

【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2年4月9日(2020.4.9)

【公表番号】特表2019-510069(P2019-510069A)

【公表日】平成31年4月11日(2019.4.11)

【年通号数】公開・登録公報2019-014

【出願番号】特願2018-551785(P2018-551785)

【国際特許分類】

|               |           |
|---------------|-----------|
| C 07D 209/34  | (2006.01) |
| C 07D 209/38  | (2006.01) |
| C 07D 209/36  | (2006.01) |
| C 07D 487/04  | (2006.01) |
| C 07D 403/06  | (2006.01) |
| C 07D 413/06  | (2006.01) |
| C 07D 417/06  | (2006.01) |
| C 07D 401/06  | (2006.01) |
| C 07D 409/06  | (2006.01) |
| C 07D 405/06  | (2006.01) |
| A 61K 31/404  | (2006.01) |
| A 61K 31/5025 | (2006.01) |
| A 61K 31/416  | (2006.01) |
| A 61K 31/655  | (2006.01) |
| A 61K 31/423  | (2006.01) |
| A 61K 31/428  | (2006.01) |
| A 61P 35/00   | (2006.01) |

【F I】

|               |       |
|---------------|-------|
| C 07D 209/34  | C S P |
| C 07D 209/38  |       |
| C 07D 209/36  |       |
| C 07D 487/04  | 1 4 0 |
| C 07D 403/06  |       |
| C 07D 413/06  |       |
| C 07D 417/06  |       |
| C 07D 401/06  |       |
| C 07D 409/06  |       |
| C 07D 405/06  |       |
| A 61K 31/404  |       |
| A 61K 31/5025 |       |
| A 61K 31/416  |       |
| A 61K 31/655  |       |
| A 61K 31/423  |       |
| A 61K 31/428  |       |
| A 61P 35/00   |       |

【手続補正書】

【提出日】令和2年2月18日(2020.2.18)

【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

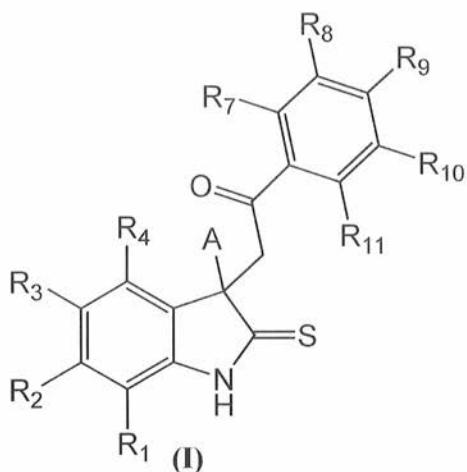
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)：

【化1】



(式中、

Aは、-OH、D、H、F、及び-NH<sub>2</sub>からなる群より選ばれ、

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、及びR<sub>4</sub>は、それぞれ独立して、H、Cl、-CN、-CF<sub>3</sub>、C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルコキシ、-C(=O)NH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、及び-OHからなる群より選ばれ、

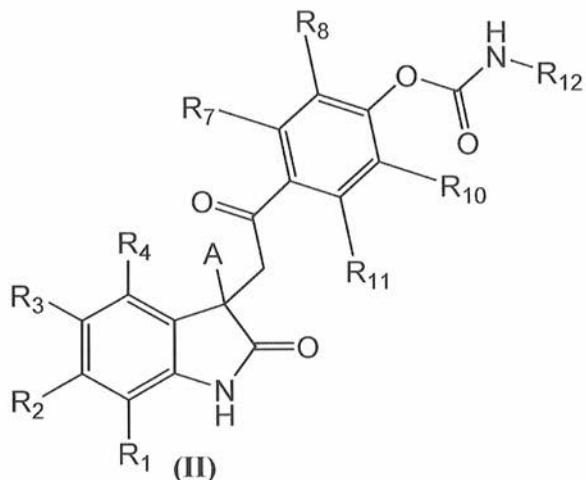
R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub>、及びR<sub>11</sub>は、それぞれ独立して、H、D、F、Cl、ハロゲン、CN、CF<sub>3</sub>、-OCH<sub>3</sub>、C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、-O(アリール)、-O(ヘテロアリール)、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>(アリール)、-NHC(=O)NH(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-NHC(=O)(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)CO<sub>2</sub>H、-N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)CONH(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)CON(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>NH(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-SO<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>3</sub>-<sub>8</sub>シクロアルキル、及びC<sub>3</sub>-<sub>8</sub>ヘテロシクロアルキルからなる群より選ばれる)

で表される、化合物、又はその立体異性体、医薬的に許容し得る塩もしくは溶媒和物。

【請求項2】

式(I-I)：

## 【化2】



(式中、

Aは、-OH、D、H、F、及び-NH<sub>2</sub>からなる群より選ばれ、

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、及びR<sub>4</sub>は、それぞれ独立して、H、C1、-CN、-CF<sub>3</sub>、C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルコキシ、-C(=O)NH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、及び-OHからなる群より選ばれ、

R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、R<sub>10</sub>、及びR<sub>11</sub>は、それぞれ独立して、H、D、F、C1、ハロゲン、CN、CF<sub>3</sub>、C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、-O(アリール)、-O(ヘテロアリール)、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>(アリール)、-NHCONH(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-NHCON(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)CONH<sub>2</sub>、-N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)CONH(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)CON(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>NH(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-SO<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>3</sub>-<sub>8</sub>シクロアルキル、及びC<sub>3</sub>-<sub>8</sub>ヘテロシクロアルキルからなる群より選ばれ、

