

【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 9 日 (2021.9.9)

【公表番号】特表 2020-529396 (P2020-529396A)

【公表日】令和 2 年 10 月 8 日 (2020.10.8)

【年通号数】公開・登録公報 2020-041

【出願番号】特願 2019-572809 (P2019-572809)

【国際特許分類】

C 07 D 221/10 (2006.01)

C 07 D 401/02 (2006.01)

A 61 K 31/473 (2006.01)

A 61 K 45/00 (2006.01)

A 61 K 31/7004 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 3/00 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 P 13/12 (2006.01)

A 61 P 1/16 (2006.01)

A 61 P 17/00 (2006.01)

【F I】

C 07 D 221/10 C S P

C 07 D 401/02

A 61 K 31/473

A 61 K 45/00

A 61 K 31/7004

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 3/00

A 61 P 35/00

A 61 P 43/00 1 0 5

A 61 P 13/12

A 61 P 1/16

A 61 P 17/00

A 61 P 43/00 1 2 1

【手続補正書】

【提出日】令和 3 年 7 月 26 日 (2021.7.26)

【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】

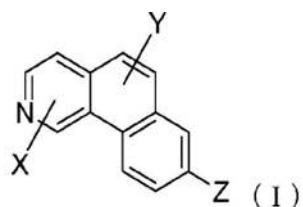
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 (I) による構造を有する化合物、またはその塩もしくは水和物もしくは溶媒和物であって



## 【化 1】



式中、Zが、 $-COOR^5$ または $-C(O)NHR^5$ であり、 $R^5$ が、H、または置換もしくは非置換のアルキル、または置換もしくは非置換のシクロアルキルであり、

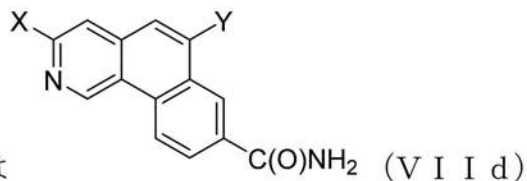
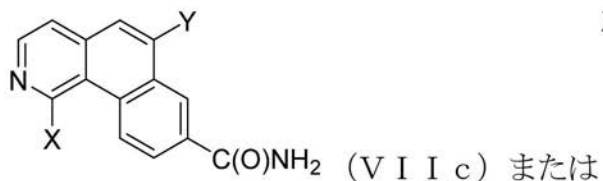
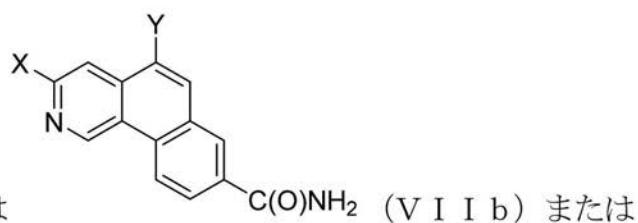
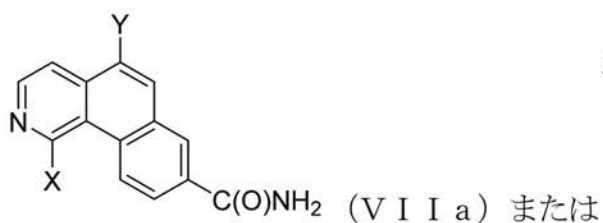
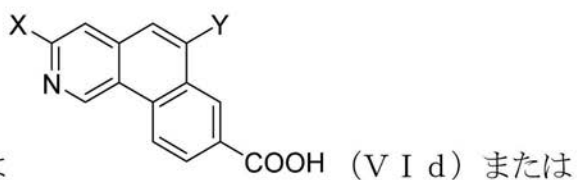
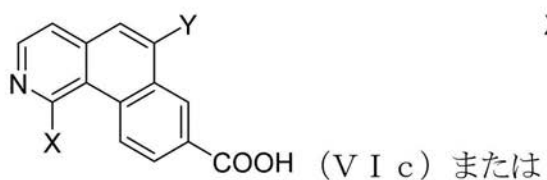
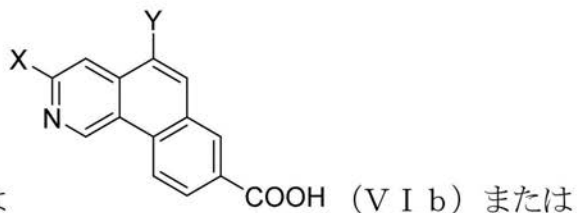
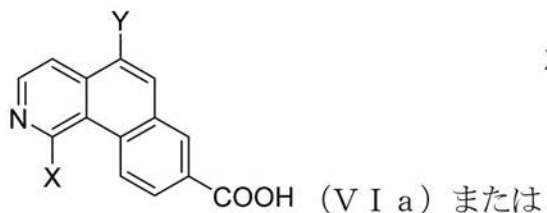
Yが、H、またはハロゲン、またはニトロ、またはシアノ、または置換もしくは非置換のアリール、または置換もしくは非置換のヘテロアリール、または置換もしくは非置換のアルキル、または置換もしくは非置換のシクロアルキル、または $NR^1R^2$ であり、ここで $R^1$ および $R^2$ がそれぞれ独立して、H、または置換もしくは非置換のアルキル、または置換もしくは非置換のシクロアルキル、または置換もしくは非置換のヘテロシクロアルキルであるか、あるいは $R^1$ および $R^2$ が、それらが結合している窒素と一緒に任意に結合して、置換もしくは非置換の4～8員環を形成し、

