

【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9月30日(2021.9.30)

【公表番号】特表2020-531469(P2020-531469A)

【公表日】令和2年11月5日(2020.11.5)

【年通号数】公開・登録公報2020-045

【出願番号】特願2020-509077(P2020-509077)

【国際特許分類】

C 0 7 D 473/18 (2006.01)

A 6 1 K 47/68 (2017.01)

A 6 1 K 47/60 (2017.01)

A 6 1 K 31/541 (2006.01)

A 6 1 P 31/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/04 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 473/18

A 6 1 K 47/68

A 6 1 K 47/60

A 6 1 K 31/541

A 6 1 P 31/00

A 6 1 P 37/04

【手続補正書】

【提出日】令和3年8月12日(2021.8.12)

【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

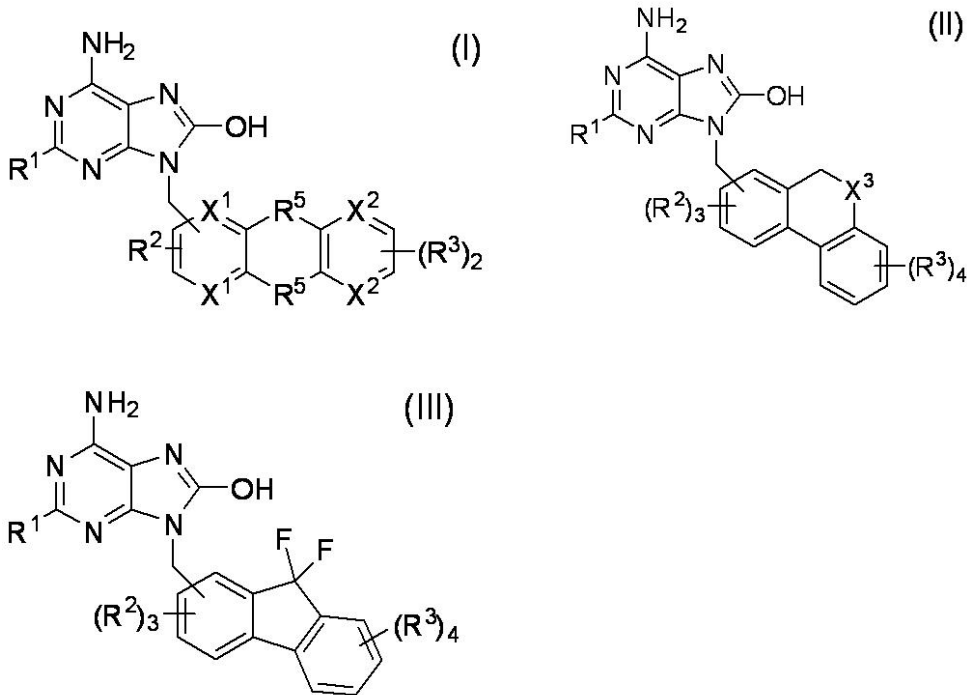
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)、(II)または(III)：

【化1】



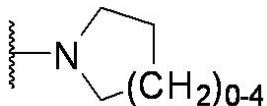
[式中、

R^1 は、 $(C_1 - C_5 \text{ アルキル})O$ 、 $(C_1 - C_2 \text{ アルキル})O(CH_2)_{2-3}O$ 、 $(C_1 - C_5 \text{ アルキル})C(=O)O$ 、 $(C_1 - C_5 \text{ アルキル})NH$ 、 $(C_1 - C_2 \text{ アルキル})O(CH_2)_{2-3}NH$ または $(C_1 - C_5 \text{ アルキル})C(=O)NH$ であり；

R^2 および R^3 は、各々独立して、 H 、 $C_1 - C_3 \text{ アルキル}$ 、ハロ、 $O(C_1 - C_3 \text{ アルキル})$ 、 CN または NO_2 であり、ここで1つの R^3 は、 $(CH_2)_x R^4$ (式中、下付き文字 x は、1、2、3 または 4 である) により置換されている；

R^4 は、 H 、ハロ、 OH 、 CN 、 NH_2 、 $NH(C_1 - C_5 \text{ アルキル})$ 、 $N(C_1 - C_5 \text{ アルキル})_2$ 、 $NH(C_3 - C_6 \text{ シクロアルキル})$ 、 $NH(C_4 - C_8 \text{ ビシクロアルキル})$ 、 $NH(C_6 - C_{10} \text{ スピロシクロアルキル})$ 、 $N(C_3 - C_6 \text{ シクロアルキル})_2$ 、 $NH(CH_2)_{1-3}$ (アリール)、 $N((CH_2)_{1-3} \text{ (アリール)})_2$ 、構造：