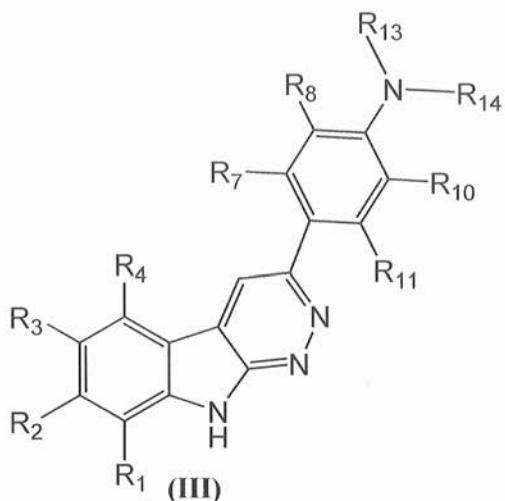
R<sub>12</sub>は、置換又は非置換C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルである)

で表される、化合物、又はその立体異性体、医薬的に許容し得る塩もしくは溶媒和物。

## 【請求項3】

式(III)：

## 【化3】



(式中、

$R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、及び $R_4$ は、それぞれ独立して、H、C1、-CN、-CF<sub>3</sub>、C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルコキシ、-C(=O)NH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、及び-OHからなる群より選ばれ、

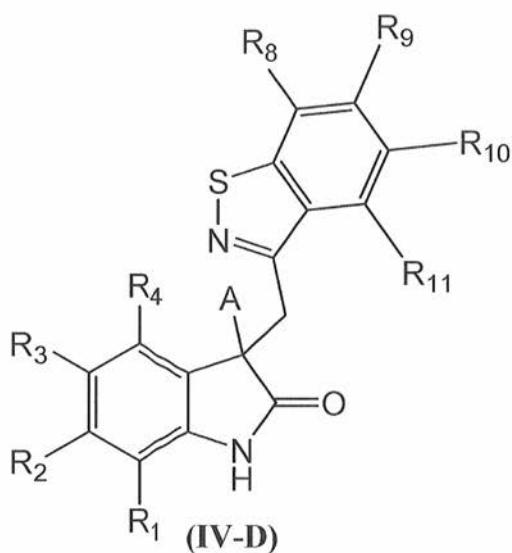
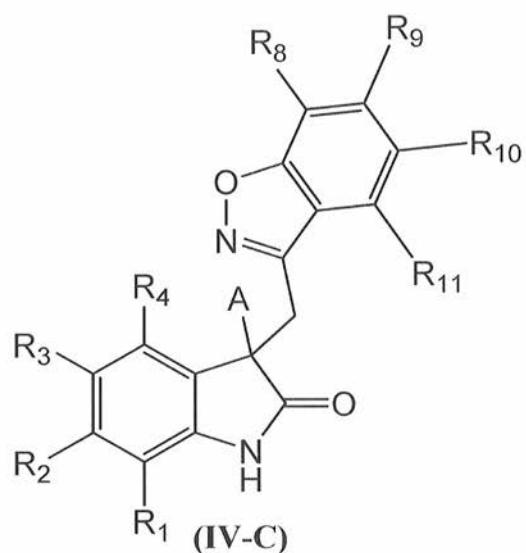
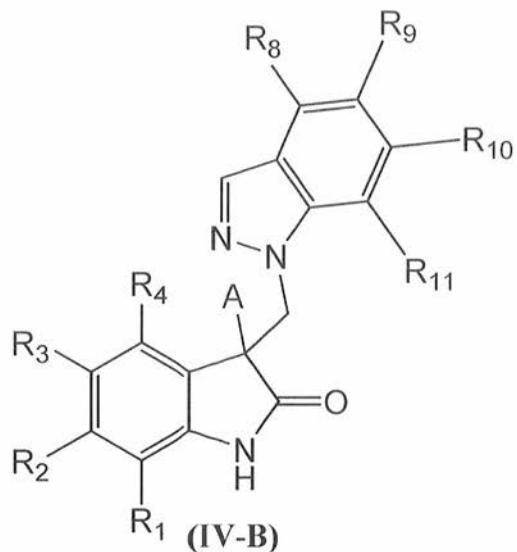
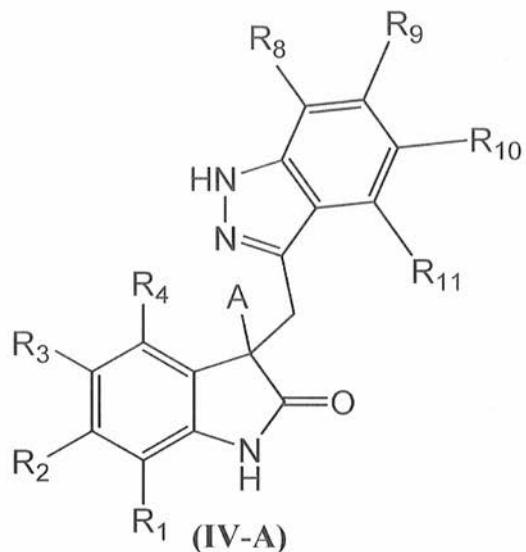
$R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_{10}$ 、及び $R_{11}$ は、それぞれ独立して、H、D、F、C1、ハロゲン、CN、CF<sub>3</sub>、C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、-O(アリール)、-O(ヘテロアリール)、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>(アリール)、-NHCONH(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-NHCON(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)CONH<sub>2</sub>、-N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)CONH(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)CON(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>NH(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-SO<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>3</sub>-<sub>8</sub>シクロアルキル、及びC<sub>3</sub>-<sub>8</sub>ヘテロシクロアルキルからなる群より選ばれ、