Xが、H、またはハロゲン、または $OR^3$ 、または $NR^3R^4$ であり、ここで、 $R^3$ および $R^4$ がそれぞれ独立して、H、または置換もしくは非置換のアルキル、または置換もしくは非置換のシクロアルキルから選択されるか、あるいは $R^3$ および $R^4$ が、それらが結合している窒素と一緒に任意に結合して、置換もしくは非置換の4～8員環を形成する、化合物、またはその塩もしくは水和物もしくは溶媒和物。

## 【請求項 2】

構造

## 【化 2】



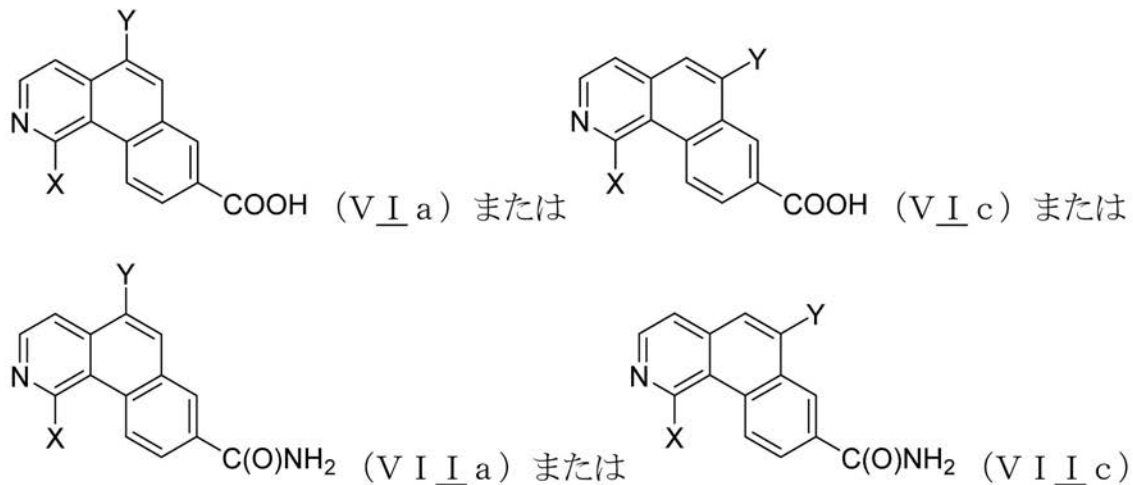
を有する、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩もしくは水和物もしくは溶媒和物。

## 【請求項 3】



構造

【化 3】



を有する、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩もしくは水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 4】

X が、H、または  $\text{NR}^3\text{R}^4$  である、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩もしくは水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 5】

X が、H、または  $\text{NH}_2$  である、請求項 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩もしくは水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 6】

Y が、ハロゲン、または非置換のアルキル、または  $\text{NR}^1\text{R}^2$  である、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩もしくは水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 7】

Y が、Br、または Cl、または  $\text{CH}_3$ 、またはアミノ置換ピリジンである、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩もしくは水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 8】

Y が、 $\text{NHR}^1$  である、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩もしくは水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 9】

