

【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 0 7 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

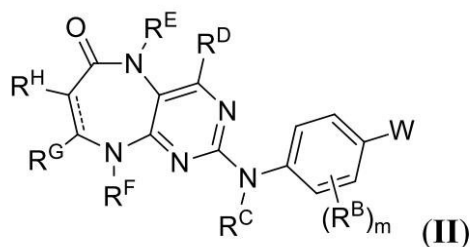
【補正の内容】

【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：

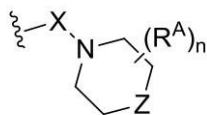
【化 2】

===

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、 $-OR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})_2$ 、 $-SR^{A1}$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-C(=NR^{A1})R^{A1}$ 、 $-C(=NR^{A1})OR^{A1}$ 、 $-C(=NR^{A1})N(R^{A1})_2$ 、 $-C(=O)R^{A1}$ 、 $-C(=O)OR^{A1}$ 、 $-C(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR^{A1}C(=O)R^{A1}$ 、 $-NR^{A1}C(=O)OR^{A1}$ 、 $-NR^{A1}C(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-OC(=O)R^{A1}$ 、 $-OC(=O)OR^{A1}$ 、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、 $-OR^{B1}$ 、 $-N(R^{B1})_2$ 、 $-SR^{B1}$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-C(=NR^{B1})R^{B1}$ 、 $-C(=NR^{B1})OR^{B1}$ 、 $-C(=NR^{B1})N(R^{B1})_2$ 、 $-C(=O)R^{B1}$ 、 $-C(=O)OR^{B1}$ 、 $-C(=O)N(R^{B1})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR^{B1}C(=O)R^{B1}$ 、 $-NR^{B1}C(=O)OR^{B1}$ 、 $-NR^{B1}C(=O)N(R^{B1})_2$ 、 $-OC(=O)R^{B1}$ 、 $-OC(=O)OR^{B1}$ 、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；

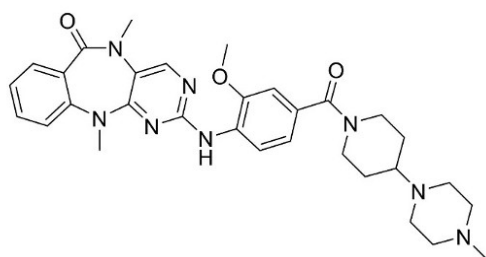
R^F は、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；および

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。

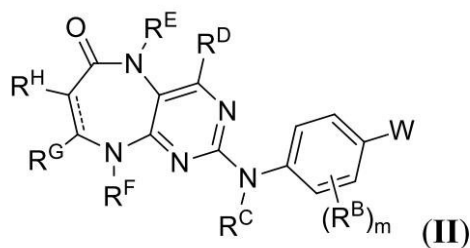
【請求項2】

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：

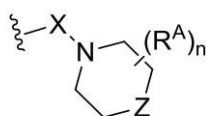
【化6】

==

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^{Z1} 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、 $-OR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})_2$ 、 $-SR^{A1}$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-C(=NR^{A1})R^{A1}$ 、 $-C(=NR^{A1})OR^{A1}$ 、 $-C(=NR^{A1})N(R^{A1})_2$ 、 $-C(=O)R^{A1}$ 、 $-C(=O)OR^{A1}$ 、 $-C(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR^{A1}C(=O)R^{A1}$ 、 $-NR^{A1}C(=O)OR^{A1}$ 、 $-NR^{A1}C(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-OC(=O)R^{A1}$ 、 $-OC(=O)OR^{A1}$ 、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、 $-OR^{B1}$ 、 $-N(R^{B1})_2$ 、 $-SR^{B1}$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-C(=NR^{B1})R^{B1}$ 、 $-C(=NR^{B1})OR^{B1}$ 、 $-C(=NR^{B1})N(R^{B1})_2$ 、 $-C(=O)R^{B1}$ 、 $-C(=O)OR^{B1}$ 、 $-C(=O)N(R^{B1})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR^{B1}C(=O)R^{B1}$ 、 $-NR^{B1}C(=O)OR^{B1}$ 、 $-NR^{B1}C(=O)N(R^{B1})_2$ 、 $-OC(=O)R^{B1}$ 、 $-OC(=O)OR^{B1}$ 、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；

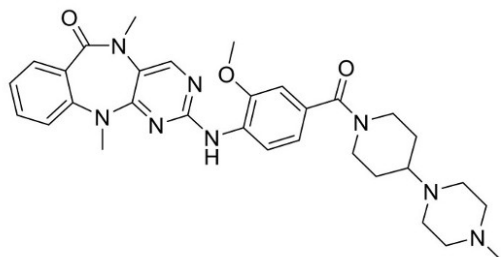
R^E は、水素または置換もしくは非置換アルキルであり；

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 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。

