

【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6月11日(2020.6.11)

【公開番号】特開2020-55813(P2020-55813A)

【公開日】令和2年4月9日(2020.4.9)

【年通号数】公開・登録公報2020-014

【出願番号】特願2019-202874(P2019-202874)

【国際特許分類】

A 6 1 K 31/5513 (2006.01)
A 6 1 P 43/00 (2006.01)
A 6 1 P 35/00 (2006.01)
A 6 1 P 11/00 (2006.01)
A 6 1 P 35/02 (2006.01)
A 6 1 P 1/04 (2006.01)
A 6 1 P 15/00 (2006.01)
A 6 1 P 25/00 (2006.01)
A 6 1 P 9/00 (2006.01)
A 6 1 P 29/00 (2006.01)
A 6 1 P 37/06 (2006.01)
A 6 1 P 31/12 (2006.01)
A 6 1 P 3/00 (2006.01)
A 6 1 P 5/00 (2006.01)
A 6 1 P 19/02 (2006.01)
A 6 1 P 9/10 (2006.01)
A 6 1 P 31/18 (2006.01)
A 6 1 P 31/16 (2006.01)
A 6 1 P 31/22 (2006.01)
A 6 1 P 31/14 (2006.01)
A 6 1 P 1/16 (2006.01)
A 6 1 P 31/20 (2006.01)
A 6 1 P 17/00 (2006.01)
A 6 1 P 39/02 (2006.01)
A 6 1 P 3/04 (2006.01)
A 6 1 P 3/10 (2006.01)
C 07 D 487/04 (2006.01)

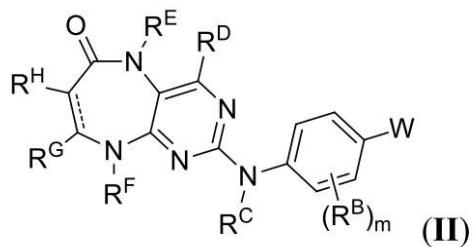
【F I】

A 6 1 K 31/5513
A 6 1 P 43/00 1 1 1
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 11/00
A 6 1 P 35/02
A 6 1 P 1/04
A 6 1 P 15/00
A 6 1 P 25/00
A 6 1 P 9/00
A 6 1 P 29/00
A 6 1 P 37/06
A 6 1 P 31/12
A 6 1 P 43/00 1 0 5

A 6 1 P	3/00	
A 6 1 P	5/00	
A 6 1 P	29/00	1 0 1
A 6 1 P	19/02	
A 6 1 P	9/10	1 0 1
A 6 1 P	31/18	
A 6 1 P	31/16	
A 6 1 P	31/22	
A 6 1 P	31/14	
A 6 1 P	1/16	
A 6 1 P	31/20	
A 6 1 P	17/00	
A 6 1 P	39/02	
A 6 1 P	3/04	
A 6 1 P	3/10	
C 0 7 D	487/04	1 5 1
C 0 7 D	487/04	C S P

【手続補正書】**【提出日】**令和2年4月16日(2020.4.16)**【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】**

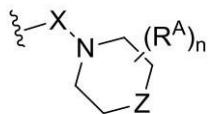
プロモドメイン含有タンパク質に関連する疾患の処置、予防もしくは前記疾患を発症するリスクの低減を必要としている対象における、前記処置、予防もしくは低減、または対象もしくは細胞におけるプロモドメイン含有タンパク質により調節される遺伝子の発現の阻害における使用のための、式(II)：

【化1】**式中：****【化2】**

は、単結合または二重結合であり；

Wは、

【化3】



であり；

Z は、 $-O-$ 、 $-N(R^Z)-$ 、または $-C(R^Z)_2-$ であり、ここで R^Z の各々は、独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換の6員のヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、 $-OR^{Z1}$ 、 $-SR^{Z1}$ 、 $-N(R^{Z1})_2$ 、または窒素原子に付着している場合は窒素保護基であるか、または R^Z の2つは結び合って、置換もしくは非置換の炭素環または置換もしくは非置換の複素環を形成しており；

R^{Z1} の各々は、独立して、水素、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素原子に付着している場合は酸素保護基、硫黄原子に付着している場合は硫黄保護基、または窒素原子に付着している場合は窒素保護基であるか、または R^{Z1} の2つは結び合って、置換もしくは非置換の複素環または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成しており；

