

【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 7 月 26 日 (2021.7.26)

【公表番号】特表 2020-519667 (P2020-519667A)

【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 2019-563164 (P2019-563164)

【国際特許分類】

C 0 7 D 471/04 (2006.01)

C 0 7 D 519/00 (2006.01)

A 6 1 K 31/538 (2006.01)

A 6 1 K 31/4462 (2006.01)

A 6 1 K 31/437 (2006.01)

A 6 1 K 31/5377 (2006.01)

A 6 1 K 31/55 (2006.01)

A 6 1 K 31/46 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

A 6 1 P 37/02 (2006.01)

A 6 1 P 29/00 (2006.01)

A 6 1 P 31/12 (2006.01)

A 6 1 P 35/02 (2006.01)

A 6 1 P 43/00 (2006.01)

【F I】

C 0 7 D 471/04 1 0 2

C 0 7 D 471/04 1 0 6 H

C 0 7 D 471/04 C S P

C 0 7 D 471/04 1 0 7 Z

C 0 7 D 519/00 3 1 1

A 6 1 K 31/538

A 6 1 K 31/4462

A 6 1 K 31/437

A 6 1 K 31/5377

A 6 1 K 31/55

A 6 1 K 31/46

A 6 1 P 35/00

A 6 1 P 37/02

A 6 1 P 29/00

A 6 1 P 31/12

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 43/00 1 2 1

C 0 7 D 471/04 1 0 4 Z

【手続補正書】

【提出日】令和 3 年 5 月 13 日 (2021.5.13)

【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

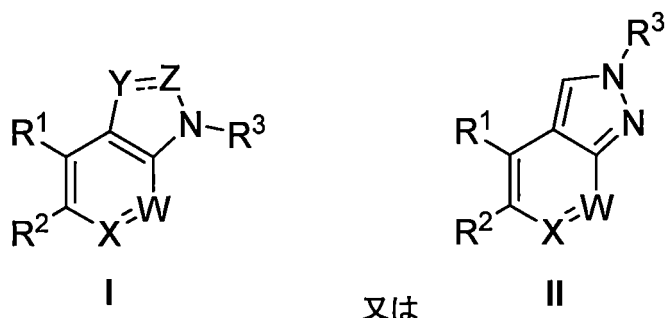
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記式 I 又は II：

【化 1】



〔式中、 $R^1$  は、ハロ、任意に置換された  $C_6 - C_{14}$  アリール、及び任意に置換された 5 ～ 14 員のヘテロアリールから成る群から選択され；

$R^2$  は、水素、ハロ、任意に置換された  $C_6 - C_{14}$  アリール、及び任意に置換された 5 ～ 14 員のヘテロアリールから成る群から選択され；

$R^3$  は、水素、任意に置換された  $C_1 - 6$  アルキル、任意に置換された  $C_3 - 8$  シクロアルキル、任意に置換された 4 ～ 8 員のヘテロシクロ、（アミノ）アルキル、（ヘテロシクロ）アルキル、及び（ヘテロアリール）アルキルから成る群から選択され；

X は、 $=C(R^{6a})-$  及び  $=N-$  から成る群から選択され；

W は、 $=C(R^{6b})-$  及び  $=N-$  から成る群から選択され；

$==$  は、単結合又は二重結合であり；

Y は、 $==$  が二重結合である場合、 $=C(R^{4a})-$  及び  $=N-$  から成る群から選択され；

Y は、 $==$  が単結合である場合、 $-C(H)R^{4a}-$  であり；

Z は、 $==$  が二重結合である場合、 $=C(R^5)-$  及び  $=N-$  から成る群から選択され；

Z は、 $==$  が単結合である場合、 $-C(=O)-$  であり；

$R^{4a}$  は、水素、ハロ及び  $C_{1-6}$  アルキルから成る群から選択され；

$R^{4b}$  は、水素、及び  $C_{1-6}$  アルキルから成る群から選択され；

$R^5$  は、水素、及び  $C_{1-6}$  アルキルから成る群から選択され；

$R^{6a}$  は、水素、ハロ、シアノ、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-4}$  ハロアルキル及び  $C_{1-4}$  アルコキシから成る群から選択され；そして

