

【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】平成31年3月7日(2019.3.7)

【公表番号】特表2018-507191(P2018-507191A)

【公表日】平成30年3月15日(2018.3.15)

【年通号数】公開・登録公報2018-010

【出願番号】特願2017-539592(P2017-539592)

【国際特許分類】

C 07 D 471/04 (2006.01)  
C 07 D 519/00 (2006.01)  
A 61 K 38/06 (2006.01)  
A 61 K 38/12 (2006.01)  
A 61 K 38/44 (2006.01)  
A 61 K 39/00 (2006.01)  
A 61 K 39/395 (2006.01)  
A 61 K 31/365 (2006.01)  
A 61 K 31/395 (2006.01)  
A 61 K 31/4045 (2006.01)  
A 61 K 31/407 (2006.01)  
A 61 K 31/4196 (2006.01)  
A 61 K 31/436 (2006.01)  
A 61 K 31/437 (2006.01)  
A 61 K 31/44 (2006.01)  
A 61 K 31/444 (2006.01)  
A 61 K 31/4545 (2006.01)  
A 61 K 31/4743 (2006.01)  
A 61 K 31/506 (2006.01)  
A 61 K 31/513 (2006.01)  
A 61 K 31/517 (2006.01)  
A 61 K 31/519 (2006.01)  
A 61 K 31/5377 (2006.01)  
A 61 K 31/565 (2006.01)  
A 61 K 31/69 (2006.01)  
A 61 K 31/704 (2006.01)  
A 61 P 35/00 (2006.01)  
A 61 P 35/02 (2006.01)  
A 61 P 43/00 (2006.01)  
A 61 K 31/145 (2006.01)  
C 07 D 249/08 (2006.01)  
C 07 D 239/553 (2006.01)  
C 07 D 239/94 (2006.01)  
C 07 D 225/06 (2006.01)  
C 07 D 307/88 (2006.01)  
C 07 D 475/04 (2006.01)  
C 07 D 491/044 (2006.01)  
C 07 D 491/08 (2006.01)  
C 07 D 213/81 (2006.01)  
C 07 D 273/08 (2006.01)  
C 07 H 15/252 (2006.01)

C 0 7 H 17/04 (2006.01)  
 C 0 7 D 401/04 (2006.01)  
 C 0 7 D 403/06 (2006.01)  
 C 0 7 D 493/04 (2006.01)  
 C 0 7 D 493/22 (2006.01)  
 C 0 7 D 498/18 (2006.01)  
 C 0 7 J 31/00 (2006.01)

## 【 F I 】

C 0 7 D	471/04	1 0 4 Z
C 0 7 D	519/00	3 0 1
A 6 1 K	38/06	
A 6 1 K	38/12	
A 6 1 K	38/44	
A 6 1 K	39/00	H
A 6 1 K	39/395	N
A 6 1 K	31/365	
A 6 1 K	31/395	
A 6 1 K	31/4045	
A 6 1 K	31/407	
A 6 1 K	31/4196	
A 6 1 K	31/436	
A 6 1 K	31/437	
A 6 1 K	31/44	
A 6 1 K	31/444	
A 6 1 K	31/4545	
A 6 1 K	31/4743	
A 6 1 K	31/506	
A 6 1 K	31/513	
A 6 1 K	31/517	
A 6 1 K	31/519	
A 6 1 K	31/5377	
A 6 1 K	31/565	
A 6 1 K	31/69	
A 6 1 K	31/704	
A 6 1 P	35/00	
A 6 1 P	35/02	
A 6 1 P	43/00	1 1 1
A 6 1 K	31/145	
C 0 7 D	249/08	5 3 0
C 0 7 D	239/553	C S P A
C 0 7 D	239/94	
C 0 7 D	225/06	
C 0 7 D	307/88	
C 0 7 D	475/04	
C 0 7 D	491/044	
C 0 7 D	491/08	
C 0 7 D	213/81	
C 0 7 D	273/08	
C 0 7 H	15/252	
C 0 7 H	17/04	

C 0 7 D	401/04
C 0 7 D	403/06
C 0 7 D	493/04
C 0 7 D	493/22
C 0 7 D	498/18
C 0 7 J	31/00

1 1 1

## 【手続補正書】

【提出日】平成31年1月23日(2019.1.23)