R^A の各々は、独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、 $-OR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})_2$ 、 $-SR^{A1}$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-C(=NR^{A1})R^{A1}$ 、 $-C(=NR^{A1})OR^{A1}$ 、 $-C(=NR^{A1})N(R^{A1})_2$ 、 $-C(=O)R^{A1}$ 、 $-C(=O)OR^{A1}$ 、 $-C(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{A1})C(=O)R^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})C(=O)OR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})C(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-OC(=O)R^{A1}$ 、 $-OC(=O)OR^{A1}$ 、または $-OC(=O)N(R^{A1})_2$ であり、ここで R^{A1} の各々は、独立して、水素、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、窒素原子に付着している場合は窒素保護基、酸素原子に付着している場合は酸素保護基、または硫黄原子に付着している場合は硫黄保護基であるか、または2つの R^{A1} 基は結び合って、置換もしくは非置換の複素環または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成しており；

n は、0、1、2、3、4、5、6、7、または8であり；

X は、 $-C(=O)-$ であり；

R^B の各々は、独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、 $-OR^{B1}$ 、 $-N(R^{B1})_2$ 、 $-SR^{B1}$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-C(=NR^{B1})R^{B1}$ 、 $-C(=NR^{B1})OR^{B1}$ 、 $-C(=NR^{B1})N(R^{B1})_2$ 、 $-C(=O)R^{B1}$ 、 $-C(=O)OR^{B1}$ 、 $-C(=O)N(R^{B1})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-N(R^{B1})C(=O)R^{B1}$ 、 $-N(R^{B1})C(=O)OR^{B1}$ 、 $-N(R^{B1})C(=O)N(R^{B1})_2$ 、 $-OC(=O)R^{B1}$ 、 $-OC(=O)OR^{B1}$ 、または $-OC(=O)N(R^{B1})_2$ であり、ここで R^{B1} の各々は、独立して、水素、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、窒素原子に付着している場合は窒素保護基、酸素原子に付着している場合は酸素保護基、または硫黄原子に付着している場合は硫黄保護基であるか、または2つの R^{B1} 基は結び合って、置換もしくは非置換の複素環または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成しており；

原子に付着している場合は硫黄保護基であるか、または2つのR^B基は結び合って、置換もしくは非置換の複素環または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成しており；

mは、0、1、2、3、または4であり；

R^Cは、水素または置換もしくは非置換C₁～₆アルキルであり；

R^Dは、水素または置換もしくは非置換アルキルであり；

R^Eは、水素または置換もしくは非置換アルキルであり；

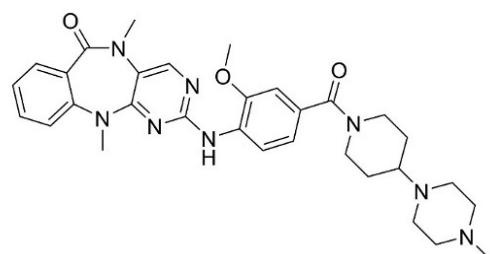
R^Fは、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；および

R^GとR^Hは結び合って、置換または非置換のフェニル環を形成している；

で表される化合物であるが、

式

【化4】



で表わされる化合物ではない、

前記化合物またはその薬学的に許容し得る塩を含む、医薬組成物。

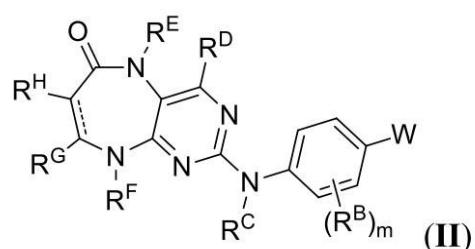
【請求項2】

プロモドメイン含有タンパク質の異常な活性に関連する疾患の処置、予防もしくは前記疾患を発症するリスクの低減における使用のための、請求項1に記載の医薬組成物。

【請求項3】

化合物が、式(II)：

【化5】



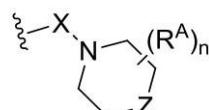
式中：

【化6】

は、単結合または二重結合であり；

Wは、

【化7】



であり；

Zは、-O-、-N(R^Z)-、または-C(R^Z)₂-であり、ここでR^Zの各々は、

独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換の6員のヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、-OR^{Z1}、-SR^{Z1}、-N(R^{Z1})₂、または窒素原子に付着している場合は窒素保護基であるか、またはR^Zの2つは結び合って、置換もしくは非置換の炭素環または置換もしくは非置換の複素環を形成しており；

R^{Z1}の各々は、独立して、水素、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素原子に付着している場合は酸素保護基、硫黄原子に付着している場合は硫黄保護基、または窒素原子に付着している場合は窒素保護基であるか、またはR^{Z1}の2つは結び合って、置換もしくは非置換の複素環または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成しており；