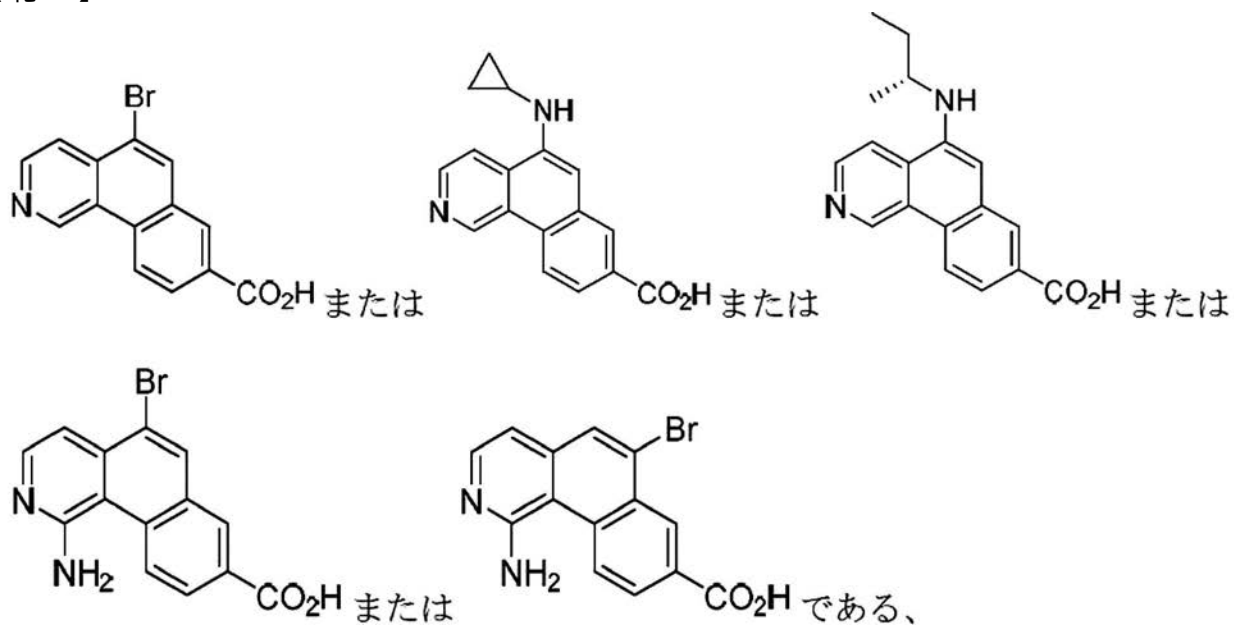
Y が、 $\text{NR}^1\text{R}^2$  であり、 $\text{R}^1$  および  $\text{R}^2$  が、それらが結合している窒素と一緒に結合して、非置換の 5 または 6 員環を形成する、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその塩もしくは水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 10】

前記化合物が、



【化 4】



請求項 1 に記載の化合物、またはその塩もしくは水和物もしくは溶媒和物。

【請求項 1 1】

前記化合物が、



[illegible]

【請求項 1 2】

【請求項 13】

【請求項 14】

b) 薬学的に許容される賦形剤と、を含む、薬学的製剤。

前記薬学的製剤が単位剤形である、請求項 14 に記載の薬学的製剤。



## 【請求項 16】

前記化合物の前記塩が、薬学的に許容される塩である、請求項 14 または請求項 15 に記載の薬学的製剤。

## 【請求項 17】

C D K 8 および / または C D K 19 および / または H I P K 2 および / または C K 2 a と接触される、有効量の請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、

C D K 8 および / または C D K 19 および / または H I P K 2 および / または C K 2 a の阻害剤。

## 【請求項 18】

疾患に罹患している動物に投与される、治療有効量の請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、

前記動物における前記疾患を治療するための医薬。

## 【請求項 19】

C D K 8 および / または C D K 19 および / または H I P K 2 および / または C K 2 a 活性が関与する疾患に罹患している動物に投与される、治療有効量の請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の化合物を含む、

前記疾患を治療するための医薬。

## 【請求項 20】

前記疾患が癌である、請求項 18 または 19 に記載の医薬。

## 【請求項 21】

前記疾患が線維症であり、前記線維症が、腎臓の線維症、または肝臓の線維症、または肺の線維症、または皮膚の線維症である、請求項 18 または 19 に記載の医薬。

## 【請求項 22】

前記動物がヒトである、請求項 18 ~ 21 のいずれか 1 項に記載の医薬。

## 【請求項 23】

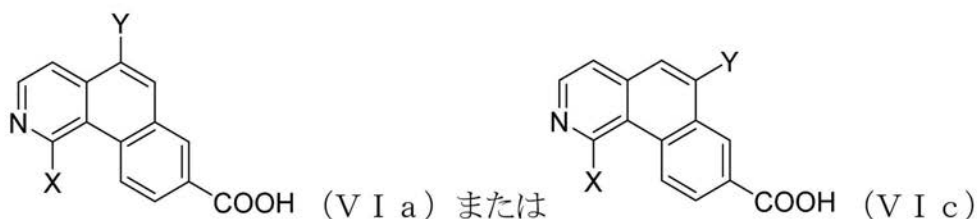
癌の治療のための医薬品の製造における、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