## 【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

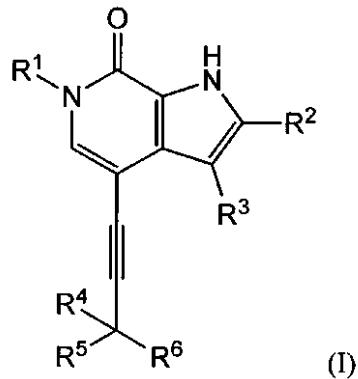
## 【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

式(I)：

## 【化176】



(式中、

R<sup>1</sup>は、C<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>2～6</sub>アルケニル、C<sub>2～6</sub>アルキニル、カルボシクリル、またはヘテロシクリルであり、前記C<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>2～6</sub>アルケニル、C<sub>2～6</sub>アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、ハロ、シアノ、C<sub>1～3</sub>アルコキシ、およびC<sub>3～8</sub>カルボシクリル（前記C<sub>3～8</sub>カルボシクリルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

R<sup>2</sup>は、C<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>2～6</sub>アルケニル、C<sub>2～6</sub>アルキニル、カルボシクリル、またはヘテロシクリルであり、前記C<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>2～6</sub>アルケニル、C<sub>2～6</sub>アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、ハロ、シアノ、C<sub>1～3</sub>アルコキシ、およびC<sub>3～8</sub>カルボシクリル（前記C<sub>3～8</sub>カルボシクリルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

R<sup>3</sup>は、H、C<sub>1～6</sub>アルキル、-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-C(=O)R<sup>a</sup>、-C(=O)OR<sup>a</sup>、または5～6員ヘテロアリール環であり、前記C<sub>1～6</sub>アルキルおよび5～6員ヘテロアリール環は、C<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>2～6</sub>アルケニル、C<sub>2～6</sub>アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、オキソ、ハロ、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-CN、-C(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-O-R<sup>b</sup>、-S-R<sup>b</sup>、-O-C(O)-R<sup>b</sup>、-C(O)-R<sup>b</sup>、-C(O)-OR<sup>b</sup>、-S(O)-R<sup>b</sup>、-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>b</sup>、-N(R<sup>b</sup>)-C(O)-R<sup>b</sup>、-N(R<sup>b</sup>)

- S (O) - R<sup>b</sup>、- N (R<sup>b</sup>) - C (O) - N (R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、および- N (R<sup>b</sup>) - S (O)<sub>2</sub> - R<sup>b</sup>からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され、任意のC<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、R<sup>f</sup>、オキソ、ハロ、- NO<sub>2</sub>、- N (R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、- CN、- C (O) - N (R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、- S (O) - N (R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、- S (O)<sub>2</sub> - N (R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、- O - R<sup>b</sup>、- S - R<sup>b</sup>、- O - C (O) - R<sup>b</sup>、- C (O) - R<sup>b</sup>、- C (O) - O - R<sup>b</sup>、- S (O) - R<sup>b</sup>、- S (O)<sub>2</sub> - R<sup>b</sup>、- N (R<sup>b</sup>) - C (O) - R<sup>b</sup>、- N (R<sup>b</sup>) - S (O) - R<sup>b</sup>、- N (R<sup>b</sup>) - C (O) - N (R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、および- N (R<sup>b</sup>) - S (O)<sub>2</sub> - R<sup>b</sup>からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

R<sup>a</sup>は、水素、C<sub>1~10</sub>アルキル、C<sub>2~10</sub>アルケニル、C<sub>2~10</sub>アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から選択され、任意のC<sub>1~10</sub>アルキル、C<sub>2~10</sub>アルケニル、C<sub>2~10</sub>アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、R<sup>d</sup>、オキソ、ハロ、- NO<sub>2</sub>、- N (R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、- CN、- C (O) - N (R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、- S (O) - N (R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、- S (O)<sub>2</sub> - N (R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、- O - R<sup>b</sup>、- S - R<sup>b</sup>、- O - C (O) - R<sup>b</sup>、- C (O) - R<sup>b</sup>、- C (O) - O - R<sup>b</sup>、- S (O) - R<sup>b</sup>、- S (O)<sub>2</sub> - R<sup>b</sup>、- N (R<sup>b</sup>) - C (O) - R<sup>b</sup>、- N (R<sup>b</sup>) - S (O) - R<sup>b</sup>、- N (R<sup>b</sup>) - C (O) - N (R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、および- N (R<sup>b</sup>) - S (O)<sub>2</sub> - R<sup>b</sup>からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

