

【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7月11日(2022.7.11)

【国際公開番号】WO2020/010155

【公表番号】特表2021-529834(P2021-529834A)

【公表日】令和3年11月4日(2021.11.4)

【出願番号】特願2021-522935(P2021-522935)

【国際特許分類】

C 0 7 D 207/34(2006.01)	10
C 0 7 D 231/38(2006.01)	
A 6 1 K 31/415(2006.01)	
C 0 7 D 403/04(2006.01)	
A 6 1 K 31/506(2006.01)	
C 0 7 D 409/04(2006.01)	
A 6 1 K 31/40(2006.01)	
C 0 7 D 405/12(2006.01)	
C 0 7 D 401/12(2006.01)	
A 6 1 K 31/4709(2006.01)	
C 0 7 D 417/14(2006.01)	20
A 6 1 K 31/427(2006.01)	
C 0 7 D 401/04(2006.01)	
A 6 1 K 31/4439(2006.01)	
C 0 7 D 405/04(2006.01)	
C 0 7 D 413/04(2006.01)	
A 6 1 K 31/422(2006.01)	
C 0 7 D 307/66(2006.01)	
A 6 1 K 31/341(2006.01)	
C 0 7 D 263/48(2006.01)	
A 6 1 K 31/421(2006.01)	30
C 0 7 D 261/14(2006.01)	
A 6 1 K 31/42(2006.01)	
A 6 1 K 31/4725(2006.01)	
A 6 1 P 43/00(2006.01)	
A 6 1 P 35/00(2006.01)	
A 6 1 P 35/02(2006.01)	
A 6 1 K 31/282(2006.01)	
A 6 1 K 31/52(2006.01)	
A 6 1 K 31/475(2006.01)	
A 6 1 K 31/337(2006.01)	40
A 6 1 K 31/4745(2006.01)	
A 6 1 K 31/7048(2006.01)	
A 6 1 K 38/12(2006.01)	
A 6 1 K 31/277(2006.01)	
A 6 1 K 39/395(2006.01)	
A 6 1 K 9/08(2006.01)	
A 6 1 P 37/02(2006.01)	
C 0 7 D 473/38(2006.01)	
C 0 7 D 519/04(2006.01)	
C 0 7 D 305/14(2006.01)	50

C 0 7 D 491/22(2006.01)

C 0 7 H 17/04(2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 207/34

C 0 7 D 231/38 Z C S P

A 6 1 K 31/415

C 0 7 D 231/38 A

C 0 7 D 403/04

A 6 1 K 31/506

C 0 7 D 409/04

10

A 6 1 K 31/40

C 0 7 D 405/12

C 0 7 D 401/12

A 6 1 K 31/4709

C 0 7 D 417/14

A 6 1 K 31/427

C 0 7 D 401/04

A 6 1 K 31/4439

C 0 7 D 405/04

C 0 7 D 413/04

20

A 6 1 K 31/422

C 0 7 D 307/66

A 6 1 K 31/341

C 0 7 D 263/48

A 6 1 K 31/421

C 0 7 D 261/14

A 6 1 K 31/42

A 6 1 K 31/4725

A 6 1 P 43/00 1 1 1

A 6 1 P 35/00

30

A 6 1 P 35/02

A 6 1 P 43/00 1 2 1

A 6 1 K 31/282

A 6 1 K 31/52

A 6 1 K 31/475

A 6 1 K 31/337

A 6 1 K 31/4745

A 6 1 K 31/7048

A 6 1 K 38/12

A 6 1 K 31/277

40

A 6 1 K 39/395 N

A 6 1 K 9/08

A 6 1 P 37/02

C 0 7 D 473/38

C 0 7 D 519/04

C 0 7 D 305/14

C 0 7 D 491/22

C 0 7 H 17/04

【 手 続 補 正 書 】

50

【提出日】令和4年7月1日(2022.7.1)

【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

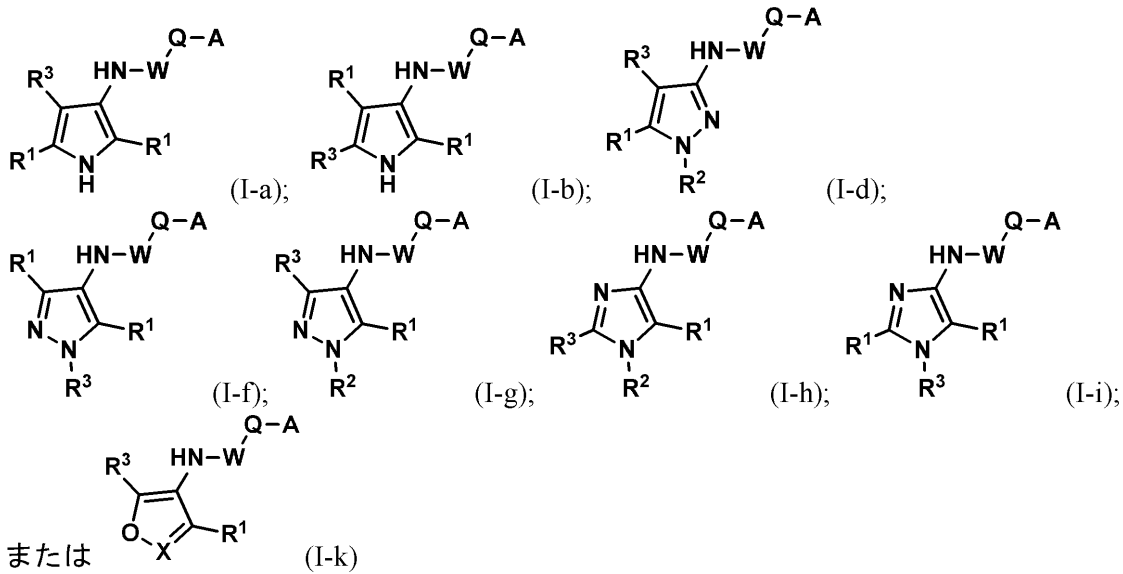
【補正方法】変更

【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I-a)、(I-b)、(I-d)、(I-f)、(I-g)、(I-h)、(I-i)または(I-k):



10

20

の化合物であって、

式中、

Wは、

- (i) C(=O)、
- (ii) C(=S)、
- (iii) S(O)<sub>1-2</sub>、
- (iv) C(=NR<sup>d</sup>)、
- (v) C(=NH)、
- (vi) C(=C-NO<sub>2</sub>)、
- (vii) S(O)N(R<sup>d</sup>)、および
- (viii) S(O)NH

からなる群より選択され、

Q-Aは、以下の(A)または(B)にしたがって定義され:

(A)

Qは、NH、O、またはCH<sub>2</sub>であり、かつ

Aは、

- (i) -(YA<sup>1</sup>)<sub>n</sub>-YA<sup>2</sup>であって、
  - ・nが0もしくは1であり、
  - ・YA<sup>1</sup>が、1~6個のR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1-6</sub>アルキレンであり、かつ
  - ・YA<sup>2</sup>が、
    - (a) 1~4個のR<sup>b</sup>で置換されていてもよいC<sub>3-20</sub>シクロアルキル、
    - (b) 1~4個のR<sup>c</sup>で置換されていてもよいC<sub>6-20</sub>アリール、
    - (c) 5~20個の環原子を含むヘテロアリールであって、1~4個の環原子がヘテロ原子

30

40

50

であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、O、およびSからなる群より独立して選択され、かつヘテロアリアル環炭素原子のうちの一つもしくは複数、1~4個の独立して選択されるR<sup>c</sup>で置換されていてもよい、該ヘテロアリアル、もしくは

(d) 3~16個の環原子を含むヘテロシクリルであって、1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、およびOからなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの一つもしくは複数、1~4個の独立して選択されるR<sup>b</sup>で置換されていてもよい、該ヘテロシクリル

である、

該-(YA1)<sub>n</sub>-YA2、または

(ii) -Z1-Z2-Z3であって、

10

・Z1が、1~4個のR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~3アルキレンであり、

・Z2が、-N(H)-、-N(R<sup>d</sup>)-、-O-、もしくは-S-であり、かつ

・Z3が、1~4個のR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>2</sub>~7アルキルである、

該-Z1-Z2-Z3、または

(iii) 1~6個の独立して選択されるR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~10アルキルである、

または、

(B)

QおよびAは、一緒になって、

20



を形成し、

はWへの結合点を表し、かつ

Eは、3~16個の環原子を含むヘテロシクリルであり、ここで、存在する窒素原子とは別に0~3個の追加の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、およびOからなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの一つもしくは複数、1~4個の独立して選択されるR<sup>b</sup>で置換されていてもよい、

30

各R<sup>1</sup>は、H、ハロ、シアノ、1~2個のR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~6アルキル、C<sub>2</sub>~6アルケニル、C<sub>2</sub>~6アルキニル、C<sub>1</sub>~4ハロアルキル、C<sub>1</sub>~4アルコキシ、C<sub>1</sub>~4ハロアルコキシ、-S(O)<sub>1~2</sub>(C<sub>1</sub>~4アルキル)、-NR<sup>e</sup>R<sup>f</sup>、-OH、オキソ、-S(O)<sub>1~2</sub>(NR'R'')、-C<sub>1</sub>~4チオアルコキシ、-NO<sub>2</sub>、-C(=O)(C<sub>1</sub>~4アルキル)、 $\text{C}(\text{=O})\text{OH}$ 、および-C(=O)N(R')(R'')からなる群より独立して選択され、R<sup>2</sup>は、

(i) 1~2個の独立して選択されるR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~6アルキル、

(ii) C<sub>3</sub>~6シクロアルキル、

40

(iii) 3~10個の環原子を含むヘテロシクリルであって、1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、およびOからなる群より独立して選択される、該ヘテロシクリル、

(iv) -C(O)(C<sub>1</sub>~4アルキル)、

(v) -C(O)O(C<sub>1</sub>~4アルキル)、

(vi) -CON(R')(R'')、

(vii) -S(O)<sub>1~2</sub>(NR'R'')、

(viii) -S(O)<sub>1~2</sub>(C<sub>1</sub>~4アルキル)、

(ix) -OH、

(x) C<sub>1</sub>~4アルコキシ、ならびに

50

(xi) H

からなる群より選択され、

R<sup>3</sup>は、

(i) -(U<sup>1</sup>)<sub>q</sub>-U<sup>2</sup>であって、

・ qが0または1であり、

・ U<sup>1</sup>が、1~6個のR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~6アルキレンであり、かつ

・ U<sup>2</sup>が、

(a) 1~4個のR<sup>b</sup>で置換されていてもよいC<sub>3</sub>~12シクロアルキル、

(b) 1~4個のR<sup>c</sup>で置換されていてもよいC<sub>6</sub>~10アリール、

(c) 5~20個の環原子を含むヘテロアリールであって、1~4個の環原子がヘテロ原子  
であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、O、およびSからなる群より独立して  
選択され、かつヘテロアリール環炭素原子のうちの一つもしくは複数が、1~4個の独立  
して選択されるR<sup>c</sup>で置換されていてもよい、該ヘテロアリール、もしくは

(d) 3~12個の環原子を含むヘテロシクリルであって、1~3個の環原子がヘテロ原子  
であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、およびOからなる群より独立して選  
択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの一つもしくは複数が、1~4個の独立し  
て選択されるR<sup>b</sup>で置換されていてもよい、該ヘテロシクリル  
である、

該-(U<sup>1</sup>)<sub>q</sub>-U<sup>2</sup>、または

(ii) 1~6個の独立して選択されるR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~10アルキル

であり、

R<sup>a</sup>の各出現は、-OH、-F、-Cl、-Br、-NR<sup>e</sup>R<sup>f</sup>、C<sub>1</sub>~4アルコキシ、C<sub>1</sub>~4ハロアルコ  
キシ、-C(=O)O(C<sub>1</sub>~4アルキル)、-C(=O)(C<sub>1</sub>~4アルキル)、-C(=O)O  
H、-CON(R')(R'')、-S(O)<sub>1~2</sub>(NR'R'')、-S(O)<sub>1~2</sub>(C<sub>1</sub>~4アルキル)  
、シアノ、および、1~4個の独立して選択されるC<sub>1</sub>~4アルキルで置換されていてもよ  
いC<sub>3</sub>~6シクロアルキルからなる群より独立して選択され、

R<sup>b</sup>の各出現は、1~6個の独立して選択されるR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~10アルキ  
ル、C<sub>1</sub>~4ハロアルキル、-OH、オキソ、-F、-Cl、-Br、-NR<sup>e</sup>R<sup>f</sup>、C<sub>1</sub>~4アルコキシ  
、C<sub>1</sub>~4ハロアルコキシ、-C(=O)(C<sub>1</sub>~4アルキル)、-C(=O)O(C<sub>1</sub>~4アルキ  
ル)、-C(=O)OH、-C(=O)N(R')(R'')、-S(O)<sub>1~2</sub>(NR'R'')、-S(O)  
1~2(C<sub>1</sub>~4アルキル)、シアノ、1~4個の独立して選択されるC<sub>1</sub>~4アルキルで置換  
されていてもよいC<sub>6</sub>~10アリール、および、1~4個の独立して選択されるC<sub>1</sub>~4アル  
キルで置換されていてもよいC<sub>3</sub>~6シクロアルキルからなる群より独立して選択され、

R<sup>c</sup>の各出現は、

(i) ハロ、

(ii) シアノ、

(iii) 1~6個の独立して選択されるR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~10アルキル、

(iv) C<sub>2</sub>~6アルケニル、

(v) C<sub>2</sub>~6アルキニル、

(vi) C<sub>1</sub>~4ハロアルキル、

(vii) C<sub>1</sub>~4アルコキシ、

(viii) C<sub>1</sub>~4ハロアルコキシ、

(ix) 1~4個の独立して選択されるC<sub>1</sub>~4アルキルで置換されていてもよい-(C<sub>0</sub>~3  
アルキレン)-C<sub>3</sub>~6シクロアルキル、

(x) ヘテロシクリルが3~16個の環原子を含み、1~3個の環原子がヘテロ原子であり  
、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、およびOからなる群より独立して選択され  
る、-(C<sub>0</sub>~3アルキレン)-ヘテロシクリル、

(xi) -S(O)<sub>1~2</sub>(C<sub>1</sub>~4アルキル)、

(xii) -NR<sup>e</sup>R<sup>f</sup>、

(xiii) -OH、

10

20

30

40

50

(xiv)  $-S(O)_{1\sim 2}(NR'R'')$ 、  
 (xv)  $-C_{1\sim 4}$ チオアルコキシ、  
 (xvi)  $-NO_2$ 、  
 (xvii)  $-C(=O)(C_{1\sim 4}$ アルキル)、  
 (xviii)  $-C(=O)O(C_{1\sim 4}$ アルキル)、  
 (xix)  $-C(=O)OH$ 、ならびに  
 (xx)  $-C(=O)N(R')(R'')$

からなる群より独立して選択され、

$R^d$ は、 $C_{1\sim 6}$ アルキル、 $C_{3\sim 6}$ シクロアルキル、 $-C(O)(C_{1\sim 4}$ アルキル)、 $-C(O)O(C_{1\sim 4}$ アルキル)、 $-CON(R')(R'')$ 、 $-S(O)_{1\sim 2}(NR'R'')$ 、 $-S(O)_{1\sim 2}(C_{1\sim 4}$ アルキル)、 $-OH$ 、および $C_{1\sim 4}$ アルコキシからなる群より選択され、  
 $R^e$ および $R^f$ の各出現は、 $H$ 、 $C_{1\sim 6}$ アルキル、 $C_{1\sim 6}$ ハロアルキル、 $C_{3\sim 6}$ シクロアルキル、 $-C(O)(C_{1\sim 4}$ アルキル)、 $-C(O)O(C_{1\sim 4}$ アルキル)、 $-CON(R')(R'')$ 、 $-S(O)_{1\sim 2}(NR'R'')$ 、 $-S(O)_{1\sim 2}(C_{1\sim 4}$ アルキル)、 $-OH$ 、および $C_{1\sim 4}$ アルコキシからなる群より独立して選択されるか、または $R^e$ および $R^f$ は、それぞれが結合した窒素原子と共に、3~8個の環原子を含む環を形成し、該環は、(a)  $H$ および $C_{1\sim 3}$ アルキルより独立して選択される1~2個の置換基でそれぞれが置換されている、1~7個の環炭素原子と、(b)  $N(R^d)$ 、 $O$ 、および $S$ からなる群よりそれぞれが独立して選択される、0~3個の環ヘテロ原子( $R'$ および $R''$ に結合した窒素原子に加えて)とを含み、かつ

$R'$ および $R''$ の各出現は、 $H$ および $C_{1\sim 4}$ アルキルからなる群より独立して選択されるか、または $R'$ および $R''$ は、それぞれが結合した窒素原子と共に、3~8個の環原子を含む環を形成し、該環は、(a)  $H$ および $C_{1\sim 3}$ アルキルより独立して選択される1~2個の置換基でそれぞれが置換されている、1~7個の環炭素原子と、(b)  $N(R^d)$ 、 $O$ 、および $S$ からなる群よりそれぞれが独立して選択される、0~3個の環ヘテロ原子( $R'$ および $R''$ に結合した窒素原子に加えて)とを含む、  
 該化合物、またはその薬学的に許容される塩。