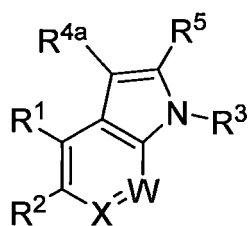
$R^{6b}$  は、水素、ハロ、シアノ、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-4}$  ハロアルキル及び  $C_{1-4}$  アルコキシから成る群から選択され、

ここで X が  $=C(R^{6a})-$  である場合 W が  $=N-$  であり；X が  $=N-$  である場合 W が  $=C(R^{6b})-$  である」を有する化合物、又は医薬的に許容できるその塩又は溶媒和物。

【請求項 2】

下記式 III：

【化 2】



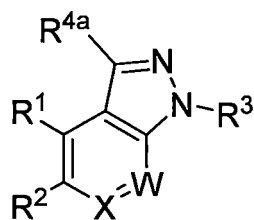
III.

を有する、請求項 1 に記載の化合物、又は医薬的に許容できるその塩又は溶媒和物。

【請求項 3】

下記式 IV：

【化 3】



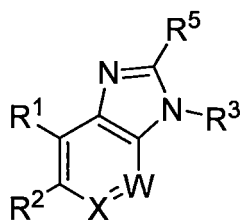
IV

を有する、請求項 1 に記載の化合物、又は医薬的に許容できるその塩又は溶媒和物。

【請求項 4】

下記式 V：

【化 4】



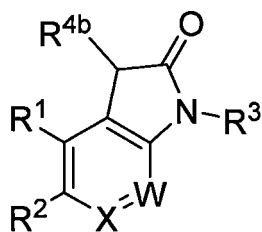
V.

を有する、請求項 1 に記載の化合物、又は医薬的に許容できるその塩又は溶媒和物。

【請求項 5】

下記式 VI：

【化 5】



VI

を有する、請求項 1 に記載の化合物、又は医薬的に許容できるその塩又は溶媒和物。

【請求項 6】

X が = N - であり、そして W が = C (H) - である、請求項 1 に記載の化合物、又は医薬的に許容できるその塩又は溶媒和物。

【請求項 7】

X が = C (H) - であり、そして W が = N - である、請求項 1 に記載の化合物、又は医薬的に許容できるその塩又は溶媒和物。

【請求項 8】

R<sup>1</sup> がハロである、請求項 1 に記載の化合物、又は医薬的に許容できるその塩又は溶媒和物。

【請求項 9】

R<sup>2</sup> がハロである、請求項 1 に記載の化合物、又は医薬的に許容できるその塩又は溶媒和物。

【請求項 10】

R<sup>1</sup> がハロであり、R<sup>2</sup> がハロであり、そして R<sup>3</sup> が任意に置換された C<sub>1</sub> - 6 がアルキル、任意に置換された C<sub>3</sub> - 8 シクロアルキル、任意に置換された 4 ~ 8 員のヘテロシクロ、(アミノ) アルキル、(ヘテロシクロ) アルキル、及び (ヘテロアリール) アルキルから成る群から選択される、請求項 1 に記載の化合物、又は医薬的に許容できるその塩又は溶媒和物。

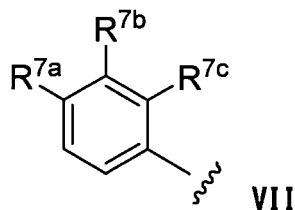
【請求項 11】

R<sup>1</sup> が、任意に置換されたフェニル、及び任意に置換された 9 ~ 14 員のヘテロアリールから成る群から選択される、請求項 1 に記載の化合物、又は医薬的に許容できるその塩又は溶媒和物。

【請求項 12】

R<sup>1</sup> が、下記式 VII :

【化 6】



VII

〔式中、R<sup>7a</sup>、R<sup>7b</sup> 及び R<sup>7c</sup> は、水素、ハロ、シアノ、アミノヒドロキシ、C<sub>1</sub> - 4 アルキル、C<sub>1</sub> - 4 ハロアルキル、C<sub>1</sub> - 4 アルコキシ、任意に置換されたフェニル、及びカルボキサミドから成る群から個々に独立して選択され、又は R<sup>7a</sup> 及び R<sup>7b</sup> は、それらが結合される炭素原子と一緒に取られる場合、5 -、6 - 又は 7 - 員の任意に置換されたヘテロシクロを形成する〕を有する任意に置換されたフェニルである、請求項 11

