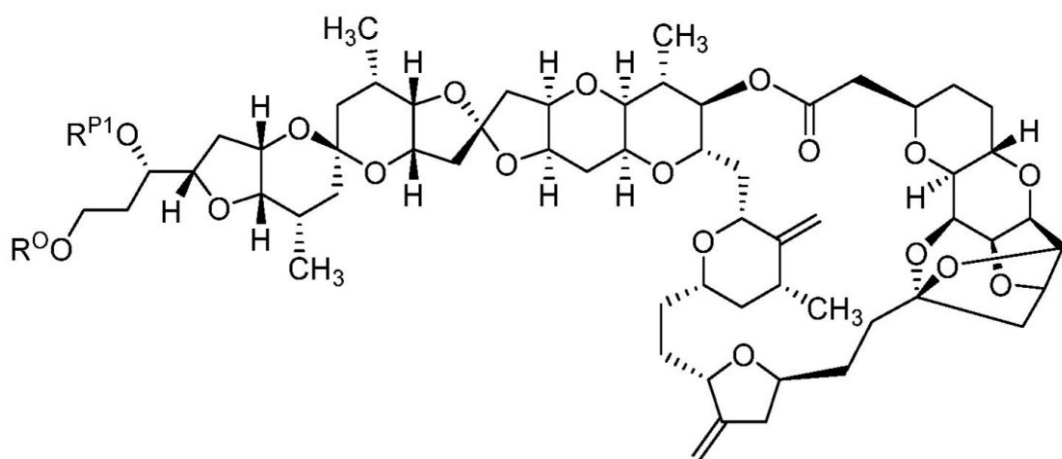
R^{Xa} および R^{Ya} は、独立して、水素、任意に置換されていてもよいアルキル、任意に置換されていてもよいアシル、または酸素保護基であるか、任意に、R^{Xa} および R^{Ya} は、介在原子と一緒に連結して、任意に置換されていてもよいヘテロシクリルを形成する、

で表される化合物またはその薬学的に許容し得る塩または立体異性体。

【請求項 9】

化合物が、式：

【化 10】



またはその薬学的に許容し得る塩または立体異性体である、請求項 8 に記載の化合物。

【請求項 10】

n が 1 である、請求項 1 または 5 に記載の化合物またはその薬学的に許容し得る塩または立体異性体。

【請求項 11】

m が 1 である、請求項 3 に記載の化合物またはその薬学的に許容し得る塩または立体異性体。

【請求項 1 2】

R^{N1} および R^{N2} の少なくとも 1 つが水素であり；任意で

R^{N1} および R^{N2} の両方が水素である；

請求項 1、2、3、4、10 および 11 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容し得る塩または立体異性体。

【請求項 1 3】

R^0 が水素、または任意に置換されていてもよい $C_1 \sim 6$ アルキルであり；任意で

R^0 が、任意に置換されていてもよい $C_1 \sim 3$ アルキルであり；任意で

R^0 が、非置換の $C_1 \sim 3$ アルキルであり；任意で

R^0 が、メチルである；

請求項 5、6、および 8 ~ 10 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容し得る塩または立体異性体。

【請求項 1 4】

R^{P2} が、水素である、請求項 3、4、11 および 12 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩または立体異性体。

【請求項 1 5】

R^{P1} が、水素である、請求項 1 ~ 6 および 8 ~ 14 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩または立体異性体。

