

【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 2 月 20 日 (2020.2.20)

【公表番号】特表 2019-504830 (P2019-504830A)

【公表日】平成 31 年 2 月 21 日 (2019.2.21)

【年通号数】公開・登録公報 2019-007

【出願番号】特願 2018-535293 (P2018-535293)

【国際特許分類】

C 0 7 D 239/94 (2006.01)

A 6 1 K 31/517 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 239/94 C S P

A 6 1 K 31/517

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 43/00 1 1 1

【手続補正書】

【提出日】令和 2 年 1 月 6 日 (2020.1.6)

【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

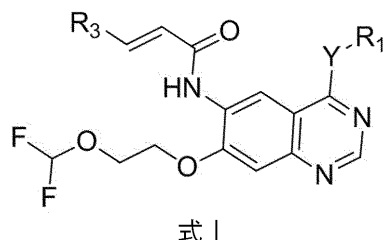
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

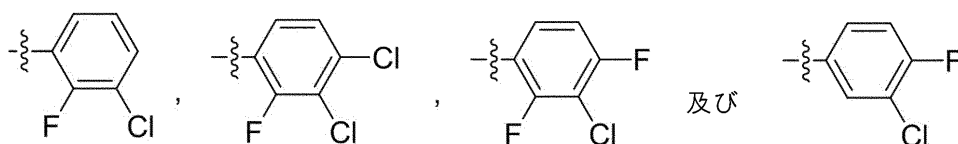
下記式 I の化合物又はそれらの薬学的に許容可能な塩の溶媒和物及び / 又はプロドラッグ。

【化 1】



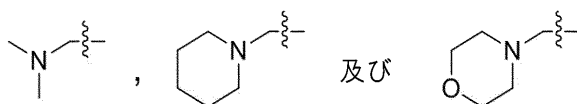
(式 I 中、R<sub>1</sub> は化 2 に示す化合物から選択され、

【化 2】



R<sub>3</sub> は、化 3 に示す化合物から選択され、

## 【化 3】



Y は、NH、O、S、SO、及び SO<sub>2</sub> から選択される。）

## 【請求項 2】

Y が、O、NH、及び NCH<sub>3</sub> から選択される、請求項 1 に記載の化合物。

## 【請求項 3】

Y が、O、及び NH から選択される、請求項 2 に記載の化合物。

## 【請求項 4】

Y が NH である、請求項 3 に記載の化合物。

## 【請求項 5】

(E) - N - [ 4 - ( 3 , 4 - ジクロロ - 2 - フルオロ - アニリノ ) - 7 - [ 2 - ( ジフルオロメトキシ ) エトキシ ] - キナゾリン - 6 - イル ] - 4 - ( ジメチルアミノ ) ブタ - 2 - エンアミド ;

(E) - N - [ 4 - ( 3 , 4 - ジクロロ - 2 - フルオロ - アニリノ ) - 7 - [ 2 - ( ジフルオロメトキシ ) エトキシ ] - キナゾリン - 6 - イル ] - 4 - モルホリノ - ブタ - 2 - エンアミド ;

(E) - N - [ 4 - ( 3 - クロロ - 2 - フルオロ - アニリノ ) - 7 - [ 2 - ( ジフルオロメトキシ ) エトキシ ] キナゾリン - 6 - イル ] - 4 - ( ジメチルアミノ ) ブタ - 2 - エンアミド ;

(E) - N - [ 4 - ( 3 - クロロ - 2 - フルオロ - アニリノ ) - 7 - [ 2 - ( ジフルオロメトキシ ) エトキシ ] キナゾリン - 6 - イル ] - 4 - ( 1 - ピペリジル ) ブタ - 2 - エンアミド ;

(E) - N - [ 4 - ( 3 - クロロ - 2 - フルオロ - アニリノ ) - 7 - [ 2 - ( ジフルオロメトキシ ) エトキシ ] キナゾリン - 6 - イル ] - 4 - モルホリノ - ブタ - 2 - エンアミド ;

(E) - N - [ 4 - ( 3 - クロロ - 2 , 4 - ジフルオロ - アニリノ ) - 7 - [ 2 - ( ジフルオロメトキシ ) エトキシ ] - キナゾリン - 6 - イル ] - 4 - ( ジメチルアミノ ) ブタ - 2 - エンアミド ;

(E) - N - [ 4 - ( 3 - クロロ - 2 , 4 - ジフルオロ - アニリノ ) - 7 - [ 2 - ( ジフルオロメトキシ ) エトキシ ] - キナゾリン - 6 - イル ] - 4 - ( 1 - ピペリジル ) ブタ - 2 - エンアミド ;

(E) - N - [ 4 - ( 3 - クロロ - 2 , 4 - ジフルオロ - アニリノ ) - 7 - [ 2 ( ジフルオロメトキシ ) エトキシ ] - キナゾリン - 6 - イル ] - 4 - モルホリノ - ブタ - 2 - エンアミド ;

(E) - N - [ 4 - ( 3 , 4 - ジクロロ - 2 - フルオロ - アニリノ ) - 7 - [ 2 - ( ジフルオロメトキシ ) - エトキシ ] キナゾリン - 6 - イル ] - 4 - ( 1 - ピペリジル ) ブタ - 2 - エンアミド ;

(E) - N - [ 4 - ( 3 - クロロ - 4 - フルオロ - アニリノ ) - 7 - [ 2 - ( ジフルオロメトキシ ) エトキシ ] キナゾリン - 6 - イル ] - 4 - ( ジメチルアミノ ) ブタ - 2 - エンアミド ;