に記載の化合物、又は医薬的に許容できるその塩又は溶媒和物。

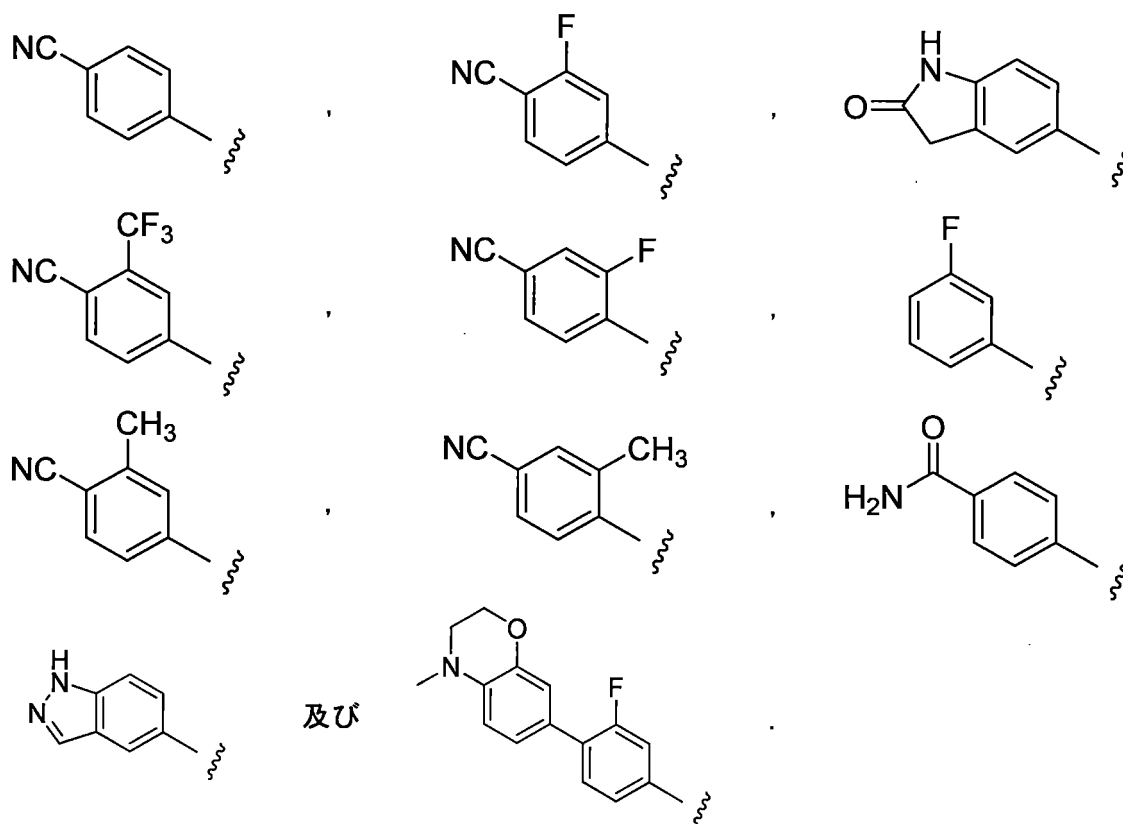
【請求項 1 3】

R<sup>7a</sup> がシアノである、請求項 1 2 に記載の化合物、又は医薬的に許容できるその塩又は溶媒和物。

【請求項 1 4】

R<sup>1</sup> が、任意に置換されたフェニル、又は下記式：

【化 7】

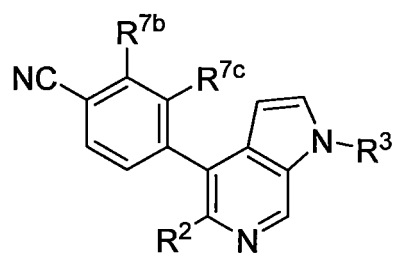


から成る群から選択された任意に置換された 9 ～ 14 員のヘテロアリールである、請求項 1 1 に記載の化合物、又は医薬的に許容できるその塩又は溶媒和物。

【請求項 1 5】

下記式VIII：

【化 8】

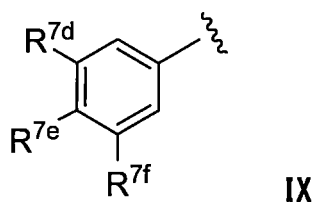


VIII

〔式中、R<sup>7b</sup> 及び R<sup>7c</sup> は、水素、ハロ、C<sub>1</sub> - 4 アルキル及び C<sub>1</sub> - 4 ハロアルキルから成る群から独立して選択される〕を有する、請求項 1 3 に記載の化合物、又は医薬的に許容できるその塩又は溶媒和物。