【請求項 1 6】

(i) R^X が、水素である；または

(ii) R^X が、 $-OR^X$ であり；任意で R^X が、 $-OH$ である；および / または

(iii) R^Y が、水素である；または

(iv) R^Y が、 $-OR^X$ であり；任意で R^Y が $-OH$ である；任意で

(v) R^X および R^Y が、水素である；

(vi) ; R^X および R^Y が、 $-OH$ である；または

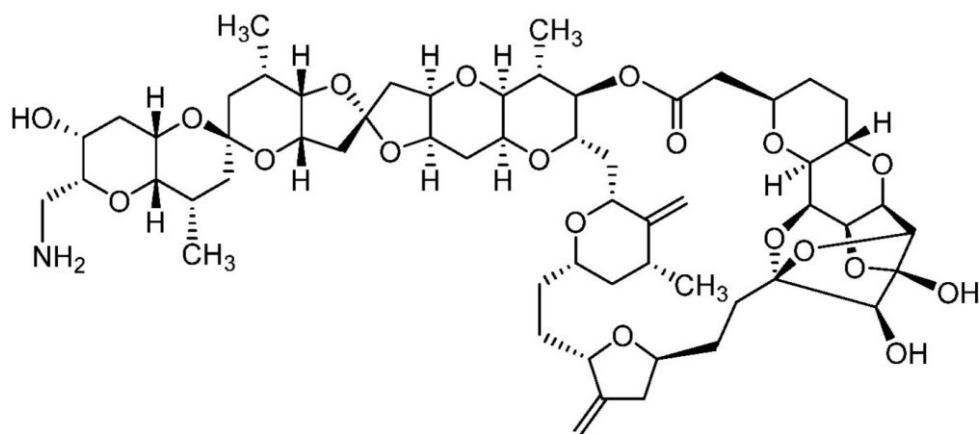
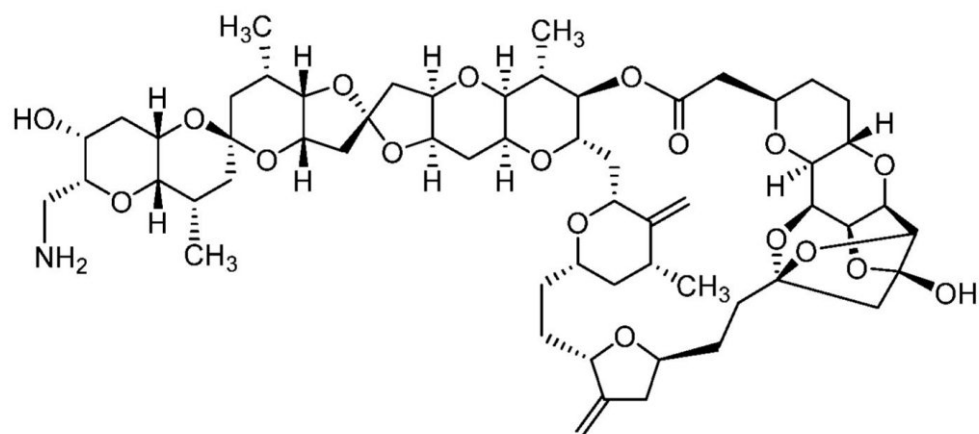
(vii) R^X が、水素であり；かつ R^Y が、 $-OH$ である；

請求項 1、3、5、8 および 10 ~ 15 のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容し得る塩または立体異性体。

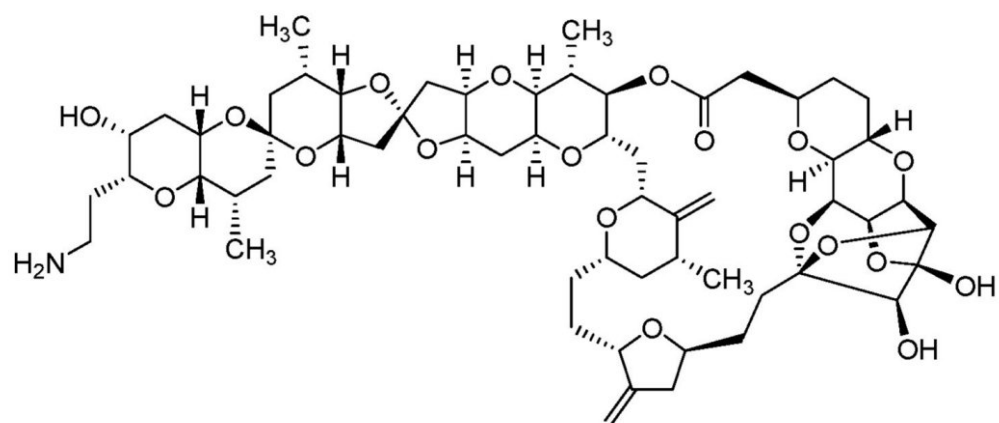
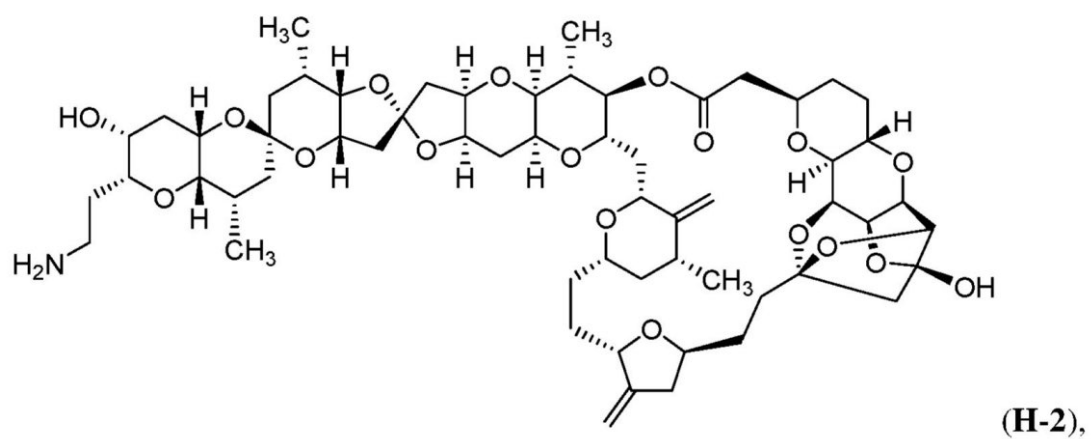
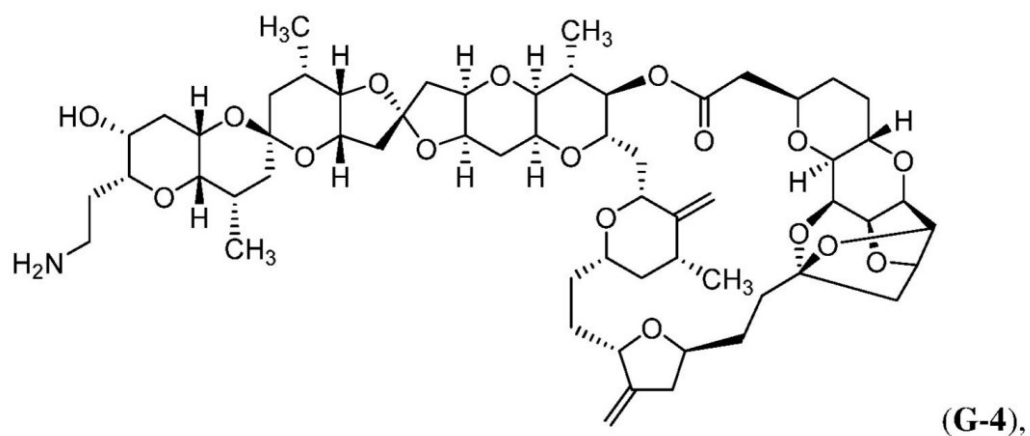
【請求項 1 7】