【請求項2】

$R^1$ の各出現が、 $H$ 、ハロ、および $C_{1\sim 3}$ アルキルより独立して選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項3】

$R^1$ の一方もしくは両方の出現が $H$ であるか;または1つの出現が $H$ である、請求項1記載の化合物。

【請求項4】

$R^1$ の一方の出現が $H$ であり、かつ他方の出現がハロであるか;または1つの出現がハロである、請求項1記載の化合物。

【請求項5】

$R^1$ の一方の出現が $H$ であり、かつ他方の出現が $C_{1\sim 3}$ アルキルであるか;または1つの出現が $C_{1\sim 3}$ アルキルである、請求項1記載の化合物。

【請求項6】

$R^2$ が、 $H$ 、 $C_{1\sim 6}$ アルキル、 $C(O)(C_{1\sim 4}$ アルキル)、および $-C(O)O(C_{1\sim 4}$ アルキル)より独立して選択され、任意で $R^2$ が $H$ である、請求項1記載の化合物。

【請求項7】

$R^3$ が $-(U^1)_q-U^2$ である、請求項1記載の化合物。

【請求項8】

$q$ が0である、請求項1記載の化合物。

【請求項9】

$U^2$ が、1~2個の $R^c$ で置換されていてもよいフェニルであるか;または  
 $U^2$ が、5~6個の環原子を含むヘテロアリーールであり、ここで、1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、 $N$ 、 $N(H)$ 、 $N(R^d)$ 、 $O$ 、および $S$ からなる群より独

10

20

30

40

50

立して選択され、かつヘテロアリール環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1~2個の独立して選択されるR<sup>c</sup>で置換されていてもよい;または  
 U<sup>2</sup>が、4~10個の環原子を含むヘテロシクリルであり、ここで、1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、およびOからなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1~4個の独立して選択されるR<sup>b</sup>で置換されていてもよい、  
 請求項1記載の化合物。

【請求項10】

R<sup>3</sup>が、1~4個の独立して選択されるR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~10アルキルであり、任意でR<sup>3</sup>がトリフルオロメチルまたはメトキシメチルである、請求項1記載の化合物。

10

【請求項11】

WがC(=O)である、請求項1記載の化合物。

【請求項12】

QおよびAが、(A)にしたがって定義される通りである、請求項1記載の化合物。

【請求項13】

QがNHである、請求項1記載の化合物。

【請求項14】

Aが-(YA1)<sub>n</sub>-YA2である、請求項1記載の化合物。

【請求項15】

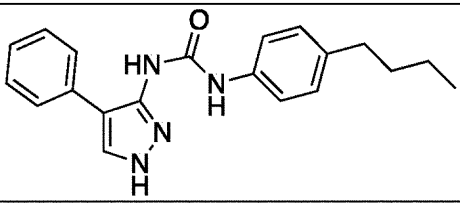
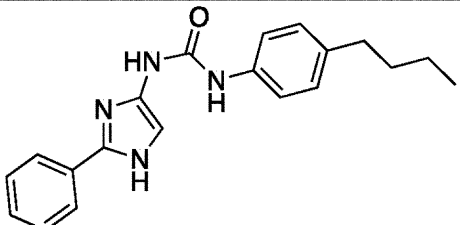
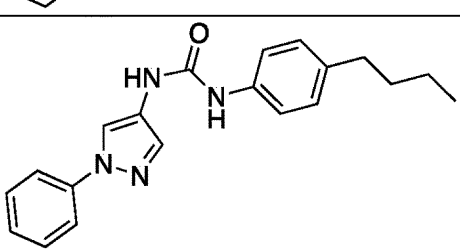
YA1がC<sub>1</sub>~3アルキレンであり、任意でYがCH<sub>2</sub>またはCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>である、請求項1記載の化合物。

20

【請求項16】

YA2が、1~3個のR<sup>c</sup>で置換されていてもよいC<sub>6</sub>~10アリールであるか;または  
 YA2が、3~12個の環原子を含むヘテロシクリルであり、ここで、1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、およびOからなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1~4個の独立して選択されるR<sup>b</sup>で置換されていてもよい、  
 請求項1記載の化合物。

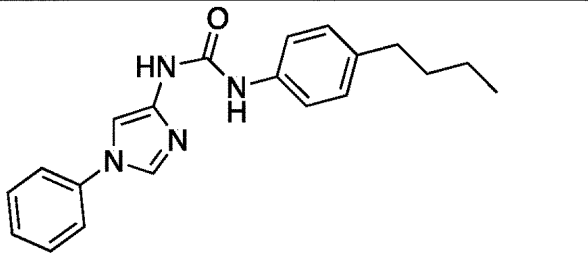
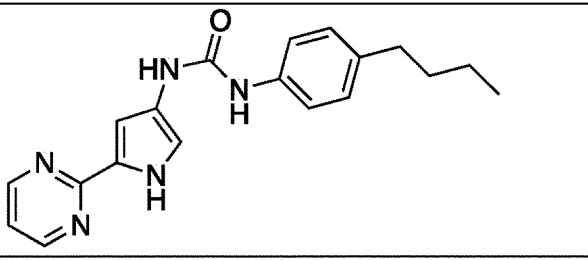
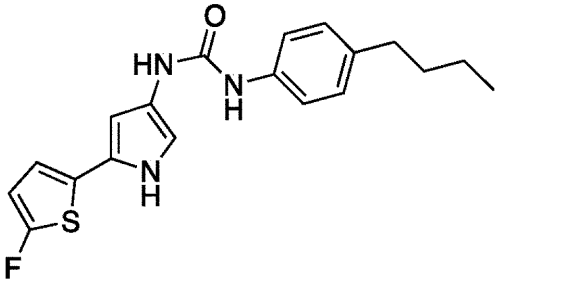
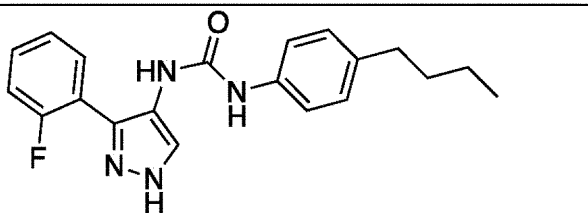
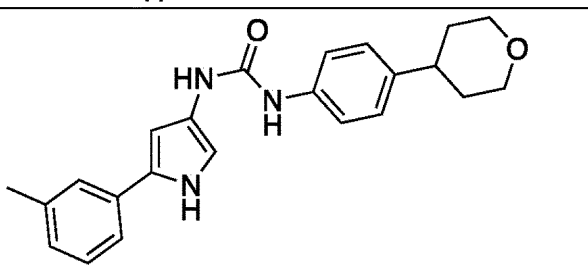
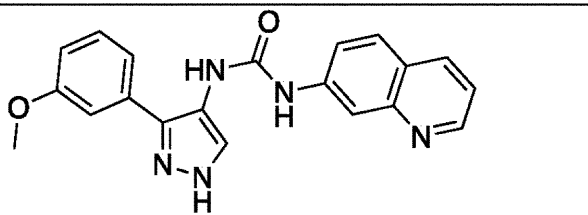
【請求項17】

化合物 #	構造
2	
3	
4	

30

40

50

6	
7	
8	
9	
10	
11	

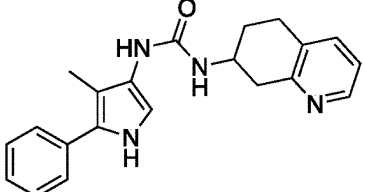
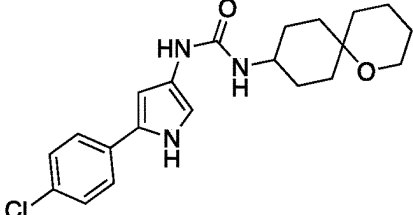
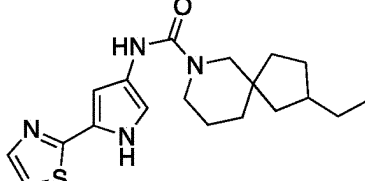
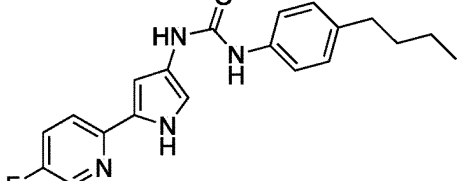
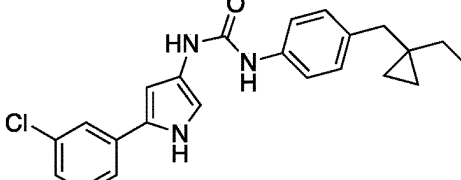
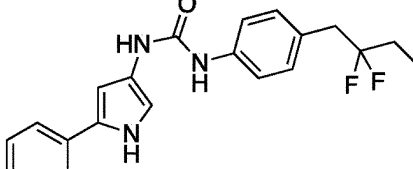
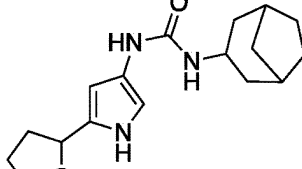
10

20

30

40

50

12	
13	
14	
15	
18	
19	
20	

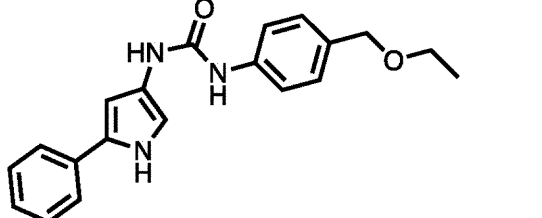
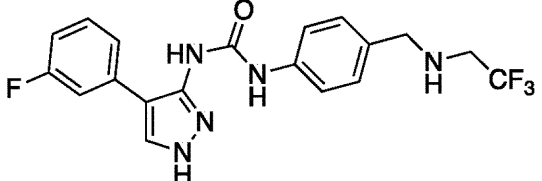
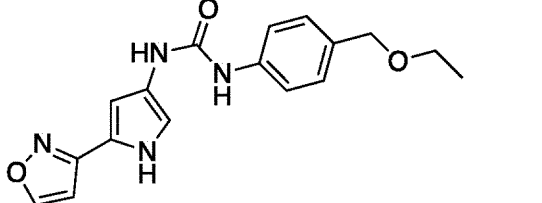
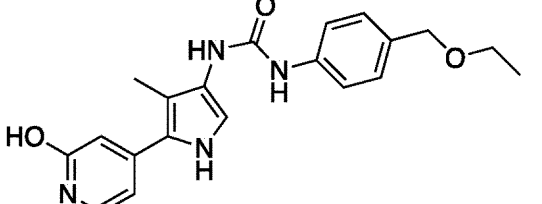
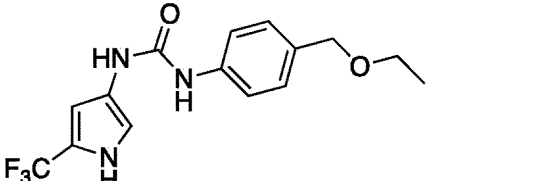
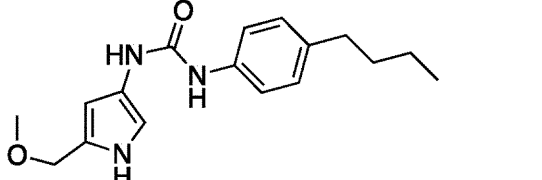
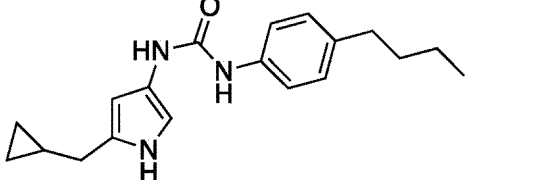
10

20

30

40

50

20a	
21	
22	
23	
24	
25	
26	

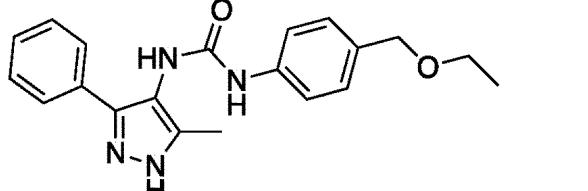
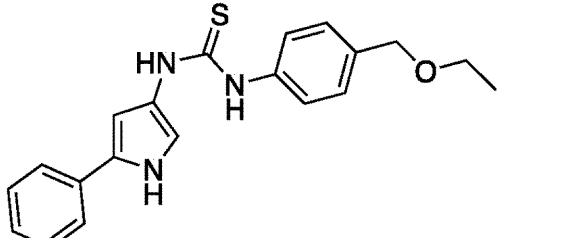
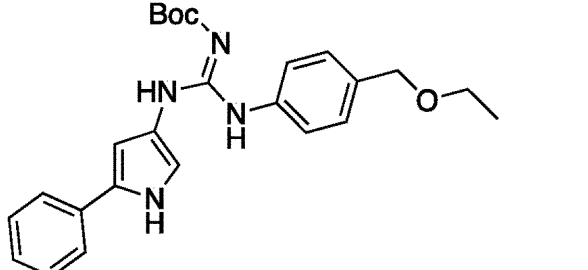
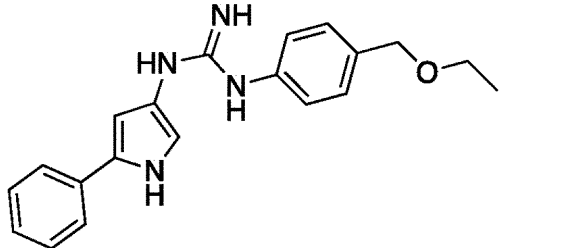
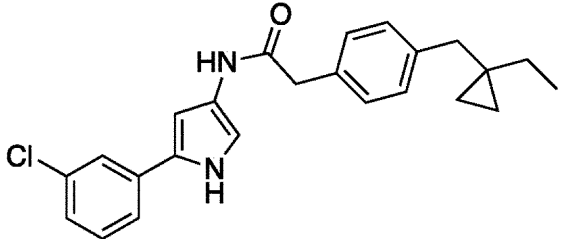
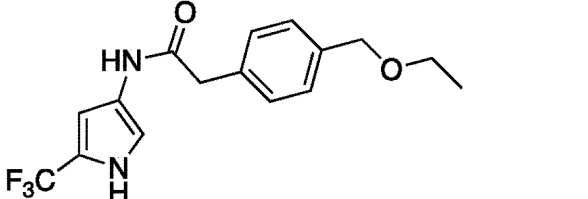
10

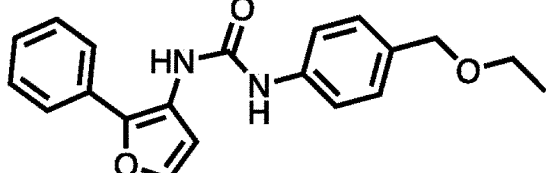
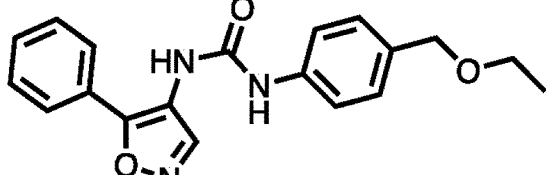
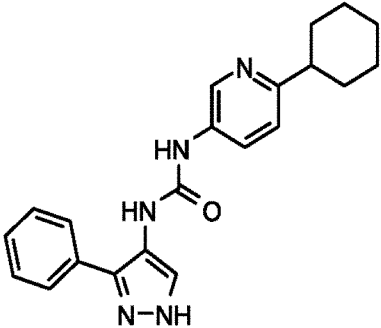
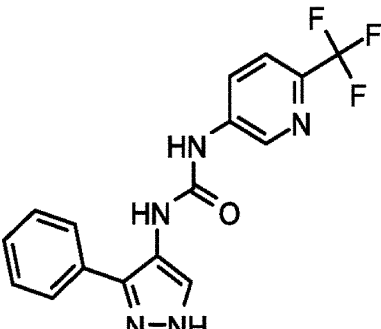
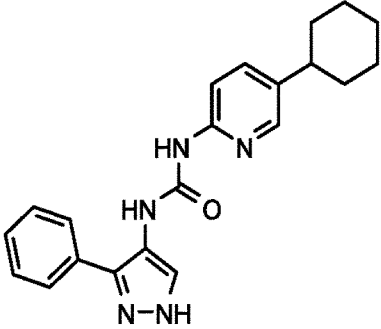
20

30

40

50

27		10
29		20
30		30
31		40
20a		50
20b		

34	 <chem>CCOCc1ccc(NC(=O)c2c(c3ccccc3n2)c4ccccc4)cc1</chem>
35	 <chem>CCOCc1ccc(NC(=O)c2c(c3ccccc3o2)n4ccccc4)cc1</chem>
36	 <chem>C1CCCCC1c2ccncc2NC(=O)c3c(c4ccccc4n3)N5=CC=CC=C5</chem>
37	 <chem>FC(F)(F)c1ccncc1NC(=O)c2c(c3ccccc3n2)N4=CC=CC=C4</chem>
38	 <chem>C1CCCCC1c2ccncc2NC(=O)c3c(c4ccccc4n3)N5=CC=CC=C5</chem>