【請求項 1 6】

$R^2$  が、下記式 I X :  
【化 9】



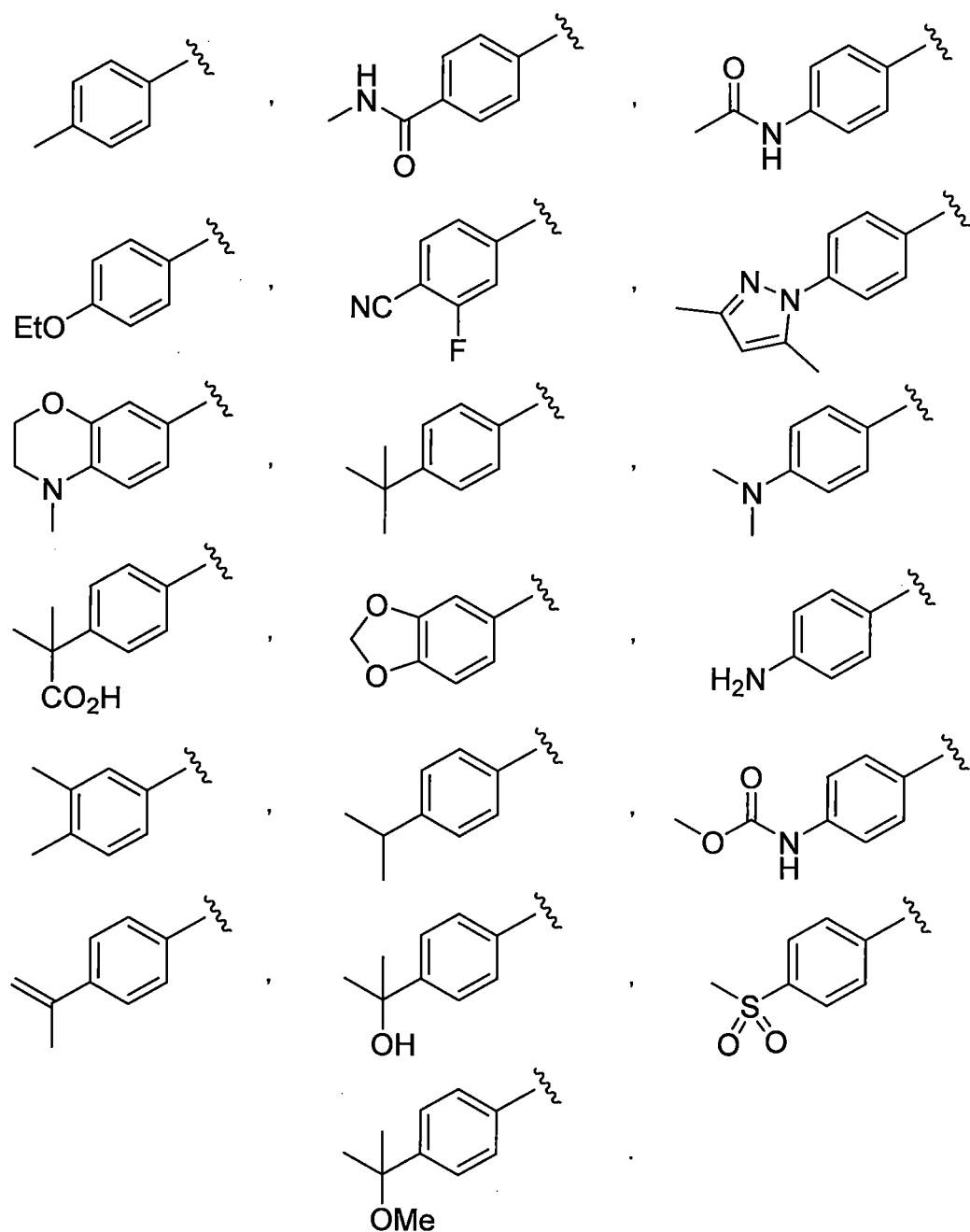
〔式中、 $R^{7d}$ 、 $R^{7c}$  及び  $R^{7f}$  が、水素、ハロ、シアノ、アミノ、ヒドロキシ、任意に置換された  $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-4}$  アルケニル、 $C_{1-4}$  ハロアルキル、 $C_{1-4}$  アルコキシ、カルボキサミド、アミド、任意に置換された  $C_{3-6}$  シクロアルキル、任意の置換されたフェニル、及び任意に置換された 5～9 員のヘテロアリールから成る群から個々に独立して選択され；又は