$R_{13}$ 及び $R_{14}$ は、それぞれ独立して、置換又は非置換C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキルである)で表される、化合物、又はその立体異性体、医薬的に許容し得る塩もしくは溶媒和物。

## 【請求項4】

式(IV-A)、式(IV-B)、式(IV-C)、又は式(IV-D)：

【化4】



、又は

(式中、

Aは、-OH、D、H、F、及び-NH<sub>2</sub>からなる群より選ばれ、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、及びR<sub>4</sub>は、それぞれ独立して、H、C<sub>1</sub>、-CN、-CF<sub>3</sub>、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、-C(=O)NH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、及び-OHからなる群より選ばれ、

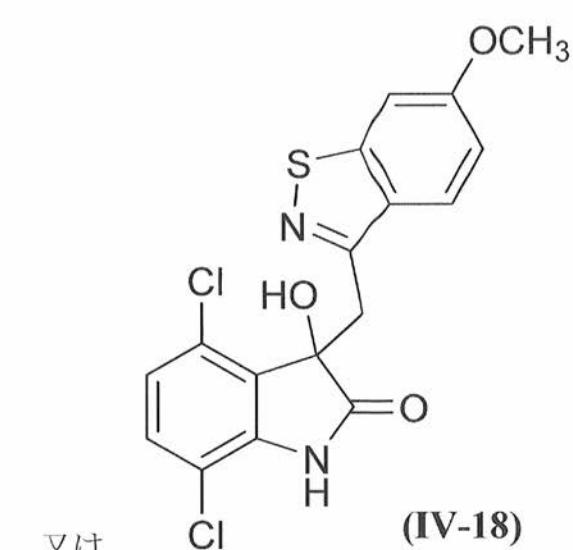
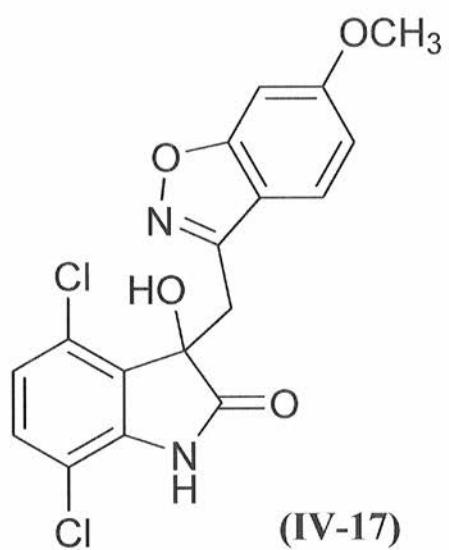
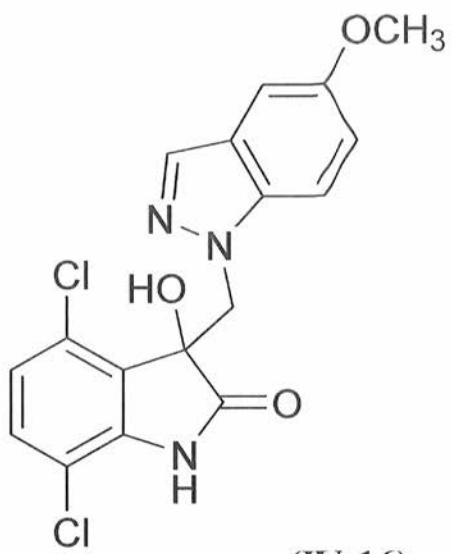
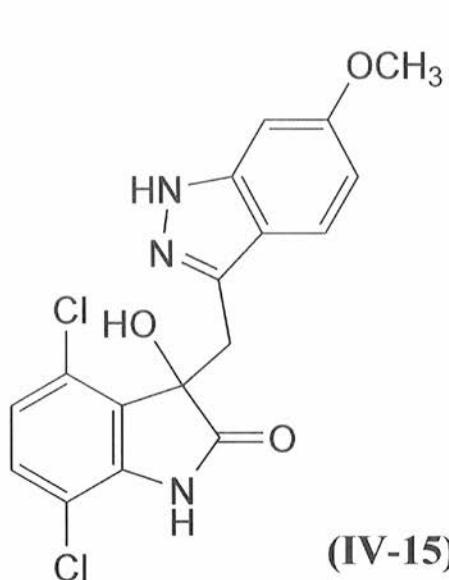
R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub>、及びR<sub>11</sub>は、それぞれ独立して、-OCH<sub>3</sub>、H、D、F、C<sub>1</sub>ハロゲン、CN、CF<sub>3</sub>、C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、-O(アリール)、-O(ヘテロアリール)、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>(C<sub>1-6</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>(C<sub>1-6</sub>アルキル)、-NHCO<sub>2</sub>(アリール)、-NHCONH(C<sub>1-6</sub>アルキル)、-NHCON(C<sub>1-6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-N(C<sub>1-6</sub>アルキル)CONH<sub>2</sub>、-N(C<sub>1-6</sub>アルキル)CONH(C<sub>1-6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1-6</sub>アルキル)CON(C<sub>1-6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>(C<sub>1-6</sub>アルキル)、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>NH(C<sub>1-6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、及びC<sub>3-8</sub>ヘテロシクロアルキルからなる群より選ばれる)