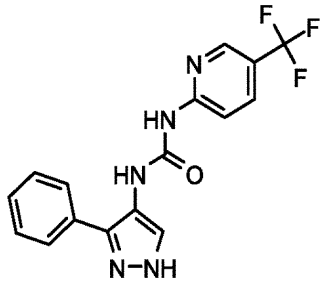
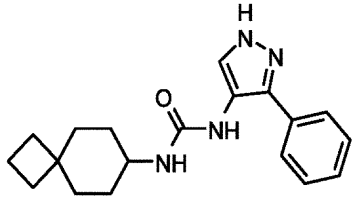
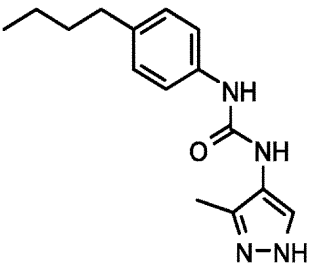
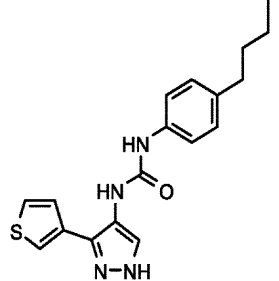
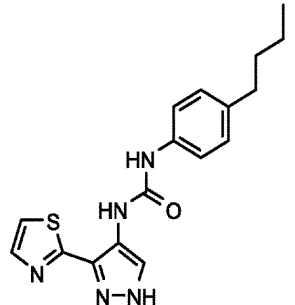
10

20

30

40

50

39	 <chem>O=C1NC(=N1)C2=CC=CC=C2NC(=O)N3=CC=C(C=C3)C(F)(F)F</chem>
40	 <chem>O=C1NC2=CN=CN2NC(=O)N3CCCC4C3CC4</chem>
41	 <chem>CC1=CN=CN1NC(=O)N2=CC=C(C=C2)CCCC</chem>
42	 <chem>CCC1=CC=C(C=C1)NC(=O)N2=CC=C(S2)C3=CN=CN3</chem>
43	 <chem>CCC1=CC=C(C=C1)NC(=O)N2=CC=C(N2)C3=NC=CS3</chem>

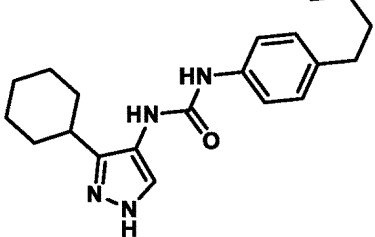
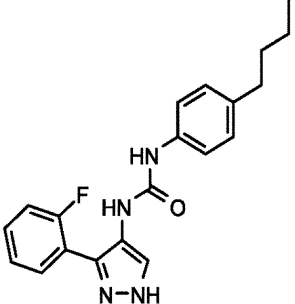
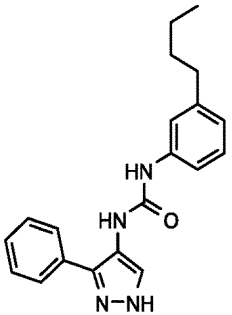
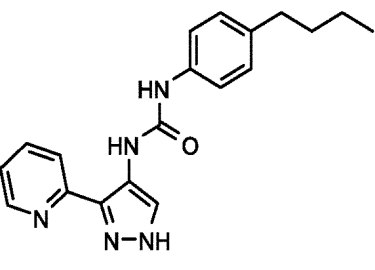
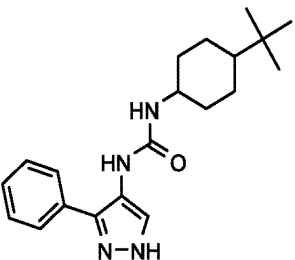
10

20

30

40

50

44	
45	
46	
47	
48	

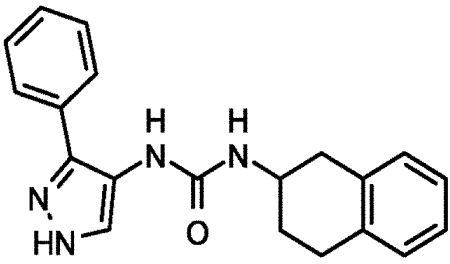
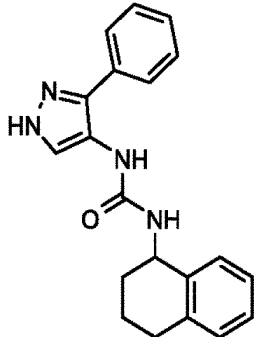
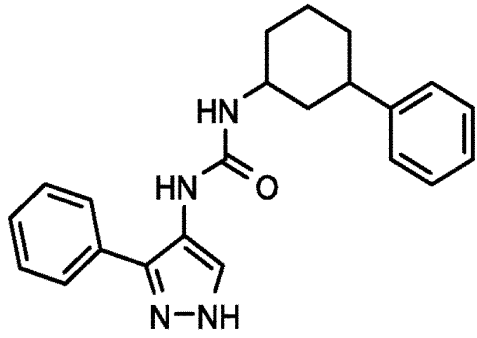
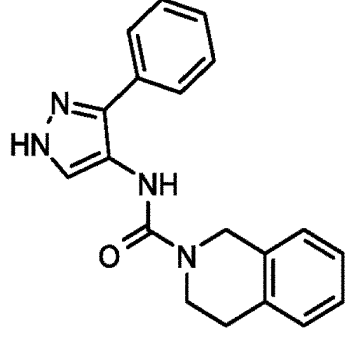
10

20

30

40

50

49	 <chem>c1ccc(cc1)c2nc3c[nH]c3n2NC(=O)Nc4ccc5CCCCC45</chem>
50	 <chem>c1ccc(cc1)c2nc3c[nH]c3n2NC(=O)Nc4ccc5CCCCC45</chem>
51	 <chem>c1ccc(cc1)c2nc3c[nH]c3n2NC(=O)Nc4ccc5CCCCC45</chem>
53	 <chem>c1ccc(cc1)c2nc3c[nH]c3n2NC(=O)Nc4ccc5CCCCC45</chem>

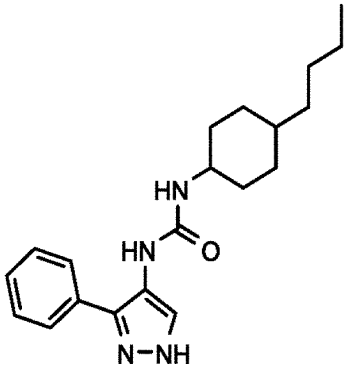
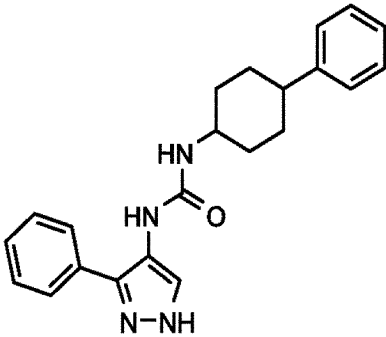
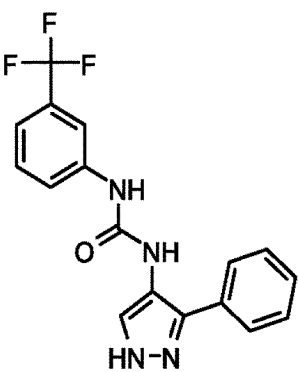
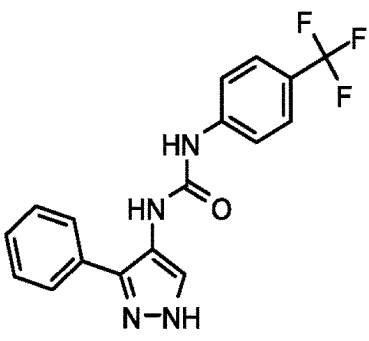
10

20

30

40

50

54	 <chem>CCCC1CCCCC1NC(=O)Nc2c[nH]c3ccccc23</chem>
55	 <chem>c1ccc(cc1)C2CCCCC2NC(=O)Nc3c[nH]c4ccccc34</chem>
56	 <chem>Cc1c[nH]c2ccccc12C(=O)Nc3ccc(C(F)(F)F)cc3</chem>
58	 <chem>Cc1c[nH]c2ccccc12C(=O)Nc3ccc(C(F)(F)F)cc3</chem>

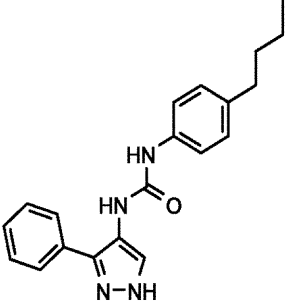
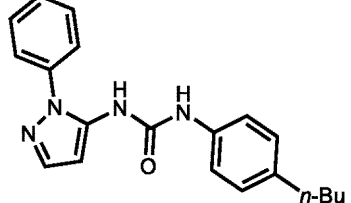
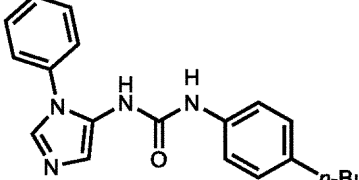
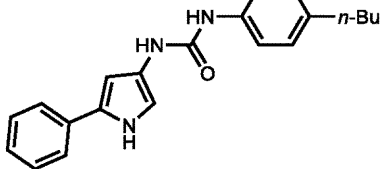
10

20

30

40

50

59	
61	
62	
63	

10

20

またはその薬学的に許容される塩より選択される、請求項1記載の化合物。

【請求項18】

請求項1記載の化合物と、1つまたは複数の薬学的に許容される賦形剤とを含む、薬学的組成物。

30

【請求項19】

有効量の請求項1記載の化合物を含む、対象におけるがんを治療するための薬学的組成物。

【請求項20】

前記がんが、黒色腫、子宮頸がん、乳がん、卵巣がん、前立腺がん、精巣がん、尿路上皮がん、膀胱がん、非小細胞肺癌、小細胞肺癌、肉腫、結腸直腸腺がん、消化管間質腫瘍、胃食道がん、結腸直腸がん、膵臓がん、腎臓がん、肝細胞がん、悪性中皮腫、白血病、リンパ腫、脊髄形成異常症候群、多発性骨髄腫、移行上皮がん、神経芽腫、形質細胞新生物、ウィルムス腫瘍、または肝細胞がんからなる群より選択される、請求項19記載の薬学的組成物。

40

【請求項21】

有効量の請求項1記載の化合物を含む、対象におけるSTINGに関連する疾患、障害、または状態を治療するための薬学的組成物。

【請求項22】

前記疾患、障害、または状態が、I型インターフェロン症、エカルディ-グティエール症候群(AGS)、遺伝型のループス、炎症関連障害、および関節リウマチより選択される、請求項21記載の薬学的組成物。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

50

【補正対象項目名】 0 0 5 1

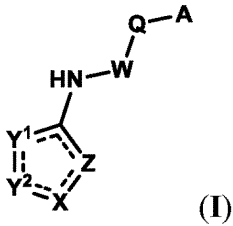
【補正方法】 変更

【補正の内容】

【 0 0 5 1 】

[本発明1001]

式 (I) :



10

の化合物であって、

式 (I) 中、

Zは、CR<sup>1</sup>およびNより独立して選択され、

Xは、O、S、N、NR<sup>2</sup>、CR<sup>1</sup>、CR<sup>3</sup>、およびNR<sup>3</sup>より独立して選択され、

各

≡

20

は単結合または二重結合であり、但し、Y<sup>1</sup>、Y<sup>2</sup>、X、およびZを含む環はヘテロアリアルであり、

Y<sup>1</sup>およびY<sup>2</sup>のそれぞれは、O、S、CR<sup>1</sup>、CR<sup>3</sup>、NR<sup>2</sup>、およびNより独立して選択され（一部の態様では、XがCR<sup>3</sup>以外またはNR<sup>3</sup>以外である場合、Y<sup>1</sup>およびY<sup>2</sup>のうちの一方は独立してCR<sup>3</sup>であり、かつ、XがCR<sup>3</sup>またはNR<sup>3</sup>である場合、Y<sup>1</sup>およびY<sup>2</sup>の両方はCR<sup>3</sup>以外であることが規定されている）、

Wは、

(i) C(=O)、

(ii) C(=S)、

(iii) S(O)<sub>1~2</sub>、

(iv) C(=NR<sup>d</sup>)、

(v) C(=NH)、

(vi) C(=C-NO<sub>2</sub>)、

(vii) S(O)N(R<sup>d</sup>)、および

(viii) S(O)NH

からなる群より選択され、

Q-Aは、以下の(A)または(B)にしたがって定義され:

(A)

Qは、NH、O、またはCH<sub>2</sub>であり、かつ

Aは、

(i) -(YA<sup>1</sup>)<sub>n</sub>-YA<sup>2</sup>であって、

・nが0もしくは1であり、

・YA<sup>1</sup>が、1~6個のR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~6アルキレンであり、かつ

・YA<sup>2</sup>が、

(a) 1~4個のR<sup>b</sup>で置換されていてもよいC<sub>3</sub>~20シクロアルキル、

(b) 1~4個のR<sup>c</sup>で置換されていてもよいC<sub>6</sub>~20アリアル、

(c) 5~20個の環原子を含むヘテロアリアルであって、1~4個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、O、およびSからなる群より独立して選択され、かつヘテロアリアル環炭素原子のうちの1つもしくは複数が、1~4個の独立して選択されるR<sup>c</sup>で置換されていてもよい、該ヘテロアリアル、もしくは

30

40

50

(d) 3 ~ 16個の環原子を含むヘテロシクリルであって、1 ~ 3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、およびOからなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの一つもしくは複数が、1 ~ 4個の独立して選択されるR<sup>b</sup>で置換されていてもよい、該ヘテロシクリル

である、

該-(YA1)<sub>n</sub>-YA2、または

(ii) -Z1-Z2-Z3であって、

・Z1が、1 ~ 4個のR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub> ~ 3アルキレンであり、

・Z2が、-N(H)-、-N(R<sup>d</sup>)-、-O-、もしくは-S-であり、かつ

・Z3が、1 ~ 4個のR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>2</sub> ~ 7アルキルである、

該-Z1-Z2-Z3、または

(iii) 1 ~ 6個の独立して選択されるR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub> ~ 10アルキルである、

または、

(B)

QおよびAは、一緒になって、



を形成し、

はWへの結合点を表し、かつ

Eは、3 ~ 16個の環原子を含むヘテロシクリルであり、ここで、存在する窒素原子とは別に0 ~ 3個の追加の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、およびOからなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの一つもしくは複数が、1 ~ 4個の独立して選択されるR<sup>b</sup>で置換されていてもよい、

各R<sup>1</sup>は、H、ハロ、シアノ、1 ~ 2個のR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub> ~ 6アルキル、C<sub>2</sub> ~ 6アルケニル、C<sub>2</sub> ~ 6アルキニル、C<sub>1</sub> ~ 4ハロアルキル、C<sub>1</sub> ~ 4アルコキシ、C<sub>1</sub> ~ 4ハロアルコキシ、-S(O)<sub>1</sub> ~ 2(C<sub>1</sub> ~ 4アルキル)、-NR<sup>e</sup>R<sup>f</sup>、-OH、オキソ、-S(O)<sub>1</sub> ~ 2(NR'R'')、-C<sub>1</sub> ~ 4チオアルコキシ、-NO<sub>2</sub>、-C(=O)(C<sub>1</sub> ~ 4アルキル)、-C(=O)O(C<sub>1</sub> ~ 4アルキル)、-C(=O)OH、および-C(=O)N(R')(R'')からなる群より独立して選択され、

R<sup>2</sup>は、

(i) 1 ~ 2個の独立して選択されるR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub> ~ 6アルキル、

(ii) C<sub>3</sub> ~ 6シクロアルキル、

(iii) 3 ~ 10個の環原子を含むヘテロシクリルであって、1 ~ 3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、およびOからなる群より独立して選択される、該ヘテロシクリル、

(iv) -C(O)(C<sub>1</sub> ~ 4アルキル)、

(v) -C(O)O(C<sub>1</sub> ~ 4アルキル)、

(vi) -CON(R')(R'')、

(vii) -S(O)<sub>1</sub> ~ 2(NR'R'')、

(viii) -S(O)<sub>1</sub> ~ 2(C<sub>1</sub> ~ 4アルキル)、

(ix) -OH、

(x) C<sub>1</sub> ~ 4アルコキシ、ならびに

(xi) H

からなる群より選択され、

10

20

30

40

50

R<sup>3</sup>は、

(i)  $-(U^1)_q-U^2$ であって、

・  $q$ が0または1であり、

・  $U^1$ が、1~6個のR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~6アルキレンであり、かつ