$R^{7d}$  及び  $R^{7e}$  は、それらが結合される炭素原子と一緒に取られる場合、任意に置換された 5－、6－又は 7－員のヘテロシクロを形成する〕を有する任意に置換されたフェニルである、請求項 1～15 のいずれか 1 項に記載の化合物、又は医薬的に許容できるその塩又は溶媒和物。

【請求項 17】

$R^2$  が、下記：

【化 10】

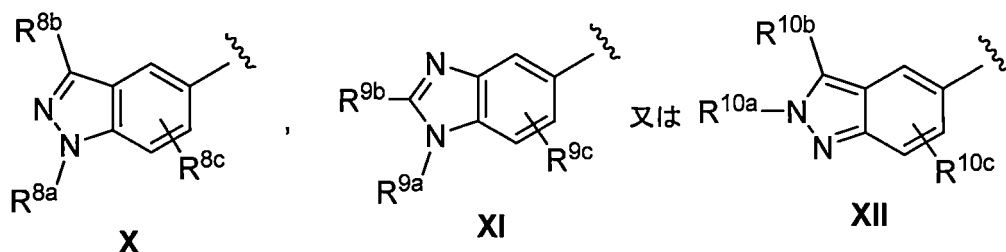


から成る群から選択された任意に置換されたフェニルである、請求項 1 ~ 15 のいずれか 1 項 に記載の化合物、又は医薬的に許容できるその塩又は溶媒和物。

【請求項 18】

R<sup>2</sup> が、下記式 X、X I 又は X II :

## 【化 1 1】

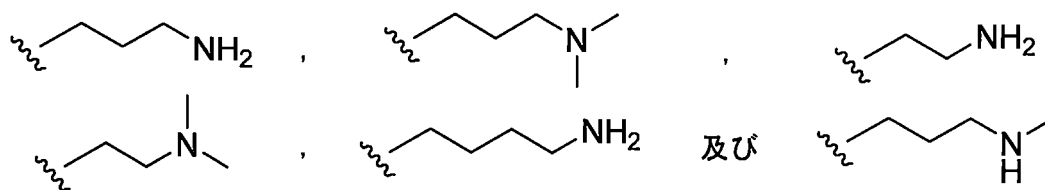


〔式中、 $R^{8a}$  は、水素及び  $C_{1-6}$  アルキルから成る群から選択され；  
 $R^{8b}$  は、水素及び  $C_{1-6}$  アルキルから成る群から選択され；  
 $R^{8c}$  は、水素、ハロ、シアノ、アミノ、ヒドロキシ、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-4}$  ハロアルキル及び  $C_{1-4}$  アルコキシから成る群から選択され；  
 $R^{9a}$  は、水素及び  $C_{1-6}$  アルキルから成る群から選択され；  
 $R^{9b}$  は、水素及び  $C_{1-6}$  アルキルから成る群から選択され；  
 $R^{9c}$  は、水素、ハロ、シアノ、アミノ、ヒドロキシ、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-4}$  ハロアルキル及び  $C_{1-4}$  アルコキシから成る群から選択され；  
 $R^{10a}$  は、水素及び  $C_{1-6}$  アルキルから成る群から選択され；  
 $R^{10b}$  は、水素及び  $C_{1-6}$  アルキルから成る群から選択され；  
 $R^{10c}$  は、水素、ハロ、シアノ、アミノ、ヒドロキシ、 $C_{1-4}$  アルキル、 $C_{1-4}$  ハロアルキル及び  $C_{1-4}$  アルコキシから成る群から選択される〕を有する任意に置換された 5～14 員のヘテロアリールである、請求項 1～17 のいずれか 1 項に記載の化合物、又は医薬的に許容できるその塩又は溶媒和物。