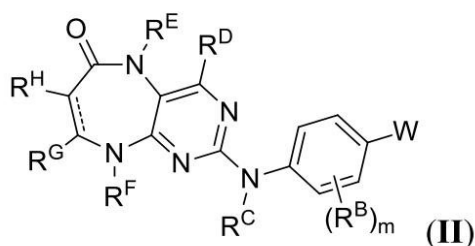
【請求項 5】

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：

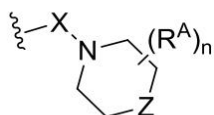
【化 10】

==

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^{Z1} 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、 $-OR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})_2$ 、 $-SR^{A1}$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-C(=NR^{A1})R^{A1}$ 、 $-C(=NR^{A1})OR^{A1}$ 、 $-C(=NR^{A1})N(R^{A1})_2$ 、 $-C(=O)R^{A1}$ 、 $-C(=O)OR^{A1}$ 、 $-C(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR^{A1}C(=O)R^{A1}$ 、 $-NR^{A1}C(=O)OR^{A1}$ 、 $-NR^{A1}C(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-OC(=O)R^{A1}$ 、 $-OC(=O)OR^{A1}$ 、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、 $-OR^{B1}$ 、 $-N(R^{B1})_2$ 、 $-SR^{B1}$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-C(=NR^{B1})R^{B1}$ 、 $-C(=NR^{B1})OR^{B1}$ 、 $-C(=NR^{B1})N(R^{B1})_2$ 、 $-C(=O)R^{B1}$ 、 $-C(=O)OR^{B1}$ 、 $-C(=O)N(R^{B1})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR^{B1}C(=O)R^{B1}$ 、 $-NR^{B1}C(=O)OR^{B1}$ 、 $-NR^{B1}C(=O)N(R^{B1})_2$ 、 $-OC(=O)R^{B1}$ 、 $-OC(=O)OR^{B1}$ 、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

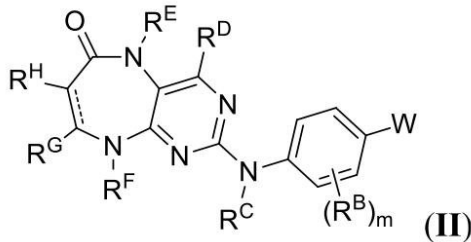
テロアリールであり；および

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 I) :

【化 1 2】



式中：

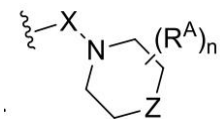
【化 1 3】



は、単結合または二重結合であり；

W は、

【化 1 4】



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、 $-OR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})_2$ 、 $-SR^{A1}$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-C(=NR^{A1})R^{A1}$ 、 $-C(=NR^{A1})OR^{A1}$ 、 $-C(=NR^{A1})N(R^{A1})_2$ 、 $-C(=O)R^{A1}$ 、 $-C(=O)OR^{A1}$ 、 $-C(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR^{A1}C(=O)R^{A1}$ 、 $-NR^{A1}C(=O)OR^{A1}$ 、 $-NR^{A1}C(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-OC(=O)R^{A1}$ 、 $-OC(=O)OR^{A1}$ 、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、 $-OR^{B1}$ 、 $-N(R^{B1})_2$ 、 $-SR^{B1}$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-C(=NR^{B1})R^{B1}$ 、 $-C(=NR^{B1})OR^{B1}$ 、 $-C(=NR^{B1})N(R^{B1})_2$ 、 $-C(=O)R^{B1}$ 、 $-C(=O)OR^{B1}$ 、 $-C(=O)N(R^{B1})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR^{B1}C(=O)R^{B1}$ 、 $-NR^{B1}C(=O)OR^{B1}$ 、 $-NR^{B1}C(=O)N(R^{B1})_2$ 、 $-OC(=O)R^{B1}$ 、 $-OC(=O)OR^{B1}$ 、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；

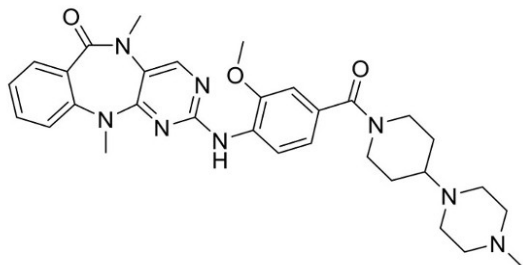
R^F は、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；および

