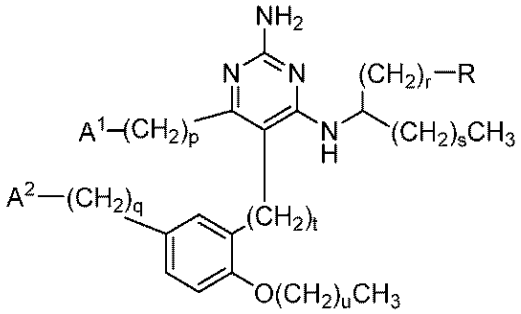
【公報種別】特許法第１７条の２の規定による補正の掲載
【部門区分】第３部門第２区分
【発行日】令和4年6月6日(2022.6.6)

【国際公開番号】WO2019/236496
【公表番号】特表2021-525771(P2021-525771A)
【公表日】令和3年9月27日(2021.9.27)
【出願番号】特願2020-567199(P2020-567199)
【国際特許分類】
C07D403/10(2006.01)
C07D239/12(2006.01)
A61K 31/506(2006.01)
A61K 31/505(2006.01)
A61K 47/38(2006.01)
A61K 47/02(2006.01)
A61K 9/08(2006.01)
A61K 45/00(2006.01)
A61K 38/22(2006.01)
A61K 39/395(2006.01)
A61P 11/00(2006.01)
A61P 35/00(2006.01)
A61P 37/08(2006.01)
A61P 11/06(2006.01)
A61P 43/00(2006.01)
【ＦＩ】
Ｃ０７Ｄ４０３/１０ ＣＳＰ
Ｃ０７Ｄ２３９/１２
Ａ６１Ｋ ３１/５０６
Ａ６１Ｋ ３１/５０５
Ａ６１Ｋ ４７/３８
Ａ６１Ｋ ４７/０２
Ａ６１Ｋ ９/０８
Ａ６１Ｋ ４５/００
Ａ６１Ｋ ３８/２２
Ａ６１Ｋ ３９/３９５ Ｎ
Ａ６１Ｐ １１/００
Ａ６１Ｐ ３５/００
Ａ６１Ｐ ３７/０８
Ａ６１Ｐ １１/０６
Ａ６１Ｐ ４３/００ １１１
Ａ６１Ｐ ４３/００ １２１

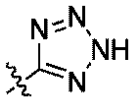
【手続補正書】
【提出日】令和4年5月27日(2022.5.27)
【手続補正１】
【補正対象書類名】特許請求の範囲
【補正対象項目名】全文
【補正方法】変更
【補正の内容】
【特許請求の範囲】

【請求項１】
式（Ｉ）
【化９１】

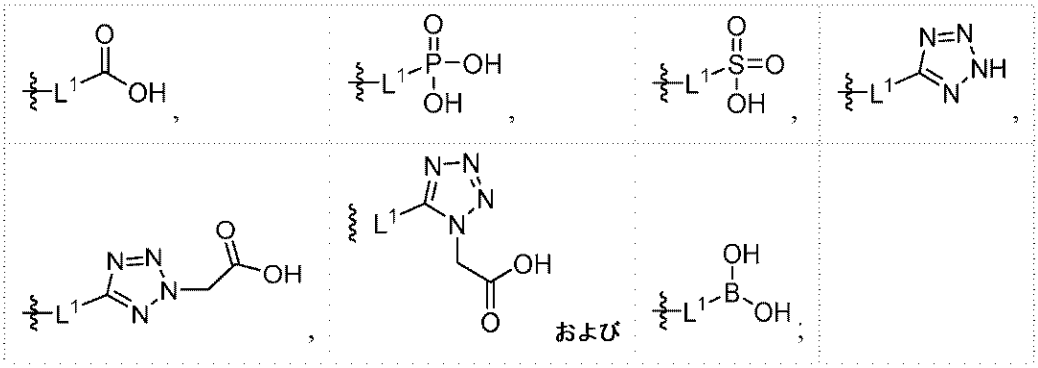


(I)