で表される、化合物、又はその立体異性体、医薬的に許容し得る塩もしくは溶媒和物。

【請求項 5】

式(IV-15)、式(IV-16)、式(IV-17)、又は式(IV-18)：

【化5】

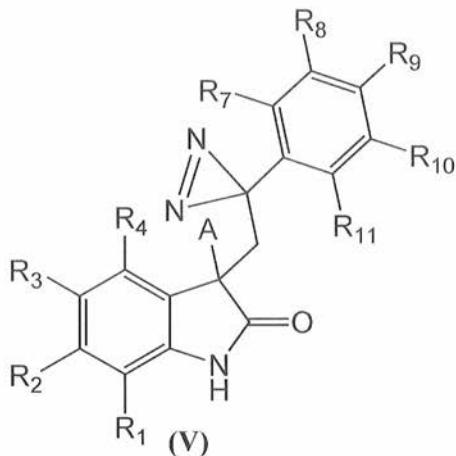


で表される、請求項4に記載の化合物。

【請求項 6】

式(V)：

## 【化6】



(式中、

Aは、-OH、D、H、F、及び-NH<sub>2</sub>からなる群より選ばれ、

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、及びR<sub>4</sub>は、それぞれ独立して、H、C1、-CN、-CF<sub>3</sub>、C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルコキシ、-C(=O)NH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、及び-OHからなる群より選ばれ、

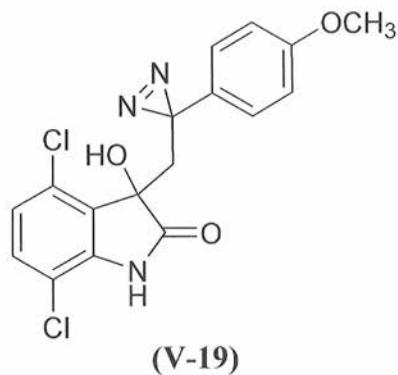
R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、R<sub>9</sub>、R<sub>10</sub>、及びR<sub>11</sub>は、それぞれ独立して、-OCH<sub>3</sub>、H、D、F、C1、ハロゲン、CN、CF<sub>3</sub>、C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、-O(アリール)、-O(ヘテロアリール)、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>(アリール)、-NHC(=O)NH(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-NHC(=O)(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)CO<sub>2</sub>H、-N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)CONH(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)CON(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>NH(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-SO<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>3</sub>-<sub>8</sub>シクロアルキル、及びC<sub>3</sub>-<sub>8</sub>ヘテロシクロアルキルからなる群より選ばれる)

で表される、化合物、又はその立体異性体、医薬的に許容し得る塩もしくは溶媒和物。

## 【請求項7】

式(V-19)：

## 【化7】

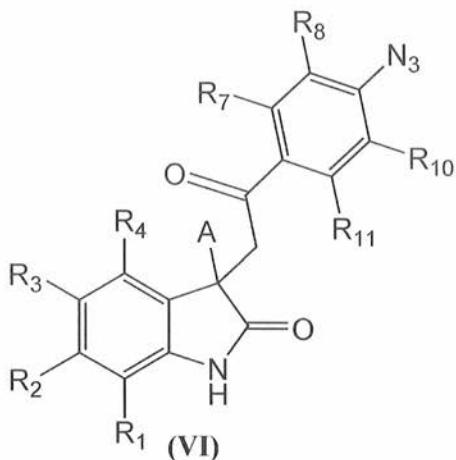


で表される、請求項6に記載の化合物。

## 【請求項8】

式(V-I)：

## 【化 8】



(式中、

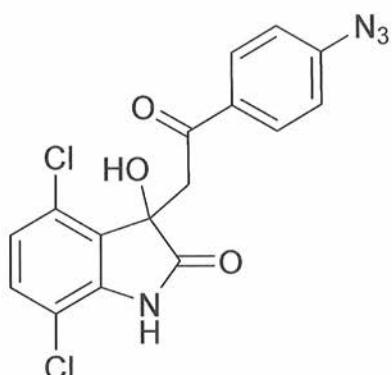
Aは、-OH、D、H、F、及び-NH<sub>2</sub>からなる群より選ばれ、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、及びR<sub>4</sub>は、それぞれ独立して、H、Cl、-CN、-CF<sub>3</sub>、C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルコキシ、-C(=O)NH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、及び-OHからなる群より選ばれ、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、R<sub>10</sub>、及びR<sub>11</sub>は、それぞれ独立して、H、D、F、Cl、ハロゲン、CN、CF<sub>3</sub>、C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、-O(アリール)、-O(ヘテロアリール)、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>(アリール)、-NHCONH(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-NHCON(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)CONH<sub>2</sub>、-N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)CONH(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)CON(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>NH(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-SO<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>3</sub>-<sub>8</sub>シクロアルキル、及びC<sub>3</sub>-<sub>8</sub>ヘテロシクロアルキルからなる群より選ばれる)