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】



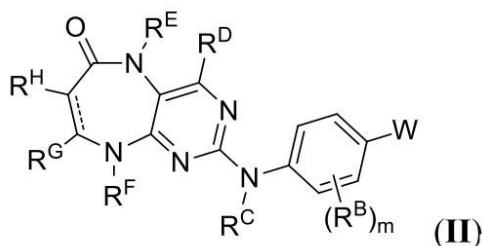
で表わされる化合物ではない、

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(II)：

【化 1 6】



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、

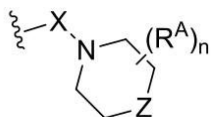
【化 1 7】

==

は、単結合または二重結合であり；

W は、

【化 1 8】



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、 $-OR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})_2$ 、 $-SR^{A1}$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-C(=NR^{A1})R^{A1}$ 、 $-C(=NR^{A1})OR^{A1}$ 、 $-C(=NR^{A1})N(R^{A1})_2$ 、 $-C(=O)R^{A1}$ 、 $-C(=O)OR^{A1}$ 、 $-C(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR^{A1}C(=O)R^{A1}$ 、 $-NR^{A1}C(=O)OR^{A1}$ 、 $-NR^{A1}C(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-OC(=O)R^{A1}$ 、 $-OC(=O)OR^{A1}$ 、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、 $-OR^{B1}$ 、 $-N(R^{B1})_2$ 、 $-SR^{B1}$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-C(=NR^{B1})R^{B1}$ 、 $-C(=NR^{B1})OR^{B1}$ 、 $-C(=NR^{B1})N(R^{B1})_2$ 、 $-C(=O)R^{B1}$ 、 $-C(=O)OR^{B1}$ 、 $-C(=O)N(R^{B1})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR^{B1}C(=O)R^{B1}$ 、 $-NR^{B1}C(=O)OR^{B1}$ 、 $-NR^{B1}C(=O)N(R^{B1})_2$ 、 $-OC(=O)R^{B1}$ 、 $-OC(=O)OR^{B1}$ 、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 $C_1 \sim 6$ 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；

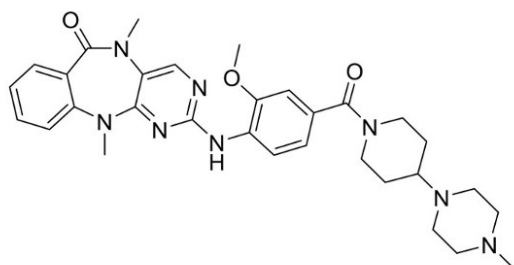
R^F は、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；および

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】



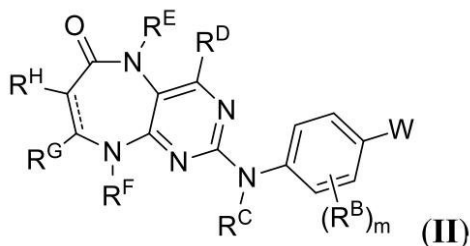
で表わされる化合物ではない、

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(II)：

【化 2 0】



式中：

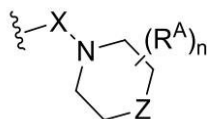
【化 2 1】

==

は、単結合または二重結合であり；

W は、

【化 2 2】



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、 $-OR^{A1}$ 、 $-N(R^{A1})_2$ 、 $-SR^{A1}$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-C(=NR^{A1})R^{A1}$ 、 $-C(=NR^{A1})OR^{A1}$ 、 $-C(=NR^{A1})N(R^{A1})_2$ 、 $-C(=O)R^{A1}$ 、 $-C(=O)OR^{A1}$ 、 $-C(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR^{A1}C(=O)R^{A1}$ 、 $-NR^{A1}C(=O)OR^{A1}$ 、 $-NR^{A1}C(=O)N(R^{A1})_2$ 、 $-OC(=O)R^{A1}$ 、 $-OC(=O)OR^{A1}$ 、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、 $-OR^{B1}$ 、 $-N(R^{B1})_2$ 、 $-SR^{B1}$ 、 $-CN$ 、 $-SCN$ 、 $-C(=NR^{B1})R^{B1}$ 、 $-C(=NR^{B1})OR^{B1}$ 、 $-C(=NR^{B1})N(R^{B1})_2$ 、 $-C(=O)R^{B1}$ 、 $-C(=O)OR^{B1}$ 、 $-C(=O)N(R^{B1})_2$ 、 $-NO_2$ 、 $-NR^{B1}C(=O)R^{B1}$ 、 $-NR^{B1}C(=O)OR^{B1}$ 、 $-NR^{B1}C(=O)N(R^{B1})_2$ 、 $-OC(=O)R^{B1}$ 、 $-OC(=O)OR^{B1}$ 、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 $C_1 \sim 6$ 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；