各々のR<sup>b</sup>は、水素、C<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、C<sub>1~6</sub>アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、各々のC<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、C<sub>1~6</sub>アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、R<sup>c</sup>、オキソ、ハロ、- NO<sub>2</sub>、- N (R<sup>c</sup>)<sub>2</sub>、- CN、- C (O) - N (R<sup>c</sup>)<sub>2</sub>、- S (O) - N (R<sup>c</sup>)<sub>2</sub>、- S (O)<sub>2</sub> - N (R<sup>c</sup>)<sub>2</sub>、- O - R<sup>c</sup>、- S - R<sup>c</sup>、- O - C (O) - R<sup>c</sup>、- C (O) - R<sup>c</sup>、- C (O) - O R<sup>c</sup>、- S (O) - R<sup>c</sup>、- S (O)<sub>2</sub> - R<sup>c</sup>、- N (R<sup>c</sup>) - C (O) - R<sup>c</sup>、- N (R<sup>c</sup>) - S (O) - R<sup>c</sup>、- N (R<sup>c</sup>) - C (O) - N (R<sup>c</sup>)<sub>2</sub>、および- N (R<sup>c</sup>) - S (O)<sub>2</sub> - R<sup>c</sup>からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；または、2つのR<sup>b</sup>が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、およびC<sub>1~3</sub>アルキル（前記C<sub>1~3</sub>アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し；

各々のR<sup>c</sup>は、水素、C<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、各々のC<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシ、C<sub>1~6</sub>アルコキシ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、およびC<sub>1~6</sub>アルキル（前記C<sub>1~6</sub>アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；または、2つのR<sup>c</sup>が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、およびC<sub>1~3</sub>アルキル（前記C<sub>1~3</sub>アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し；

各々のR<sup>d</sup>は、C<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、C<sub>1~6</sub>アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、各々のC<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、C<sub>1~6</sub>アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、R<sup>e</sup>、オキソ、ハロ、- NO<sub>2</sub>、- N (R<sup>e</sup>)<sub>2</sub>、- CN、- C (O) - N (R<sup>e</sup>)<sub>2</sub>、- S (O) - N (R<sup>e</sup>)<sub>2</sub>、- S (O)<sub>2</sub> - N (R<sup>e</sup>)<sub>2</sub>、- O - R<sup>e</sup>、- S - R<sup>e</sup>、- O - C (O) - R<sup>e</sup>、- C (O)

- R<sup>e</sup>、 - C(O) - OR<sup>c</sup>、 - S(O) - R<sup>c</sup>、 - S(O)<sub>2</sub> - R<sup>c</sup>、 - N(R<sup>c</sup>) - C(O) - R<sup>c</sup>、 - N(R<sup>c</sup>) - S(O) - R<sup>c</sup>、 - N(R<sup>c</sup>) - C(O) - N(R<sup>c</sup>)<sub>2</sub>、および - N(R<sup>e</sup>) - S(O)<sub>2</sub> - R<sup>e</sup>からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され、

各々のR<sup>e</sup>は、水素、C<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、C<sub>1~6</sub>アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、各々のC<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、C<sub>1~6</sub>アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシ、C<sub>1~6</sub>アルコキシ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、およびC<sub>1~6</sub>アルキル（前記C<sub>1~6</sub>アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；または、2つのR<sup>e</sup>が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、およびC<sub>1~3</sub>アルキル（前記C<sub>1~3</sub>アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し；

各々のR<sup>f</sup>は、C<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、C<sub>1~6</sub>アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、各々のC<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、C<sub>1~6</sub>アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシ、C<sub>1~6</sub>アルコキシ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、およびC<sub>1~6</sub>アルキル（前記C<sub>1~6</sub>アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

R<sup>4</sup>は存在しないか、H、ヒドロキシ、またはC<sub>1~6</sub>アルキル（前記C<sub>1~6</sub>アルキルは、ハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）であり；

R<sup>5</sup>は、Hまたはハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたC<sub>1~6</sub>アルキルであり；R<sup>6</sup>は、C<sub>1~6</sub>アルキル、カルボシクリル、またはヘテロシクリルであり、前記C<sub>1~6</sub>アルキル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、1つまたは複数のR<sup>g</sup>で任意選択的に置換され；または、R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>が、それらが結合する炭素とともに、カルボシクリルまたはヘテロシクリルを形成し、前記カルボシクリルおよびヘテロシクリルは、1つまたは複数のR<sup>g</sup>で任意選択的に置換され；