化合物が、

【化 1 1】



【化 1 2】

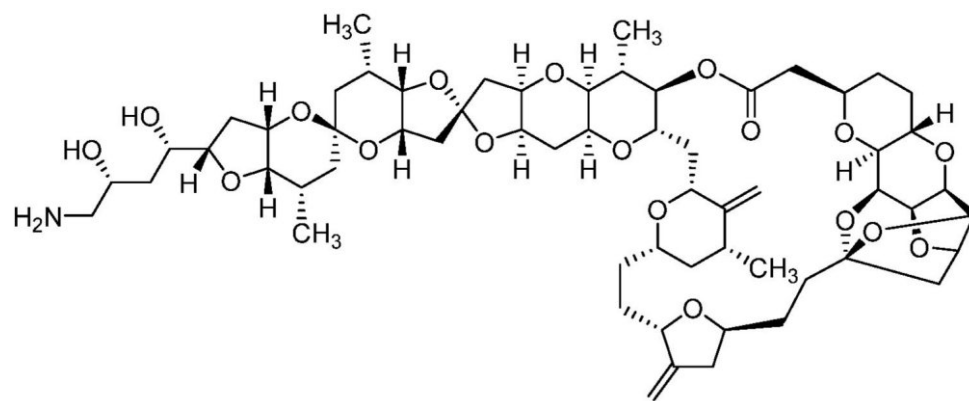


からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物およびその薬学的に許容し得る塩。

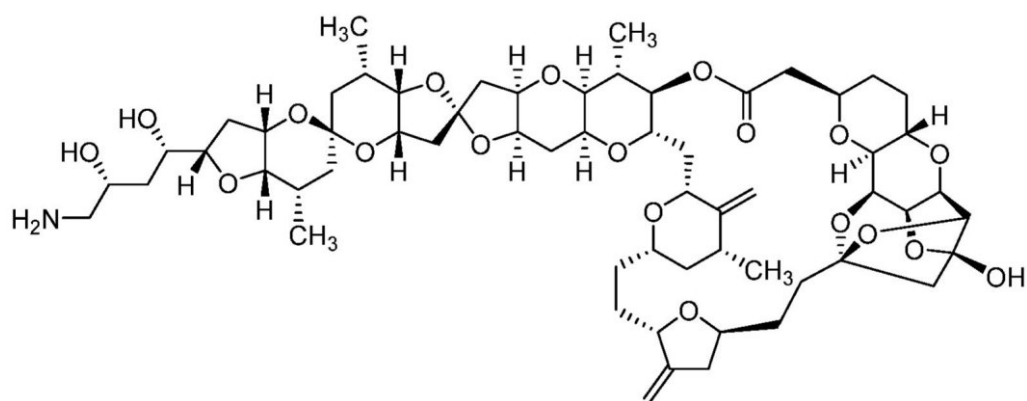
【請求項 1 8】