## 【請求項 24】

線維症の治療のための医薬品の製造における、請求項 1 ~ 11 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

## 【請求項 25】

## 【化 6】

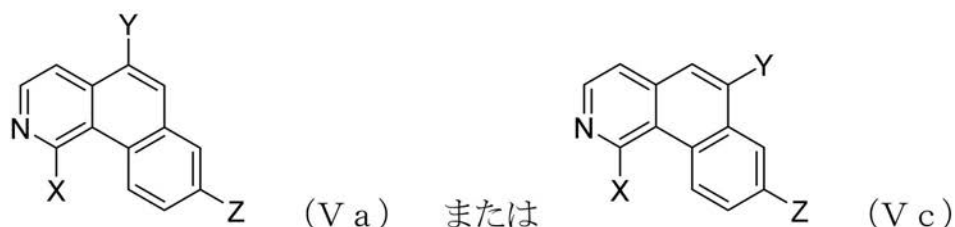


からなる群から選択される構造を有する、請求項 1 に記載の化合物、またはその塩もしくは水和物もしくは溶媒和物。

## 【請求項 26】



## 【化 7】



からなる群から選択される構造を有し、

Y は、Br、または Cl、または CN、または NO<sub>2</sub>、または非置換の C<sub>1</sub> もしくは C<sub>2</sub> もしくは C<sub>3</sub> もしくは C<sub>4</sub> アルキル、または p - ハロフェニル -、または m - ハロフェニル、または o - ハロフェニル、またはピリジニル、またはアミノピリジニル、またはピラゾリル、またはメチル、またはフェニル、または p - クロロフェニル、またはシクロプロピル、またはピリジン - 3 - イル、または 6 - アミノピリジン - 3 - イル、またはピリジン - 4 - イル、またはピラゾール - 3 - イルである、

請求項 1 に記載の化合物、またはその塩もしくは水和物もしくは溶媒和物。

## 【請求項 2 7】

## 【化 8】



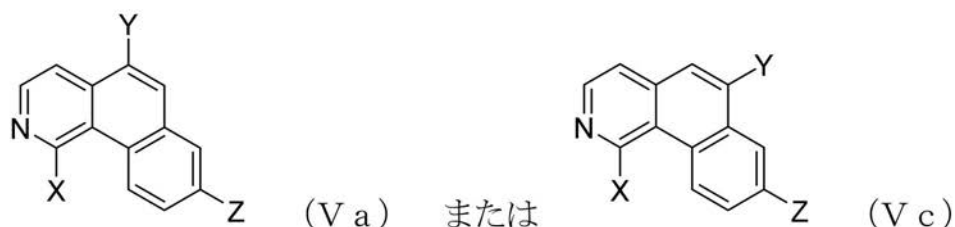
からなる群から選択される構造を有し、

Y は、NR<sup>1</sup>R<sup>2</sup> であり、R<sup>1</sup> および R<sup>2</sup> が、それぞれ独立して、H、または非置換の C<sub>1</sub> もしくは C<sub>2</sub> もしくは C<sub>3</sub> もしくは C<sub>4</sub> もしくは C<sub>5</sub> アルキル、または非置換の C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> シクロアルキル、または非置換の C<sub>3</sub> ~ C<sub>7</sub> ヘテロシクロアルキル、またはハロ置換アリール、またはピリジニルである、