R^Aの各々は、独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、-OR^{A1}、-N(R^{A1})₂、-SR^{A1}、-CN、-SCN、-C(=NR^{A1})R^{A1}、-C(=NR^{A1})OR^{A1}、-C(=NR^{A1})N(R^{A1})₂、-C(=O)R^{A1}、-C(=O)OR^{A1}、-C(=O)N(R^{A1})₂、-NO₂、-N(R^{A1})C(=O)R^{A1}、-N(R^{A1})C(=O)OR^{A1}、-N(R^{A1})C(=O)N(R^{A1})₂、-OC(=O)R^{A1}、-OC(=O)OR^{A1}、または-OC(=O)N(R^{A1})₂であり、ここでR^{A1}の各々は、独立して、水素、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、窒素原子に付着している場合は窒素保護基、酸素原子に付着している場合は酸素保護基、または硫黄原子に付着している場合は硫黄保護基であるか、または2つのR^{A1}基は結び合って、置換もしくは非置換の複素環または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成しており；

nは、0、1、2、3、4、5、6、7、または8であり；

Xは、-C(=O)-であり；

R^Bの各々は、独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、-OR^{B1}、-N(R^{B1})₂、-SR^{B1}、-CN、-SCN、-C(=NR^{B1})R^{B1}、-C(=NR^{B1})OR^{B1}、-C(=NR^{B1})N(R^{B1})₂、-C(=O)R^{B1}、-C(=O)OR^{B1}、-C(=O)N(R^{B1})₂、-NO₂、-N(R^{B1})C(=O)R^{B1}、-N(R^{B1})C(=O)OR^{B1}、-N(R^{B1})C(=O)N(R^{B1})₂、-OC(=O)R^{B1}、-OC(=O)OR^{B1}、または-OC(=O)N(R^{B1})₂であり、ここでR^{B1}の各々は、独立して、水素、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、窒素原子に付着している場合は窒素保護基、酸素原子に付着している場合は酸素保護基、または硫黄原子に付着している場合は硫黄保護基であるか、または2つのR^{B1}基は結び合って、置換もしくは非置換の複素環または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成しており；

mは、0、1、2、3、または4であり；

R^Cは、水素または置換もしくは非置換C_{1~6}アルキルであり；

R^Dは、水素または置換もしくは非置換アルキルであり；

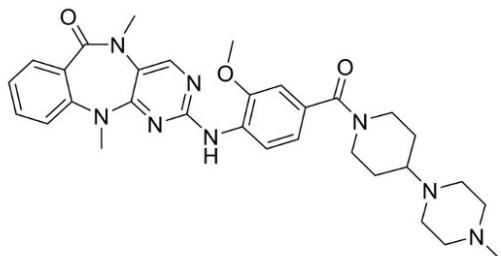
R^Eは、水素または置換もしくは非置換アルキルであり；

R^F は、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；および

R^G と R^H は結び合って、置換または非置換のフェニル環を形成している；
で表される化合物であるが、

式

【化 8】



で表わされる化合物ではない、

前記化合物またはその薬学的に許容し得る塩である、

プロモドメインに関連する疾患の処置、予防または前記疾患を発症するリスクの低減を必要としている対象における、前記処置、予防もしくは低減における使用のための、
請求項 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 4】

プロモドメインの異常な活性に関連する疾患の処置、予防もしくは前記疾患を発症するリスクの低減における使用のための、請求項 3 に記載の医薬組成物。

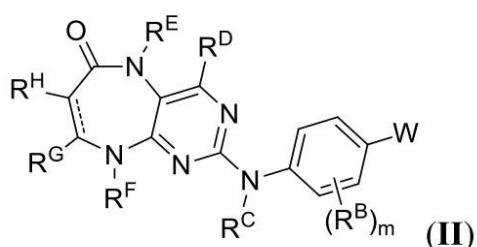
【請求項 5】

異常な活性が、上昇した活性である、請求項 2 または 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 6】

男性避妊のための、式 (II) :

【化 9】



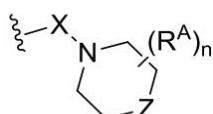
式中：

【化 10】

は、単結合または二重結合であり；

W は、

【化 11】



であり；

Z は、-O-、-N(R^Z)-、または-C(R^Z)2- であり、ここで R^Z の各々は、
独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルケニル

、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換の6員のヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、-OR^{Z1}、-SR^{Z1}、-N(R^{Z1})₂、または窒素原子に付着している場合は窒素保護基であるか、またはR^Zの2つは結び合って、置換もしくは非置換の炭素環または置換もしくは非置換の複素環を形成しており；

R^{Z1}の各々は、独立して、水素、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素原子に付着している場合は酸素保護基、硫黄原子に付着している場合は硫黄保護基、または窒素原子に付着している場合は窒素保護基であるか、またはR^{Z1}の2つは結び合って、置換もしくは非置換の複素環または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成しており；