（式中、
Ｒは－ＯＨ、－ＳＯ２ＣＨ３、－ＮＨ２、－ＮＨＡｃおよび
【化９２】

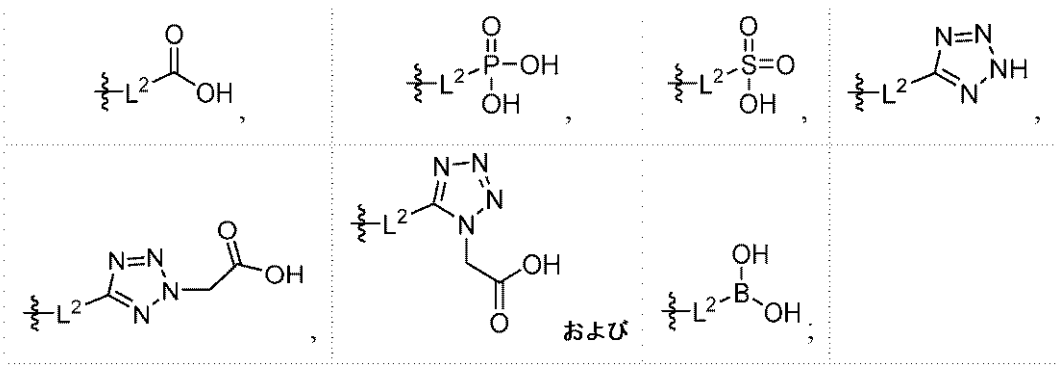


からなる群から選択され、
Ａ１は
【化９３】



および

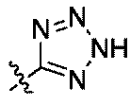
からなる群から選択され、
Ａ２は
【化９４】



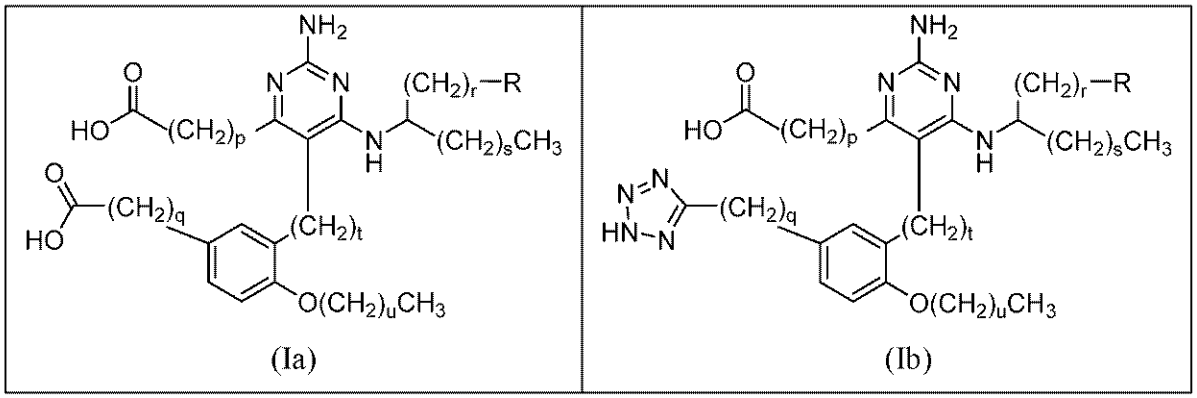
および

からなる群から選択され、
Ｌ１は結合または－（ＣＨ２）ｍ－であり、

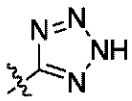
Ｌ２は結合または－（ＣＨ２）ｎ－であり、
ｍ、ｎ、ｐ、ｑ、ｒ、ｓ、ｔおよびｕは０～４から独立に選択され、
Ａ１（ＣＨ２）ｐが－ＣＨ２ＣＨ２Ｃ（＝Ｏ）ＯＨであり、Ａ２（ＣＨ２）ｑが－ＣＨ２Ｃ（＝Ｏ）ＯＨであり、ｒが２であり、ｓが３であり、ｔが１であり、ｕが０である場合、Ｒは－ＯＨ、－ＮＨ２、－ＮＨＡｃまたは
【化９５】



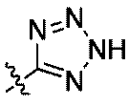
である）
の構造を有する化合物、またはその薬学的に許容される塩。
【請求項２】
前記式（Ｉ）の化合物が式（Ｉａ）または式（Ｉｂ）の化合物
【化９６】



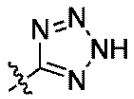
（式中、Ｒは－ＯＨ、－ＳＯ２ＣＨ３、－ＮＨ２、－ＮＨＡｃおよび
【化９７】



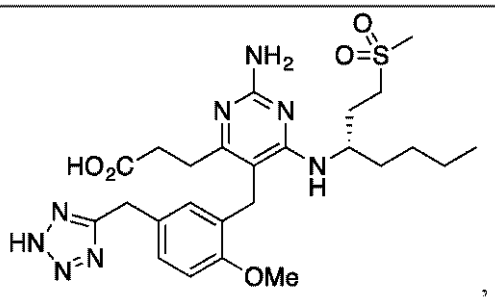
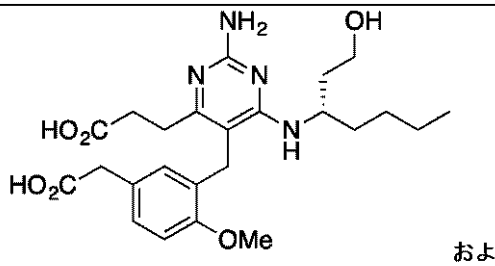
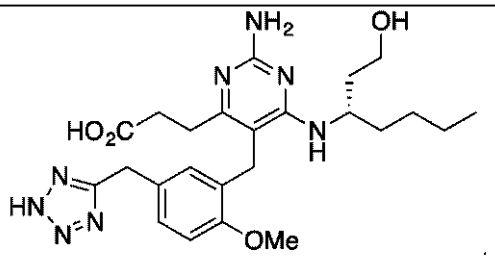
からなる群から選択され、
ｐ、ｑ、ｒ、ｓ、ｔおよびｕは０～４から独立に選択され、
前記化合物が式（Ｉａ）の化合物であり、ｐが２であり、ｑが１であり、ｒが２であり、ｓが３であり、ｔが１であり、ｕが０である場合、Ｒは－ＯＨ、－ＮＨ２、－ＮＨＡｃまたは
【化９８】



である）、
である、請求項１に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。
【請求項３】
ｐが２であり、ｑが１である、請求項１または２に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。
【請求項４】
Ｒが－ＯＨである、請求項１から３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される塩。

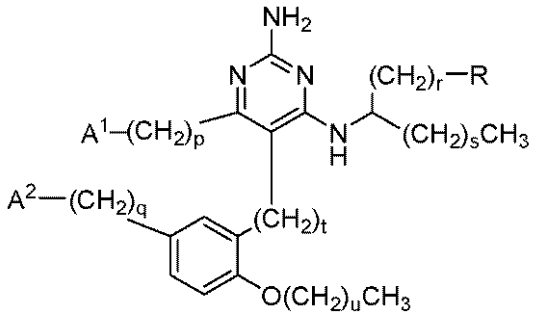
【請求項５】
Ｒが－ＳＯ２ＣＨ３であり、
前記化合物が式（Ｉａ）の化合物であり、ｐが２であり、ｑが１であり、ｒが２であり、ｓが３であり、ｔが１であり、ｕが０である場合、Ｒは－ＯＨ、－ＮＨ２、－ＮＨＡｃまたは
【化９９】


である、
請求項１から３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される塩。
【請求項６】
前記化合物が単一エナンチオマーである、請求項１から５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される塩。
【請求項７】
【化１００】

1B	
2B	 および
3B	

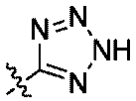
からなる群から選択される、請求項１に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。
【請求項８】
請求項１から７のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される担体とを含む医薬組成物。
【請求項９】
前記薬学的に許容される担体が、カルボキシメチルセルロース、生理食塩水、水または別の水溶液である、請求項８に記載の医薬組成物。