で表される、化合物、又はその立体異性体、医薬的に許容し得る塩もしくは溶媒和物。

## 【請求項 9】

式(VI-20)：

## 【化 9】

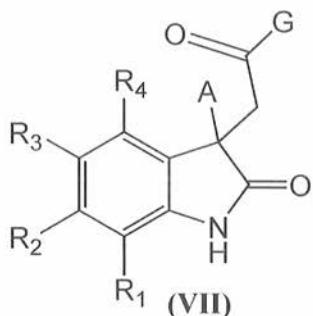


(VI-20)

で表される、請求項8に記載の化合物。

## 【請求項 10】

式(VIII)：  
【化10】

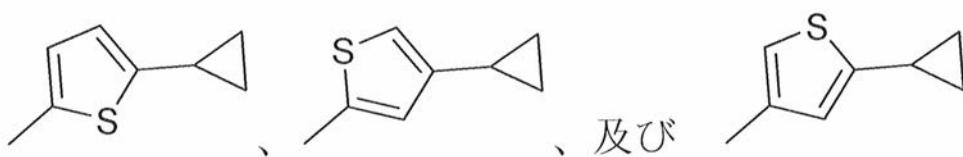
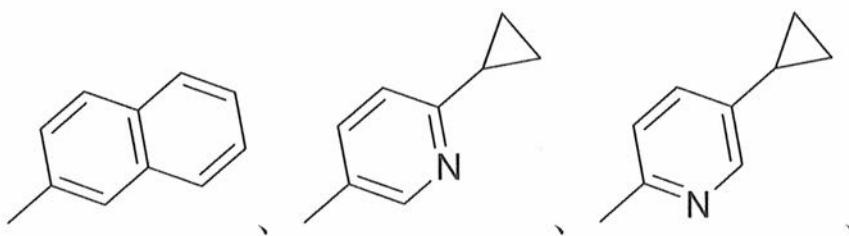


(式中、

Aは、-OH、D、H、F、及び-NH<sub>2</sub>からなる群より選ばれ、R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、及びR<sub>4</sub>は、それぞれ独立して、H、Cl、-CN、-CF<sub>3</sub>、C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルコキシ、-C(=O)NH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、及び-OHからなる群より選ばれ、

Gは、

【化11】



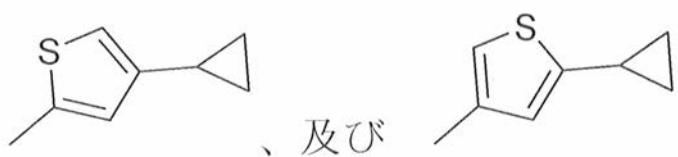
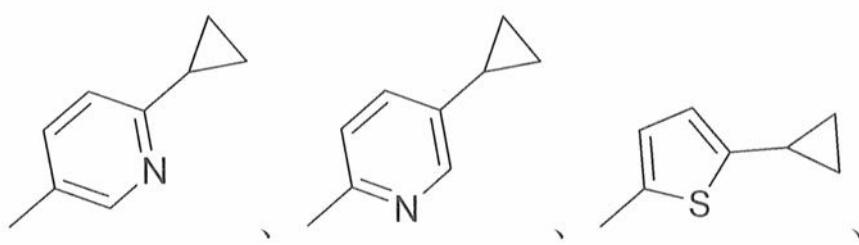
からなる群より選ばれる)

で表される、化合物、又はその立体異性体、医薬的に許容し得る塩もしくは溶媒和物。

【請求項11】

前記Gは、

【化 1 2】

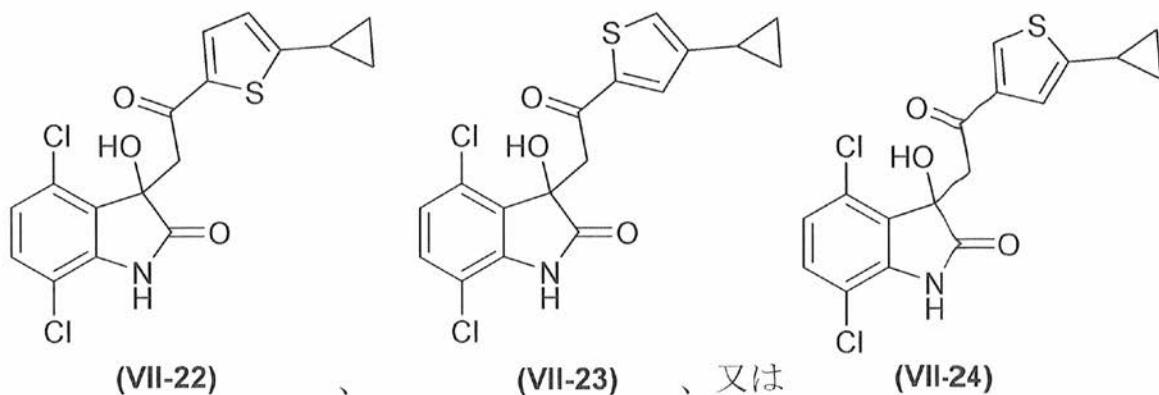
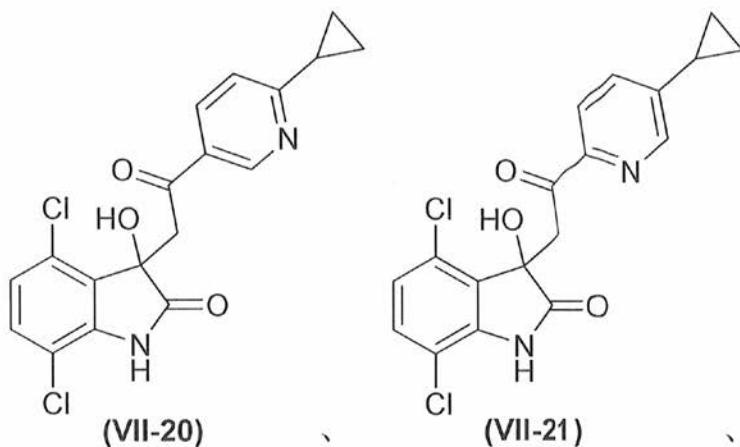