化合物が、

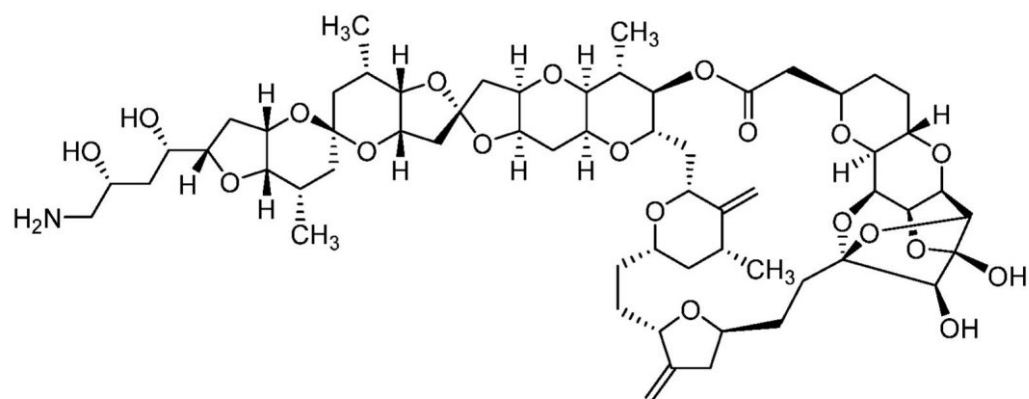
【化 1 3】



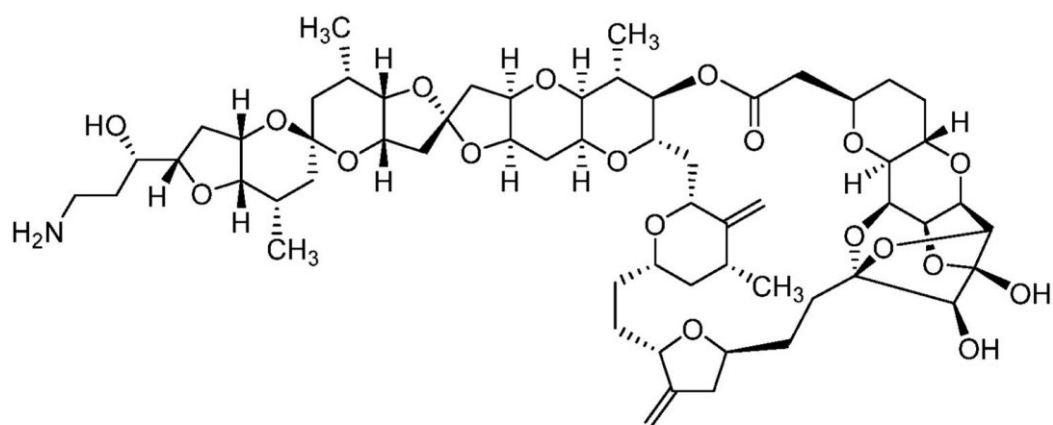
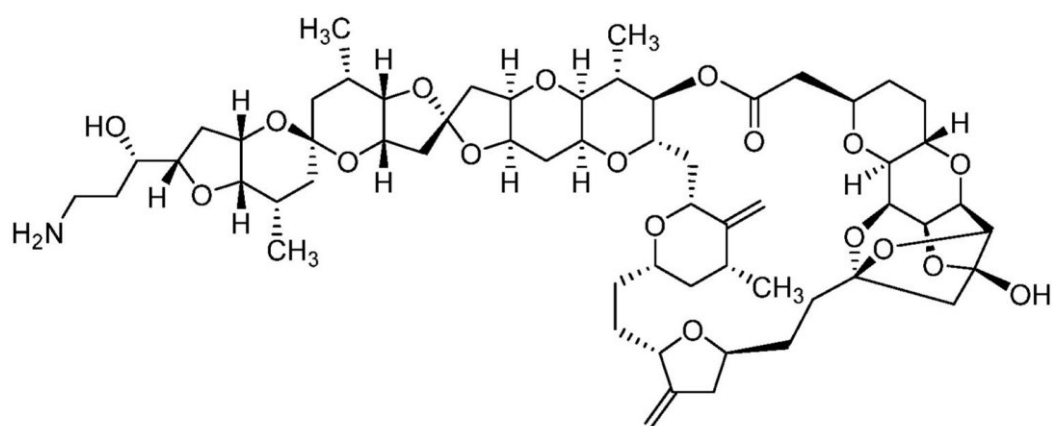
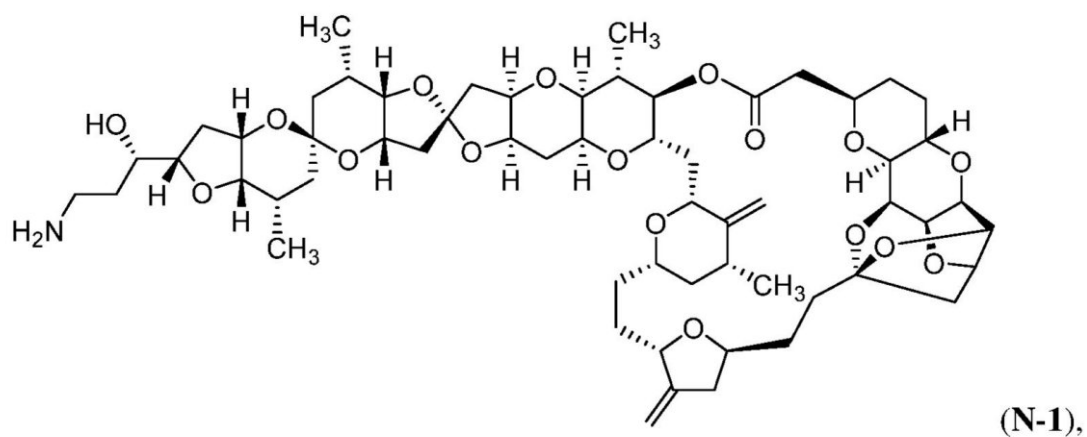
(K-2),