・  $U^2$ が、

(a) 1~4個のR<sup>b</sup>で置換されていてもよいC<sub>3</sub>~12シクロアルキル、

(b) 1~4個のR<sup>c</sup>で置換されていてもよいC<sub>6</sub>~10アリール、

(c) 5~20個の環原子を含むヘテロアリールであって、1~4個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、O、およびSからなる群より独立して選択され、かつヘテロアリール環炭素原子のうちの一つもしくは複数が、1~4個の独立して選択されるR<sup>c</sup>で置換されていてもよい、該ヘテロアリール、もしくはは

(d) 3~12個の環原子を含むヘテロシクリルであって、1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、およびOからなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの一つもしくは複数が、1~4個の独立して選択されるR<sup>b</sup>で置換されていてもよい、該ヘテロシクリルである、

該 $-(U^1)_q-U^2$ 、または

(ii) 1~6個の独立して選択されるR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~10アルキルであり、

R<sup>a</sup>の各出現は、-OH、-F、-Cl、-Br、-NR<sup>e</sup>R<sup>f</sup>、C<sub>1</sub>~4アルコキシ、C<sub>1</sub>~4ハロアルコキシ、-C(=O)O(C<sub>1</sub>~4アルキル)、-C(=O)(C<sub>1</sub>~4アルキル)、-C(=O)OH、-CON(R')(R'')、-S(O)<sub>1~2</sub>(NR'R'')、-S(O)<sub>1~2</sub>(C<sub>1</sub>~4アルキル)、シアノ、および、1~4個の独立して選択されるC<sub>1</sub>~4アルキルで置換されていてもよいC<sub>3</sub>~6シクロアルキルからなる群より独立して選択され、

R<sup>b</sup>の各出現は、1~6個の独立して選択されるR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~10アルキル、C<sub>1</sub>~4ハロアルキル、-OH、オキソ、-F、-Cl、-Br、-NR<sup>e</sup>R<sup>f</sup>、C<sub>1</sub>~4アルコキシ、C<sub>1</sub>~4ハロアルコキシ、-C(=O)(C<sub>1</sub>~4アルキル)、-C(=O)O(C<sub>1</sub>~4アルキル)、-C(=O)OH、-C(=O)N(R')(R'')、-S(O)<sub>1~2</sub>(NR'R'')、-S(O)<sub>1~2</sub>(C<sub>1</sub>~4アルキル)、シアノ、1~4個の独立して選択されるC<sub>1</sub>~4アルキルで置換されていてもよいC<sub>6</sub>~10アリール、および、1~4個の独立して選択されるC<sub>1</sub>~4アルキルで置換されていてもよいC<sub>3</sub>~6シクロアルキルからなる群より独立して選択され、

R<sup>c</sup>の各出現は、

(i) ハロ、

(ii) シアノ、

(iii) 1~6個の独立して選択されるR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~10アルキル、

(iv) C<sub>2</sub>~6アルケニル、

(v) C<sub>2</sub>~6アルキニル、

(vi) C<sub>1</sub>~4ハロアルキル、

(vii) C<sub>1</sub>~4アルコキシ、

(viii) C<sub>1</sub>~4ハロアルコキシ、

(ix) 1~4個の独立して選択されるC<sub>1</sub>~4アルキルで置換されていてもよい-(C<sub>0</sub>~3アルキレン)-C<sub>3</sub>~6シクロアルキル、

(x) ヘテロシクリルが3~16個の環原子を含み、1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、およびOからなる群より独立して選択される、-(C<sub>0</sub>~3アルキレン)-ヘテロシクリル、

(xi) -S(O)<sub>1~2</sub>(C<sub>1</sub>~4アルキル)、

(xii) -NR<sup>e</sup>R<sup>f</sup>、

(xiii) -OH、

(xiv) -S(O)<sub>1~2</sub>(NR'R'')、

10

20

30

40

50

( xv ) -C<sub>1</sub> ~ 4チオアルコキシ、

( xvi ) -NO<sub>2</sub>、

( xvii ) -C(=O)(C<sub>1</sub> ~ 4アルキル)、

( xviii ) -C(=O)O(C<sub>1</sub> ~ 4アルキル)、

( xix ) -C(=O)OH、ならびに

( xx ) -C(=O)N(R')(R'')

からなる群より独立して選択され、

R<sup>d</sup>は、C<sub>1</sub> ~ 6アルキル、C<sub>3</sub> ~ 6シクロアルキル、-C(O)(C<sub>1</sub> ~ 4アルキル)、-C(O)O(C<sub>1</sub> ~ 4アルキル)、-CON(R')(R'')、-S(O)<sub>1</sub> ~ 2(NR'R'')、-S(O)<sub>1</sub> ~ 2(C<sub>1</sub> ~ 4アルキル)、-OH、およびC<sub>1</sub> ~ 4アルコキシからなる群より選択され、

R<sup>e</sup>およびR<sup>f</sup>の各出現は、H、C<sub>1</sub> ~ 6アルキル、C<sub>1</sub> ~ 6ハロアルキル、C<sub>3</sub> ~ 6シクロアルキル、-C(O)(C<sub>1</sub> ~ 4アルキル)、-C(O)O(C<sub>1</sub> ~ 4アルキル)、-CON(R')(R'')、-S(O)<sub>1</sub> ~ 2(NR'R'')、-S(O)<sub>1</sub> ~ 2(C<sub>1</sub> ~ 4アルキル)、-OH、およびC<sub>1</sub> ~ 4アルコキシからなる群より独立して選択されるか、またはR<sup>e</sup>およびR<sup>f</sup>は、それぞれが結合した窒素原子と共に、3 ~ 8個の環原子を含む環を形成し、該環は、(a) HおよびC<sub>1</sub> ~ 3アルキルより独立して選択される1 ~ 2個の置換基でそれぞれが置換されている、1 ~ 7個の環炭素原子と、(b) N(R<sup>d</sup>)、O、およびSからなる群よりそれぞれが独立して選択される、0 ~ 3個の環ヘテロ原子(R'およびR''に結合した窒素原子に加えて)とを含み、かつ

R'およびR''の各出現は、HおよびC<sub>1</sub> ~ 4アルキルからなる群より独立して選択されるか、またはR'およびR''は、それぞれが結合した窒素原子と共に、3 ~ 8個の環原子を含む環を形成し、該環は、(a) HおよびC<sub>1</sub> ~ 3アルキルより独立して選択される1 ~ 2個の置換基でそれぞれが置換されている、1 ~ 7個の環炭素原子と、(b) N(R<sup>d</sup>)、O、およびSからなる群よりそれぞれが独立して選択される、0 ~ 3個の環ヘテロ原子(R'およびR''に結合した窒素原子に加えて)とを含む、  
該化合物、またはその薬学的に許容される塩。

[本発明1002]

XがNR<sup>2</sup>である、本発明1001の化合物。

[本発明1003]

Y<sup>2</sup>が独立してCR<sup>3</sup>である、本発明1001または1002の化合物。

[本発明1004]

Y<sup>1</sup>がNおよびCR<sup>1</sup>(例えば、CH)より独立して選択される、本発明1001 ~ 1003のいずれかの化合物。

[本発明1005]

Y<sup>2</sup>が独立してCR<sup>1</sup>(例えば、CH)またはNである、本発明1001または1002の化合物。

[本発明1006]

XがNR<sup>3</sup>である、本発明1001の化合物。

[本発明1007]

Y<sup>1</sup>およびY<sup>2</sup>のうちの1 ~ 2つが独立してCR<sup>1</sup>である、本発明1001または1002の化合物。

[本発明1008]

Y<sup>1</sup>およびY<sup>2</sup>のそれぞれが、独立して選択されるCR<sup>1</sup>である、本発明1001 ~ 1002および1006 ~ 1007のいずれかの化合物。

[本発明1009]

Y<sup>1</sup>およびY<sup>2</sup>のうちの一方が、独立して選択されるCR<sup>1</sup>であり、かつY<sup>1</sup>およびY<sup>2</sup>のうちの他方がNである、本発明1001 ~ 1002および1006 ~ 1007のいずれかの化合物。

[本発明1010]

Xが独立してCR<sup>1</sup>(例えば、CH)またはNである、本発明1001または1002の化合物。

[本発明1011]

10

20

30

40

50

Y1およびY2のうち的一方がOであり、かつY1およびY2のうち残りの1つがCR3であるか；または、Y1およびY2のうち一方がSであり、かつY1およびY2のうち残りの1つがCR3である、本発明1001~1002および1010のいずれかの化合物。

[本発明1012]

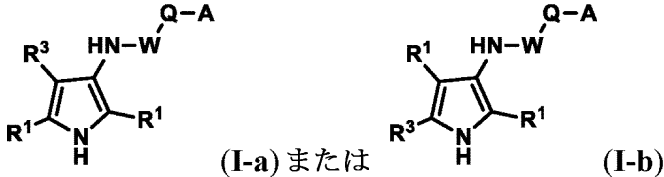
ZがCR1である、本発明1001~1011のいずれかの化合物。

[本発明1013]

ZがNである、本発明1001~1011のいずれかの化合物。

[本発明1014]

式:



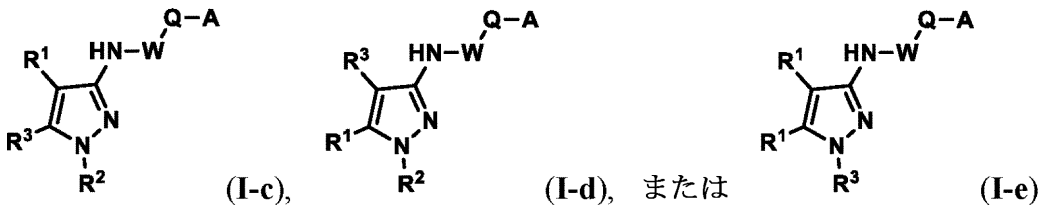
10

(ある特定の態様では、R1の各出現が、H、ハロ、およびC1~3アルキルより独立して選択され、例えば、一方もしくは両方の出現がHであるか；または一方の出現がHであり、かつ他方の出現はハロであるか；または一方の出現がHであり、かつ他方の出現がC1~3アルキルである)を有する、本発明1001の化合物。

[本発明1015]

20

式:

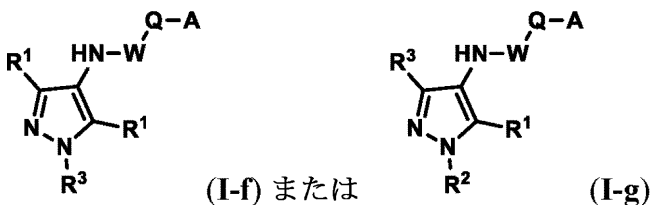


(ある特定の態様では、R1の各出現が、H、ハロ、およびC1~3アルキルより独立して選択され、例えば、一方もしくは両方の出現がHであるか；または一方の出現がHであり、かつ他方の出現がハロであるか；または一方の出現がHであり、かつ他方の出現がC1~3アルキルであるか；または1つの出現がHであるか；または1つの出現がハロであるか；または1つの出現がC1~3アルキルである)を有する、本発明1001の化合物。

30

[本発明1016]

式:



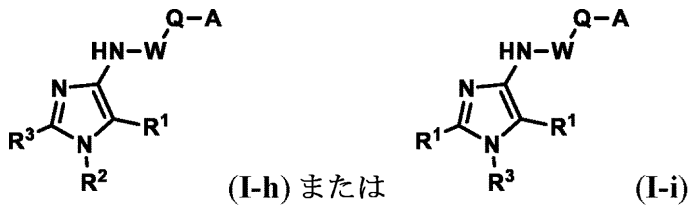
40

(ある特定の態様では、R1の各出現が、H、ハロ、およびC1~3アルキルより独立して選択され、例えば、一方もしくは両方の出現がHであるか；または一方の出現がHであり、かつ他方の出現がハロであるか；または一方の出現がHであり、かつ他方の出現がC1~3アルキルであるか；または1つの出現がHであるか；または1つの出現がハロであるか；または1つの出現がC1~3アルキルである)を有する、本発明1001の化合物。

[本発明1017]

式:

50

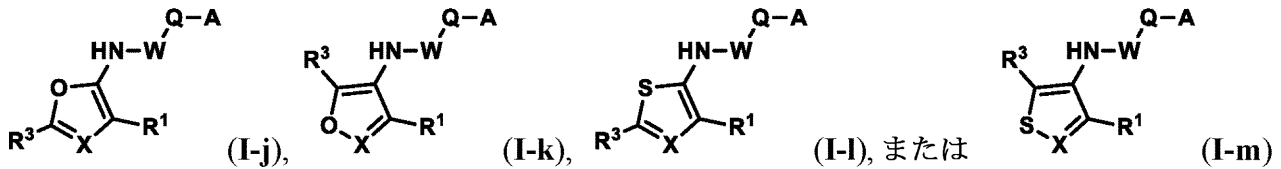


(ある特定の態様では、 $R^1$ の各出現が、H、ハロ、および $C_1 \sim 3$ アルキルより独立して選択され、例えば、一方もしくは両方の出現がHであるか;または一方の出現がHであり、かつ他方の出現がハロであるか;または一方の出現がHであり、かつ他方の出現が $C_1 \sim 3$ アルキルであるか;または1つの出現がHであるか;または1つの出現がハロであるか;または1つの出現が $C_1 \sim 3$ アルキルである)を有する、本発明1001の化合物。

10

[本発明1018]

式:



20

(例えば、 $X = CR^1$ 、または $X = N$ ) (ある特定の態様では、 $R^1$ の各出現が、H、ハロ、および $C_1 \sim 3$ アルキルより独立して選択され、例えば、一方もしくは両方の出現がHであるか;または一方の出現がHであり、かつ他方の出現がハロであるか;または一方の出現がHであり、かつ他方の出現が $C_1 \sim 3$ アルキルであるか;または1つの出現がHであるか;または1つの出現がハロであるか;または1つの出現が $C_1 \sim 3$ アルキルである)を有する、本発明1001の化合物。

[本発明1019]

各 $R^1$ が、H、ハロ、シアノ、1~2個の $R^a$ で置換されていてもよい $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキル、 $C_1 \sim 4$ アルコキシ、および、 $C_1 \sim 4$ ハロアルコキシからなる群より独立して選択される、本発明1001~1018のいずれかの化合物。

30

[本発明1020]

各 $R^1$ が、H、ハロ、シアノ、1~2個の $R^a$ で置換されていてもよい $C_1 \sim 3$ アルキル、および、 $C_1 \sim 4$ ハロアルキルからなる群より独立して選択される、本発明1001~1019のいずれかの化合物。

[本発明1021]

$R^2$ が、H、 $C_1 \sim 6$ アルキル、 $C(O)$  ( $C_1 \sim 4$ アルキル)、および $-C(O)O$  ( $C_1 \sim 4$ アルキル)より独立して選択される(例えば、 $R^2$ がHである)、本発明1001~1020のいずれかの化合物。

[本発明1022]

$R^3$ が $-(U^1)_q-U^2$ である、本発明1001~1021のいずれかの化合物。

40

[本発明1023]

$q$ が1である、本発明1001~1022のいずれかの化合物。

[本発明1024]

$U^1$ が $C_1 \sim 3$ アルキレン(例えば、 $CH_2$ )である、本発明1001~1023のいずれかの化合物。

[本発明1025]

$q$ が0である、本発明1001~1022のいずれかの化合物。

[本発明1026]

$U^2$ が、1~4個の $R^c$ で置換されていてもよい $C_6 \sim 10$ アリールである、本発明1001~1025のいずれかの化合物。

50

[本発明1027]

U<sup>2</sup>が、1~2個のR<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェニルである、本発明1001~1026のいずれかの化合物。

[本発明1028]

U<sup>2</sup>が、1個のR<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェニルである、本発明1001~1026のいずれかの化合物。

[本発明1029]

U<sup>2</sup>が、5~10個の環原子を含むヘテロアリアルであり、ここで、1~4個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、O、およびSからなる群より独立して選択され、かつヘテロアリアル環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1~4個の独立して選択されるR<sup>c</sup>で置換されていてもよい、本発明1001~1025および1028のいずれかの化合物。

10

[本発明1030]

U<sup>2</sup>が、5~6個の環原子を含むヘテロアリアルであり、ここで、1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、O、およびSからなる群より独立して選択され、かつヘテロアリアル環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1~2個の独立して選択されるR<sup>c</sup>で置換されていてもよい、本発明1001~1025および1028~1029のいずれかの化合物。

[本発明1031]

U<sup>2</sup>が、ピリミジニル(例えば、ピリミジン-2-イル)、チエニル(例えば、2-チエニル)、チアゾリル(例えば、2-チアゾリル)、ピリジニル(例えば、2-ピリジニル)、およびオキサゾリル(例えば、3-イソキサゾリル)からなる群より選択され、これらのそれぞれが、1~2個の独立して選択されるR<sup>c</sup>で置換されていてもよい、本発明1001~1025および1030のいずれかの化合物。

20

[本発明1032]

U<sup>2</sup>のR<sup>c</sup>置換基の各出現が、ハロ(例えば、ClまたはF)、シアノ、1~2個の独立して選択されるR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~6アルキル、C<sub>1</sub>~4ハロアルキル、OH、C<sub>1</sub>~4アルコキシ、および、C<sub>1</sub>~4ハロアルキルより独立して選択される、本発明1026~1031のいずれかの化合物。