【請求項１０】
水中０．１％～５％のカルボキシメチルセルロースを含む、請求項８または９に記載の医薬組成物。
【請求項１１】
少なくとも１つまたは複数の追加の治療剤をさらに含む、請求項８から１０のいずれか一項に記載の医薬組成物。
【請求項１２】
前記少なくとも１つまたは複数の追加の治療剤が、グルココルチコイド、ベーターアドレナリン受容体アゴニスト、抗ＰＤ－１、抗ＰＤ－Ｌ１および抗ＣＴＬＡ－４からなる群から選択される、請求項１１に記載の医薬組成物。
【請求項１３】
吸入用に製剤化されている、請求項８から１２のいずれか一項に記載の医薬組成物。
【請求項１４】
呼吸器状態の処置をそれを必要とする対象において行うための組成物であって、前記組成物は、式（Ｉ）の化合物、またはその薬学的に許容される塩：
【化１０１】

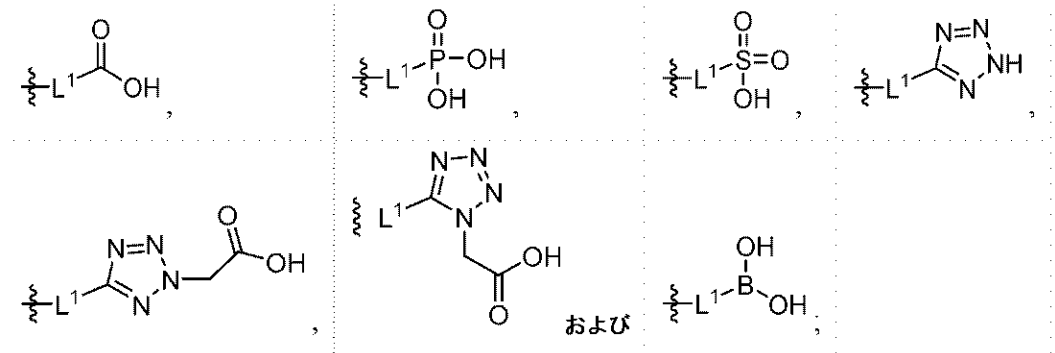


(I)

（式中、
Ｒは－ＯＨ、－ＳＯ２ＣＨ３、－ＮＨ２、－ＮＨＡｃおよび
【化１０２】

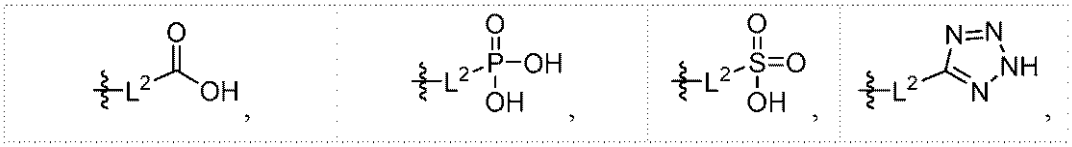


からなる群から選択され、
Ａ１は
【化１０３】

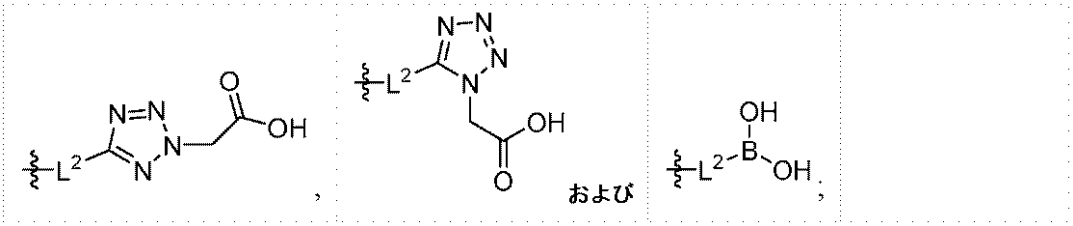


からなる群から選択され、
Ａ２は

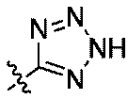
【化１０４－１】



【化１０４－２】

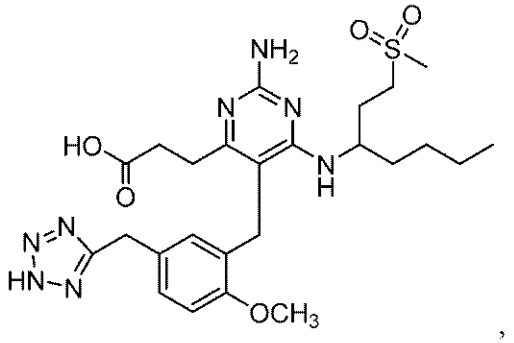
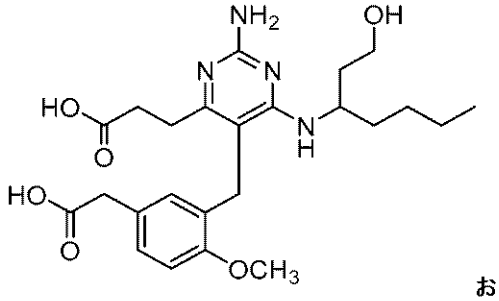


からなる群から選択され、
Ｌ１は結合または－（ＣＨ２）ｍ－であり、
Ｌ２は結合または－（ＣＨ２）ｎ－であり、
ｍ、ｎ、ｐ、ｑ、ｒ、ｓ、ｔおよびｕは０～４から独立に選択され、
Ａ１（ＣＨ２）ｐが－ＣＨ２ＣＨ２Ｃ（＝Ｏ）ＯＨであり、Ａ２（ＣＨ２）ｑが－ＣＨ２Ｃ（＝Ｏ）ＯＨであり、ｒが２であり、ｓが３であり、ｔが１であり、ｕが０である場合、Ｒは－ＯＨ、－ＮＨ２、－ＮＨＡｃまたは
【化１０５】

