

【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 8 月 22 日(2022.8.22)

【国際公開番号】WO2020/037091

【公表番号】特表 2021-534168(P2021-534168A)

【公表日】令和 3 年 12 月 9 日(2021.12.9)

【出願番号】特願 2021-507787(P2021-507787)

【国際特許分類】

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

A 6 1 K 3 1 / 4 7 4 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

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

10

【 F I 】

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 0 5 C

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

A 6 1 K 3 1 / 4 7 4 5

C 0 7 D 5 1 9 / 0 0 3 0 1

A 6 1 K 4 5 / 0 0

20

【手続補正書】

【提出日】令和 4 年 8 月 12 日(2022.8.12)

【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】

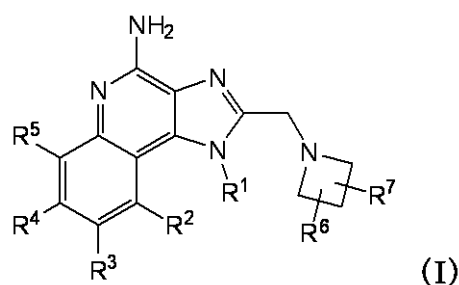
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式(I):

30

【化 1】



[ 式中、

40

R<sup>1</sup>は、独立して、1～3個のハロゲンで置換されている非分岐C<sub>2-6</sub>アルキレン、0～3個のハロゲンで置換されている分岐C<sub>3-6</sub>アルキレン、および0～3個のハロゲンで置換されているC<sub>3-6</sub>シクロアルキルから選択され；

R<sup>2</sup>、R<sup>3</sup>およびR<sup>5</sup>は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、シアノ、C<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>ハロアルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、およびC<sub>1-4</sub>ハロアルコキシから選択され；

R<sup>4</sup>は、独立して、N、N(R<sup>a</sup>)、O、およびSからそれぞれ独立して選択される、1～4個の環原子を含む5員ヘテロアリールであり、ここでヘテロアリールは0～3個のR<sup>b</sup>で置換され；

R<sup>6</sup>およびR<sup>7</sup>は、それぞれ独立して、H、ハロゲン、OH、シアノ、C<sub>1-4</sub>アルキル、C<sub>1-4</sub>アルコキシ、C<sub>1-4</sub>ハロアルキルおよびC<sub>1-4</sub>ハロアルコキシから選択されるか；

50

あるいは、 $R^6$ および $R^7$ は、同じ炭素原子に結合する場合、それぞれが接続する炭素原子と一体になって、さらに2～5個の環原子(このうち1～2個の環原子は、 $N(R^a)$ 、O、およびSからそれぞれ独立して選択される)を含むヘテロシクリルを形成し、ここでヘテロシクリルは、0～2個の $R^c$ で置換され;

$R^a$ は、それぞれ独立して、Hおよび $C_{1-4}$ アルキルから選択され;

$R^b$ は、独立して、ハロゲン、OH、シアノ、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ ハロアルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、および $C_{1-4}$ ハロアルコキシから選択され;および

$R^c$ は、独立して、ハロゲン、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ ハロアルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、および $C_{1-4}$ ハロアルコキシから選択される]

の化合物、またはその互変異性体または医薬的に許容される塩。

10

【請求項2】

$R^1$ が、独立して、1～3個のFで置換されている非分岐 $C_{2-4}$ アルキレン、0～2個のFで置換されている分岐 $C_{3-4}$ アルキレンおよび $C_{3-4}$ シクロアルキルから選択され;

$R^2$ 、 $R^3$ および $R^5$ が、それぞれ独立して、H、ハロゲンおよび $C_{1-4}$ アルキルから選択され;

$R^4$ が、独立して、ピラゾリル、チエニルまたはイソチアゾリルであり;

$R^6$ および $R^7$ が、それぞれ独立して、H、ハロゲン、OH、シアノ、 $C_{1-4}$ アルキル、 $C_{1-4}$ アルコキシ、および $C_{1-4}$ ハロアルキルから選択されるか;

あるいは、 $R^6$ および $R^7$ が同じ炭素原子に結合する場合、それぞれが接続する炭素原子と一体になって、さらに3～5個の環原子(このうち1個の環原子はOである)を含むヘテロシクリルを形成する、

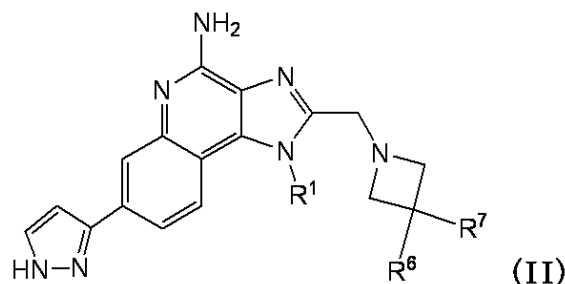
20

請求項1に記載の化合物、またはその互変異性体または医薬的に許容される塩。

【請求項3】

式(II):