[本発明1033]

U<sup>2</sup>が、4~10個の環原子を含むヘテロシクリルであり、ここで、1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、およびOからなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1~4個の独立して選択されるR<sup>b</sup>で置換されていてもよい(例えば、U<sup>2</sup>がテトラヒドロフランである)、本発明1001~1025のいずれかの化合物。

30

[本発明1034]

U<sup>2</sup>が、1~3個のR<sup>b</sup>で置換されていてもよいC<sub>3</sub>~20シクロアルキルである(例えば、U<sup>2</sup>がシクロプロピルである)、本発明1001~1025のいずれかの化合物。

[本発明1035]

U<sup>2</sup>のR<sup>b</sup>置換基の各出現が、F、Cl、Br、シアノ、1~2個の独立して選択されるR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~6アルキル、C<sub>1</sub>~4ハロアルキル、OH、C<sub>1</sub>~4アルコキシ、および、C<sub>1</sub>~4ハロアルキルより独立して選択される、本発明1033または1034の化合物。

40

[本発明1036]

U<sup>2</sup>が、本発明1026~1028および1032において定義される通りであり、かつqが0である、本発明1001~1022のいずれかの化合物。

[本発明1037]

U<sup>2</sup>が、本発明1029~1032において定義される通りであり、かつqが0である、本発明1001~1022のいずれかの化合物。

[本発明1038]

50

U<sup>2</sup>が、本発明1033および1035において定義される通りであり、かつqが0である、本発明1001~1022のいずれかの化合物。

[本発明1039]

U<sup>2</sup>が、本発明1034および1035において定義される通りであり、かつqが1である、本発明1001~1022のいずれかの化合物。

[本発明1040]

R<sup>3</sup>が、1~4個の独立して選択されるR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~10アルキルである(例えば、R<sup>3</sup>がトリフルオロメチルまたはメトキシメチルである)、本発明1001~1021のいずれかの化合物。

[本発明1041]

R<sup>3</sup>が、1~3個の独立して選択されるBrで、Clで、Fで、またはC<sub>1</sub>~4アルコキシで置換されていてもよいC<sub>1</sub>~6アルキルより選択される(例えば、R<sup>3</sup>がCF<sub>3</sub>またはメトキシメチルである)、本発明1001~1021のいずれかの化合物。

[本発明1042]

Wが、(i) C(=O)、(ii) C(=S)、(iv) C(=NR<sup>d</sup>) (例えば、C(=NBoc))、および(v) C(=NH)からなる群より選択される、本発明1001~1041のいずれかの化合物。

[本発明1043]

WがC(=O)である、本発明1001~1042のいずれかの化合物。

[本発明1044]

Wが、C(=S)、C(=NH)、またはC(=NR<sup>d</sup>)である、本発明1001~1043のいずれかの化合物。

[本発明1045]

QおよびAが、(A)にしたがって定義される通りである、本発明1001~1044のいずれかの化合物。

[本発明1046]

QがNHである、本発明1001~1045のいずれかの化合物。

[本発明1047]

Aが-(YA<sup>1</sup>)<sub>n</sub>-YA<sup>2</sup>である、本発明1001~1046のいずれかの化合物。

[本発明1048]

nが0である、本発明1001~1047のいずれかの化合物。

[本発明1049]

nが1である、本発明1001~1047のいずれかの化合物。

[本発明1050]

YA<sup>1</sup>がC<sub>1</sub>~3アルキレンである(例えば、YがCH<sub>2</sub>またはCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>である)、本発明1001~1047および1049のいずれかの化合物。

[本発明1051]

YA<sup>2</sup>が、1~4個のR<sup>c</sup>で置換されていてもよいC<sub>6</sub>~20アリールである、本発明1001~1050のいずれかの化合物。

[本発明1052]

YA<sup>2</sup>が、1~3個のR<sup>c</sup>で置換されていてもよいC<sub>6</sub>~10アリールである、本発明1001~1051のいずれかの化合物。

[本発明1053]

YA<sup>2</sup>が、1~3個のR<sup>c</sup>で置換されていてもよいフェニルである、本発明1001~1052のいずれかの化合物。

[本発明1054]

YA<sup>2</sup>が、1~2個のR<sup>c</sup>で置換されたフェニルである、本発明1001~1053のいずれかの化合物。

[本発明1055]

YA<sup>2</sup>が、パラ位においてR<sup>c</sup>で置換されたフェニルである、本発明1054の化合物。

10

20

30

40

50

[本発明1056]

YA2が、5～20個の環原子を含むヘテロアリアルであり、ここで、1～4個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、O、およびSからなる群より独立して選択され、かつヘテロアリアル環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1～4個の独立して選択されるR<sup>c</sup>で置換されているとしてもよい、本発明1001～1050のいずれかの化合物。

[本発明1057]

YA2が、5～10個の環原子を含むヘテロアリアルであり、ここで、1～4個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、O、およびSからなる群より独立して選択され、かつヘテロアリアル環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1～4個の独立して選択されるR<sup>c</sup>で置換されているとしてもよい、本発明1001～1050および1056のいずれかの化合物。

10

[本発明1058]

YA2が、5～10個の環原子を含むヘテロアリアルであり、ここで、1～4個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、およびN(R<sup>d</sup>)からなる群より独立して選択され、かつヘテロアリアル環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1～3個の独立して選択されるR<sup>c</sup>で置換されているとしてもよい、本発明1001～1050および1056～1057のいずれかの化合物。

[本発明1059]

YA2が、5～10個の環原子を含むヘテロアリアルであり、ここで、1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、およびN(R<sup>d</sup>)からなる群より独立して選択され、かつヘテロアリアル環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1～2個の独立して選択されるR<sup>c</sup>で置換されているとしてもよい、本発明1001～1050および1056～1058のいずれかの化合物。

20

[本発明1060]

YA2が、6～10個の環原子を含むヘテロアリアルであり、1～2個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、およびN(R<sup>d</sup>)からなる群より独立して選択され、かつヘテロアリアル環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1～2個の独立して選択されるR<sup>c</sup>で置換されているとしてもよい、本発明1001～1050および1056～1059のいずれかの化合物。

30

[本発明1061]

YA2が、1～2個の独立して選択されるR<sup>c</sup>で置換されているとしてもよい(例えば、非置換の)クニオリニルまたはテトラヒドロキノリルである、本発明1001～1050および1056～1060のいずれかの化合物。

[本発明1062]

YA2のR<sup>c</sup>置換基の各出現が、  
(iii) 1～6個の独立して選択されるR<sup>a</sup>で置換されているとしてもよいC<sub>1</sub>～10アルキル、  
(ix) 1～4個の独立して選択されるC<sub>1</sub>～4アルキルで置換されているとしてもよい-(C<sub>0</sub>～3アルキレン)-C<sub>3</sub>～6シクロアルキル、ならびに  
(x) ヘテロシクリルが3～16個の環原子を含み、1～3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、およびOからなる群より独立して選択される、-(C<sub>0</sub>～3アルキレン)-ヘテロシクリル  
より独立して選択される、本発明1051～1061のいずれかの化合物。

40

[本発明1063]

YA2のR<sup>c</sup>置換基の各出現が独立して、1～6個の独立して選択されるR<sup>a</sup>で置換されているとしてもよいC<sub>1</sub>～6アルキルである、本発明1051～1062のいずれかの化合物。

[本発明1064]

YA2のR<sup>c</sup>置換基が、ハロ(例えば、F)で置換されているとしてもよいC<sub>1</sub>～6アルキル、C<sub>1</sub>～4アルコキシ、および/またはNR<sup>e</sup>R<sup>f</sup>より独立して選択される、本発明1051～1063のいずれかの化合物。

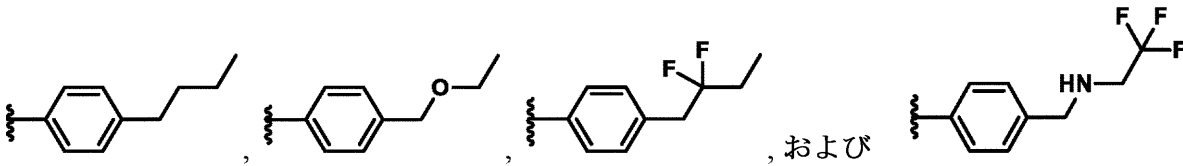
50

[本発明1065]

YA2のR<sup>c</sup>置換基が独立して、非置換のC<sub>1</sub>~6アルキル（例えば、n-ブチル）、エトキシメチル、CH<sub>2</sub>NHCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>、およびCH<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>である、本発明1064の化合物。

[本発明1066]

Aが、



10

より選択される、本発明1001~1048および1051~1065のいずれかの化合物。

[本発明1067]

YA2のR<sup>c</sup>置換基の各出現が、

(ix) 1~4個の独立して選択されるC<sub>1</sub>~4アルキルで置換されていてもよい-(C<sub>0</sub>~3アルキレン)-C<sub>3</sub>~6シクロアルキル、ならびに

(x) ヘテロシクリルが3~16個の環原子を含み、1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、およびOからなる群より独立して選択される、-(C<sub>0</sub>~3アルキレン)-ヘテロシクリル

より独立して選択される、本発明1051~1062のいずれかの化合物。

20

[本発明1068]

YA2のR<sup>c</sup>置換基の各出現が、

(ix) 1個の独立して選択されるC<sub>1</sub>~4アルキルで置換されていてもよい-(C<sub>1</sub>アルキレン)-C<sub>3</sub>~6シクロアルキル、ならびに

(x) ヘテロシクリルが6個の環原子を含み、1個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、およびOからなる群より独立して選択される、-ヘテロシクリル

より独立して選択される、本発明1051~1062および1067のいずれかの化合物。

[本発明1069]

YA2のR<sup>c</sup>置換基の各出現が、

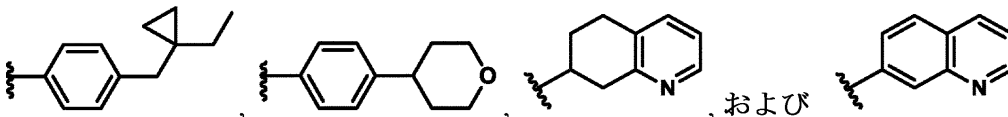


30

より独立して選択される、本発明1068の化合物。

[本発明1070]

Aが、



40

より選択される、本発明1001~1048、1051~1061、および1067~1069のいずれかの化合物。

[本発明1071]

YA2が、1~4個のR<sup>b</sup>で置換されていてもよいC<sub>3</sub>~20シクロアルキルである、本発明1001~1048のいずれかの化合物。

[本発明1072]

YA2が、3~12個の環原子を含むヘテロシクリルであり、ここで、1~3個の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、およびOからなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの一つまたは複数が、1~4個

50

の独立して選択されるR<sup>b</sup>で置換されていてもよい、本発明1001~1049のいずれかの化合物。

[本発明1073]

YA2のR<sup>b</sup>置換基の各出現が、1~6個の独立して選択されるR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~10アルキル、C<sub>1</sub>~4ハロアルキル、-OH、オキソ、-F、-Cl、-Br、C<sub>1</sub>~4アルコキシ、C<sub>1</sub>~4ハロアルコキシ、および、1~4個の独立して選択されるC<sub>1</sub>~4アルキルで置換されていてもよいC<sub>3</sub>~6シクロアルキルより選択される、本発明1071または1072の化合物。

[本発明1074]

YA2のR<sup>b</sup>置換基の各出現が、1~6個の独立して選択されるR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~10アルキル、およびC<sub>1</sub>~4ハロアルキルより選択される、本発明1071~1073のいずれかの化合物。

10

[本発明1075]

YA2のR<sup>b</sup>置換基の各出現が、1~2個の独立して選択されるR<sup>a</sup>で置換されていてもよいC<sub>1</sub>~6アルキルより選択される、本発明1071~1074のいずれかの化合物。

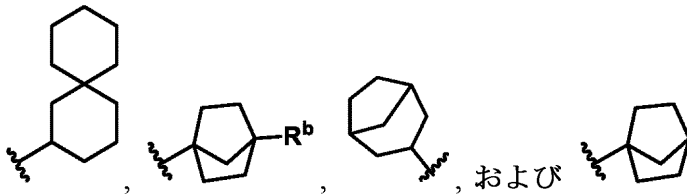
[本発明1076]

YA2のR<sup>b</sup>置換基の各出現が、非置換のC<sub>1</sub>~6アルキル(例えば、n-ブチルなどのブチル)より選択される、本発明1071~1075のいずれかの化合物。

[本発明1077]

Aが、

20

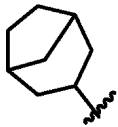


より選択される、本発明1001~1048、1071、および1073~1076のいずれかの化合物。

[本発明1078]

Aが、

30

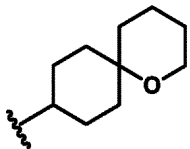


である、本発明1001~1048、1071、および1073~1077のいずれかの化合物。

[本発明1079]

Aが、

40



である、本発明1001~1048および1072~1076のいずれかの化合物。

[本発明1080]

QおよびAが、一緒になって、



50

を形成し、

がWへの結合点を表し、かつ

Eが、3～16個の環原子を含むヘテロシクリルであり、ここで、存在する窒素原子とは別に0～3個の追加の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、およびOからなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1～4個の独立して選択されるR<sup>b</sup>で置換されている、本発明1001～1045のいずれかの化合物。

10

[本発明1081]

Eが、3～12個の環原子を含むヘテロシクリルであり、ここで、存在する窒素原子とは別に0～3個の追加の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、およびOからなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1～2個の独立して選択されるR<sup>b</sup>で置換されている、本発明1001～1045および1080のいずれかの化合物。

[本発明1082]

Eが、6～12個の環原子を含むヘテロシクリルであり、ここで、存在する窒素原子とは別に0～3個の追加の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、およびOからなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1～2個の独立して選択されるR<sup>b</sup>で置換されている、本発明1001～1045および1080～1081のいずれかの化合物。

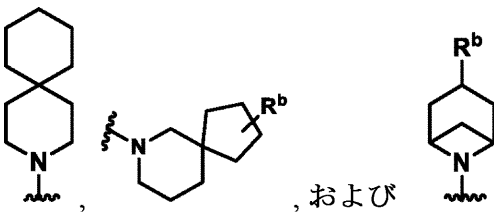
20

[本発明1083]

Eが、6～12個の環原子を含むヘテロシクリル(例えば、スピロ環式ヘテロシクリル)であり、ここで、存在する窒素原子とは別に0～2個の追加の環原子がヘテロ原子であり、各ヘテロ原子が、N、N(H)、N(R<sup>d</sup>)、およびOからなる群より独立して選択され、かつヘテロシクリル環炭素原子のうちの1つまたは複数が、1個の独立して選択されるR<sup>b</sup>で置換されている、本発明1001～1045および1080～1082のいずれかの化合物。

[本発明1084]

Eが、



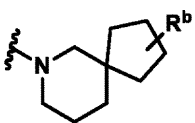
30

より選択される(例えば、R<sup>b</sup>が、n-ブチルおよびエチルなどの非置換のC<sub>1</sub>～6アルキルである)、本発明1001～1045および1080～1082のいずれかの化合物。

40

[本発明1085]

Eが、



である(例えば、R<sup>b</sup>が、エチルなどの非置換のC<sub>1</sub>～6アルキルである)、本発明1001～1045および1080～1083のいずれかの化合物。

[本発明1086]

QがNHであり、WがC(=O)であり、かつAがYA<sup>2</sup>であり、ここでYA<sup>2</sup>が、本発明1

50

051～1055および1062～1065において定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1087]

QがNHであり、WがC(=O)であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1051～1055および1067～1070において定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1088]

QがNHであり、WがC(=O)であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1056～1061および1062～1065において定義される通りである、本発明1001の化合物。

10

[本発明1089]

QがNHであり、WがC(=O)であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1056～1061および1067～1070において定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1090]

QがNHであり、WがC(=O)であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1071および1073～1078において定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1091]

QがNHであり、WがC(=O)であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1072、1073～1076、および1079において定義される通りである、本発明1001の化合物。

20

[本発明1092]

QがNHであり、WがC(=S)であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1051～1055および1062～1065において定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1093]

QがNHであり、Wが、C(=NR<sup>d</sup>) (例えば、C(=N(Boc))、またはC(=NH)) であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1051～1055および1062～1065において定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1094]

QがCH<sub>2</sub>またはOであり、WがC(=O)であり、かつAがYA2であり、ここでYA2が、本発明1051～1055および1062～1065において定義される通りである、本発明1001の化合物。

30

[本発明1095]

WがC(=O)であり、かつQ-Aが、本発明1080～1085において定義される通りである、本発明1001の化合物。

[本発明1096]

R<sup>3</sup>が、本発明1022～1028および1032において定義される通りである、本発明1086～1095のいずれかの化合物。

[本発明1097]

R<sup>3</sup>が、本発明1022～1025および1029～1032において定義される通りである、本発明1086～1095のいずれかの化合物。

40

[本発明1098]