からなる群より選ばれる、請求項 1 0 に記載の化合物。

【請求項 1 2】

式 (V I I - 2 0 )、式 (V I I - 2 1 )、式 (V I I - 2 2 )、式 (V I I - 2 3 )  
、又は式 (V I I - 2 4 )：

## 【化13】



で表される、請求項10に記載の化合物。

## 【請求項13】

前記R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、及びR<sub>4</sub>は、それぞれ独立して、H及びC1からなる群より選ばれる、請求項1、2、3、4、6、8、及び10のいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項14】

前記R<sub>1</sub>及びR<sub>4</sub>はC1であり、前記R<sub>2</sub>及びR<sub>3</sub>はHである、請求項1、2、3、4、6、8、及び10のいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項15】

前記Aは-OHである、請求項1、2、4、6、8、及び10のいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項16】

前記R<sub>8</sub>、R<sub>10</sub>、及びR<sub>11</sub>はHである、請求項1、2、3、4、6、及び8のいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項17】

前記R<sub>9</sub>はH又は-OCH<sub>3</sub>である、請求項1、4、及び6のいずれか1項に記載の化合物。

## 【請求項18】

請求項1～17のいずれか1項に記載の化合物と、医薬的に許容し得る担体又は医薬的に許容し得る賦形剤とを含む、医薬組成物。

## 【請求項19】

請求項1～17のいずれか1項に記載の化合物と、少なくとも1種の追加の医薬的活性剤とを含む、医薬組成物。

**【請求項 2 0】**

癌の治療用薬剤の製造における、請求項 1 ~ 1 7 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

**【請求項 2 1】**

腫瘍細胞を殺傷する又は腫瘍細胞の増殖を阻害する薬剤の製造における、請求項 1 ~ 1 7 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用。

**【請求項 2 2】**

細胞の増殖を阻害する薬剤の製造における、請求項 1 ~ 1 7 のいずれか 1 項に記載の化合物の使用であり、

前記細胞は、ETS 遺伝子を過剰発現させるか又は ETS 融合遺伝子を含む、使用。

**【請求項 2 3】**

前記 ETS 遺伝子又は ETS 融合遺伝子は、FLI 1、ERG、ETV 1、及び ETV 4 からなる群より選ばれる、請求項 2 2 に記載の使用。

**【請求項 2 4】**

前記癌は、ユーリング肉腫、前立腺癌、神経膠芽腫、急性骨髄性白血病、乳癌、頭部及び頸部癌、黒色腫、非小細胞肺癌、卵巣癌、及び子宮癌からなる群より選ばれる、請求項 2 0 に記載の使用。

**【請求項 2 5】**

前記腫瘍細胞は癌細胞であり、該癌は、ユーリング肉腫、前立腺癌、神経膠芽腫、急性骨髄性白血病、乳癌、頭部及び頸部癌、黒色腫、非小細胞肺癌、卵巣癌、及び子宮癌からなる群より選ばれる、請求項 2 1 に記載の使用。

**【請求項 2 6】**

前記細胞は癌細胞であり、該癌は、ユーリング肉腫、前立腺癌、神経膠芽腫、急性骨髄性白血病、乳癌、頭部及び頸部癌、黒色腫、非小細胞肺癌、卵巣癌、及び子宮癌からなる群より選ばれる、請求項 2 2 に記載の使用。

**【手続補正 2】**

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0037

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0037】

第 2 様の一実施形態では、R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、R<sub>10</sub>、及び R<sub>11</sub> は、それぞれ独立して、H 及び C<sub>1</sub> からなる群より選ばれる。

**【手続補正 3】**

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0042

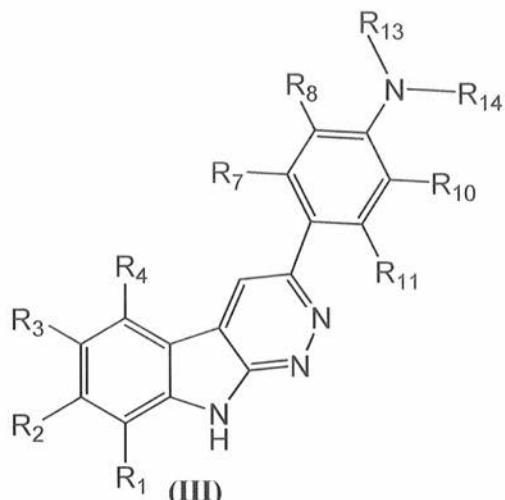
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0042】

第 3 様では、式(III)：

## 【化14】



(式中、

$R_1$ 、 $R_2$ 、 $R_3$ 、及び $R_4$ は、それぞれ独立して、H、C1、-CN、-CF<sub>3</sub>、C<sub>1-6</sub>アルキル、C<sub>1-6</sub>アルコキシ、-C(=O)NH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、及び-OHからなる群より選ばれ、