(L-6),



【化 1 4】

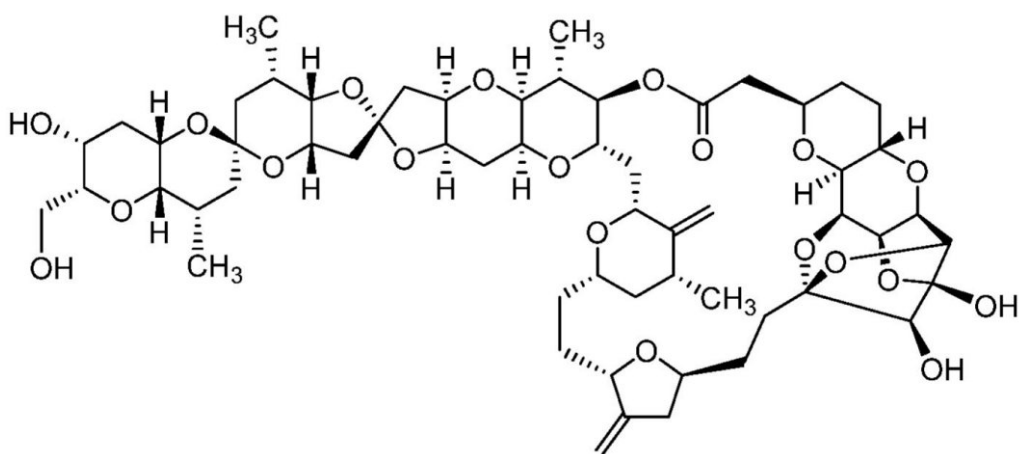
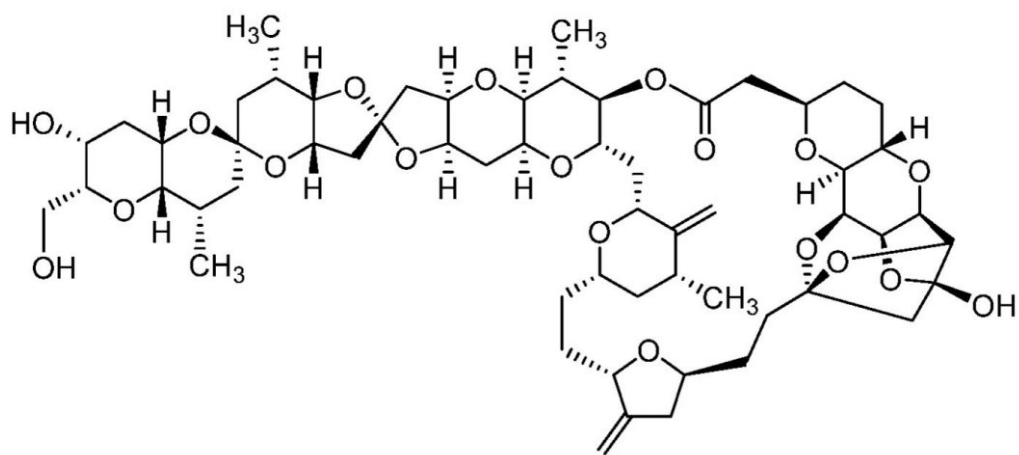