## 【請求項 19】

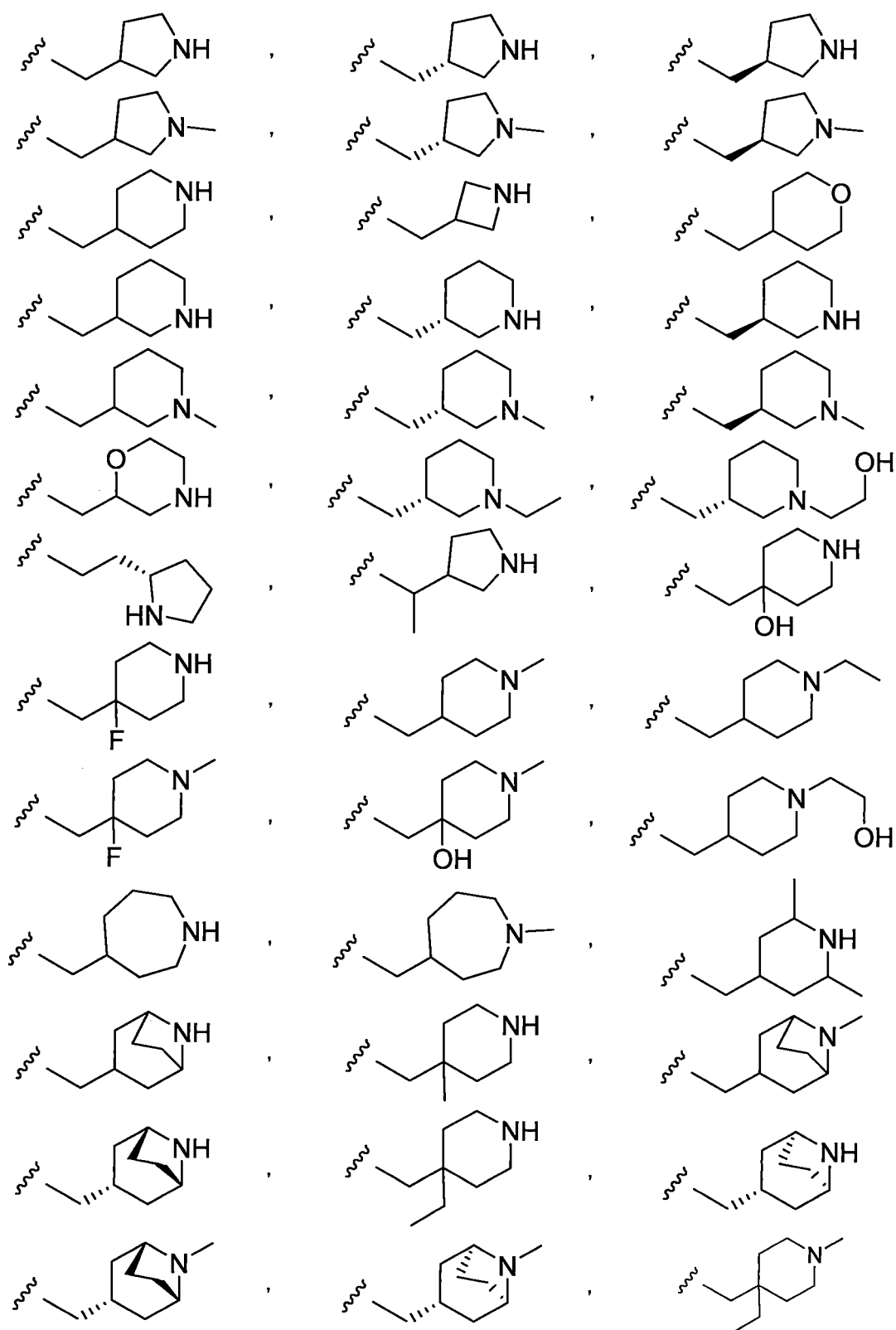
$R^2$  が、下記：

【化 1 3】

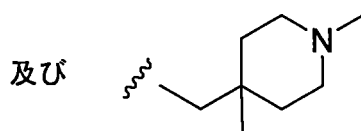


$\mathbb{R}^3$  が、下記：

【化 1 4 - 1】



【化 1 4 - 2】



から成る群から選択された（ヘテロシクロ）アルキルである、請求項 1 ～ 19 のいずれか 1 項に記載の化合物、又は医薬的に許容できるその塩又は溶媒和物。

【請求項 22】

表 1 の化合物中のいずれか 1 つ又は 2 つ以上の化合物である、請求項 1 に記載の化合物、又は医薬的に許容できるその塩又は溶媒和物。

【請求項 23】