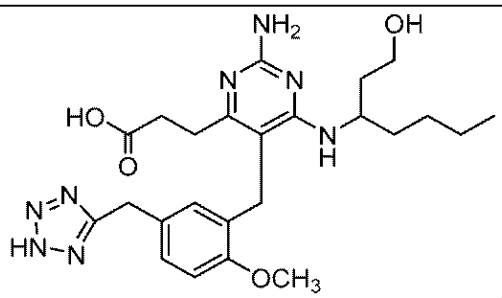


である）
を含む、組成物。
【請求項１５】
前記式（Ｉ）の化合物、またはその薬学的に許容される塩が、

【化１０６－１】

化合物	
1A	
2A	 および

【化１０６－２】

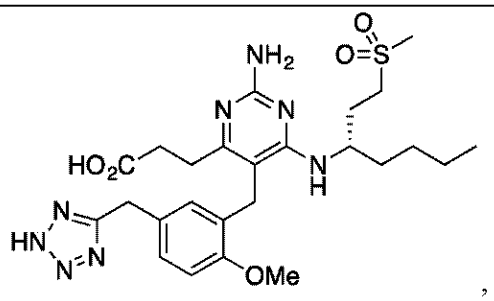
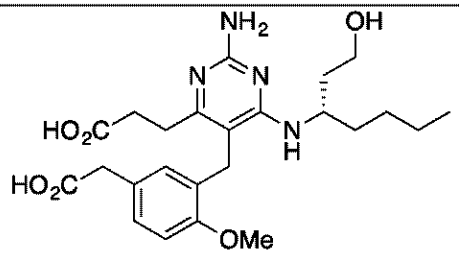
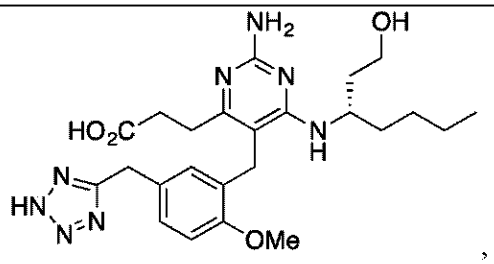
3A	

またはその薬学的に許容される塩からなる群から選択される、請求項１４に記載の組成物。

【請求項１６】

前記式（Ｉ）の化合物、またはその薬学的に許容される塩が、

【化１０７】

化合物	
1B	
2B	 および
3B	

またはその薬学的に許容される塩からなる群から選択される、請求項１４または１５に記載の組成物。

【請求項１７】

対象において呼吸器状態を処置するための、請求項８から１３のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項１８】

前記呼吸器状態が、がんである、請求項１４から１７のいずれか一項に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項１９】

前記がんが、肺がん；頭頸部がん；耳、鼻または咽喉がん；および上気道または下気道のがんからなる群から選択される、請求項１８に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項２０】

前記がんが肺がんである、請求項１８または１９に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項２１】

前記呼吸器状態が非がん性疾患である、請求項１４から１７のいずれか一項に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項２２】

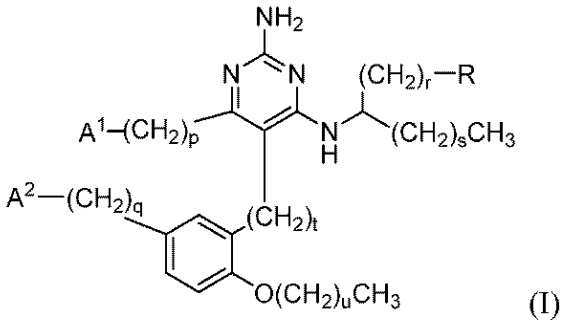
前記呼吸器状態が、喘息、アレルギーおよびＣＯＰＤからなる群から選択される、請求項１４から１７または２１のいずれか一項に記載の組成物または医薬組成物。

【請求項２３】

前記呼吸器状態が気道消化器状態である、請求項１４から１７または２１のいずれか一項に記載の組成物または医薬組成物。

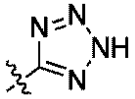
【請求項２４】
鼻腔内または気管内投与されることを特徴とする、請求項１４から２３のいずれか一項に記載の組成物または医薬組成物。
【請求項２５】
前記対象が前記化合物を吸入する、請求項１４から２４のいずれか一項に記載の組成物または医薬組成物。
【請求項２６】
１つまたは複数の追加の治療剤と組み合わせて投与されることを特徴とする、請求項１４から２５のいずれか一項に記載の組成物または医薬組成物。
【請求項２７】
前記１つまたは複数の追加の治療剤が、グルココルチコイド、ベーター－アドレナリン受容体アゴニスト、抗ＰＤ－１、抗ＰＤ－Ｌ１および抗ＣＴＬＡ－４からなる群から選択される、請求項２６に記載の組成物または医薬組成物。
【請求項２８】
治療における使用のための、請求項１から７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される塩を含む組成物。
【請求項２９】
呼吸器状態の処置における使用のための、請求項１から７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される塩を含む組成物。
【請求項３０】
医薬の製造における、請求項１から７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される塩の使用。
【請求項３１】
前記医薬が呼吸器状態を処置するために使用される、請求項３０に記載の使用。
【請求項３２】
治療における使用のための、請求項８から１３のいずれか一項に記載の医薬組成物。
【請求項３３】
呼吸器状態の処置における使用のための、請求項８から１３のいずれか一項に記載の医薬組成物。
【請求項３４】
前記呼吸器状態が、がんである、請求項２９に記載の組成物、請求項３１に記載の使用、または請求項３３に記載の医薬組成物。
【請求項３５】
前記がんが、肺がん；頭頸部がん；耳、鼻または咽喉がん；および上気道または下気道のがんからなる群から選択される、請求項３４に記載の組成物、使用、または医薬組成物。
【請求項３６】
前記がんが肺がんである、請求項３４または３５に記載の組成物、使用、または医薬組成物。
【請求項３７】
前記呼吸器状態が非がん性疾患である、請求項２９に記載の組成物、請求項３１に記載の使用、または請求項３３に記載の医薬組成物。
【請求項３８】
前記呼吸器状態が、喘息、アレルギーおよびＣＯＰＤからなる群から選択される、請求項２９に記載の組成物、請求項３１に記載の使用、または請求項３３に記載の医薬組成物。
【請求項３９】
前記呼吸器状態が気道消化器状態である、請求項２９に記載の組成物、請求項３１に記載の使用、または請求項３３に記載の医薬組成物。
【請求項４０】
前記組成物または医薬組成物が鼻腔内または気管内投与用に製剤化されている、請求項２８から３９のいずれか一項に記載の組成物、使用、または医薬組成物。