$R_7$ 、 $R_8$ 、 $R_{10}$ 、及び $R_{11}$ は、それぞれ独立して、H、D、F、Cl、ハロゲン、CN、CF<sub>3</sub>、C<sub>1-6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、-O(アリール)、-O(ヘテロアリール)、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>(C<sub>1-6</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>(C<sub>1-6</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>(アリール)、-NHCONH(C<sub>1-6</sub>アルキル)、-NHCON(C<sub>1-6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-N(C<sub>1-6</sub>アルキル)CONH<sub>2</sub>、-N(C<sub>1-6</sub>アルキル)CONH(C<sub>1-6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1-6</sub>アルキル)CON(C<sub>1-6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>(C<sub>1-6</sub>アルキル)、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>NH(C<sub>1-6</sub>アルキル)、-SO<sub>2</sub>N(C<sub>1-6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>3-8</sub>シクロアルキル、及びC<sub>3-8</sub>ヘテロシクロアルキルからなる群より選ばれ、

$R_{13}$ 及び $R_{14}$ は、それぞれ独立して、置換又は非置換C<sub>1-6</sub>アルキルである)で表される化合物、又はその立体異性体、医薬的に許容し得る塩もしくは溶媒和物が提供される。

## 【手続補正4】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0046

【補正方法】変更

【補正の内容】

## 【0046】

第3態様の一実施形態では、 $R_{13}$ 及び $R_{14}$ は-C<sub>1-3</sub>である。

## 【手続補正5】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0055

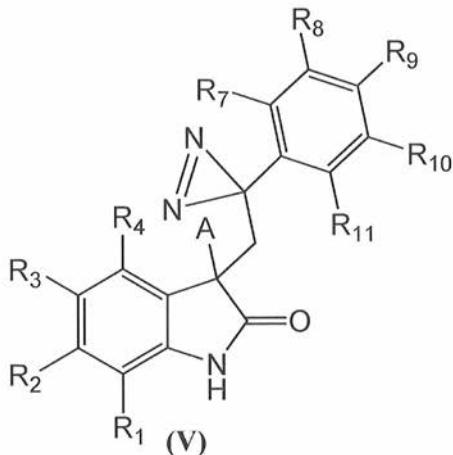
【補正方法】変更

【補正の内容】

## 【0055】

第5態様では、式(V)：

## 【化15】



(式中、

A は、 - O H 、 D 、 H 、 F 、 及び - N H <sub>2</sub> からなる群より選ばれ、

R <sub>1</sub> 、 R <sub>2</sub> 、 R <sub>3</sub> 、 及び R <sub>4</sub> は、 それぞれ独立して、 H 、 C 1 、 - C N 、 - C F <sub>3</sub> 、 C <sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル、 C <sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルコキシ、 - C ( = O ) N H <sub>2</sub> 、 - N O <sub>2</sub> 、 - N H <sub>2</sub> 、 及び - O H からなる群より選ばれ、

R <sub>7</sub> 、 R <sub>8</sub> 、 R <sub>9</sub> 、 R <sub>10</sub> 、 及び R <sub>11</sub> は、 それぞれ独立して、 - O C H <sub>3</sub> 、 H 、 D 、 F 、 C 1 、 ハロゲン、 C N 、 C F <sub>3</sub> 、 C <sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル、 アリール、 ヘテロアリール、 - O (アリール) 、 - O (ヘテロアリール) 、 - C O <sub>2</sub> H 、 - C O <sub>2</sub> ( C <sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル) 、 - N H S O <sub>2</sub> ( C <sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル) 、 - N H S O <sub>2</sub> (アリール) 、 - N H C O N H ( C <sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル) 、 - N H C O N ( C <sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル) <sub>2</sub> 、 - N ( C <sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル) C O N H <sub>2</sub> 、 - N ( C <sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル) C O N H ( C <sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル) 、 - N ( C <sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル) C O N ( C <sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル) <sub>2</sub> 、 - S O <sub>2</sub> ( C <sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル) 、 - S O <sub>2</sub> N H <sub>2</sub> 、 - S O <sub>2</sub> N H ( C <sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル) 、 - S O <sub>2</sub> N ( C <sub>1</sub> - <sub>6</sub> アルキル) <sub>2</sub> 、 C <sub>3</sub> - <sub>8</sub> シクロアルキル、 及び C <sub>3</sub> - <sub>8</sub> ヘテロシクロアルキルからなる群より選ばれる)

で表される化合物、 又はその立体異性体、 医薬的に許容し得る塩もしくは溶媒和物が提供される。

## 【手続補正6】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0062

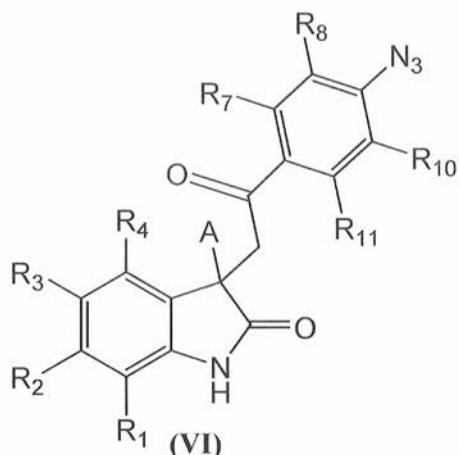
【補正方法】変更

【補正の内容】

【0062】

第6態様において、式(VI)：

## 【化16】



(式中、

Aは、-OH、D、H、F、及び-NH<sub>2</sub>からなる群より選ばれ、

R<sub>1</sub>、R<sub>2</sub>、R<sub>3</sub>、及びR<sub>4</sub>は、それぞれ独立して、H、C1、-CN、-CF<sub>3</sub>、C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルコキシ、-C(=O)NH<sub>2</sub>、-NO<sub>2</sub>、-NH<sub>2</sub>、及び-OHからなる群より選ばれ、