からなる群から選択される、請求項 3 に記載の化合物およびその薬学的に許容し得る塩。

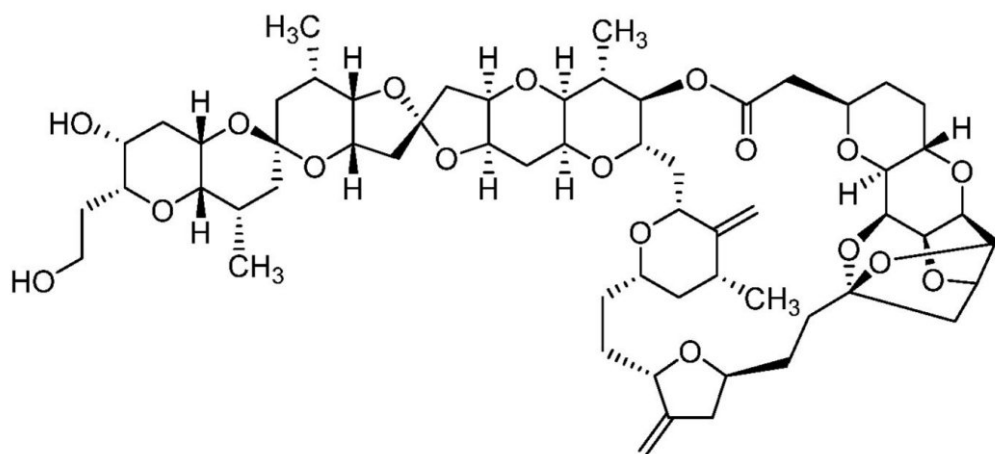
【請求項 1 9】

化合物が、

【化 1 5】

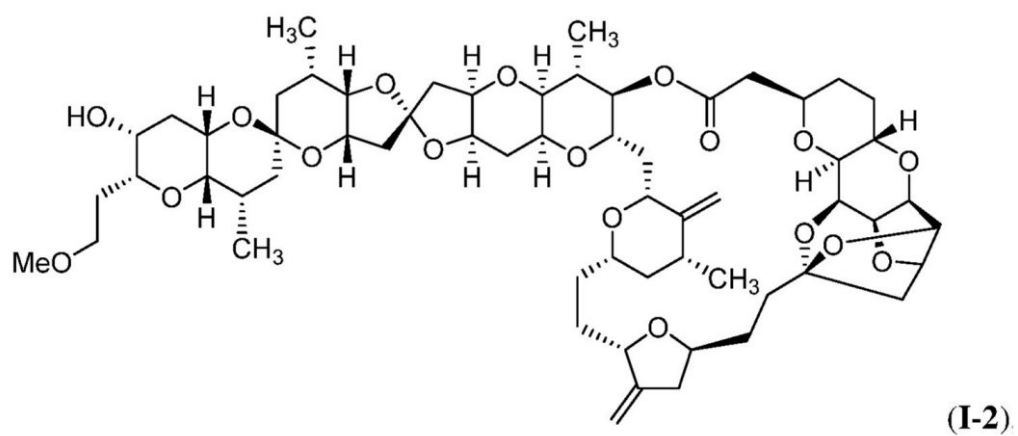
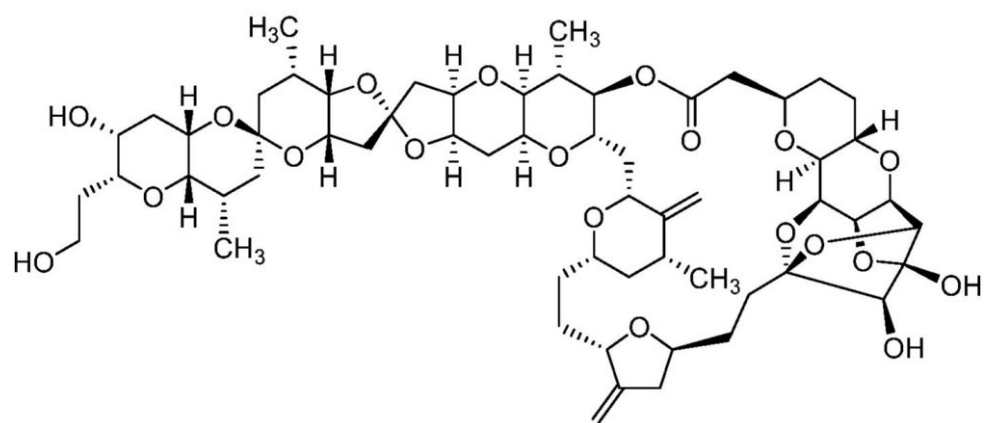
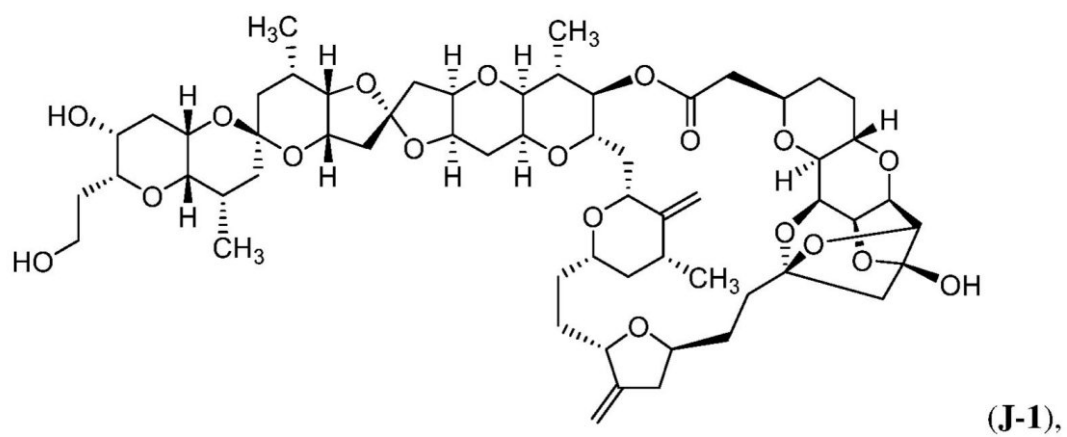