各々のR<sup>g</sup>は、C<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリル、R<sup>k</sup>、ハロ、オキソ(=O)、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>h</sup>)<sub>2</sub>、-CN、-C(O)-N(R<sup>h</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)-N(R<sup>h</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>-N(R<sup>h</sup>)<sub>2</sub>、-O-R<sup>h</sup>、-S-R<sup>h</sup>、-O-C(O)-R<sup>h</sup>、-C(O)-R<sup>h</sup>、-C(O)-OR<sup>h</sup>、-S(O)-R<sup>h</sup>、-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>h</sup>、-N(R<sup>h</sup>)-C(O)-R<sup>h</sup>、-N(R<sup>h</sup>)-S(O)-R<sup>h</sup>、-N(R<sup>h</sup>)-C(O)-N(R<sup>h</sup>)<sub>2</sub>、および-N(R<sup>h</sup>)-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>h</sup>からなる群から独立して選択され；

各々のR<sup>h</sup>は、水素、C<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、C<sub>1~6</sub>アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、各々のC<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、C<sub>1~6</sub>アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシ、C<sub>1~6</sub>アルコキシ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、およびC<sub>1~6</sub>アルキル（前記C<sub>1~6</sub>アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；または、2つのR<sup>h</sup>が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、およびC<sub>1~3</sub>アルキル（前記C<sub>1~3</sub>アルキルは、オキソ

およびハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される)からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し;

各々のR<sup>k</sup>は、C<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、前記C<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、ハロ、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>h</sup>)<sub>2</sub>、-CN、-C(O)-N(R<sup>h</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)-N(R<sup>h</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>-N(R<sup>h</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>-N(R<sup>h</sup>)<sub>2</sub>、-O-R<sup>h</sup>、-S-R<sup>h</sup>、-O-C(O)-R<sup>h</sup>、-C(O)-OR<sup>h</sup>、-S(O)-R<sup>h</sup>、-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>h</sup>、-N(R<sup>h</sup>)-C(O)-R<sup>h</sup>、-N(R<sup>h</sup>)-S(O)-R<sup>h</sup>、-N(R<sup>h</sup>)-C(O)-N(R<sup>h</sup>)<sub>2</sub>、および-N(R<sup>h</sup>)-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>h</sup>からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で置換される)の化合物またはその塩。

#### 【請求項2】

R<sup>1</sup>は、ハロ、シアノ、C<sub>1~3</sub>アルコキシ、およびC<sub>3~8</sub>カルボシクリル(前記C<sub>3~8</sub>カルボシクリルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される)からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたC<sub>1~6</sub>アルキルである、請求項1に記載の化合物またはその塩。

#### 【請求項3】

R<sup>1</sup>はメチルである、請求項1に記載の化合物またはその塩。

#### 【請求項4】

R<sup>2</sup>は、ハロ、シアノ、C<sub>1~3</sub>アルコキシ、およびC<sub>3~8</sub>カルボシクリル(前記C<sub>3~8</sub>カルボシクリルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される)からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたC<sub>1~6</sub>アルキルである、請求項1~3のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

#### 【請求項5】

R<sup>2</sup>はメチルである、請求項1~3のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

#### 【請求項6】

R<sup>3</sup>はHである、請求項1~5のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

#### 【請求項7】

R<sup>3</sup>は、カルボシクリル、ヘテロシクリル、オキソ、ハロ、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-CN、-C(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-O-R<sup>b</sup>、-S-R<sup>b</sup>、-O-C(O)-R<sup>b</sup>、-C(O)-R<sup>b</sup>、-C(O)-OR<sup>b</sup>、-S(O)-R<sup>b</sup>、-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>b</sup>、-N(R<sup>b</sup>)-C(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、および-N(R<sup>b</sup>)-S(O)-R<sup>b</sup>からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたC<sub>1~6</sub>アルキルであり、任意のカルボシクリル、およびヘテロシクリルは、R<sup>f</sup>、オキソ、ハロ、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-CN、-C(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-O-R<sup>b</sup>、-S-R<sup>b</sup>、-O-C(O)-R<sup>b</sup>、-C(O)-R<sup>b</sup>、-C(O)-OR<sup>b</sup>、-S(O)-R<sup>b</sup>、-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>b</sup>、-N(R<sup>b</sup>)-C(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、および-N(R<sup>b</sup>)-S(O)-R<sup>b</sup>からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項1~5のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