【請求項４１】
前記組成物または医薬組成物が吸入用に製剤化されている、請求項２８から４０のいずれか一項に記載の組成物、使用、または医薬組成物。
【請求項４２】
前記組成物または医薬組成物が、１つまたは複数の追加の治療剤とともに投与するために製剤化されている、請求項２８から４１のいずれか一項に記載の組成物、使用、または医薬組成物。
【請求項４３】
前記１つまたは複数の追加の治療剤が、グルココルチコイド、ベーターアドレナリン受容体アゴニスト、抗ＰＤ－１、抗ＰＤ－Ｌ１および抗ＣＴＬＡ－４からなる群から選択される、請求項４２に記載の組成物、使用、または医薬組成物。
【手続補正２】
【補正対象書類名】明細書
【補正対象項目名】００２０
【補正方法】変更
【補正の内容】
【００２０】
本開示は、呼吸器疾患の処置における使用のための医薬組成物を提供する。特定の実施形態では、呼吸器状態が肺がんである。
本発明の実施形態において、例えば以下の項目が提供される。
（項目１）
式（Ｉ）
【化９１】



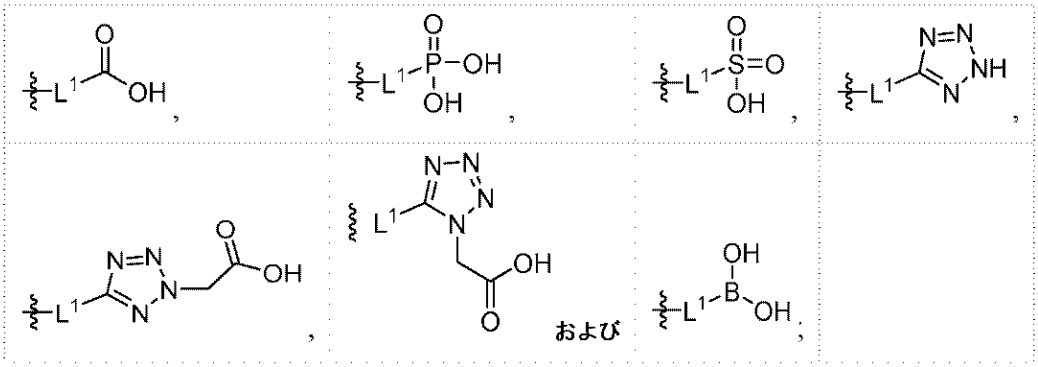
(I)

