

【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5年2月17日(2023.2.17)

【国際公開番号】WO2020/176654

【公表番号】特表2022-521797(P2022-521797A)

【公表日】令和4年4月12日(2022.4.12)

【年通号数】公開公報(特許)2022-065

【出願番号】特願2021-550133(P2021-550133)

【国際特許分類】

10

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 P 3 5 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 D 4 7 1 / 1 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 D 4 8 7 / 1 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 5 1 9 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 D 4 1 3 / 1 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 4 2 4 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 D 2 7 1 / 1 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 1 2 N 9 / 5 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

20

【F I】

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 1 6

A 6 1 P 3 5 / 0 0 Z N A

C 0 7 D 4 7 1 / 1 4 1 0 2

C 0 7 D 4 8 7 / 1 4

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 1 4 4

C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 1 4 0

A 6 1 K 3 1 / 5 1 9

C 0 7 D 4 1 3 / 1 2 C S P

A 6 1 K 3 1 / 4 2 4 5

30

C 0 7 D 2 7 1 / 1 0

C 1 2 N 9 / 5 0

【手続補正書】

【提出日】令和5年2月9日(2023.2.9)

【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】

40

【特許請求の範囲】

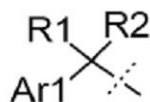
【請求項1】

式Iの化合物、

Z1-Q 式I

又はその薬学的に許容される塩であって、

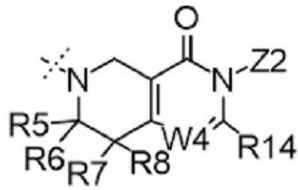
Z1は、



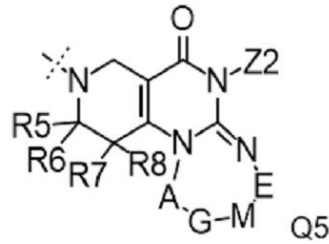
50

であり、

Q は、



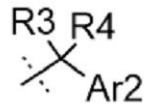
Q3 及び



10

から成る群から独立して選択され、

Z<sub>2</sub> は、



であり、

Ar<sub>1</sub> 及び Ar<sub>2</sub> は、アリール、ヘテロアリール、チオフェニル及びフェニルから独立して選択され、

20

Ar<sub>1</sub> は、1～3個のJ基で任意に置換することができる、

Ar<sub>2</sub> は1～3個のJJ基で置換され、

J は、ハロゲン、-CN、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)任意に置換されたアルキル、(C<sub>3</sub>～C<sub>9</sub>)任意に置換されたシクロアルキル、(C<sub>3</sub>～C<sub>9</sub>)シクロアルキル(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)ハロアルキル、-CF<sub>3</sub>、-NH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-SH、-SR<sub>15</sub>、-OH、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)任意に置換されたアルコキシ、-NR<sub>17</sub>R<sub>18</sub>、置換された(C<sub>3</sub>～C<sub>9</sub>)シクロアルキル(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>～C<sub>9</sub>)シクロアルキル(C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>)アルキニル、(C<sub>4</sub>～C<sub>8</sub>)シクロアルケニル、(C<sub>4</sub>～C<sub>8</sub>)シクロアルケニル(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)アルキル、アリール、ヘテロアリール、ヘテロシクリル、任意に置換されたアリール、任意に置換されたヘテロアリール、任意に置換されたヘテロシクリル、-C(O)OH、-C(O)OR<sub>15</sub>、-OC(O)OR<sub>15</sub>、(C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>)アルキニル、(C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>)アルケニル、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)ハロアルコキシ、-S(O)<sub>2</sub>OR<sub>15</sub>、-SO<sub>2</sub>NR<sub>17</sub>R<sub>18</sub>、-S(O)<sub>2</sub>R<sub>15</sub>、-NR<sub>15</sub>S(O)<sub>2</sub>R<sub>16</sub>、-C(O)NR<sub>17</sub>R<sub>18</sub>、-C(O)R<sub>15</sub>及び-NR<sub>15</sub>C(O)R<sub>16</sub>から独立して選択され、

30

JJ は、ハロゲン、-CN、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)ハロアルキル、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)任意に置換されたアルキル、-CF<sub>3</sub>、-NH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-SH、-SR<sub>15</sub>、-OH、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)任意に置換されたアルコキシ、-NR<sub>17</sub>R<sub>18</sub>、アリール、ヘテロアリール、-C(O)OH、-C(O)OR<sub>15</sub>、-OC(O)OR<sub>15</sub>、(C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>)アルキニル、(C<sub>2</sub>～C<sub>8</sub>)アルケニル、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)ハロアルコキシ、-S(O)<sub>2</sub>OR<sub>15</sub>、-SO<sub>2</sub>NR<sub>17</sub>R<sub>18</sub>、-S(O)<sub>2</sub>R<sub>15</sub>、-NR<sub>15</sub>S(O)<sub>2</sub>R<sub>16</sub>、-C(O)NR<sub>17</sub>R<sub>18</sub>、-C(O)R<sub>15</sub>及び-NR<sub>15</sub>C(O)R<sub>16</sub>から独立して選択され、