R<sub>7</sub>、R<sub>8</sub>、R<sub>10</sub>、及びR<sub>11</sub>は、それぞれ独立して、H、D、F、C1、ハロゲン、CN、CF<sub>3</sub>、C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル、アリール、ヘテロアリール、-O(アリール)、-O(ヘテロアリール)、-CO<sub>2</sub>H、-CO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-NH<sub>2</sub>SO<sub>2</sub>(アリール)、-NHCONH(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-NHCON(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)CONH<sub>2</sub>、-N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)CONH(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)CON(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-SO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>、-SO<sub>2</sub>NH(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)、-SO<sub>2</sub>N(C<sub>1</sub>-<sub>6</sub>アルキル)<sub>2</sub>、C<sub>3</sub>-<sub>8</sub>シクロアルキル、及びC<sub>3</sub>-<sub>8</sub>ヘテロシクロアルキルからなる群より選ばれる)

で表される化合物、又はその立体異性体、医薬的に許容し得る塩もしくは溶媒和物が提供される。

## 【手続補正7】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0072

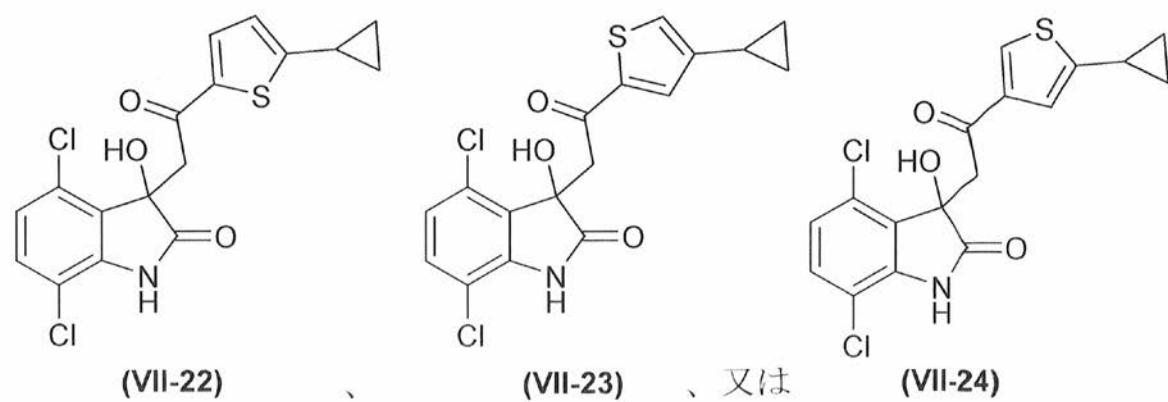
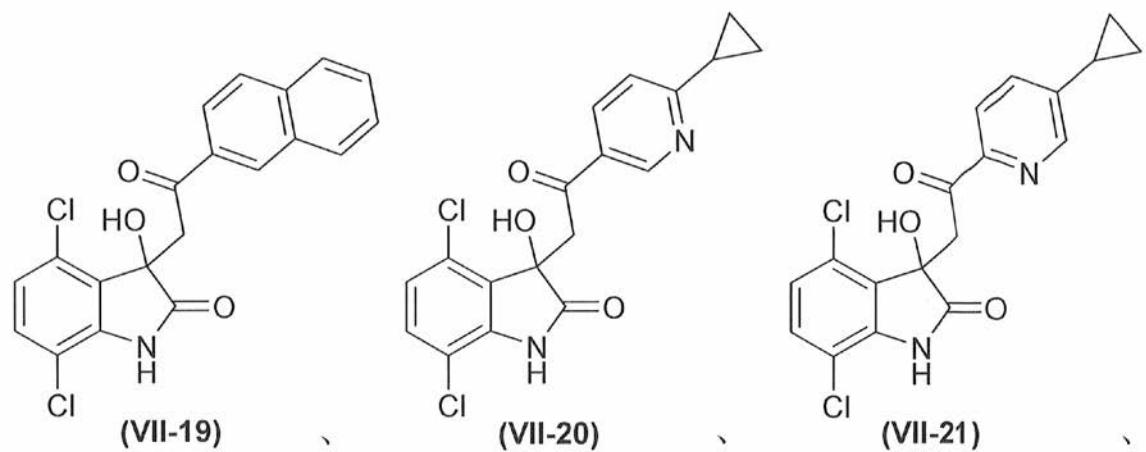
【補正方法】変更

【補正の内容】

## 【0072】

第7態様の一実施形態では、化合物は、式(VII-19)、式(VII-20)、式(VII-21)、式(VII-22)、式(VII-23)、又は式(VII-24)：

【化17】



で表される。