（式中、
Ｒは－ＯＨ、－ＳＯ２ＣＨ３、－ＮＨ２、－ＮＨＡｃおよび
【化９２】

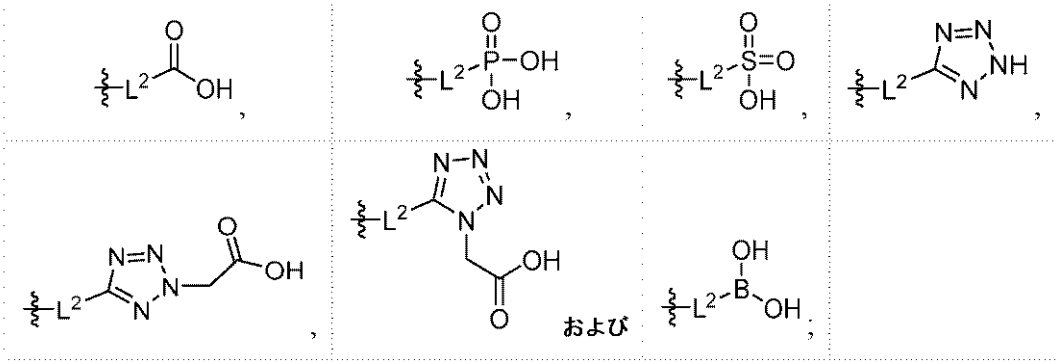


からなる群から選択され、
Ａ１は

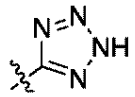
【化９３】



からなる群から選択され、
Ａ２は
【化９４】

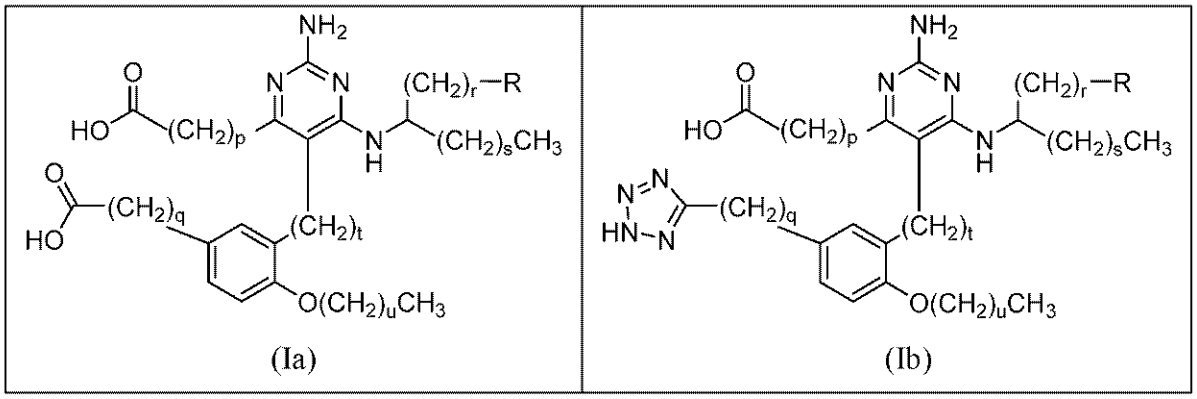


からなる群から選択され、
Ｌ１は結合または－（ＣＨ２）ｍ－であり、
Ｌ２は結合または－（ＣＨ２）ｎ－であり、
ｍ、ｎ、ｐ、ｑ、ｒ、ｓ、ｔおよびｕは０～４から独立に選択され、
Ａ１（ＣＨ２）ｐが－ＣＨ２ＣＨ２Ｃ（＝Ｏ）ＯＨであり、Ａ２（ＣＨ２）ｑが－ＣＨ２Ｃ（＝Ｏ）ＯＨであり、ｒが２であり、ｓが３であり、ｔが１であり、ｕが０である場合、Ｒは－ＯＨ、－ＮＨ２、－ＮＨＡｃまたは
【化９５】



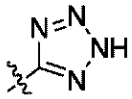
である）
の構造を有する化合物、またはその薬学的に許容される塩。
（項目２）
前記式（Ｉ）の化合物が式（Ｉａ）または式（Ｉｂ）の化合物

【化９６】



（式中、Ｒは－ＯＨ、－ＳＯ$_2$ＣＨ$_3$、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＡｃおよび

【化９７】

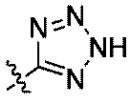


からなる群から選択され、

ｐ、ｑ、ｒ、ｓ、ｔおよびｕは０～４から独立に選択され、

前記化合物が式（Ｉａ）の化合物であり、ｐが２であり、ｑが１であり、ｒが２であり、ｓが３であり、ｔが１であり、ｕが０である場合、Ｒは－ＯＨ、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＡｃまたは

【化９８】



である）、

である、項目１に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

（項目３）

ｐが２であり、ｑが１である、項目１または２に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

（項目４）

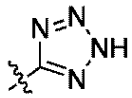
Ｒが－ＯＨである、項目１から３のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。

（項目５）

Ｒが－ＳＯ$_2$ＣＨ$_3$であり、

前記化合物が式（Ｉａ）の化合物であり、ｐが２であり、ｑが１であり、ｒが２であり、ｓが３であり、ｔが１であり、ｕが０である場合、Ｒは－ＯＨ、－ＮＨ$_2$、－ＮＨＡｃまたは

【化９９】



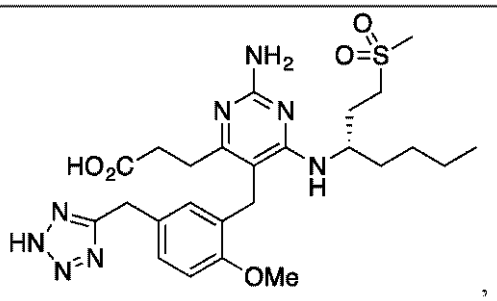
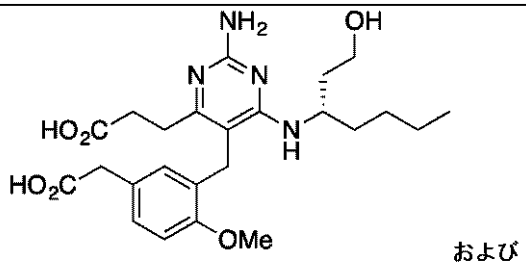
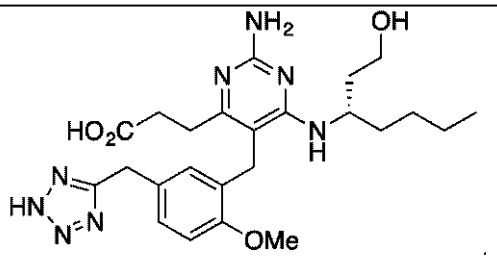
である、

項目１から３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される塩。

（項目６）

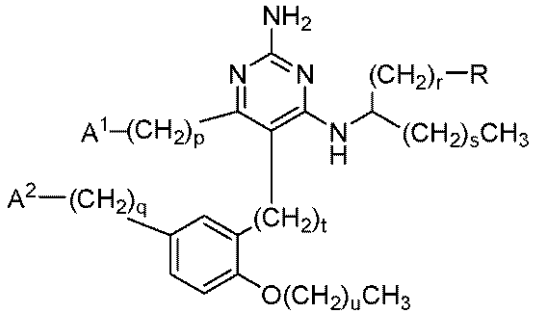
前記化合物が単一エナンチオマーである、項目１から５のいずれか一項に記載の化合物

、またはその薬学的に許容される塩。
（項目７）
【化１００】

1B	
2B	 および
3B	

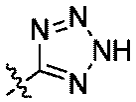
からなる群から選択される、項目１に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩。
（項目８）
項目１から７のいずれか一項に記載の化合物、またはその薬学的に許容される塩と、薬学的に許容される担体とを含む医薬組成物。
（項目９）
前記薬学的に許容される担体が、カルボキシメチルセルロース、生理食塩水、水または別の水溶液である、項目８に記載の医薬組成物。
（項目１０）
水中０．１％～５％のカルボキシメチルセルロースを含む、項目８または９に記載の医薬組成物。
（項目１１）
少なくとも１つまたは複数の追加の治療剤をさらに含む、項目８から１０のいずれか一項に記載の医薬組成物。
（項目１２）
前記少なくとも１つまたは複数の追加の治療剤が、グルココルチコイド、ベーターアドレナリン受容体アゴニスト、抗ＰＤ－１、抗ＰＤ－Ｌ１および抗ＣＴＬＡ－４からなる群から選択される、項目１１に記載の医薬組成物。
（項目１３）
吸入用に製剤化されている、項目８から１２のいずれか一項に記載の医薬組成物。
（項目１４）
呼吸器状態を処置する方法であって、有効量の式（Ｉ）の化合物、またはその薬学的に許容される塩：