請求項 1 に記載の化合物、またはその塩もしくは水和物もしくは溶媒和物。

## 【請求項 2 8】

## 【化 9】



からなる群から選択される構造を有し、

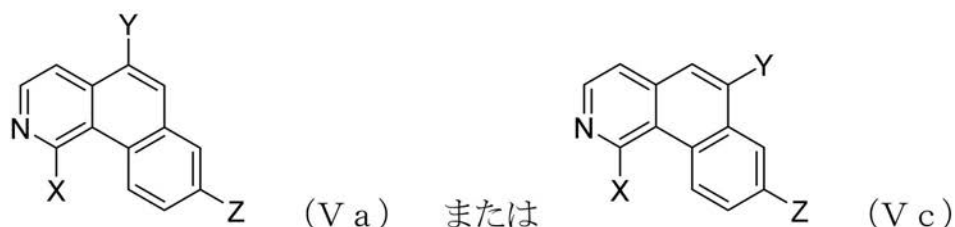
Y は、NHR<sup>1</sup> であり、R<sup>1</sup> が、H、またはプロピル、または sec - ブチル、またはシクロプロピル、またはシクロブチル、またはシクロペンチル、または p - クロロフェニル -、または m - クロロフェニルである、

請求項 1 に記載の化合物、またはその塩もしくは水和物もしくは溶媒和物。

## 【請求項 2 9】



## 【化 1 0】



からなる群から選択される構造を有し、

Y は、 $\text{NR}^1\text{R}^2$  であり、 $\text{R}^1$  および  $\text{R}^2$  は、それらが結合している窒素と一緒に結合して、置換もしくは非置換の 5 または 6 員環を形成する、

請求項 1 に記載の化合物、またはその塩もしくは水和物もしくは溶媒和物。

## 【請求項 3 0】

## 【化 1 1】



からなる群から選択される構造を有し、

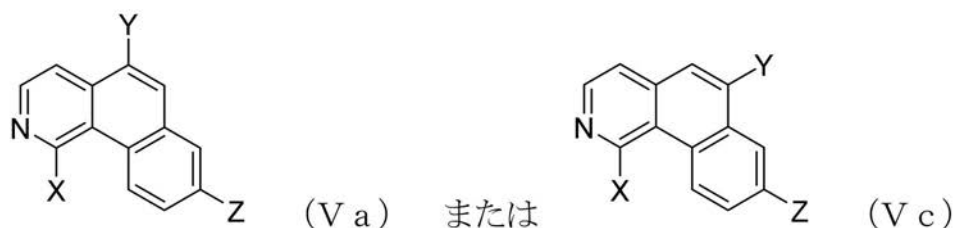
Z は、 $-\text{COOH}$ 、または  $-\text{CONH}_2$  であり、

Y は、ハロゲン、またはシアノ、またはニトロ、またはメチル、またはフェニル、またはハロゲン置換フェニル、またはシクロプロピル、またはピペリジン、またはアミノ置換ピペリジン、またはピリジニル、またはピラゾールである、