請求項 1 ～ 22 のいずれか 1 項に記載の化合物、又は医薬的に許容できるその塩又は溶媒和物、及び医薬的に許容できる担体を含む医薬組成物。

【請求項 24】

癌、慢性自己免疫障害、炎症状態、増殖性障害、敗血症又はウィルス感染症の治療への使用のための請求項 23 に記載の医薬組成物。

【請求項 25】

癌の治療への使用のための請求項 24 に記載の医薬組成物。

【請求項 26】

前記癌が表 2 中の癌のいずれか 1 つ又は 2 つ以上の癌である、請求項 25 に記載の医薬組成物。

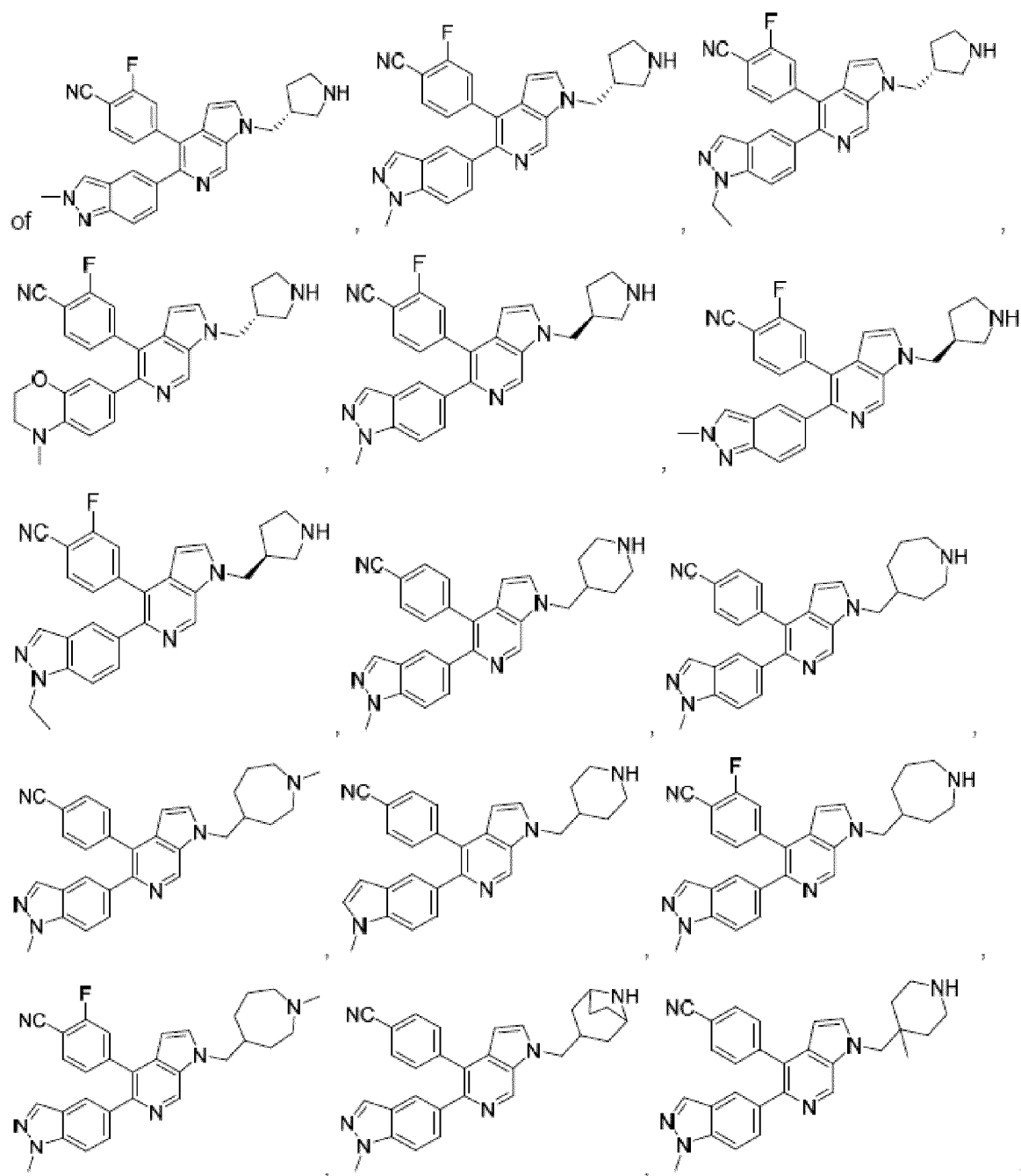
【請求項 27】