R<sup>3</sup>が、本発明1022～1025および1033～1035において定義される通りである、本発明1086～1095のいずれかの化合物。

[本発明1099]

R<sup>3</sup>が、本発明1036において定義される通りである、本発明1086～1095のいずれかの化合物。

[本発明1100]

式(1-a)を有する、本発明1086～1099のいずれかの化合物。

50

[本発明1101]

式(1-b)を有する、本発明1086～1099のいずれかの化合物。

[本発明1102]

式(1-c)を有する、本発明1086～1099のいずれかの化合物。

[本発明1103]

式(1-d)を有する、本発明1086～1099のいずれかの化合物。

[本発明1104]

式(1-e)を有する、本発明1086～1099のいずれかの化合物。

[本発明1105]

式(1-f)を有する、本発明1086～1099のいずれかの化合物。

10

[本発明1106]

式(1-g)を有する、本発明1086～1099のいずれかの化合物。

[本発明1107]

式(1-h)を有する、本発明1086～1099のいずれかの化合物。

[本発明1108]

式(1-i)を有する、本発明1086～1099のいずれかの化合物。

[本発明1109]

式(1-j)を有する、本発明1086～1099のいずれかの化合物。

[本発明1110]

式(1-k)を有する、本発明1086～1099のいずれかを有する化合物。

20

[本発明1111]

式(1-l)を有する、本発明1086～1099のいずれかの化合物。

[本発明1112]

式(1-m)を有する、本発明1086～1099のいずれかを有する化合物。

[本発明1113]

R<sup>1</sup>が、本発明1019および1020において定義される通りである、本発明1086～1112のいずれかの化合物。

[本発明1114]

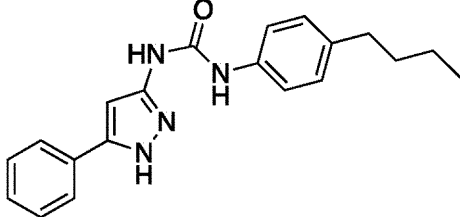
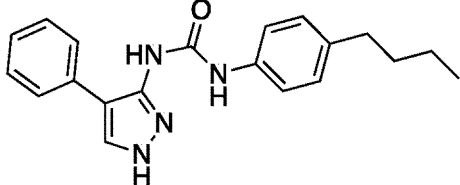
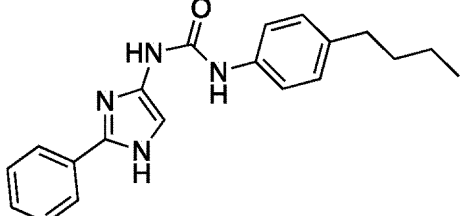
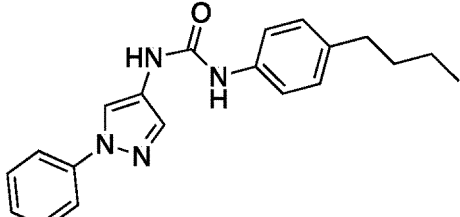
R<sup>2</sup>が、本発明1021において定義される通りである、本発明1086～1113のいずれかの化合物。

30

[本発明1115]

40

50

化合物 #	構造
1	 <chem>CCCCNC(=O)Nc1nc2c(c1)ncn2c3ccccc3</chem>
2	 <chem>CCCCNC(=O)Nc1nc2c(c1)ncn2c3ccccc3</chem>
3	 <chem>CCCCNC(=O)Nc1nc2c(c1)ncn2c3ccccc3</chem>
4	 <chem>CCCCNC(=O)Nc1nc2c(c1)ncn2c3ccccc3</chem>

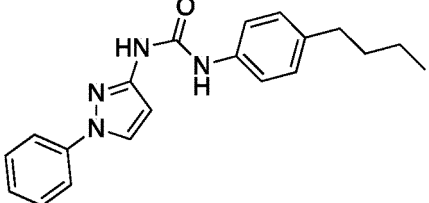
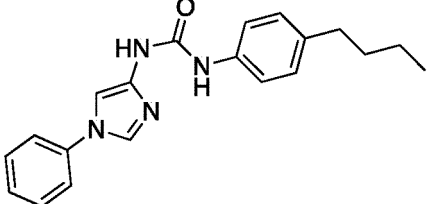
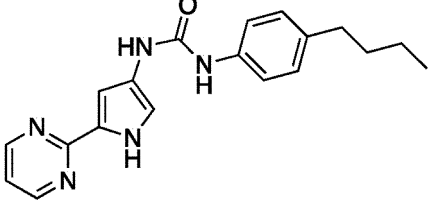
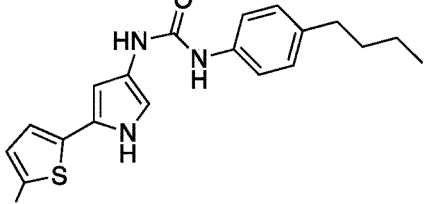
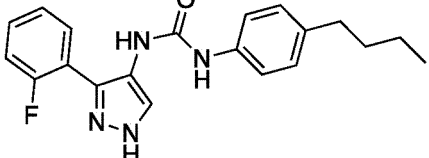
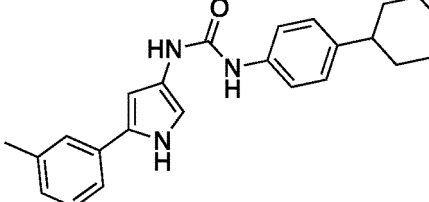
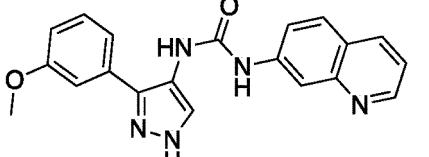
10

20

30

40

50

5	
6	
7	
8	
9	
10	
11	

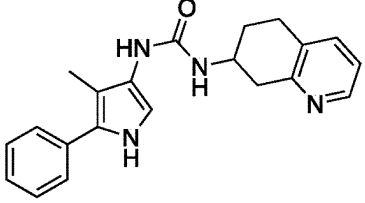
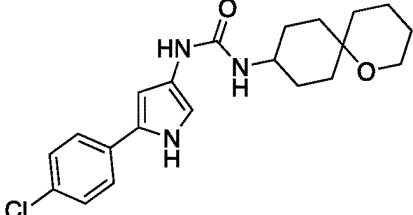
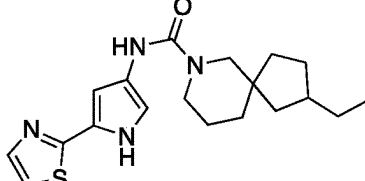
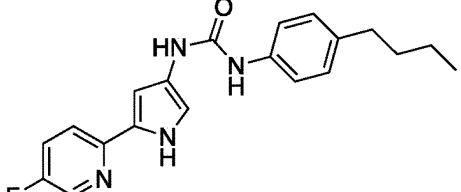
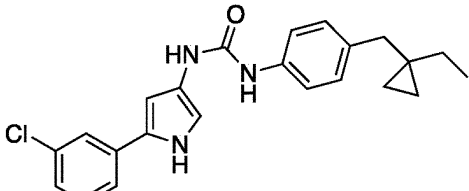
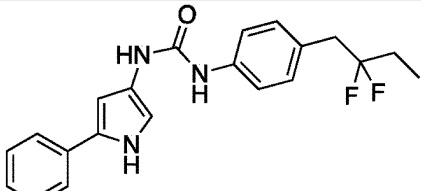
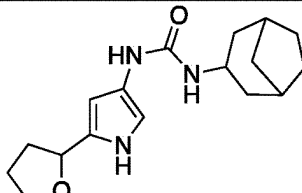
10

20

30

40

50

12	
13	
14	
15	
18	
19	
20	

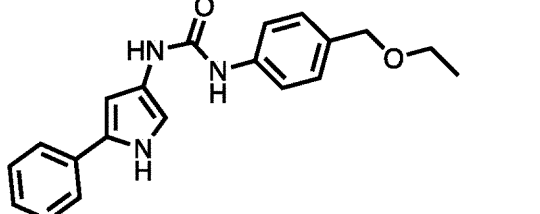
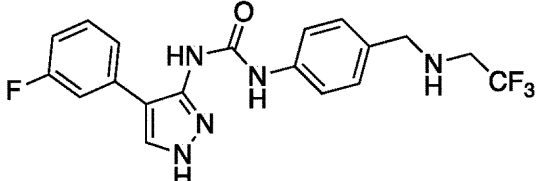
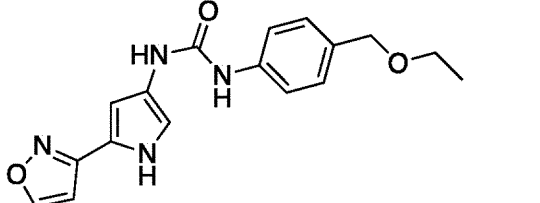
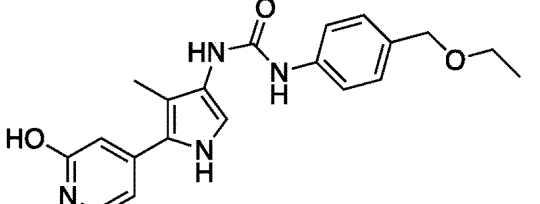
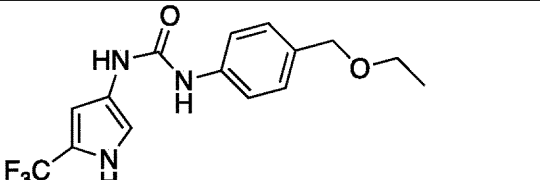
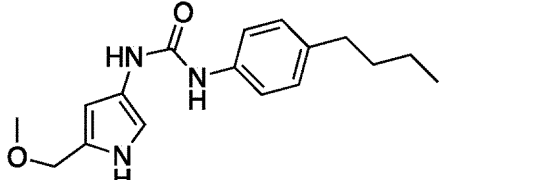
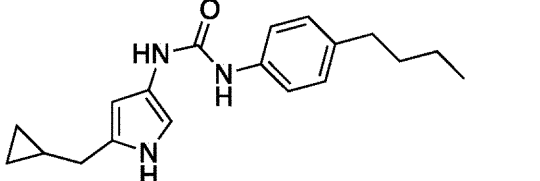
10

20

30

40

50

20a	
21	
22	
23	
24	
25	
26	

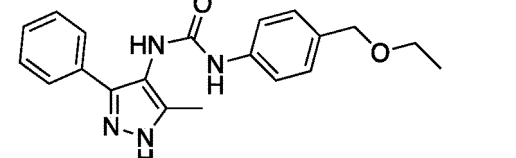
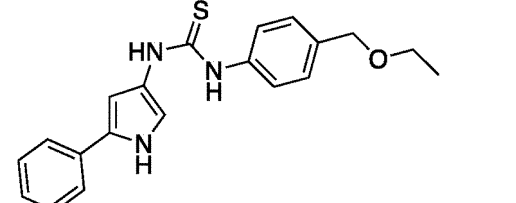
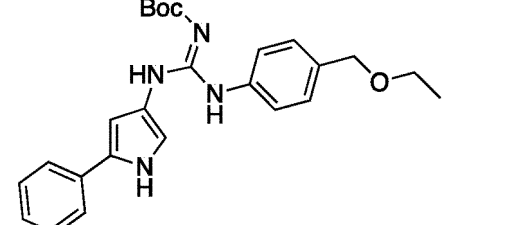
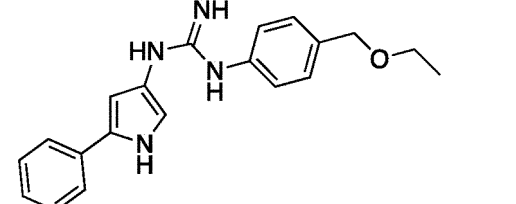
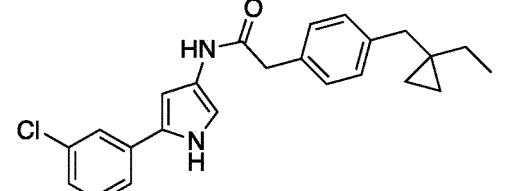
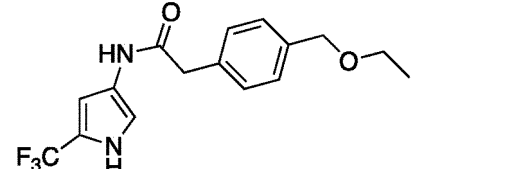
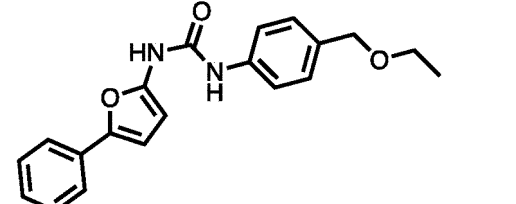
10

20

30

40

50

27	
29	
30	
31	
20a	
20b	
32	

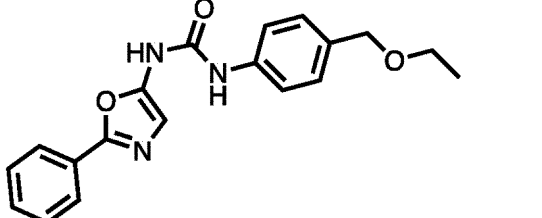
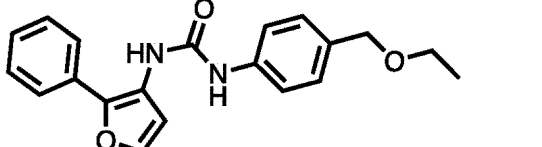
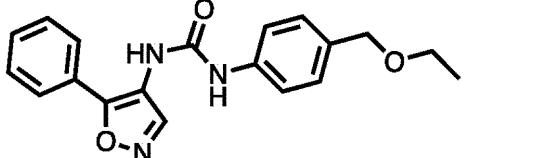
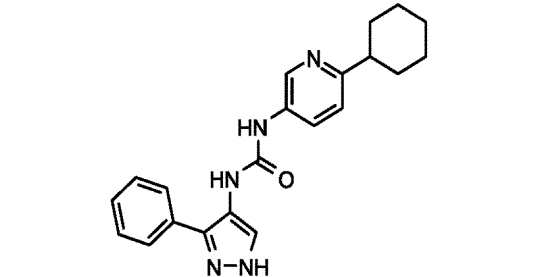
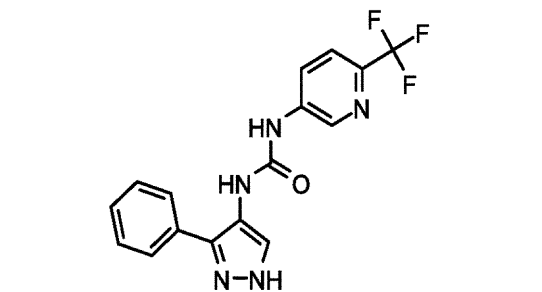
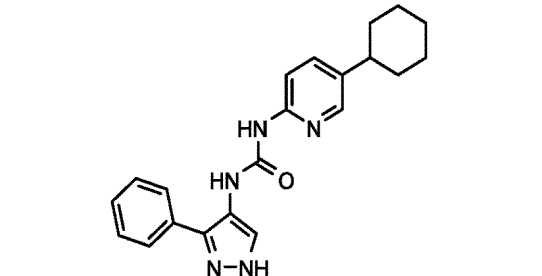
10

20

30

40

50

33	
34	
35	
36	
37	
38	

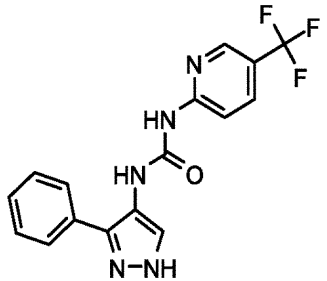
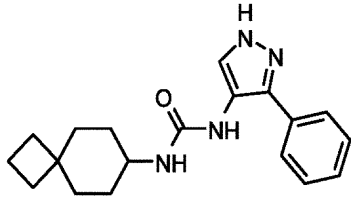
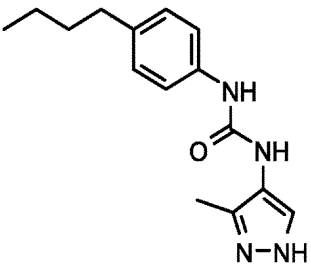
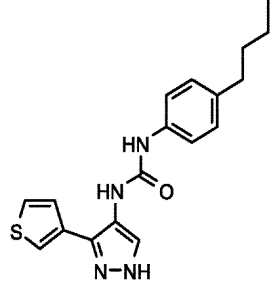
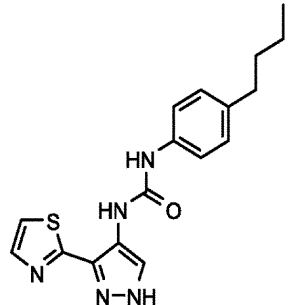
10