40

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>、及びR<sub>8</sub>は、水素、ハロゲン、-OH及び(C<sub>1</sub>～C<sub>3</sub>)任意に置換されたアルキルからそれぞれ独立して選択され、

R<sub>5</sub>及びR<sub>6</sub>は共に、=Oを形成することができ、

R<sub>7</sub>及びR<sub>8</sub>は共に、=Oを形成することができ、

R<sub>14</sub>は、水素、ハロゲン、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)任意に置換されたアルキル、(C<sub>3</sub>～C<sub>6</sub>)シクロアルキル、(C<sub>1</sub>～C<sub>6</sub>)ハロアルキル、(C<sub>2</sub>～C<sub>6</sub>)任意に置換されたアルケ

50

ニル、(C<sub>2</sub> ~ C<sub>6</sub>)任意に置換されたアルキニル、-CN、-S(O)<sub>2</sub>R<sub>15</sub>、-NR<sub>17</sub>R<sub>18</sub>、-S(O)<sub>2</sub>R<sub>15</sub>、-C(NH)NH<sub>2</sub>、-C(O)R<sub>15</sub>、及び-C(O)OR<sub>15</sub>から独立して選択され、

R<sub>15</sub>、R<sub>16</sub>、R<sub>17</sub>、R<sub>18</sub>、及びR<sub>28</sub>は、水素及び(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>)任意に置換されたアルキルから独立して選択され、

R<sub>17</sub>及びR<sub>18</sub>は、それらが結合する窒素と共に、3 ~ 6個の原子の環を形成することができ、

W<sub>4</sub>は、=C(R<sub>14</sub>)-及び窒素からなる群から独立して選択され、

Aは、SS及び



10

から成る群から独立して選択され、

Gは、SS及び



20

からなる群から独立して選択され、

Mは、SS及び



からなる群から独立して選択され、

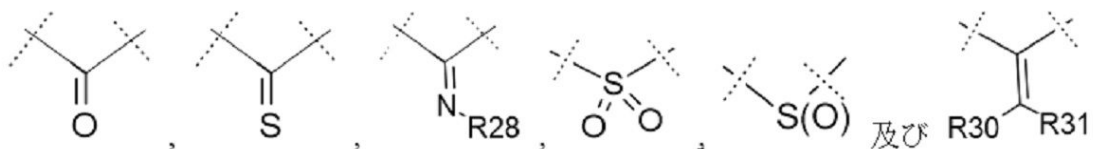
Eは、単結合、SS、及び



30

からなる群から独立して選択され、

SSは、



40

からなる群から独立して選択され、

R<sub>20</sub>、R<sub>21</sub>、R<sub>26</sub>及びR<sub>27</sub>は、水素、ハロゲン及び(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>)任意に置換されたアルキルからなる群からそれぞれ独立して選択され、

R<sub>22</sub>、R<sub>23</sub>、R<sub>24</sub>及びR<sub>25</sub>は、水素、ハロゲン、-CN、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>)任意に置換されたアルキル、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>9</sub>)任意に置換されたシクロアルキル、(C<sub>3</sub> ~ C<sub>9</sub>)シクロアルキル(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub>)ハロアルキル、-NH<sub>2</sub>、-N

50

O<sub>2</sub>、-SH、-SR<sub>15</sub>、-OH、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)任意に置換されたアルコキシ、-NR<sub>17</sub>R<sub>18</sub>、置換された(C<sub>3</sub>~C<sub>9</sub>)シクロアルキル(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、(C<sub>3</sub>~C<sub>9</sub>)シクロアルキル(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)アルキニル、(C<sub>4</sub>~C<sub>8</sub>)シクロアルケニル、(C<sub>4</sub>~C<sub>8</sub>)シクロアルケニル(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)アルキル、アリール、ヘテロアリール、-C(O)OH、-C(O)OR<sub>15</sub>、-OC(O)OR<sub>15</sub>、(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)アルキニル、(C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>)アルケニル、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)ハロアルコキシ、-S(O)<sub>2</sub>OR<sub>15</sub>、-SO<sub>2</sub>NR<sub>17</sub>R<sub>18</sub>、-S(O)<sub>2</sub>R<sub>15</sub>、-NR<sub>15</sub>S(O)<sub>2</sub>R<sub>16</sub>、-C(O)NR<sub>17</sub>R<sub>18</sub>、-C(O)R<sub>15</sub>、及び-NR<sub>15</sub>C(O)R<sub>16</sub>からなる群からそれぞれ独立して選択され、