【化１０１】

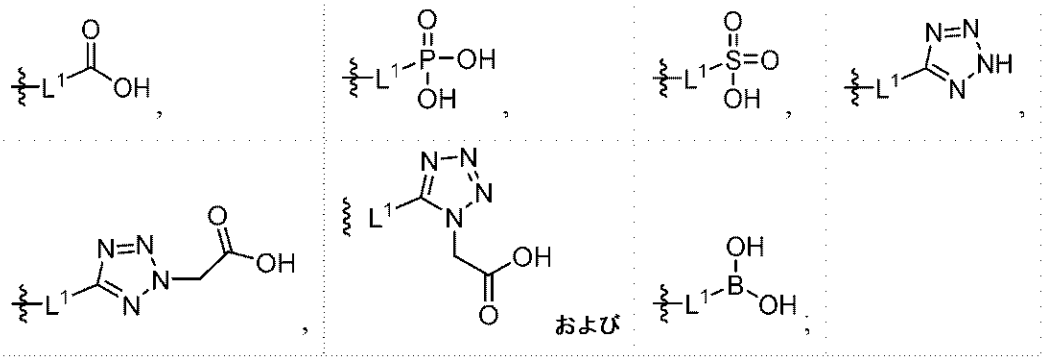


(I)

（式中、
Ｒは－ＯＨ、－ＳＯ２ＣＨ３、－ＮＨ２、－ＮＨＡｃおよび
【化１０２】

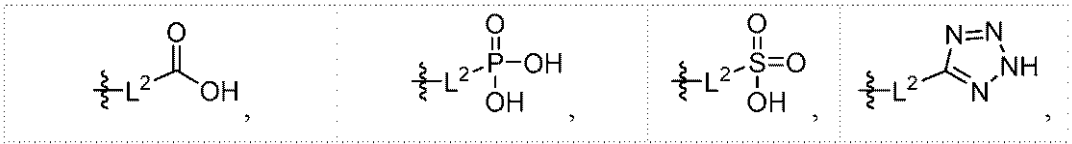


からなる群から選択され、
Ａ１は
【化１０３】

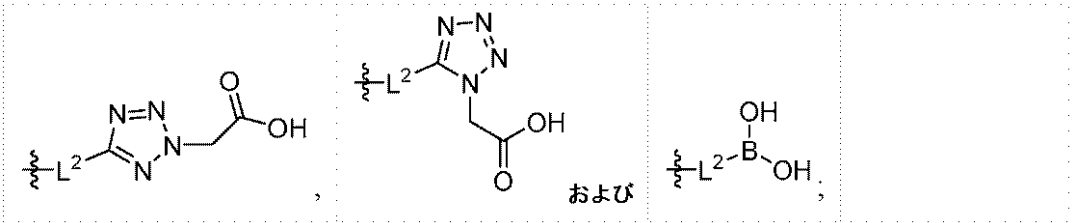


および

からなる群から選択され、
Ａ２は
【化１０４－１】



【化１０４－２】

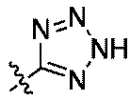


および

からなる群から選択され、

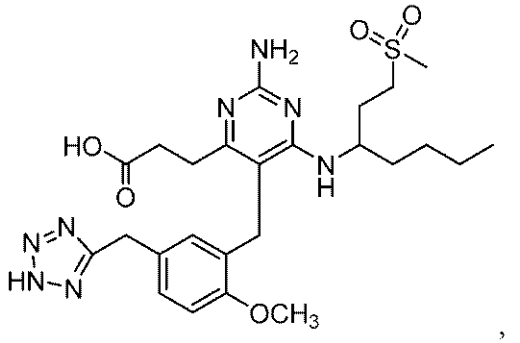
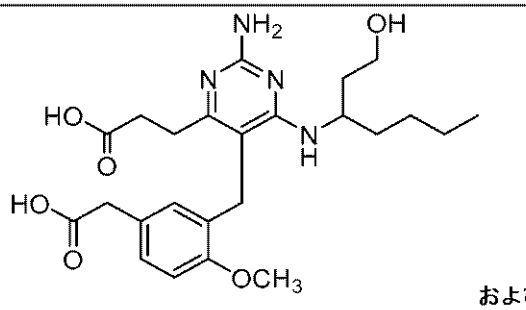
Ｌ^{1}は結合または－（ＣＨ$_{2}$）$_{m}$－であり、
Ｌ^{2}は結合または－（ＣＨ$_{2}$）$_{n}$－であり、
ｍ、ｎ、ｐ、ｑ、ｒ、ｓ、ｔおよびｕは０～４から独立に選択され、
Ａ^{1}（ＣＨ$_{2}$）$_{p}$が－ＣＨ$_{2}$ＣＨ$_{2}$Ｃ（＝Ｏ）ＯＨであり、Ａ^{2}（ＣＨ$_{2}$）$_{q}$が－ＣＨ$_{2}$Ｃ（＝Ｏ）ＯＨであり、ｒが２であり、ｓが３であり、ｔが１であり、ｕが０である場合、Ｒは－ＯＨ、－ＮＨ$_{2}$、－ＮＨＡｃまたは

【化１０５】



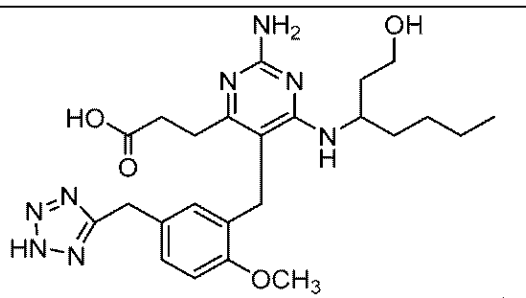
である）
を、それを必要とする対象に投与するステップを含む方法。
（項目１５）
前記式（Ｉ）の化合物、またはその薬学的に許容される塩が、