20

30

40

50

39	 <chem>C1=CN=C2C(=N1)C(=N2)C3=CC=CC=C3C(=O)Nc4ccc(C(F)(F)F)cn4</chem>
40	 <chem>C1CC2CCCCC2C1NC(=O)Nc3c[nH]n3C4=CC=CC=C4</chem>
41	 <chem>CCCC1=CC=C(NC(=O)Nc2c[nH]n2C)C=C1</chem>
42	 <chem>CCCC1=CC=C(NC(=O)Nc2c[nH]n2C3=CC=CS3)C=C1</chem>
43	 <chem>CCCC1=CC=C(NC(=O)Nc2c[nH]n2C3=CN=C(S3)C4=CC=CC=C4)C=C1</chem>

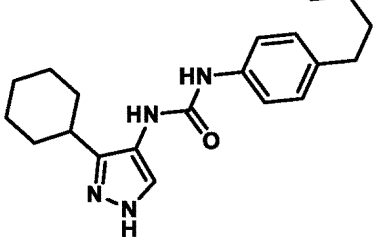
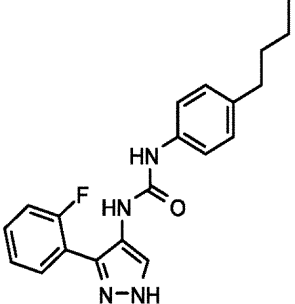
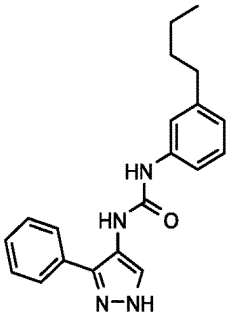
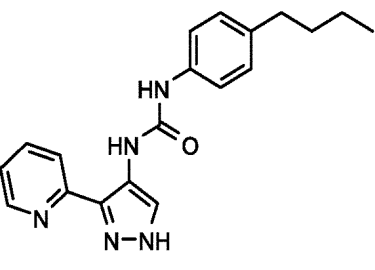
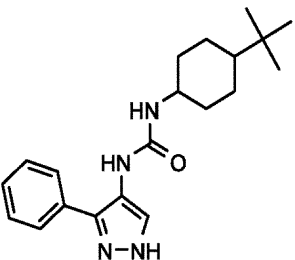
10

20

30

40

50

44	
45	
46	
47	
48	

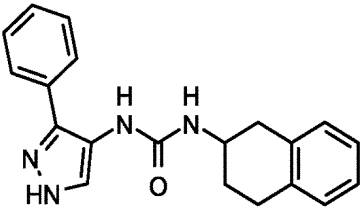
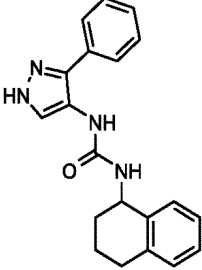
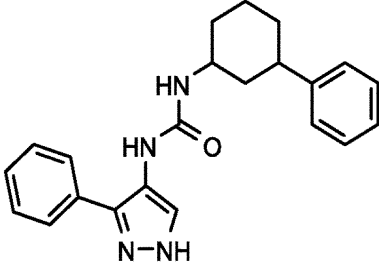
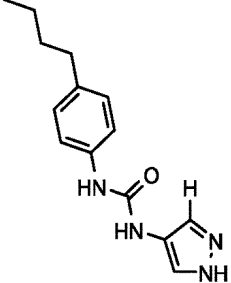
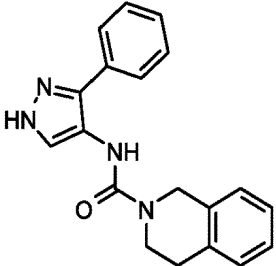
10

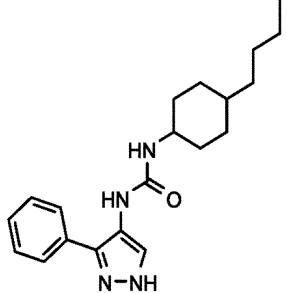
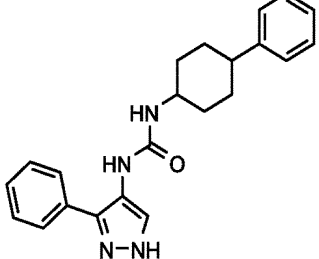
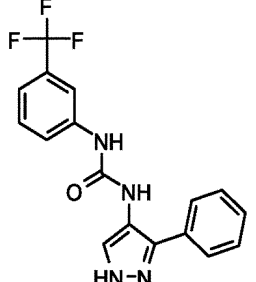
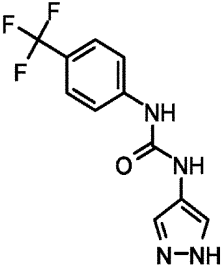
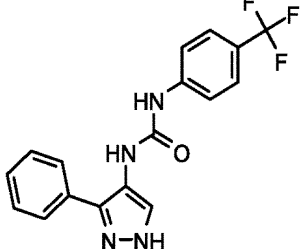
20

30

40

50

49	 <chem>O=C(Nc1c[nH]c2c1[nH]2)c3ccc4c3CCc5ccccc45</chem>	10
50	 <chem>O=C(Nc1c[nH]c2c1[nH]2)c3ccc4c3CCc5ccccc45</chem>	20
51	 <chem>O=C(Nc1c[nH]c2c1[nH]2)c3ccc4c3CCc5ccccc45</chem>	30
52	 <chem>CCCC(=O)Nc1c[nH]c2c1[nH]2</chem>	40
53	 <chem>O=C(Nc1c[nH]c2c1[nH]2)c3ccc4c3CCc5ccccc45</chem>	50

54	 <chem>CCCC1CCC(CC1)NC(=O)Nc2c[nH]c2-c3ccccc3</chem>
55	 <chem>c1ccc(cc1)NC(=O)Nc2c[nH]c2-c3ccccc3</chem>
56	 <chem>Cc1c[nH]c1-c2ccccc2NC(=O)Nc3ccc(cc3)C(F)(F)F</chem>
57	 <chem>Cc1c[nH]c1-c2ccccc2NC(=O)Nc3ccc(cc3)C(F)(F)F</chem>
58	 <chem>Cc1c[nH]c1-c2ccccc2NC(=O)Nc3ccc(cc3)C(F)(F)F</chem>

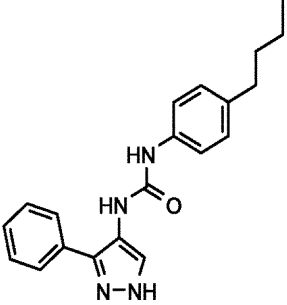
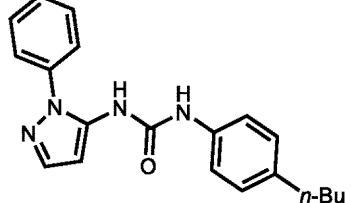
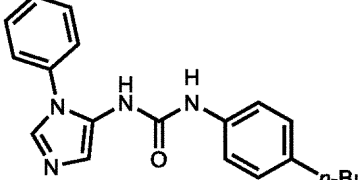
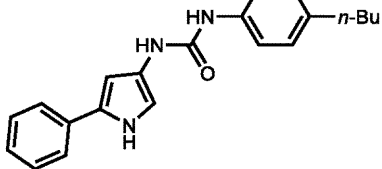
10

20

30

40

50

59	
61	
62	
63	

10

20

またはその薬学的に許容される塩より選択される、本発明1001～1114のいずれかの化合物。

[本発明1116]

本発明1001～1115のいずれかの化合物と、1つまたは複数の薬学的に許容される賦形剤とを含む、薬学的組成物。

[本発明1117]

STINGを本発明1001～1115のいずれかの化合物と接触させる工程を含む、STING活性を阻害するための方法。

[本発明1118]

阻害することがSTINGをアンタゴナイズすることを含む、本発明1117の方法。

[本発明1119]

インビトロで実行される、本発明1117または1118の方法。

[本発明1120]

STINGを含む1つまたは複数の細胞を含む試料を、前記化合物と接触させる工程を含む、本発明1119の方法。

[本発明1121]

前記1つまたは複数の細胞が1つまたは複数のがん細胞である、本発明1119または1120の方法。

[本発明1122]

前記試料が、1つまたは複数のがん細胞をさらに含む（例えば、前記がんが、黒色腫、子宮頸がん、乳がん、卵巣がん、前立腺がん、精巣がん、尿路上皮がん、膀胱がん、非小細胞肺癌、小細胞肺癌、肉腫、結腸直腸腺がん、消化管間質腫瘍、胃食道がん、結腸直腸がん、膵臓がん、腎臓がん、肝細胞がん（hepatocellular cancer）、悪性中皮腫

30

40

50

白血病、リンパ腫、脊髄形成異常症候群、多発性骨髄腫、移行上皮がん、神経芽腫、形質細胞新生物、ウィルムス腫瘍、または肝細胞がん (hepatocellular carcinoma) からなる群より選択される)、本発明1120または1121の方法。

[本発明1123]

インビボで実行される、本発明1117の方法。

[本発明1124]

疾患の病態および/または症状および/または進行にSTINGシグナル伝達の増大(例えば、亢進)が寄与する該疾患を有する対象に、前記化合物を投与する工程を含む、本発明1123の方法。

[本発明1125]

前記対象がヒトである、本発明1124の方法。

[本発明1126]

前記疾患ががんである、本発明1124の方法。

[本発明1127]

前記がんが、黒色腫、子宮頸がん、乳がん、卵巣がん、前立腺がん、精巣がん、尿路上皮がん、膀胱がん、非小細胞肺癌、小細胞肺癌、肉腫、結腸直腸腺がん、消化管間質腫瘍、胃食道がん、結腸直腸がん、膵臓がん、腎臓がん、肝細胞がん、悪性中皮腫、白血病、リンパ腫、脊髄形成異常症候群、多発性骨髄腫、移行上皮がん、神経芽腫、形質細胞新生物、ウィルムス腫瘍、または肝細胞がんからなる群より選択される、本発明1126の方法。

[本発明1128]

前記がんが難治性がんである、本発明1126または1127の方法。

[本発明1129]

前記化合物が、1つまたは複数の追加のがん療法と組み合わせて投与される、本発明1124の方法。

[本発明1130]

前記1つまたは複数の追加のがん療法が、手術、放射線療法、化学療法、毒素療法、免疫療法、寒冷療法、もしくは遺伝子療法、またはそれらの組合せを含む、本発明1129の方法。

[本発明1131]

化学療法が、1つまたは複数の追加の化学療法剤を投与することを含む、本発明1130の方法。

[本発明1132]

前記1つまたは複数の追加の化学療法剤が、アルキル化剤(例えば、シスプラチン、カルボプラチン、メクロレタミン、シクロホスファミド、クロラムブシル、イホスファミド、および/またはオキサリプラチン)、代謝拮抗剤(例えば、アザチオプリンおよび/またはメルカプトプリン)、テルペノイド(例えば、ピンカアルカロイドおよび/またはタキサン、例えば、ピンクリスチン、ピンブラスチン、ピノレルピン、および/またはピンデシン、タキソール、パクリタキセル、および/またはドセタキセル)、トポイソメラーゼ(例えば、1型トポイソメラーゼおよび/または2型トポイソメラーゼ、例えば、イリノテカンおよび/またはトポテカンなどのカンプトテシン、アムサクリン、エトポシド、エトポシドホスフェート、および/またはテニポシド)、細胞障害性抗生物質(例えば、アクチノマイシン、アントラサイクリン、ドキシソルピシン、ダウノルピシン、バルルピシン、イダルピシン、エピルピシン、プレオマイシン、プリカマイシン、および/またはマイトマイシン)、ホルモン(例えば、黄体形成ホルモン放出ホルモンアゴニスト、例えば、ロイプロリジン(leuprolidine)、ゴセレリン、トリプトレリン、ヒストレリン、ピカルタミド、フルタミド、および/またはニルタミド)、抗体(例えば、アブシキシマブ、アダリムマブ、アレムツズマブ、アトリスマブ、バシリキシマブ、ベリムマブ、ベバシズマブ、プレツキシマブベドチン、カナキヌマブ、セツキシマブ、セルトリズマブペゴル、ダクリズマブ、デノスマブ、エクリズマブ、エファリズマブ、ゲムツズマブ、ゴリムマブ

10

20

30

40

50

、ゴリムマブ、イブリツモマブチウキセタン、インフリキシマブ、イピリムマブ、ムロモ  
 ナブ-CD3、ナタリズマブ、オファツムマブ、オマリズマブ、パリビズマブ、パニツムア  
 ブ、ラニビズマブ、リツキシマブ、トシリズマブ、トシツモマブ、および/またはトラス  
 ツズマブ)、抗血管新生剤、サイトカイン、血栓剤、増殖阻害性物質、抗蠕虫剤、ならび  
 に、免疫チェックポイント受容体を標的にする免疫チェックポイント阻害物質より選択さ  
 れ、該免疫チェックポイント受容体が、CTLA-4、PD-1、PD-L1、PD-1-PD-L1、PD-  
 1-PD-L2、インターロイキン-2(IL-2)、インドールアミン2,3-ジオキシゲナーゼ(1  
 DO)、IL-10、トランスフォーミング増殖因子-(TGF)、T細胞免疫グロブリンお  
 よびムチン3(TIM3またはHAVCR2)、ガレクチン9-TIM3、ホスファチジルセリン-T  
 IM3、リンパ球活性化遺伝子3タンパク質(LAG3)、MHCクラスII-LAG3、4-1BB-4-  
 1BBリガンド、OX40-OX40リガンド、GITR、GITRリガンド-GITR、CD27、CD70-  
 CD27、TNFRSF25、TNFRSF25-TL1A、CD40L、CD40-CD40リガンド、HVEM-L  
 IGH1-LTA、HVEM、HVEM-BTLA、HVEM-CD160、HVEM-LIGHT、HVEM-BTLA  
 -CD160、CD80、CD80-PDL-1、PDL2-CD80、CD244、CD48-CD244、CD244  
 、ICOS、ICOS-ICOSリガンド、B7-H3、B7-H4、VISTA、TMIGD2、HLA2-TMI  
 GD2、BTNL2を含むブチロフィリン、シグレックファミリー、TIGITおよびPVRファミ  
 リーメンバー、KIR、ILTおよびLIR、NKG2DおよびNKG2A、MICAおよびMICB、CD  
 244、CD28、CD86-CD28、CD86-CTLA、CD80-CD28、CD39、CD73アデノシン  
 -CD39-CD73、CXCR4-CXCL12、ホスファチジルセリン、TIM3、ホスファチジルセ  
 リン-TIM3、SIRPA-CD47、VEGF、ニューロピリン、CD160、CD30、ならびにCD1  
 55(例えば、CTLA-4またはPD1またはPD-L1)からなる群より選択される、本発明1  
 131の方法。

10

20

[本発明1133]

前記化合物が腫瘍内に投与される、本発明1124~1132のいずれかの方法。

[本発明1134]

そのような治療を必要とする対象に、有効量の本発明1001~1115のいずれかの化合  
 物または本発明1116の薬学的組成物を投与する工程を含む、がんを治療する方法。

[本発明1135]

前記がんが、黒色腫、子宮頸がん、乳がん、卵巣がん、前立腺がん、精巣がん、尿路上  
 皮がん、膀胱がん、非小細胞肺がん、小細胞肺がん、肉腫、結腸直腸腺がん、消化管間質  
 腫瘍、胃食道がん、結腸直腸がん、膵臓がん、腎臓がん、肝細胞がん、悪性中皮腫、白血  
 病、リンパ腫、脊髄形成異常症候群、多発性骨髄腫、移行上皮がん、神経芽腫、形質細胞  
 新生物、ウィルムス腫瘍、または肝細胞がんからなる群より選択される、本発明1134の  
 方法。

30

[本発明1136]

前記がんが難治性がんである、本発明1134または1135の方法。

[本発明1137]

前記化合物が、1つまたは複数の追加のがん療法と組み合わせて投与される、本発明11  
 36の方法。

[本発明1138]

前記1つまたは複数の追加のがん療法が、手術、放射線療法、化学療法、毒素療法、免  
 疫療法、寒冷療法、もしくは遺伝子療法、またはそれらの組合せを含む、本発明1137の  
 方法。

40

[本発明1139]

化学療法が、1つまたは複数の追加の化学療法剤を投与することを含む、本発明1138  
 の方法。

[本発明1140]

前記1つまたは複数の追加の化学療法剤が、アルキル化剤(例えば、シスプラチン、カ  
 ルボプラチン、メクロレタミン、シクロホスファミド、クロラムブシル、イホスファミド  
 、および/またはオキサリプラチン)、代謝拮抗剤(例えば、アザチオプリンおよび/ま