R<sub>22</sub>及びR<sub>23</sub>は、それらが結合する炭素と共に、3~6個の炭素原子を有する非芳香族環を形成することができ、

R<sub>22</sub>及びR<sub>23</sub>は、それらが結合する炭素と共に、1~2個の酸素原子を有する非芳香族環を形成することができ、

R<sub>24</sub>及びR<sub>25</sub>は、それらが結合する炭素と共に、1~2個の酸素原子を有する非芳香族環を形成することができ、

R<sub>24</sub>及びR<sub>25</sub>は、それらが結合する炭素と共に、3~6個の炭素原子を有する非芳香族環を形成することができ、

R<sub>30</sub>及びR<sub>31</sub>は、水素及び(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)任意に置換されたアルキルからなる群からそれぞれ独立して選択される、

化合物又はその薬学的に許容される塩。

10

20

【請求項2】

QがQ<sub>3</sub>である、請求項1に記載の前記化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項3】

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、R<sub>4</sub>、R<sub>5</sub>、R<sub>6</sub>、R<sub>7</sub>及びR<sub>8</sub>はそれぞれ水素であり、

Ar<sub>1</sub>及びAr<sub>2</sub>は、それぞれフェニルである、請求項2に記載の前記化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項4】

W<sub>4</sub>は窒素であり、

Jは、ハロゲン、-CN、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)任意に置換されたアルキル、(C<sub>3</sub>~C<sub>9</sub>)任意に置換されたシクロアルキル、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)ハロアルキル、-CF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)任意に置換されたアルコキシ、-NR<sub>17</sub>R<sub>18</sub>、任意に置換されたヘテロシクリル、(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)アルキニル、(C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>)アルケニル及び(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)ハロアルキルオキシから独立して選択され、

J<sub>1</sub>は、ハロゲン、-CN、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)任意に置換されたアルキル、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)任意に置換されたシクロアルキル、-CF<sub>3</sub>、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)ハロアルキル、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)任意に置換されたアルコキシ、(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)アルキニル、(C<sub>2</sub>~C<sub>8</sub>)アルケニル、及び(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)ハロアルキルオキシから独立して選択され、

R<sub>14</sub>は、水素、ハロゲン、(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)任意に置換されたアルキル、及び-CNから独立して選択される、請求項3に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

30

40

【請求項5】

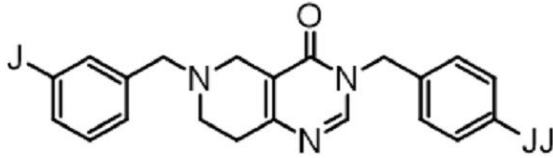
Jは、水素、ハロゲン、-CN及び(C<sub>2</sub>~C<sub>6</sub>)アルキニルから独立して選択され、

J<sub>1</sub>は、ハロゲン、-CF<sub>3</sub>及び(C<sub>1</sub>~C<sub>6</sub>)ハロアルキルから独立して選択される、請求項4に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項6】

前記化合物は下記式で表される、請求項5に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

50



## 【請求項 7】

QはQ 5である、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 8】

10

R 1、R 2、R 3、R 4、R 5、R 6、R 7、及び R 8 は水素であり、  
A は



であり、

M は

20



であり、

E は単結合である、請求項 7 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 9】

J は、ハロゲン、 $-CN$ 、 $(C 1 \sim C 6)$  任意に置換されたアルキル、 $(C 3 \sim C 9)$  任意に置換されたシクロアルキル、 $(C 1 \sim C 6)$  ハロアルキル、 $-CF_3$ 、 $(C 1 \sim C 6)$  任意に置換されたアルコキシ、 $-NR 1 7 R 1 8$ 、任意に置換されたヘテロシクリル、 $(C 2 \sim C 6)$  アルキニル、 $(C 2 \sim C 8)$  アルケニル、及び  $(C 1 \sim C 6)$  ハロアルキルオキシから独立に選択され、

30

J J は、ハロゲン、 $-CN$ 、 $(C 1 \sim C 6)$  ハロアルキル、 $(C 1 \sim C 6)$  任意に置換されたアルキル、 $-CF_3$ 、 $(C 1 \sim C 6)$  任意に置換されたアルコキシ、 $(C 2 \sim C 6)$  アルキニル、 $(C 2 \sim C 8)$  アルケニル、及び  $(C 1 \sim C 6)$  ハロアルキルオキシから独立に選択される、請求項 8 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 10】