R^Aの各々は、独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、-OR^{A1}、-N(R^{A1})₂、-SR^{A1}、-CN、-SCN、-C(=NR^{A1})R^{A1}、-C(=NR^{A1})OR^{A1}、-C(=NR^{A1})N(R^{A1})₂、-C(=O)R^{A1}、-C(=O)OR^{A1}、-C(=O)N(R^{A1})₂、-NO₂、-N(R^{A1})C(=O)R^{A1}、-N(R^{A1})C(=O)OR^{A1}、-N(R^{A1})C(=O)N(R^{A1})₂、-OC(=O)R^{A1}、-OC(=O)OR^{A1}、または-OC(=O)N(R^{A1})₂であり、ここでR^{A1}の各々は、独立して、水素、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、窒素原子に付着している場合は窒素保護基、酸素原子に付着している場合は酸素保護基、または硫黄原子に付着している場合は硫黄保護基であるか、または2つのR^{A1}基は結び合って、置換もしくは非置換の複素環または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成しており；

nは、0、1、2、3、4、5、6、7、または8であり；

Xは、-C(=O)-であり；

R^Bの各々は、独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、-OR^{B1}、-N(R^{B1})₂、-SR^{B1}、-CN、-SCN、-C(=NR^{B1})R^{B1}、-C(=NR^{B1})OR^{B1}、-C(=NR^{B1})N(R^{B1})₂、-C(=O)R^{B1}、-C(=O)OR^{B1}、-C(=O)N(R^{B1})₂、-NO₂、-N(R^{B1})C(=O)R^{B1}、-N(R^{B1})C(=O)OR^{B1}、-N(R^{B1})C(=O)N(R^{B1})₂、-OC(=O)R^{B1}、-OC(=O)OR^{B1}、または-OC(=O)N(R^{B1})₂であり、ここでR^{B1}の各々は、独立して、水素、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、窒素原子に付着している場合は窒素保護基、酸素原子に付着している場合は酸素保護基、または硫黄原子に付着している場合は硫黄保護基であるか、または2つのR^{B1}基は結び合って、置換もしくは非置換の複素環または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成しており；

mは、0、1、2、3、または4であり；

R^Cは、水素または置換もしくは非置換C_{1~6}アルキルであり；

R^Dは、水素または置換もしくは非置換アルキルであり；

R^Eは、水素または置換もしくは非置換アルキルであり；

R^Fは、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリール環を形成しており；

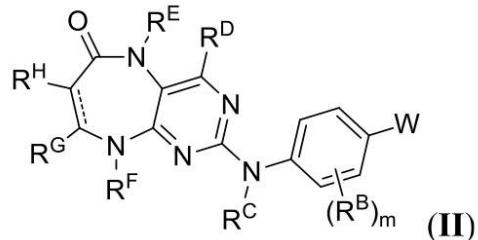
テロアリールであり；および

R^G と R^H は結び合って、置換または非置換のフェニル環を形成している；
で表される化合物またはその薬学的に許容し得る塩を含む、医薬組成物。

【請求項 7】

対象においてプロモドメイン含有タンパク質の活性の阻害における使用のための、式(I)：

【化12】



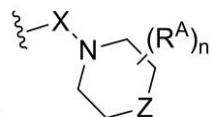
式中：

【化13】

は、単結合または二重結合であり；

Wは、

【化14】



であり；

Z は、-O-、-N(R^Z)-、または-C(R^Z)₂-であり、ここで R^Z の各々は、独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換の6員のヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、-OR^{Z1}、-SR^{Z1}、-N(R^Z)₂、または窒素原子に付着している場合は窒素保護基であるか、または R^Z の2つは結び合って、置換もしくは非置換の炭素環または置換もしくは非置換の複素環を形成しており；

R^{Z1} の各々は、独立して、水素、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素原子に付着している場合は酸素保護基、硫黄原子に付着している場合は硫黄保護基、または窒素原子に付着している場合は窒素保護基であるか、または R^{Z1} の2つは結び合って、置換もしくは非置換の複素環または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成しており；

R^A の各々は、独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、-OR^{A1}、-N(R^A)₂、-SR^{A1}、-CN、-SCN、-C(=NR^{A1})R^{A1}、-C(=NR^{A1})OR^{A1}、-C(=NR^{A1})N(R^A)₂、-C(=O)R^{A1}、-C(=O)OR^{A1}、-C(=O)N(R^A)₂、-NO₂、-N(R^A)C(=O)R^{A1}、-N(R^A)C(=O)OR^{A1}、-N(R^A)C(=O)N(R^A)₂、-OC(=O)R^{A1}、-OC(=O)OR^{A1}、または-OC(=O)N(R^A)₂であり、ここで R^{A1} の各々は、独立して、水素、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル

、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、窒素原子に付着している場合は窒素保護基、酸素原子に付着している場合は酸素保護基、または硫黄原子に付着している場合は硫黄保護基であるか、または2つのR^{A1}基は結び合って、置換もしくは非置換の複素環または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成しており；

nは、0、1、2、3、4、5、6、7、または8であり；

Xは、-C(=O)-であり；

R^Bの各々は、独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、-OR^{B1}、-N(R^{B1})₂、-SR^{B1}、-CN、-SCN、-C(=NR^{B1})R^{B1}、-C(=NR^{B1})OR^{B1}、-C(=NR^{B1})N(R^{B1})₂、-C(=O)R^{B1}、-C(=O)OR^{B1}、-C(=O)N(R^{B1})₂、-NO₂、-NR^{B1}C(=O)R^{B1}、-NR^{B1}C(=O)OR^{B1}、-NR^{B1}C(=O)N(R^{B1})₂、-OC(=O)R^{B1}、-OC(=O)OR^{B1}、または-OC(=O)N(R^{B1})₂であり、ここでR^{B1}の各々は、独立して、水素、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、窒素原子に付着している場合は窒素保護基、酸素原子に付着している場合は酸素保護基、または硫黄原子に付着している場合は硫黄保護基であるか、または2つのR^{B1}基は結び合って、置換もしくは非置換の複素環または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成しており；

mは、0、1、2、3、または4であり；

R^Cは、水素または置換もしくは非置換C_{1~6}アルキルであり；

R^Dは、水素または置換もしくは非置換アルキルであり；

R^Eは、水素または置換もしくは非置換アルキルであり；

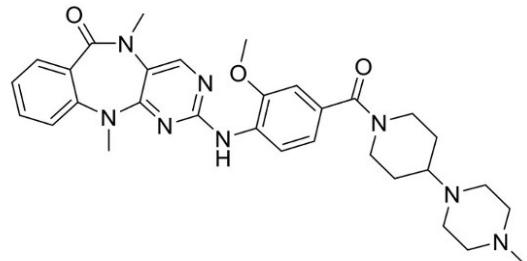
R^Fは、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；および

R^GとR^Hは結び合って、置換または非置換のフェニル環を形成している；

で表される化合物であるが、

式

【化15】



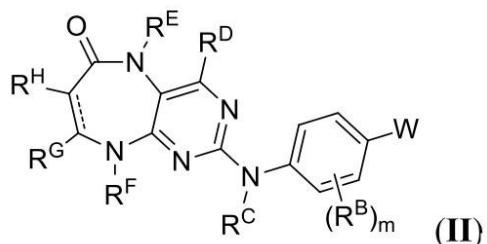
で表わされる化合物ではない、

前記化合物またはその薬学的に許容し得る塩を含む、医薬組成物。

【請求項8】

対象における、プロモドメイン含有タンパク質のプロモドメインの、第2タンパク質のアセチル-リシン残基への結合の阻害における使用のための、式(I1)：

【化16】



式中：

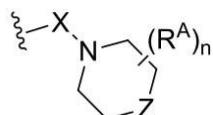
第2タンパク質は、少なくとも1つのアセチル・リシン残基を含み、かつプロモドメイン含有タンパク質とは異なるタンパク質であり、

【化17】

は、単結合または二重結合であり；

Wは、

【化18】



であり；

Zは、-O-、-N(R^Z)-、または-C(R^Z)₂-であり、ここでR^Zの各々は、独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換の6員のヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、-OR^{Z1}、-SR^{Z1}、-N(R^{Z1})₂、または窒素原子に付着している場合は窒素保護基であるか、またはR^Zの2つは結び合って、置換もしくは非置換の炭素環または置換もしくは非置換の複素環を形成しており；

R^{Z1}の各々は、独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素原子に付着している場合は酸素保護基、硫黄原子に付着している場合は硫黄保護基、または窒素原子に付着している場合は窒素保護基であるか、またはR^{Z1}の2つは結び合って、置換もしくは非置換の複素環または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成しており；

R^Aの各々は、独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、-OR^{A1}、-N(R^{A1})₂、-SR^{A1}、-CN、-SCN、-C(=NR^{A1})R^{A1}、-C(=NR^{A1})OR^{A1}、-C(=NR^{A1})N(R^{A1})₂、-C(=O)R^{A1}、-C(=O)OR^{A1}、-C(=O)N(R^{A1})₂、-NO₂、-N(R^{A1})C(=O)R^{A1}、-N(R^{A1})C(=O)OR^{A1}、-N(R^{A1})C(=O)N(R^{A1})₂、-OC(=O)R^{A1}、-OC(=O)OR^{A1}、または-OC(=O)N(R^{A1})₂であり、ここでR^{A1}の各々は、独立して、水素、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、窒素原子に付着している場合は窒素保護基、酸素原子に付着している場合は酸素保護基、または硫黄原子に付着している