【化2】



30

[ 式中、

$R^1$ は、独立して、2,2-ジフルオロエチル、イソプロピル、シクロプロピル、およびシクロブチルから選択され;

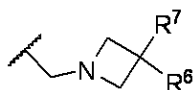
$R^6$ は、独立して、H、F、OH、 $CH_3$ 、 $OCH_3$ 、およびCNから選択され;

$R^7$ は、独立して、H、Fおよび $CH_3$ から選択されるか;

40

あるいは、

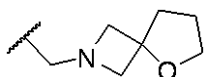
【化3】



は、

50

## 【化 4】



である]

の請求項1または請求項2に記載の化合物、またはその互変異性体または医薬的に許容される塩。

## 【請求項 4】

実施例1～17から選択される、請求項1に記載の化合物、またはその互変異性体または医薬的に許容される塩。

10

## 【請求項 5】

請求項1～4のいずれか一項で特許請求される化合物またはその医薬的に許容される塩、および1つ以上の医薬的に許容される賦形剤を含む、医薬組成物。

## 【請求項 6】

薬剤として用いるための、請求項1～4のいずれか一項に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩を含む、請求項5に記載の医薬組成物。

## 【請求項 7】

がん治療に用いるための、請求項1～4のいずれか一項で特許請求される化合物またはその医薬的に許容される塩を含む、医薬組成物。

## 【請求項 8】

がんが、急性骨髄性白血病、副腎皮質がん、カポジ肉腫、リンパ腫、肛門がん、虫垂癌、奇形腫/ラブドイド腫瘍、基底細胞がん、胆管がん、膀胱がん、骨がん、脳腫瘍、乳がん、気管支腫瘍、カルチノイド腫瘍、心臓腫瘍、子宮頸がん、脊索腫、慢性リンパ性白血病、慢性骨髄増殖性腫瘍、結腸がん、大腸がん、頭蓋咽頭腫、胆管がん、子宮内膜がん、上衣腫、食道がん、鼻腔神経芽細胞腫、ユーイング肉腫、眼腫瘍、卵管がん、胆嚢がん、消化管カルチノイド腫瘍、消化管間質腫瘍、胚細胞腫瘍、有毛細胞白血病、頭頸部がん、心臓腫瘍、肝臓がん、下咽頭がん、膵臓がん、腎臓がん、喉頭がん、慢性骨髄性白血病、口唇および口腔がん、肺がん、黒色腫、メルケル細胞がん、中皮腫、口唇がん、口唇部がん、骨肉腫、卵巣がん、陰茎がん、咽頭がん、前立腺がん、直腸がん、唾液腺がん、皮膚がん、小腸がん、軟部組織肉腫、精巣がん、喉のがん、甲状腺がん、尿道がん、子宮がん、膣がん、および外陰がんから選択される、請求項7に記載の医薬組成物。

20

30

## 【請求項 9】

がんが、難治性がんである、請求項7または請求項8に記載の医薬組成物。

## 【請求項 10】

がんが、乳がん、結腸がん、直腸がん、大腸がん、膵臓がん、および前立腺がんから選択される、請求項7に記載の医薬組成物。

## 【請求項 11】

がんが、ホルモン受容体陽性乳がん、マイクロサテライト安定性結腸がんまたはマイクロサテライト安定性直腸がん、膵臓がんおよび前立腺がんから選択される、請求項7に記載の医薬組成物。

40

## 【請求項 12】

1つ以上の別のがん治療と組み合わせて投与される、請求項7～11のいずれか一項に記載の医薬組成物。

## 【請求項 13】

1つ以上の別のがん治療に、手術、放射線療法、化学療法、毒素治療、免疫療法、凍結療法または遺伝子治療、またはその組み合わせが含まれる、請求項12に記載の医薬組成物。

## 【請求項 14】

別のがん治療に、ニボルマブ、ペムブロリズマブ、PDR001、MEDI-0680、セミピリマブ、JS001、BGB-A317、INCSHR1210、TSR-042、GLS-010、AM-0001、S

50

TI-1110、AGEN2034、MGD013、IBI308、BMS-936559、アテゾリズマブ、デュルバルマブ、アベルマブ、STI-1014、CX-072、LY3300054、CK-301、ウレルマブ、PF-05082566、MEDI6469、TRX518、バルリルマブ、CP-870893、BMS-986016、MGA271、リリルマブ、IPH2201、エマクツズマブ、INCB024360、ガルニセルチブ、ウロクブルマブ、BKT140、バビツキシマブ、CC-90002、ペバシズマブ、MNRP1685A、イピリムマブ、MK-1308、AGEN-1884、およびトレメリムマブから選択される1つ以上の薬剤が含まれる、請求項12に記載の医薬組成物。

【請求項15】

別のがん治療に、ニボルマブ、イピリムマブ、ペムブロリズマブ、アテゾリズマブ、デュルバルマブおよびアベルマブから選択される1つ以上の薬剤が含まれる、請求項12に記載の医薬組成物。

10

20

30

40

50