J は、水素、ハロゲン、 $-CN$ 、及び  $(C 2 \sim C 6)$  アルキニルから独立に選択され、

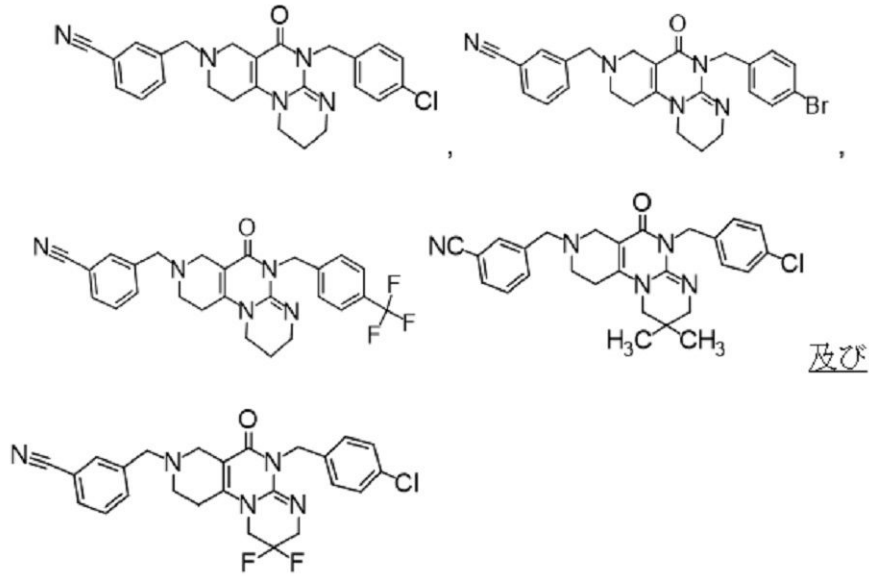
40

J J は、ハロゲン、 $-CF_3$ 、及び  $(C 1 \sim C 6)$  ハロアルキルから独立に選択される、請求項 9 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

## 【請求項 11】

前記化合物は、

50



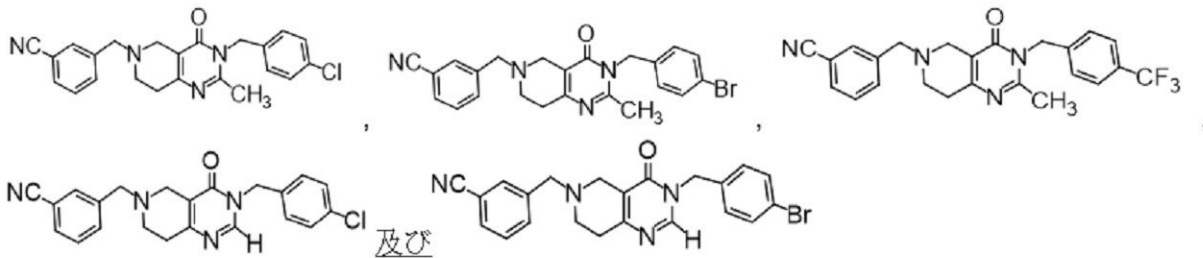
10

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

20

【請求項 1 2】

前記化合物は、

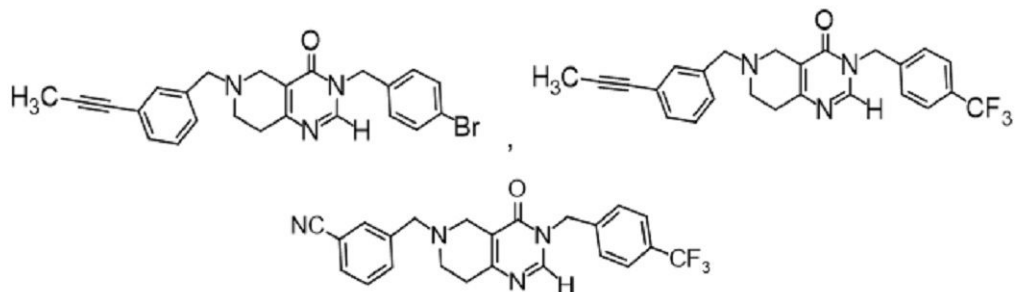


30

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 3】

前記化合物は、



40

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 1 4】

被験体における癌の治療する方法に用いる請求項 1 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の化合物であり、前記方法は、有効量の、前記化合物又はその薬学的に許容される塩を前記被験体に投与する工程を含む、化合物。

【請求項 1 5】

請求項 1 ~ 1 1 のいずれか一項に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩、並びに

50

薬学的に許容される担体又は賦形剤を含む、薬学的組成物。

10

20

30

40

50