【化 1 6】

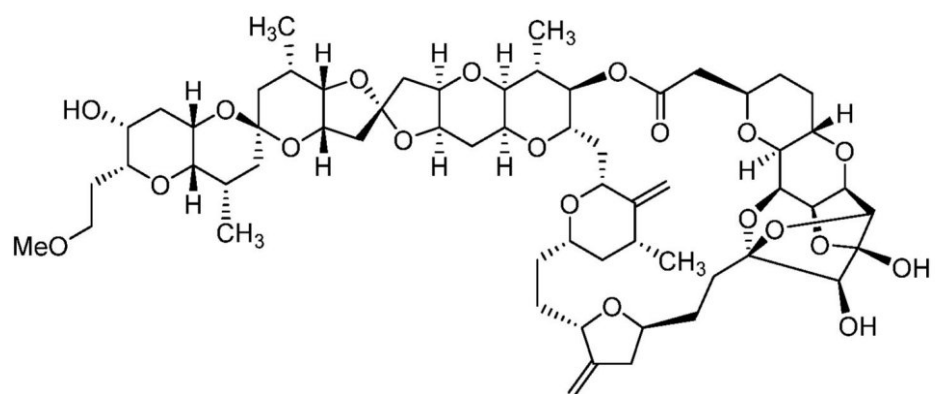
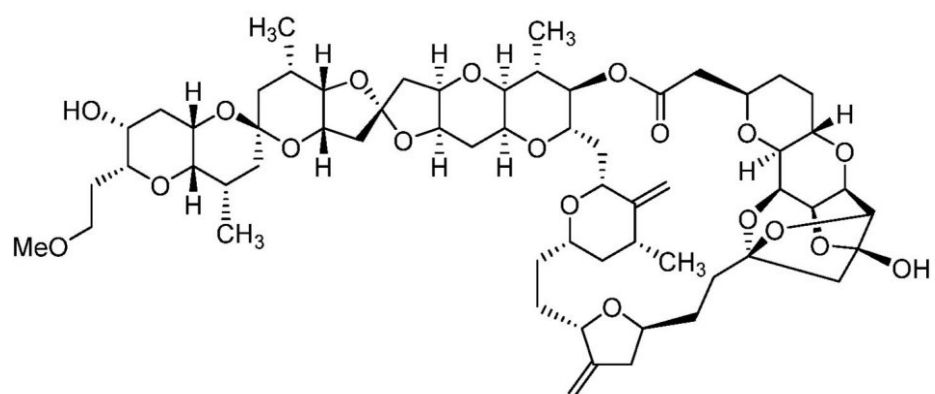


(E-2)