場合は硫黄保護基であるか、または2つのR^{A1}基は結び合って、置換もしくは非置換の複素環または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成しており；

nは、0、1、2、3、4、5、6、7、または8であり；

Xは、-C(=O)-であり；

R^Bの各々は、独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、-OR^{B1}、-N(R^{B1})₂、-SR^{B1}、-CN、-SCN、-C(=NR^{B1})R^{B1}、-C(=NR^{B1})OR^{B1}、-C(=NR^{B1})N(R^{B1})₂、-C(=O)R^{B1}、-C(=O)OR^{B1}、-C(=O)N(R^{B1})₂、-NO₂、-NR^{B1}C(=O)R^{B1}、-NR^{B1}C(=O)OR^{B1}、-NR^{B1}C(=O)N(R^{B1})₂、-OC(=O)R^{B1}、-OC(=O)OR^{B1}、または-OC(=O)N(R^{B1})₂であり、ここでR^{B1}の各々は、独立して、水素、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、窒素原子に付着している場合は窒素保護基、酸素原子に付着している場合は酸素保護基、または硫黄原子に付着している場合は硫黄保護基であるか、または2つのR^{B1}基は結び合って、置換もしくは非置換の複素環または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成しており；

mは、0、1、2、3、または4であり；

R^Cは、水素または置換もしくは非置換C_{1~6}アルキルであり；

R^Dは、水素または置換もしくは非置換アルキルであり；

R^Eは、水素または置換もしくは非置換アルキルであり；

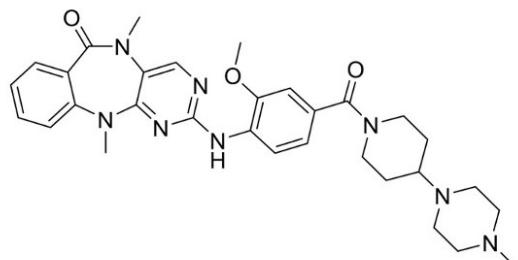
R^Fは、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；および

R^GとR^Hは結び合って、置換または非置換のフェニル環を形成している；

で表される化合物であるが、

式

【化19】



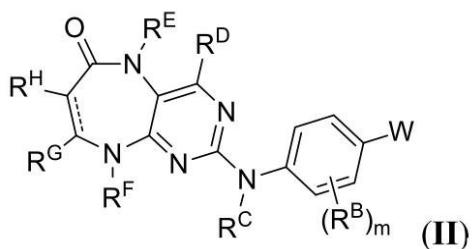
で表わされる化合物ではない、

前記化合物またはその薬学的に許容し得る塩を含む、医薬組成物。

【請求項9】

対象においてプロモドメイン含有タンパク質により調節される遺伝子の発現の調整または阻害における使用のための、式(I-I)：

【化20】



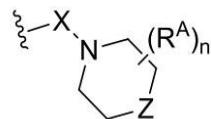
式中：

【化21】

は、単結合または二重結合であり；

Wは、

【化22】



であり；

Zは、-O-、-N(R^Z)-、または-C(R^Z)₂-であり、ここでR^Zの各々は、独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換の6員のヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、-OR^{Z1}、-SR^{Z1}、-N(R^{Z1})₂、または窒素原子に付着している場合は窒素保護基であるか、またはR^Zの2つは結び合って、置換もしくは非置換の炭素環または置換もしくは非置換の複素環を形成しており；

R^{Z1}の各々は、独立して、水素、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、酸素原子に付着している場合は酸素保護基、硫黄原子に付着している場合は硫黄保護基、または窒素原子に付着している場合は窒素保護基であるか、またはR^{Z1}の2つは結び合って、置換もしくは非置換の複素環または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成しており；

R^Aの各々は、独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、-OR^{A1}、-N(R^{A1})₂、-SR^{A1}、-CN、-SCN、-C(=NR^{A1})R^{A1}、-C(=NR^{A1})OR^{A1}、-C(=NR^{A1})N(R^{A1})₂、-C(=O)R^{A1}、-C(=O)OR^{A1}、-C(=O)N(R^{A1})₂、-NO₂、-N(R^{A1})C(=O)R^{A1}、-N(R^{A1})C(=O)OR^{A1}、-N(R^{A1})C(=O)N(R^{A1})₂、-OC(=O)R^{A1}、-OC(=O)OR^{A1}、または-OC(=O)N(R^{A1})₂であり、ここでR^{A1}の各々は、独立して、水素、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、窒素原子に付着している場合は窒素保護基、酸素原子に付着している場合は酸素保護基、または硫黄原子に付着している場合は硫黄保護基であるか、または2つのR^{A1}基は結び合って、置換もしくは非置換の複素環または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成しており；