【化2】



を有する環状アミン基、6員環の芳香族基またはヘテロ芳香族基、あるいは5員環のヘテロ芳香族基であり；

ここで、アルキル、シクロアルキル、ビシクロアルキル、スピロシクロアルキル、環状アミン、6員環の芳香族基またはヘテロ芳香族基、あるいは5員環のヘテロ芳香族基は、所望により、 OH 、ハロ、 CN 、 $(C_1 - C_3 \text{ アルキル})$ 、 $O(C_1 - C_3 \text{ アルキル})$ 、 $C(=O)(Me)$ 、 $SO_2(C_1 - C_3 \text{ アルキル})$ 、 $C(=O)(Et)$ 、 NH_2 、 $NH(Me)$ 、 $N(Me)_2$ 、 $NH(Et)$ 、 $N(Et)_2$ および $N(C_1 - C_3 \text{ アルキル})_2$ から選択される1以上の置換基で置換されている；および

シクロアルキル、ビシクロアルキル、スピロシクロアルキルまたは環状アミン基は、 O 、 S 、 NH 、 $N(C_1 - C_3 \text{ アルキル})$ または $N(Boc)$ により置換された CH_2 基を有している；

R^5 は、各々独立して、 O 、 S または NR^6 であり；

R^6 は、 H または $C_1 - C_3 \text{ アルキル}$ であり；

X^1 は、各々独立して、 CR^2 または N であり；

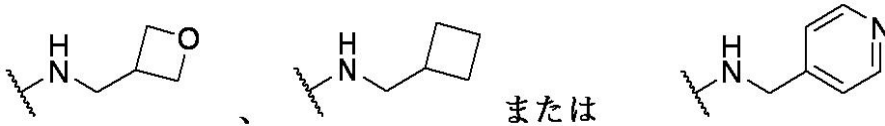
X^2 は、各々独立して、 CR^3 または N であり；および

X^3 は、O、S、NH、 $N(C_1 - C_3 \text{ アルキル})$ 、 $C=O$ または $N(C=O)(C_1 - C_3 \text{ アルキル})$ である]
 の構造を有する、化合物。

【請求項 2】

R^4 が、OH、 $NH(CHMe_2)$ 、 $NHCH_2C_6H_5$ 、 $NHMe$ 、 $NHCH_2CH_2OH$ 、

【化 3】

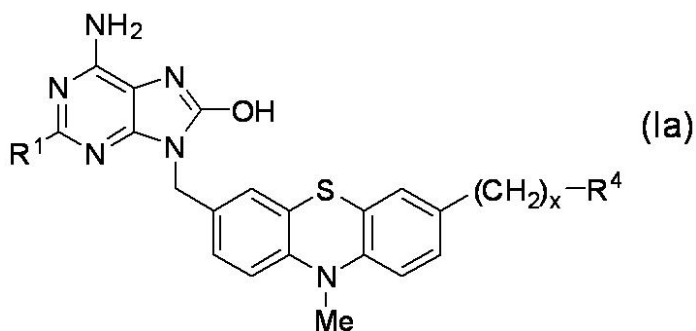


である、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 3】

式 (I a) :