前記癌が、急性単球性白血病、急性骨髄性白血病、慢性骨髄性白血病、慢性リンパ球性白血病混合系統白血病、NUT 正中線癌、多発性骨髄腫、小細胞肺癌、非小細胞肺癌、神経芽細胞腫、バーキットリンパ腫、子宮頸癌、食道癌、卵巣癌、大腸癌、前立腺癌、乳癌、膀胱癌、卵巣癌、神経膠腫、肉腫、食道扁平上皮癌、及び甲状腺乳頭癌から成る群から選択される、請求項 25 に記載の医薬組成物。

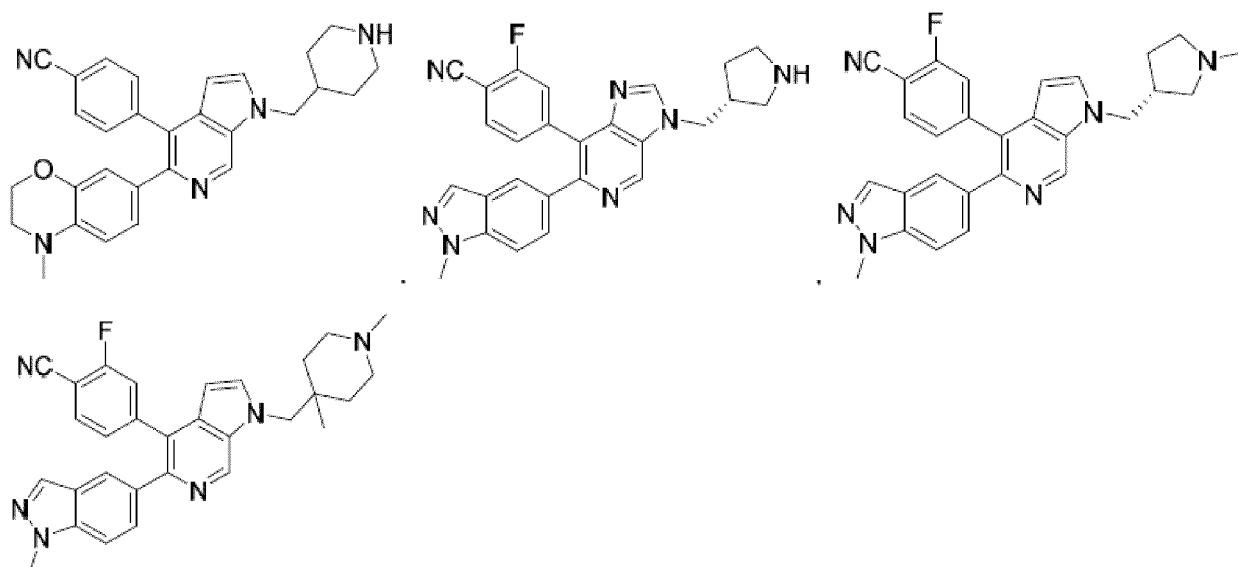
【請求項 28】

以下：

【化 1 5 - 1】



【化 1 5 - 2】

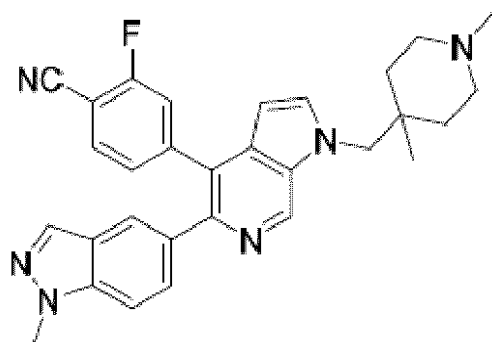


からなる群から選択される化合物。

【請求項 2 9】

以下：

【化 1 6】



で表される、請求項 1 に記載の化合物。