【化１０６－１】

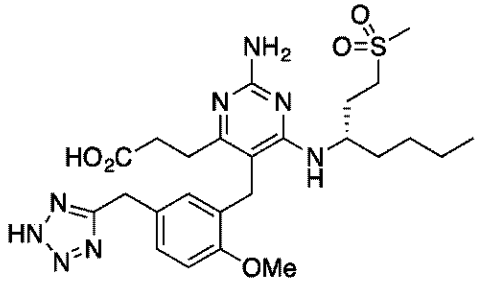
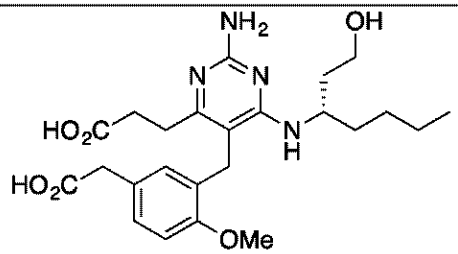
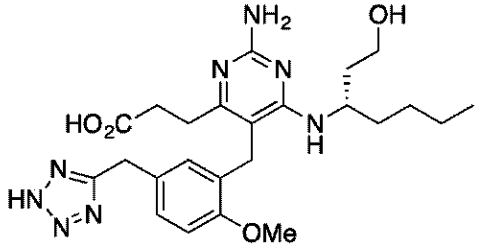
化合物	
1A	
2A	

および

【化１０６－２】

3A	

またはその薬学的に許容される塩からなる群から選択される、項目１４に記載の方法。
（項目１６）
前記式（Ｉ）の化合物、またはその薬学的に許容される塩が、
【化１０７】

化合物	
1B	 ,
2B	 および
3B	 ,

またはその薬学的に許容される塩からなる群から選択される、項目１４または１５に記載の方法。
（項目１７）
呼吸器状態を処置する方法であって、有効量の項目８から１３のいずれか一項に記載の医薬組成物を、対象に投与するステップを含む方法。
（項目１８）
前記呼吸器状態が、がんである、項目１４から１７のいずれか一項に記載の方法。
（項目１９）
前記がんが、肺がん；頭頸部がん；耳、鼻または咽喉がん；および上気道または下気道のがんからなる群から選択される、項目１８に記載の方法。
（項目２０）
前記がんが肺がんである、項目１８または１９に記載の方法。
（項目２１）
前記呼吸器状態が非がん性疾患である、項目１４から１７のいずれか一項に記載の方法。
（項目２２）
前記呼吸器状態が、喘息、アレルギーおよびＣＯＰＤからなる群から選択される、項目１４から１７または２１のいずれか一項に記載の方法。
（項目２３）
前記呼吸器状態が気道消化器状態である、項目１４から１７または２１のいずれか一項

に記載の方法。
（項目２４）
前記投与が鼻腔内または気管内である、項目１４から２３のいずれか一項に記載の方法。
（項目２５）
前記対象が前記化合物を吸入する、項目１４から２４のいずれか一項に記載の方法。
（項目２６）
前記化合物が１つまたは複数の追加の治療剤と組み合わせて投与される、項目１４から２５のいずれか一項に記載の方法。
（項目２７）
前記１つまたは複数の追加の治療剤が、グルココルチコイド、ベーターアドレナリン受容体アゴニスト、抗ＰＤ－１、抗ＰＤ－Ｌ１および抗ＣＴＬＡ－４からなる群から選択される、項目２６に記載の方法。
（項目２８）
治療における使用のための、項目１から７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される塩。
（項目２９）
呼吸器状態の処置における使用のための、項目１から７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される塩。
（項目３０）
医薬の製造における、項目１から７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される塩の使用。
（項目３１）
前記医薬が呼吸器状態を処置するために使用される、項目３０に記載の使用。
（項目３２）
治療における使用のための、項目８から１３のいずれか一項に記載の医薬組成物。
（項目３３）
呼吸器状態の処置における使用のための、項目８から１３のいずれか一項に記載の医薬組成物。
（項目３４）
前記呼吸器状態が、がんである、項目２９に記載の使用のための化合物、項目３１に記載の使用、または項目３３に記載の医薬組成物。
（項目３５）
前記がんが、肺がん；頭頸部がん；耳、鼻または咽喉がん；および上気道または下気道のがんからなる群から選択される、項目３４に記載の使用のための化合物、使用、または医薬組成物。
（項目３６）
前記がんが肺がんである、項目３４または３５に記載の使用のための化合物、使用、または医薬組成物。
（項目３７）
前記呼吸器状態が非がん性疾患である、項目２９に記載の使用のための化合物、項目３１に記載の使用、または項目３３に記載の医薬組成物。
（項目３８）
前記呼吸器状態が、喘息、アレルギーおよびＣＯＰＤからなる群から選択される、項目２９に記載の使用のための化合物、項目３１に記載の使用、または項目３３に記載の医薬組成物。
（項目３９）
前記呼吸器状態が気道消化器状態である、項目２９に記載の使用のための化合物、項目３１に記載の使用、または項目３３に記載の医薬組成物。
（項目４０）
化合物または医薬組成物が鼻腔内または気管内投与用に製剤化される、項目２８から３

９のいずれか一項に記載の使用のための化合物、使用、または医薬組成物。
（項目４１）
化合物または医薬組成物が吸入用に製剤化される、項目２８から４０のいずれか一項に記載の使用のための化合物、使用、または医薬組成物。
（項目４２）
化合物または医薬組成物が、１つまたは複数の追加の治療剤とともに投与するために製剤化される、項目２８から４１のいずれか一項に記載の使用のための化合物、使用、または医薬組成物。
（項目４３）
前記１つまたは複数の追加の治療剤が、グルココルチコイド、ベーターアドレナリン受容体アゴニスト、抗ＰＤ－１、抗ＰＤ－Ｌ１および抗ＣＴＬＡ－４からなる群から選択される、項目４２に記載の使用のための化合物、使用、または医薬組成物。