【化 1 7】



【化 1 8】

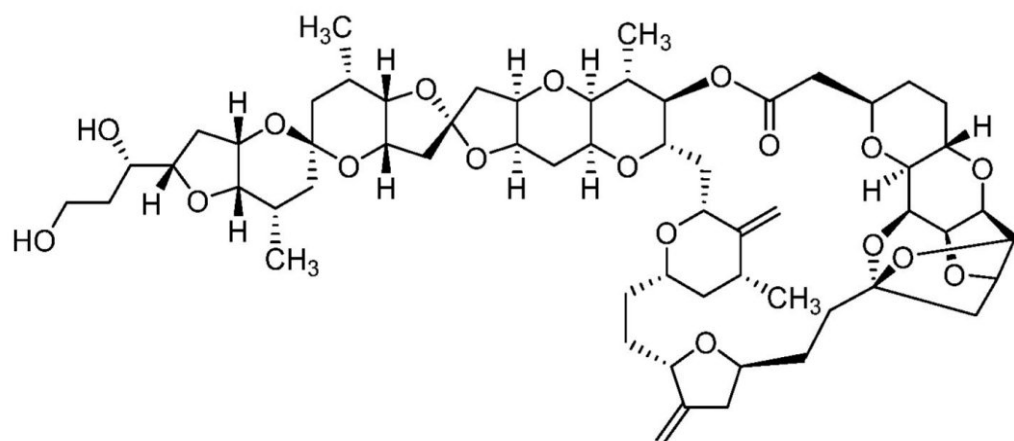


からなる群から選択される、請求項 5 に記載の化合物およびその薬学的に許容し得る塩。

【請求項 20】

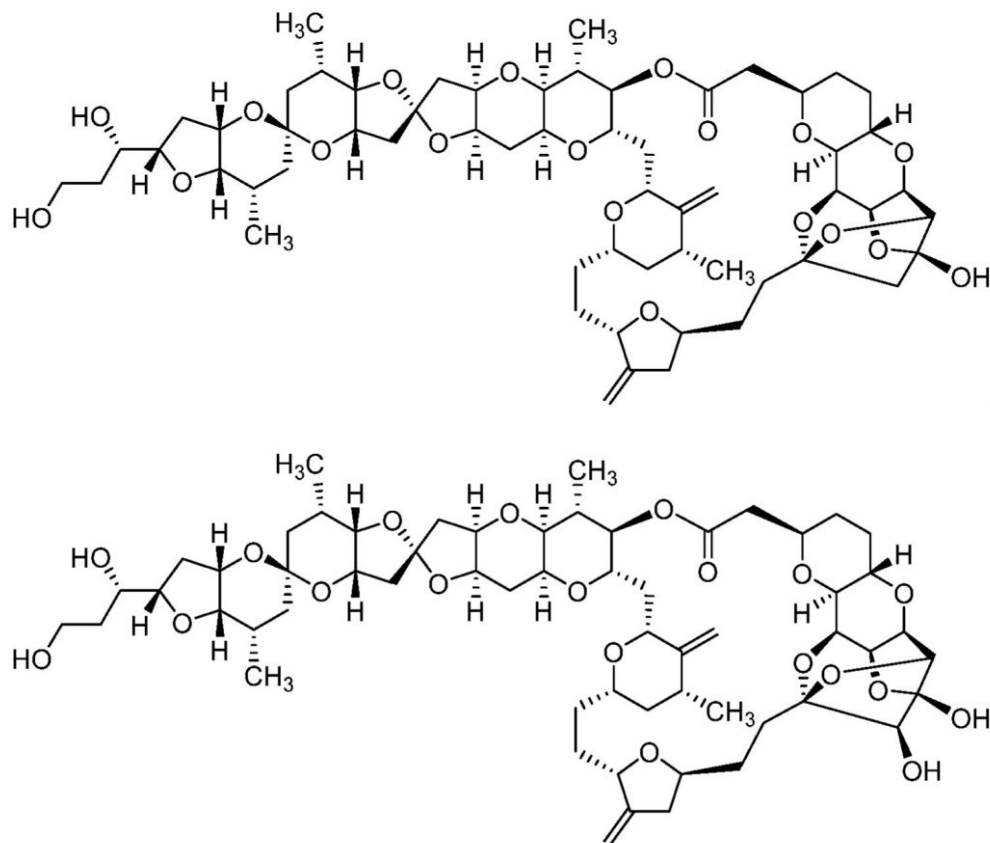
化合物が、

【化 1 9】



(M-3)

【化 20】



からなる群から選択される、請求項 8 に記載の化合物およびその薬学的に許容し得る塩。

【請求項 21】

請求項 1 ~ 20 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容し得る塩または立体異性体、および薬学的に許容し得る担体を含む、医薬組成物。

【請求項 22】

増殖性疾患の処置における使用のための；任意で腫瘍またはがんの処置または腫瘍またはがんの成長の阻害において使用のための；請求項 1 ~ 20 のいずれか一項に記載の化合物またはその薬学的に許容し得る塩または立体異性体であって；任意で

腫瘍またはがんが、血管新生、浸潤、または転移により特徴づけられ；任意でがんまたは腫瘍が、頭頸部がん、乳がん、結腸直腸がん、食道がん、子宮がん、卵巣がん、子宮内膜がん、肉腫、胃部がん、肺がん、膀胱がん、小腸がん、または汗腺がんであり；任意で

がんまたは腫瘍が：

(i) 頭頸部がん、任意で頭頸部がんが、頭頸部の扁平上皮細胞癌 (S C C H N)、または腺様嚢胞癌である；

(i i) 乳がん、任意で乳がんが、H E R 2 陽性乳がん、H E R 2 陰性乳がん、またはトリプルネガティブ乳がんである；

(i i i) 結腸直腸がん；

(i v) 食道がん、任意で食道がんが、食道腺癌である；

(v) 子宮がん；

(v i) 卵巣がん；

(v i i) 肉腫、任意で肉腫が、子宮肉腫、線維肉腫、血管肉腫、滑膜肉腫、軟部組織肉腫、または内膜肉腫である；

(v i i i) 胃部がん；

- (i x) 小腸がん、任意で小腸がんが、小腸腺癌である；
- (x) 膀胱がん、任意で膀胱がんが、尿路上皮癌である；
- (x i) 肺がん、任意で肺がんが、非小細胞肺がんである；
- (x i i) 汗腺がん、任意で汗腺がんが、汗腺癌である；
- (x i i i) 子宮内膜がん；または
- (x i v) 希少がん

である、前記化合物またはその薬学的に許容し得る塩または立体異性体

【請求項 23】

(i) 抗 E G F R (上皮成長因子受容体) モノクローナル抗体 (m A b) 治療、任意でがんが、頭頸部の扁平上皮細胞癌 (S C C H N) であり、任意で抗 E G F R m A b が、セツキシマブである；

(i i) H E R 2 (ヒト上皮成長因子受容体) m A b 治療、任意でがんが、乳がんであり、任意で H E R 2 m A b が、トラスツズマブである；

(i i i) プログラム死 1 タンパク質 (P D - 1) 抗体；

(i v) プログラム死 L 1 タンパク質 (P D - L 1) 抗体；および / または

(v) 放射線治療

と組み合わせた使用のための、請求項 22 に記載の使用のための化合物。