#### 【請求項8】

R<sup>3</sup>は-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>である、請求項1~5のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

#### 【請求項9】

R<sup>3</sup>は-C(=O)R<sup>a</sup>である、請求項1~5のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

## 【請求項 10】

$R^3$  は  $-C(=O)OR^a$  である、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

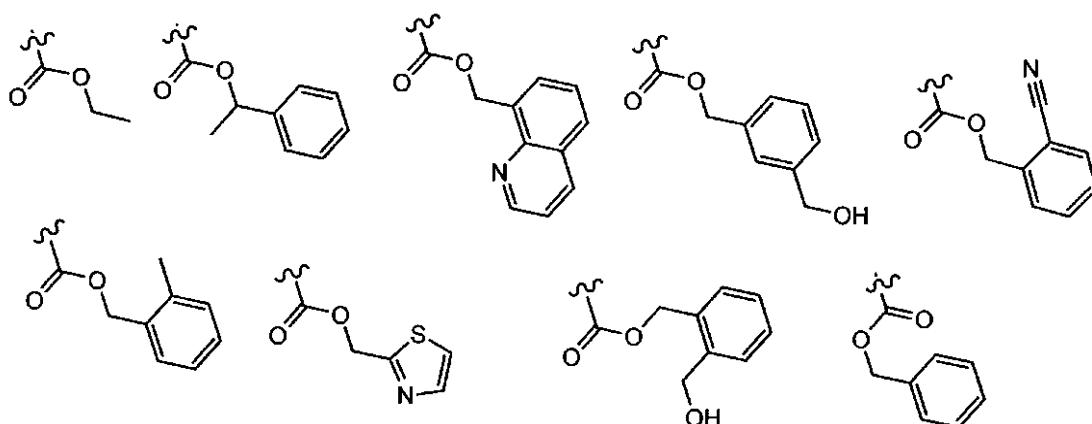
## 【請求項 11】

$R^3$  は、 $C_1 \sim _6$  アルキル、 $C_2 \sim _6$  アルケニル、 $C_2 \sim _6$  アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$  からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された 5 ~ 6 員ヘテロアリール環であり、任意の $C_1 \sim _6$  アルキル、 $C_2 \sim _6$  アルケニル、 $C_2 \sim _6$  アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、 $R^f$ 、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-O-R^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$  からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