請求項 1 に記載の化合物、またはその塩もしくは水和物もしくは溶媒和物。

## 【請求項 3 1】

## 【化 1 2】



からなる群から選択される構造を有し、

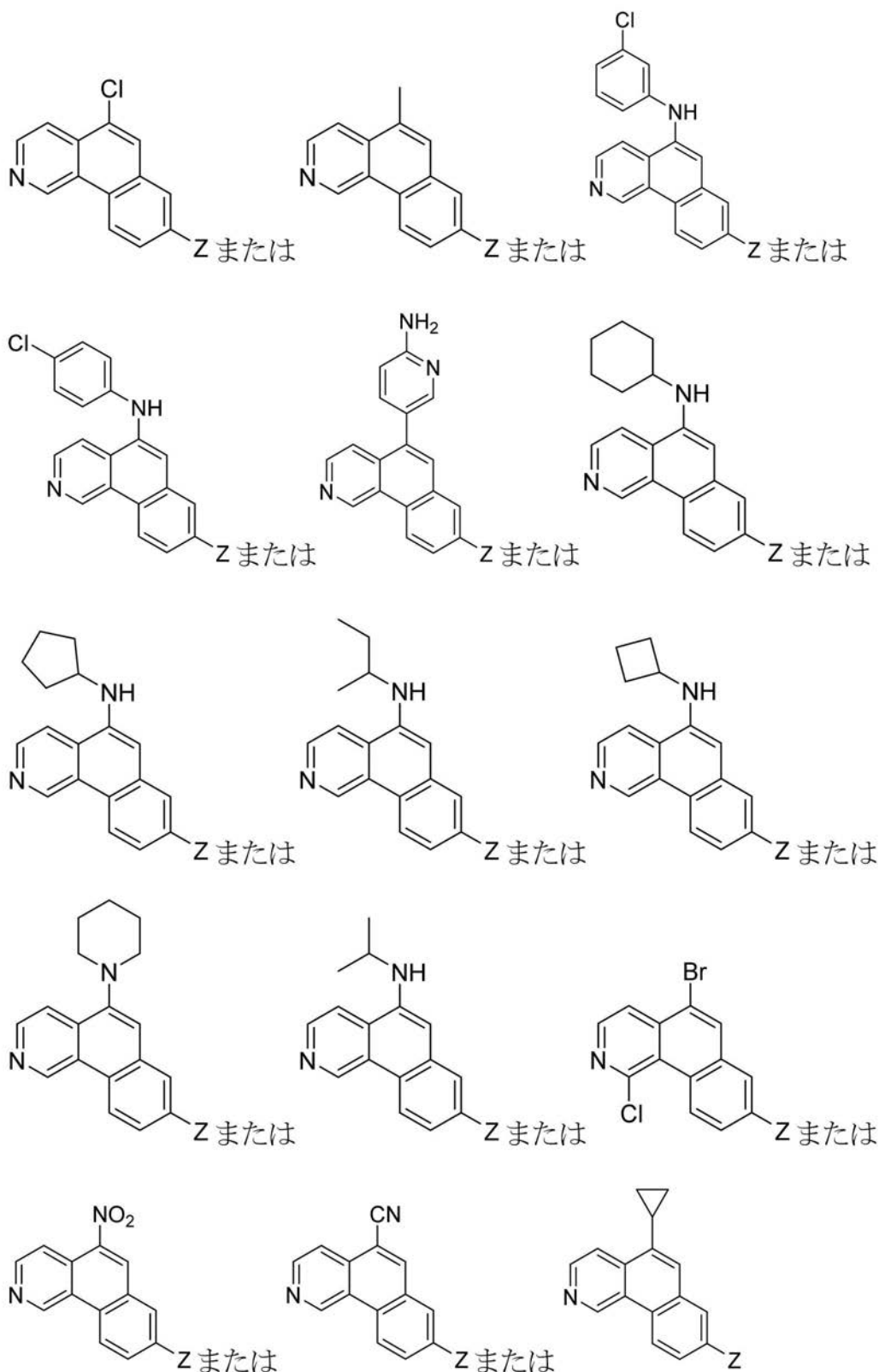
Z は、 $-\text{COOH}$ 、または  $-\text{CONH}_2$  であり、X は、H、または  $\text{NH}_2$  であり、Y は、ハロゲン、またはシアノ、またはニトロ、またはメチル、またはフェニル、またはハロゲン置換フェニル、またはシクロプロピル、またはピペリジン、またはアミノ置換ピペリジン、またはピリジニル、またはピラゾールである、

化合物、またはその塩もしくは水和物もしくは溶媒和物。

## 【請求項 3 2】



## 【化 1 3】



からなる群から選択される構造を有し、

Z が、 $-\text{COOR}^5$  または  $-\text{C}(\text{O})\text{NHR}^5$  であり、 $\text{R}^5$  が、置換もしくは非置換のアルキル、または置換もしくは非置換のシクロアルキルである、

化合物、またはその塩もしくは水和物もしくは溶媒和物。

## 【請求項 33】

5 - プロモベンゾ[h]イソキノリン - 8 - カルボキシレート、5 - クロロベンゾ[h]



] イソキノリン - 8 - カルボキシレート、5 - メチルベンゾ [ H ] イソキノリン - 8 - カ  
ルボキシレート、5 - ( シクロヘキシルアミノ ) ベンゾ [ h ] イソキノリン - 8 - カルボ  
キシレート、5 - ( s e c - ブチルアミノ ) ベンゾ [ h ] イソキノリン - 8 - カルボキシ  
レート、5 - ( シクロプロピルアミノ ) ベンゾ [ h ] イソキノリン - 8 - カルボキシレ  
ート、5 - ( シクロブチルアミノ ) ベンゾ [ h ] イソキノリン - 8 - カルボキシレート、5  
- シアノベンゾ [ h ] イソキノリン - 8 - カルボキシレート、5 - シクロプロピルベンゾ  
[ h ] イソキノリン - 8 - カルボキシレート、1 - アミノ - 5 - プロモベンゾ [ h ] イソ  
キノリン - 8 - カルボキシレート、5 - プロモ - 1 - メトキシベンゾ [ h ] イソキノリン  
- 8 - カルボキシレート、及び 1 - アミノ - 6 - プロモベンゾ [ h ] イソキノリン - 8 -  
カルボキシレートからなる群から選択される構造を有する、  
化合物、またはその塩もしくは水和物もしくは溶媒和物。