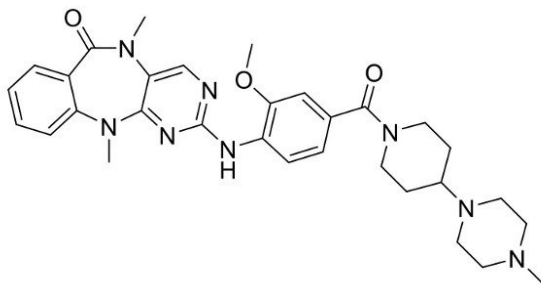
R^F は、水素、置換もしくは非置換アルキル、置換もしくは非置換アルケニル、置換もしくは非置換ヘテロシクリル、置換もしくは非置換アリール、または置換もしくは非置換ヘテロアリールであり；および

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(TATAP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(EP300)である、請求項1～5および7～9

【請求項 1 1】

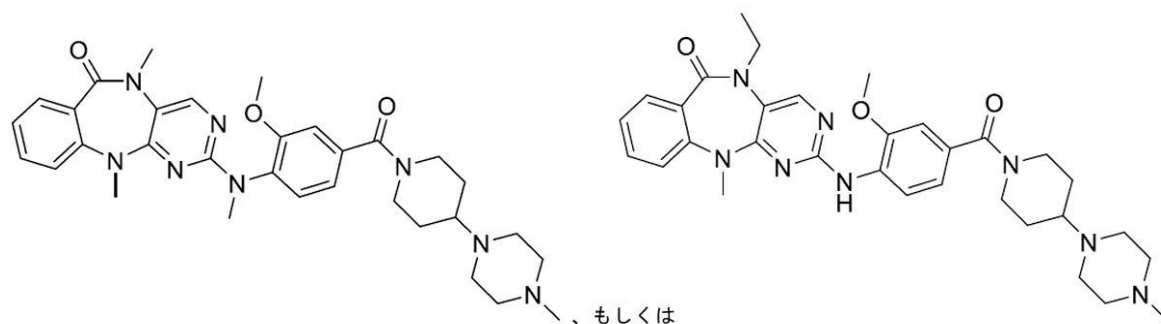
【請求項 1 2】

【請求項 13】

【請求項 14】

【請求項 15】

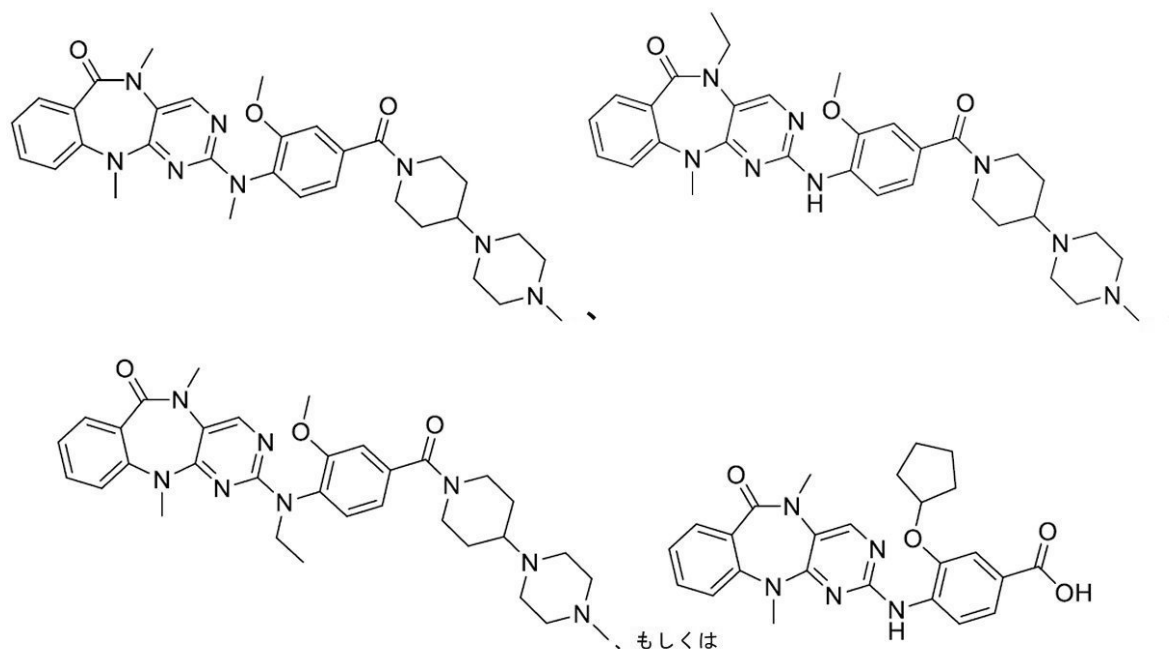
【化 2 4】



【請求項 16】

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 員単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
。