nは、0、1、2、3、4、5、6、7、または8であり；

Xは、-C(=O)-であり；

R^Bの各々は、独立して、水素、ハロゲン、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、-OR^{B1}、-N(R^{B1})₂、-SR^{B1}、-CN、-SCN、-C(=NR^{B1})R^{B1}、-C(=NR^{B1})OR^{B1}、-C(=NR^{B1})N(R^{B1})₂、-C(=O)R^{B1}、-C(=O)OR^{B1}、-C(=O)N(R^{B1})₂、-NO₂、-N(R^{B1})C(=O)R^{B1}、-N(R^{B1})C(=O)OR^{B1}、-N(R^{B1})C(=O)N(R^{B1})₂、-OC(=O)R^{B1}、-OC(=O)OR^{B1}、または-OC(=O)N(R^{B1})₂であり、ここでR^{B1}の各々は、独立して、水素、置換もしくは非置換アシル、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換アルキニル、置換もしくは非置換カルボシクリル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、置換もしくは非置換ヘテロアリール、窒素原子に付着している場合は窒素保護基、酸素原子に付着している場合は酸素保護基、または硫黄原子に付着している場合は硫黄保護基であるか、または2つのR^{B1}基は結び合って、置換もしくは非置換の複素環または置換もしくは非置換のヘテロアリール環を形成しており；

mは、0、1、2、3、または4であり；

R^Cは、水素または置換もしくは非置換C_{1~6}アルキルであり；

R^Dは、水素または置換もしくは非置換アルキルであり；

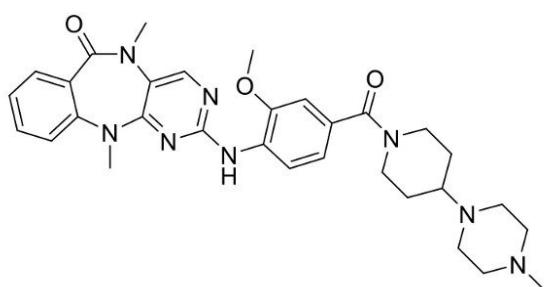
R^Eは、水素または置換もしくは非置換アルキルであり；

R^Fは、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；および

R^GとR^Hは結び合って、置換または非置換のフェニル環を形成している；で表される化合物であるが、

式

【化23】



で表わされる化合物ではない、

前記化合物またはその薬学的に許容し得る塩を含む、医薬組成物。

【請求項10】

プロモドメイン含有タンパク質が、プロモおよび特異的末端(BET)タンパク質である、またはプロモドメイン含有タンパク質が、プロモドメイン含有タンパク質2(BRD2)、プロモドメイン含有タンパク質3(BRD3)、またはプロモドメイン含有タンパク質4(BRD4)である、またはプロモドメイン含有タンパク質が、TBP(TATAボックス結合タンパク質)関連因子タンパク質(TAF)である、またはプロモドメイン含有タンパク質が、TAF1またはTAF1Lである、またはプロモドメイン含有タンパク質が、CREB結合タンパク質(CBP)である、またはプロモドメイン含有タンパク質が、E1A結合タンパク質p300(EPP300)である、請求項1~5および7~9

のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 1】

疾患が、増殖性疾患である、または疾患が、良性新生物である、または疾患が、病的血管形成である、または疾患が、炎症性疾患である、または疾患が、心血管疾患である、または疾患が、自己免疫疾患である、または疾患が、ウイルス感染である、または疾患が、線維性疾患である、または疾患が、代謝性疾患である、または疾患が、内分泌疾患である、または疾患が、リウマチ性関節炎、敗血症、アテローム発生、アテローム性動脈硬化症、ヒト免疫不全ウイルス（HIV）感染症、後天性免疫不全症候群（AIDS）、ヒトパピローマウイルス（HPV）感染症、C型肝炎ウイルス（HCV）感染症、単純ヘルペスウイルス（HSV）感染症、エボラウイルス感染症、重症急性呼吸器症候群（SARS）、インフルエンザ、放射能中毒、強皮症、特発性肺線維症、移植片対宿主病（GVHD）、糖尿病、または肥満である、請求項1～5のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 2】

Z が、-O-である、 Z が、-N(R^z)-である、または Z が、-C(R^z)₂-である、または Z が、-CH(R^z)-である、請求項1～11のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 3】

R^zの少なくとも1つが、-OR^z¹である、またはR^zの少なくとも1つが、置換または非置換ヘテロシクリルである、請求項1～12のいずれか一項に記載の医薬組成物。

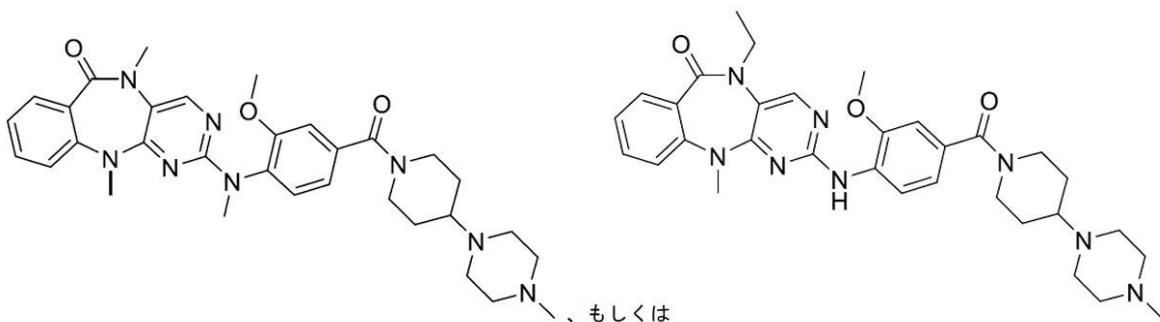
【請求項 1 4】

R^Fが、水素である、またはR^Fが、置換C_{1～6}アルキルである、またはR^Fが、非置換C_{1～6}アルキルである、請求項1～13のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 5】