【化 4】

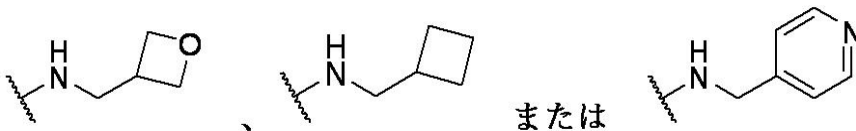


により示される構造を有する、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 4】

R^4 が、OH、 $NH(CHMe_2)$ 、 $NHCH_2C_6H_5$ 、 $NHMe$ 、 $NHCH_2CH_2OH$ 、

【化 5】



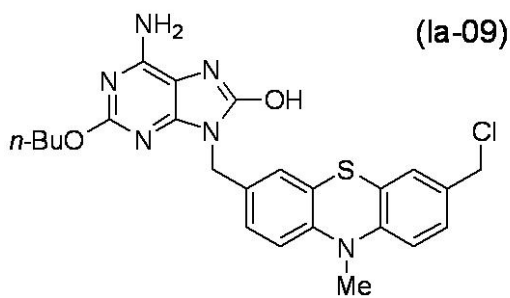
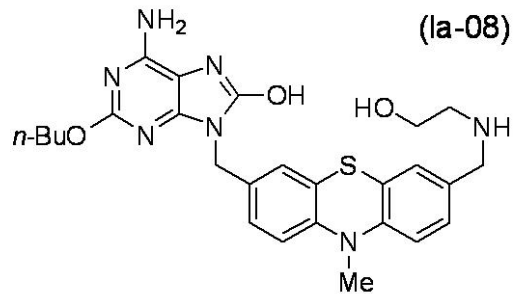
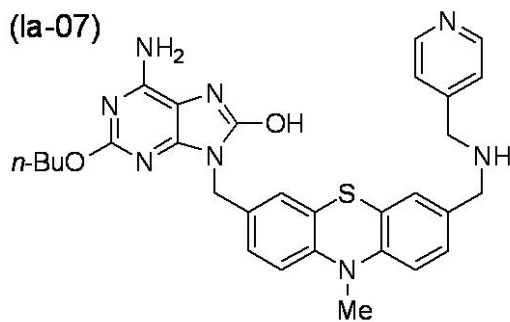
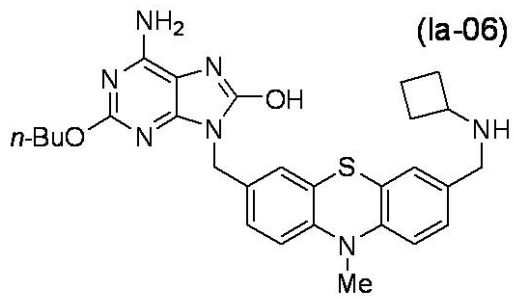
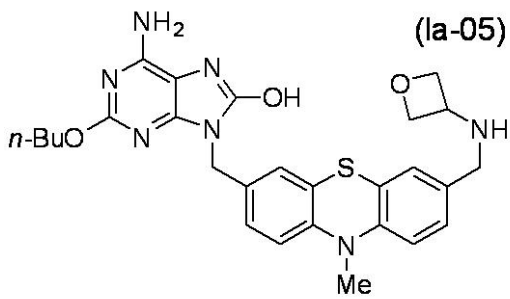
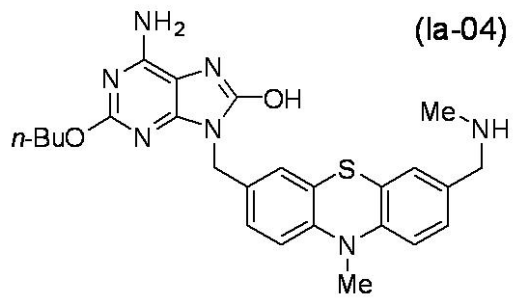
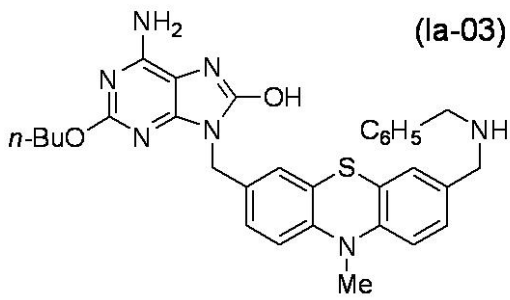
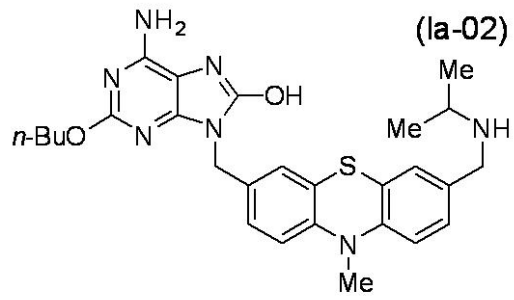
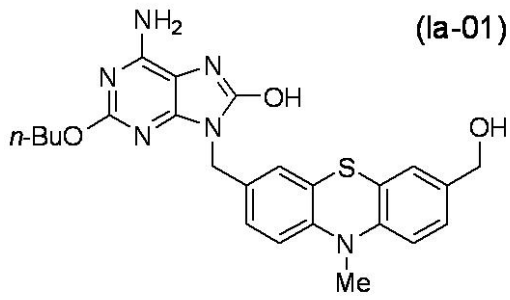
である、請求項 3 記載の化合物。

【請求項 5】

R^1 が、 $n-BuO$ であり、下付き文字 x が 1 である、請求項 4 記載の化合物。

【請求項 6】

【化 6】



および

から選択される、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 7】

抗体にコンジュゲートされる、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 8】

2 k D a ~ 4 0 k D a の大きさのポリ(エチレングリコール)基と共有結合される、請求項 1 記載の化合物。

【請求項 9】

請求項 1 に記載の化合物を含む、トル様受容体 7 の活性化により治療できる症状を治療するための医薬組成物。