(E) - N - [ 4 - ( 3 - クロロ - 4 - フルオロ - アニリノ ) - 7 - [ 2 - ( ジフルオロメトキシ ) エトキシ ] キナゾリン - 6 - イル ] - 4 - ( 1 - ピペリジル ) ブタ - 2 - エンアミド ;

(E) - N - [ 4 - ( 3 - クロロ - 4 - フルオロ - アニリノ ) - 7 - [ 2 - ( ジフルオロメトキシ ) エトキシ ] キナゾリン - 6 - イル ] - 4 - モルホリノ - ブタ - 2 - エンアミド ;

(E) - N - ( 4 - ( 3 - クロロ - 2 - フルオロフェノキシ ) - 7 - ( 2 - ( ジフルオロ

メトキシ)エトキシ)キナゾリン - 6 - イル) - 4 - (ジメチルアミノ)ブタ - 2 - エン  
アミド ;

(E) - N - (4 - (3 - クロロ - 4 - フルオロフェノキシ) - 7 - (2 - (ジフルオロ  
メトキシ)エトキシ)キナゾリン - 6 - イル) - 4 - (ジメチルアミノ)ブタ - 2 - エン  
アミド ;

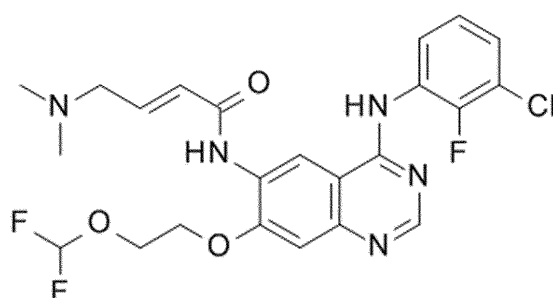
(E) - N - (4 - (3 - クロロ - 2 - フルオロフェノキシ) - 7 - (2 - (ジフルオロ  
メトキシ)エトキシ)キナゾリン - 6 - イル) - 4 - (ピペリジン - 1 - イル)ブタ - 2  
- エンアミド ;

(E) - N - (4 - (3 - クロロ - 2 - フルオロフェノキシ) - 7 - (2 - (ジフルオロ  
メトキシ)エトキシ)キナゾリン - 6 - イル) - 4 - モルホリノブタ - 2 - エンアミド ;  
から選択される、請求項 1 に記載の化合物、又はそれらの薬学的に許容可能な塩、及び /  
又は水和物。

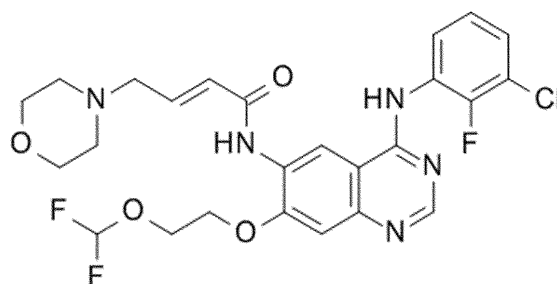
【請求項 6】

前記式 I の化合物が、以下の化 4 から化 7 のいずれかの化合物、又はそれらの薬学的に  
許容可能な塩、及び / 又は溶媒和物。

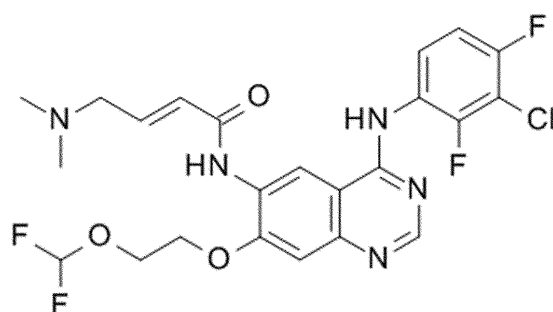
【化 4】



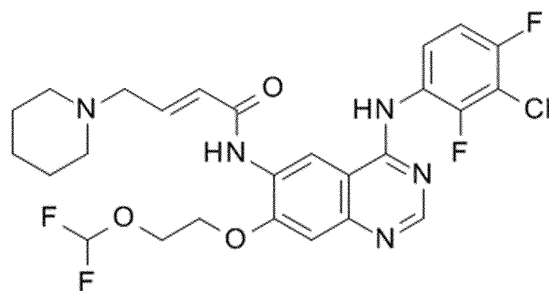
【化 5】



【化 6】



## 【化 7】



## 【請求項 7】

請求項 1 から請求項 6 のいずれか 1 項に記載の 1 つ又は複数の化合物、又はそれらの薬学的に許容可能な塩、及び / 又は溶媒和物と、薬学的に許容可能な担体及び / 又は希釈剤を含む、医薬組成物。

## 【請求項 8】

癌を治療するための薬物の調整方法であって、請求項 1 から請求項 6 のいずれか一項に記載の 1 つ又は複数の化合物、又はそれらの薬学的に許容可能な塩、及び / 又は溶媒和物を用いることを特徴とする調整方法。

## 【請求項 9】

前記癌が、乳癌、皮膚癌、前立腺癌、結腸癌、膀胱癌、腎癌、卵巣癌、及び肺癌から選択される、請求項 8 に記載の調整方法。

## 【請求項 10】

前記癌が脳癌である、請求項 8 に記載の調整方法。