50

たはメルカプトプリン)、テルペノイド(例えば、ビンカアルカロイドおよび/またはタキサン、例えば、ビンクリスチン、ビンブラスチン、ビノレルビン、および/またはビンデシン、タキソール、パクリタキセル、および/またはドセタキセル)、トポイソメラーゼ(例えば、1型トポイソメラーゼおよび/または2型トポイソメラーゼ、例えば、イリノテカンおよび/またはトポテカンなどのカンプトテシン、アムサクリン、エトポシド、エトポシドホスフェート、および/またはテニポシド)、細胞障害性抗生物質(例えば、アクチノマイシン、アントラサイクリン、ドキソルピシン、ダウノルピシン、バルルピシン、イダルピシン、エピルピシン、プレオマイシン、プリカマイシン、および/またはマイトマイシン)、ホルモン(例えば、黄体形成ホルモン放出ホルモンアゴニスト、例えば、ロイプロリジン、ゴセレリン、トリプトレリン、ヒストレリン、ピカルタミド、フルタミド、および/またはニルタミド)、抗体(例えば、アブシキシマブ、アダリムマブ、アレムツズマブ、アトリスマブ、パシリキシマブ、ベリムマブ、ベバシズマブ、プレツキシマブ、ベドチン、カナキヌマブ、セツキシマブ、セルトリズマブ、ペゴル、ダクリズマブ、デノスマブ、エクリズマブ、エファリズマブ、ゲムツズマブ、ゴリムマブ、ゴリムマブ、イブリツモマブ、チウキセタン、インフリキシマブ、イピリムマブ、ムロモナブ-CD3、ナタリズマブ、オファツムマブ、オマリズマブ、パリビズマブ、パニツムアブ、ラニビズマブ、リツキシマブ、トシリズマブ、トシツモマブ、および/またはトラスツズマブ)、抗血管新生剤、サイトカイン、血栓剤、増殖阻害性物質、抗蠕虫剤、ならびに、免疫チェックポイント受容体を標的にする免疫チェックポイント阻害物質より選択され、該免疫チェックポイント受容体が、CTLA-4、PD-1、PD-L1、PD-1-PD-L1、PD-1-PD-L2、インターロイキン-2(IL-2)、インドールアミン2,3-ジオキシゲナーゼ(IDO)、IL-10、トランスフォーミング増殖因子-(TGF)、T細胞免疫グロブリンおよびムチン3(TIM3またはHAVCR2)、ガレクチン9-TIM3、ホスファチジルセリン-TIM3、リンパ球活性化遺伝子3タンパク質(LAG3)、MHCクラスII-LAG3、4-1BB-4-1BBリガンド、OX40-OX40リガンド、GITR、GITRリガンド-GITR、CD27、CD70-CD27、TNFRSF25、TNFRSF25-TL1A、CD40L、CD40-CD40リガンド、HVEM-LIGHT-LTA、HVEM、HVEM-BTLA、HVEM-CD160、HVEM-LIGHT、HVEM-BTLA-CD160、CD80、CD80-PDL-1、PDL2-CD80、CD244、CD48-CD244、CD244、ICOS、ICOS-I、ICOSリガンド、B7-H3、B7-H4、VISTA、TMIGD2、HLA2-TMIGD2、BTNL2を含むブチロフィリン、シグレックファミリー、TIGITおよびPVRファミリーメンバー、KIR、ILTおよびLIR、NKG2DおよびNKG2A、MICAおよびMICB、CD244、CD28、CD86-CD28、CD86-CTLA、CD80-CD28、CD39、CD73アデノシン-CD39-CD73、CXCR4-CXCL12、ホスファチジルセリン、TIM3、ホスファチジルセリン-TIM3、SIRPA-CD47、VEGF、ニューロピリン、CD160、CD30、ならびにCD155(例えば、CTLA-4またはPD1またはPD-L1)からなる群より選択される、本発明1139の方法。

10

20

30

40

50

[本発明1141]

前記化合物が腫瘍内に投与される、本発明1134~1140のいずれかの方法。

[本発明1142]

それを必要とする対象に、有効量の本発明1001~1115のいずれかの化合物または本発明1116の薬学的組成物を投与する工程を含む、該対象において免疫応答を誘導する方法。

[本発明1143]

前記対象ががんを有する、本発明1142の方法。

[本発明1144]

前記対象が、1つまたは複数のがん療法を受けたかつ/または受けているかつ/または受ける対象である、本発明1143の方法。

[本発明1145]

前記がんが、黒色腫、子宮頸がん、乳がん、卵巣がん、前立腺がん、精巣がん、尿路上皮がん、膀胱がん、非小細胞肺がん、小細胞肺がん、肉腫、結腸直腸腺がん、消化管間質腫瘍、胃食道がん、結腸直腸がん、膵臓がん、腎臓がん、肝細胞がん、悪性中皮腫、白血

病、リンパ腫、脊髄形成異常症候群、多発性骨髄腫、移行上皮がん、神経芽腫、形質細胞新生物、ウィルムス腫瘍、または肝細胞がんからなる群より選択される、本発明1143の方法。

[本発明1146]

前記がんが難治性がんである、本発明1145の方法。

[本発明1147]

前記免疫応答が自然免疫応答である、本発明1142の方法。

[本発明1148]

前記少なくとも1つまたは複数のがん療法の、手術、放射線療法、化学療法、毒素療法、免疫療法、寒冷療法、もしくは遺伝子療法、またはそれらの組合せを含む、本発明1147の方法。

10

[本発明1149]

化学療法が、1つまたは複数の追加の化学療法剤を投与することを含む、本発明1148の方法。

[本発明1150]

前記1つまたは複数の追加の化学療法剤が、アルキル化剤（例えば、シスプラチン、カルボプラチン、メクロレタミン、シクロホスファミド、クロラムブシル、イホスファミド、および/またはオキサリプラチン）、代謝拮抗剤（例えば、アザチオプリンおよび/またはメルカプトプリン）、テルペノイド（例えば、ピンカアルカロイドおよび/またはタキサン、例えば、ピンクリスチン、ピンブラスチン、ビノレルピン、および/またはビンデシン、タキソール、パクリタキセル、および/またはドセタキセル）、トポイソメラーゼ（例えば、1型トポイソメラーゼおよび/または2型トポイソメラーゼ、例えば、イリノテカンおよび/またはトポテカンなどのカンプトテシン、アムサクリン、エトポシド、エトポシドホスフェート、および/またはテニポシド）、細胞障害性抗生物質（例えば、アクチノマイシン、アントラサイクリン、ドキシソルピシン、ダウノルビシン、バルルビシン、イダルビシン、エピルビシン、プレオマイシン、プリカマイシン、および/またはマイトマイシン）、ホルモン（例えば、黄体形成ホルモン放出ホルモンアゴニスト、例えば、ロイプロリジン、ゴセレリン、トリプトレリン、ヒストレリン、ピカルタミド、フルタミド、および/またはニルタミド）、抗体（例えば、アブシキシマブ、アダリムマブ、アレムツズマブ、アトリスマブ、パシリキシマブ、ベリムマブ、ベバシズマブ、プレツキシマブ、ベドチン、カナキヌマブ、セツキシマブ、セルトリズマブ、ダクリズマブ、デノスマブ、エクリズマブ、エファリズマブ、ゲムツズマブ、ゴリムマブ、ゴリムマブ、イブリツモマブ、チウキセタン、インフリキシマブ、イピリムマブ、ムロモナブ-CD3、ナタリズマブ、オフアツムマブ、オマリズマブ、パリビズマブ、パニツムマブ、ラニビズマブ、リツキシマブ、トシリズマブ、トシツモマブ、および/またはトラスツズマブ）、抗血管新生剤、サイトカイン、血栓剤、増殖阻害性物質、抗蠕虫剤、ならびに、免疫チェックポイント受容体を標的にする免疫チェックポイント阻害物質より選択され、該免疫チェックポイント受容体が、CTLA-4、PD-1、PD-L1、PD-1-PD-L1、PD-1-PD-L2、インターロイキン-2（IL-2）、インドールアミン2,3-ジオキシゲナーゼ（IDO）、IL-10、トランスフォーミング増殖因子- $\beta$ （TGF $\beta$ ）、T細胞免疫グロブリンおよびムチン3（TIM3またはHAVCR2）、ガレクチン9-TIM3、ホスファチジルセリン-TIM3、リンパ球活性化遺伝子3タンパク質（LAG3）、MHCクラスII-LAG3、4-1BB-4-1BBリガンド、OX40-OX40リガンド、GITR、GITRリガンド-GITR、CD27、CD70-CD27、TNFRSF25、TNFRSF25-TL1A、CD40L、CD40-CD40リガンド、HVEM-LIGHT-LTA、HVEM、HVEM-BTLA、HVEM-CD160、HVEM-LIGHT、HVEM-BTLA-CD160、CD80、CD80-PDL-1、PDL2-CD80、CD244、CD48-CD244、CD244、ICOS、ICOS-I、COSリガンド、B7-H3、B7-H4、VISTA、TMIGD2、HHLA2-TMIGD2、BTNL2を含むブチロフィリン、シグレックファミリー、TIGITおよびPVRファミリーメンバー、KIR、ILTおよびLIR、NKG2DおよびNKG2A、MICAおよびMICB、CD244、CD28、CD86-CD28、CD86-CTLA、CD80-CD28、CD39、CD73アデノシン-CD39-CD73、C

20

30

40

50

XCR4-CXCL12、ホスファチジルセリン、TIM3、ホスファチジルセリン-TIM3、SIRP A-CD47、VEGF、ニューロピリン、CD160、CD30、ならびにCD155（例えば、CTLA-4またはPD1またはPD-L1）からなる群より選択される、本発明1149の方法。

[本発明1151]

そのような治療を必要とする対象に、有効量の本発明1001~1115のいずれかの化合物または本発明1116の薬学的組成物を投与する工程を含む、疾患の病態および/または症状および/または進行にSTINGシグナル伝達の増大（例えば、亢進）が寄与する該疾患の治療の方法。

[本発明1152]

疾患の病態および/または症状および/または進行にSTINGシグナル伝達の増大（例えば、亢進）が寄与する該疾患を有する対象に、有効量の本発明1001~1115のいずれかの化合物または本発明1116の薬学的組成物を投与する工程を含む、治療の方法。

10

[本発明1153]

対象に本発明1001~1115のいずれかの化合物または本発明1116の薬学的組成物を投与する工程を含み、該化合物または組成物が、疾患の病態および/または症状および/または進行にSTINGシグナル伝達の増大（例えば、亢進）が寄与する該疾患を治療するのに有効な量で投与され、それにより、該疾患が治療される、治療の方法。

[本発明1154]

前記疾患ががんである、本発明1151~1153のいずれかの方法。

[本発明1155]

前記がんが、黒色腫、子宮頸がん、乳がん、卵巣がん、前立腺がん、精巣がん、尿路上皮がん、膀胱がん、非小細胞肺がん、小細胞肺がん、肉腫、結腸直腸腺がん、消化管間質腫瘍、胃食道がん、結腸直腸がん、膵臓がん、腎臓がん、肝細胞がん、悪性中皮腫、白血病、リンパ腫、脊髄形成異常症候群、多発性骨髄腫、移行上皮がん、神経芽腫、形質細胞新生物、ウィルムス腫瘍、または肝細胞がんからなる群より選択される、本発明1154の方法。

20

[本発明1156]

前記がんが難治性がんである、本発明1154または1155の方法。

[本発明1157]

前記化合物が、1つまたは複数の追加のがん療法と組み合わせて投与される、本発明1154~1156のいずれかの方法。

30

[本発明1158]

前記1つまたは複数の追加のがん療法が、手術、放射線療法、化学療法、毒素療法、免疫療法、寒冷療法、もしくは遺伝子療法、またはそれらの組合せを含む、本発明1157の方法。

[本発明1159]

化学療法が、1つまたは複数の追加の化学療法剤を投与することを含む、本発明1158の方法。

[本発明1160]

前記1つまたは複数の追加の化学療法剤が、アルキル化剤（例えば、シスプラチン、カルボプラチン、メクロレタミン、シクロホスファミド、クロラムブシル、イホスファミド、および/またはオキサリプラチン）、代謝拮抗剤（例えば、アザチオプリンおよび/またはメルカプトプリン）、テルペノイド（例えば、ピンカアルカロイドおよび/またはタキサン、例えば、ピンクリスチン、ピンブラスチン、ピノレルピン、および/またはビンデシン、タキソール、パクリタキセル、および/またはドセタキセル）、トポイソメラーゼ（例えば、1型トポイソメラーゼおよび/または2型トポイソメラーゼ、例えば、イリノテカンおよび/またはトポテカンなどのカンプトテシン、アムサクリン、エトポシド、エトポシドホスフェート、および/またはテニポシド）、細胞障害性抗生物質（例えば、アクチノマイシン、アントラサイクリン、ドキシソルピシン、ダウノルビシン、バルルビシン、イダルビシン、エピルビシン、プレオマイシン、プリカマイシン、および/またはマイ

40

50

トマイシン)、ホルモン(例えば、黄体形成ホルモン放出ホルモンアゴニスト、例えば、ロイプロリジン、ゴセレリン、トリプトレリン、ヒストレリン、ピカルタミド、フルタミド、および/またはニルタミド)、抗体(例えば、アブシキシマブ、アダリムマブ、アレムツズマブ、アトリスマブ、バシリキシマブ、ベリムマブ、ペバシズマブ、プレツキシマブベドチン、カナキヌマブ、セツキシマブ、セルトリズマブベゴル、ダクリズマブ、デノスマブ、エクリズマブ、エファリズマブ、ゲムツズマブ、ゴリムマブ、ゴリムマブ、イブリツモマブチウキセタン、インフリキシマブ、イピリムマブ、ムロモナブ-CD3、ナタリズマブ、オファツムマブ、オマリズマブ、パリビズマブ、パニツムアブ、ラニビズマブ、リツキシマブ、トシリズマブ、トシツモマブ、および/またはトラスツズマブ)、抗血管新生剤、サイトカイン、血栓剤、増殖阻害性物質、抗蠕虫剤、ならびに、免疫チェックポイント受容体を標的にする免疫チェックポイント阻害物質より選択され、該免疫チェックポイント受容体が、CTLA-4、PD-1、PD-L1、PD-1-PD-L1、PD-1-PD-L2、インターロイキン-2(IL-2)、インドールアミン2,3-ジオキシゲナーゼ(IDO)、IL-10、トランスフォーミング増殖因子-(TGF)、T細胞免疫グロブリンおよびムチン3(TIM3またはHAVCR2)、ガレクチン9-TIM3、ホスファチジルセリン-TIM3、リンパ球活性化遺伝子3タンパク質(LAG3)、MHCクラスII-LAG3、4-1BB-4-1BBリガンド、OX40-OX40リガンド、GITR、GITRリガンド-GITR、CD27、CD70-CD27、TNFRSF25、TNFRSF25-TL1A、CD40L、CD40-CD40リガンド、HVEM-LIGHT-LTA、HVEM、HVEM-BTLA、HVEM-CD160、HVEM-LIGHT、HVEM-BTLA-CD160、CD80、CD80-PDL-1、PDL2-CD80、CD244、CD48-CD244、CD244、ICOS、ICOS-I 20 COSリガンド、B7-H3、B7-H4、VISTA、TMIGD2、HLA2-TMIGD2、BTNL2を含むブチロフィリン、シグレックファミリー、TIGITおよびPVRファミリーメンバー、KIR、ILTおよびLIR、NKG2DおよびNKG2A、MICAおよびMICB、CD244、CD28、CD86-CD28、CD86-CTLA、CD80-CD28、CD39、CD73アデノシン-CD39-CD73、CXCR4-CXCL12、ホスファチジルセリン、TIM3、ホスファチジルセリン-TIM3、SIRP A-CD47、VEGF、ニューロピリン、CD160、CD30、ならびにCD155(例えば、CTLA-4またはPD1またはPD-L1)からなる群より選択される、本発明1159の方法。

10

20

[本発明1161]

前記化合物が腫瘍内に投与される、本発明1151~1160のいずれかの方法。

[本発明1162]

そのような治療を必要とする対象に、有効量の本発明1001~1115のいずれかの化合物または本発明1116の薬学的組成物を投与する工程を含む、STINGに関連する疾患、障害、または状態の治療の方法。

30

[本発明1163]

前記疾患、障害、または状態が、I型インターフェロン症、エカルディ-グティエール症候群(AGS)、遺伝型のループス、炎症関連障害、および関節リウマチより選択される、本発明1162の方法。

[本発明1164]

前記疾患、障害、または状態がI型インターフェロン症(例えば、乳児発症性STING関連血管炎(SAVI))である、本発明1163の方法。

40

[本発明1165]

前記I型インターフェロン症が乳児発症性STING関連血管炎(SAVI))である、本発明1164の方法。

[本発明1166]

前記疾患、障害、または状態がエカルディ-グティエール症候群(AGS)である、本発明1163の方法。

[本発明1167]

前記疾患、障害、または状態が遺伝型のループスである、本発明1163の方法。

[本発明1168]

前記疾患、障害、または状態が炎症関連障害である、本発明1163の方法。

50

[本発明1169]

前記炎症関連障害が全身性エリテマトーデスである、本発明1168の方法。

[本発明1170]

前記対象を同定する工程をさらに含む、本発明1117～1169のいずれかの方法。

本発明の1つまたは複数の態様の詳細は、添付の図面および以下の説明に示される。本発明の他の特徴および利点は、説明および図面から、ならびに請求項から明らかであろう。

10

20

30

40

50