化合物が、式：

【化24】

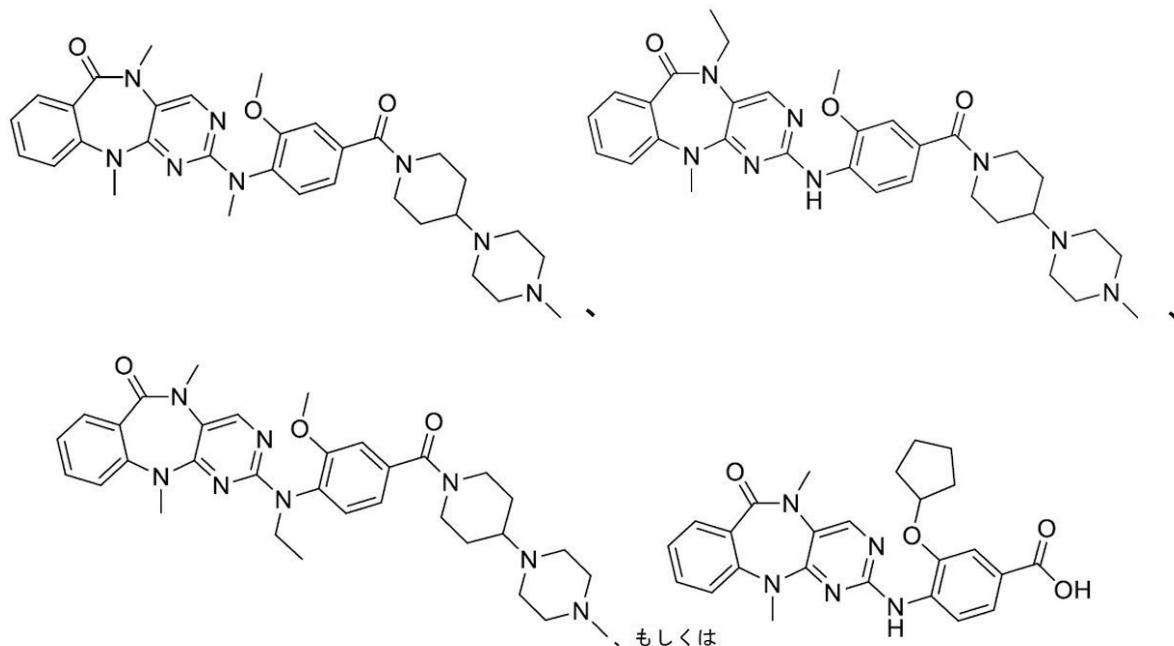


で表される化合物、またはその薬学的に許容し得る塩である、請求項1～14のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 6】

式：

【化 2 5】



で表される化合物、またはその薬学的に許容し得る塩。

【請求項 1 7】

請求項 1 6 に記載の化合物またはその薬学的に許容し得る塩、および薬学的に許容し得る賦形剤を含む、医薬組成物。

【請求項 1 8】

R^C が、水素である、請求項 1 ~ 1 4 のいずれか一項に記載の医薬組成物。

【請求項 1 9】

R^F が、メチルである、請求項 1 4 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 0】

R^Z の少なくとも 1 つが、 $-OH$ または置換または非置換の 6 員单環式ヘテロシクリルであり、ここで複素環系中の 1 または 2 個の原子が、独立して、窒素、酸素または硫黄である、請求項 1 3 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 1】

R^Z の少なくとも 1 つが、式：

【化 2 6】



で表わされるものである、請求項 2 0 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 2】

プロモドメイン含有タンパク質の活性が、キナーゼの活性と比較して、化合物により選択的に阻害されている、請求項 7 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 3】

第 2 タンパク質がヒストンである、請求項 8 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 4】

遺伝子の転写が化合物により調整または阻害される、請求項 9 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 5】

疾患が、がんである、請求項 1 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 6】

疾患が、肺がん、多発性骨髄腫、神経芽細胞腫、結腸がん、精巣がん、卵巣がん、N U

T 正中線癌、または混合系統型白血病（M L L）である、請求項 1 1 に記載の医薬組成物。
。