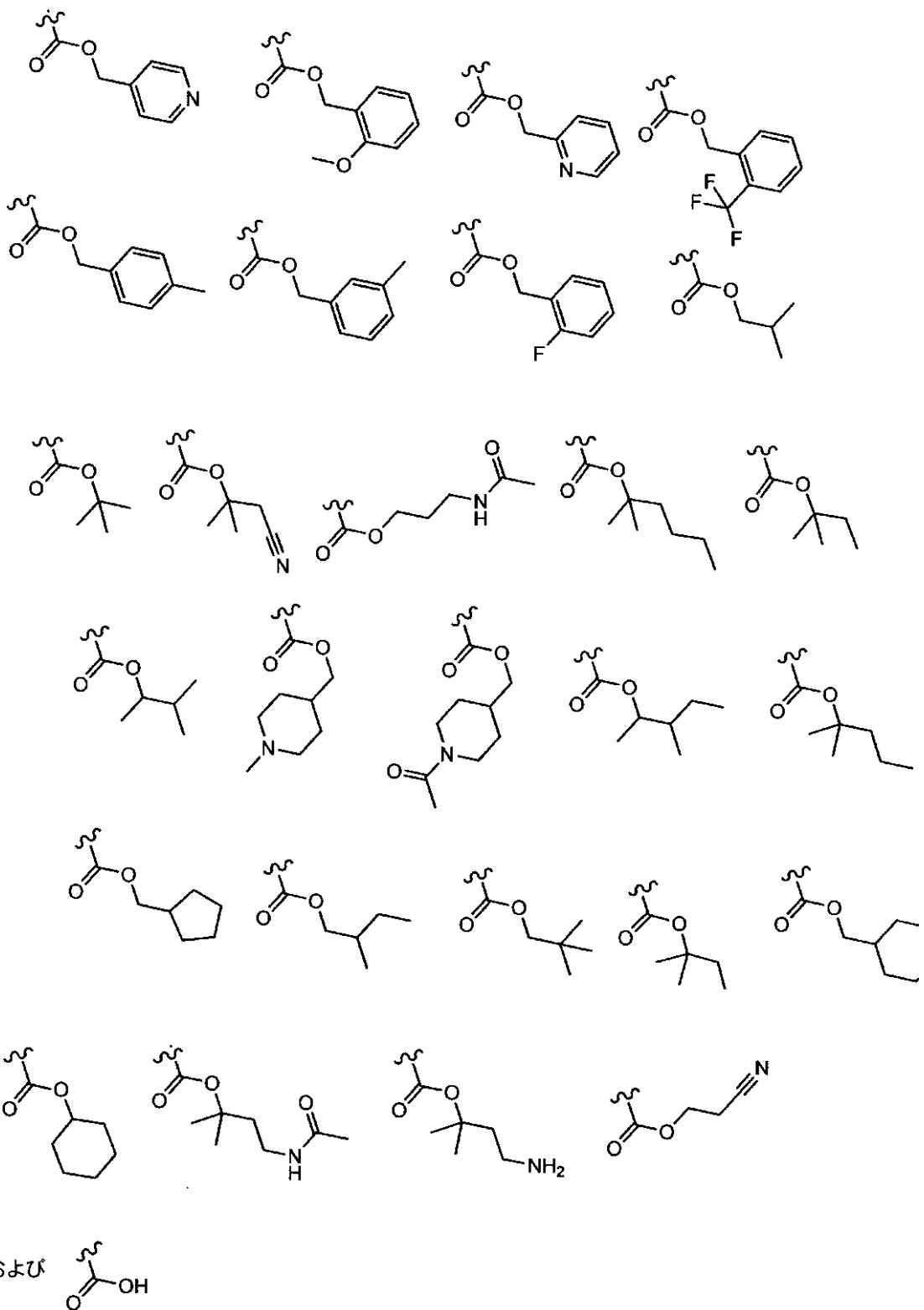
## 【請求項 12】

$R^3$  は、

## 【化 177】



【化178】

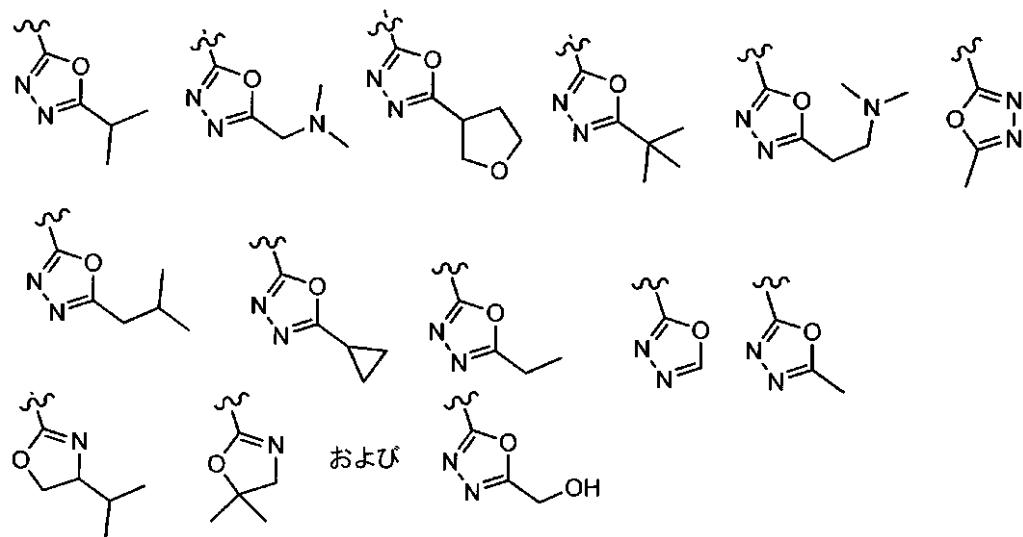


からなる群から選択される、請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

【請求項13】

$\text{R}^3$  は、

【化179】

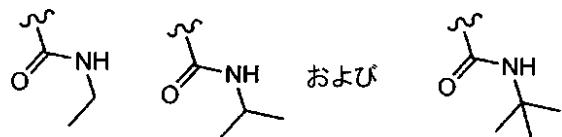


からなる群から選択される、請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

【請求項14】

 $R^3$ は、

【化180】

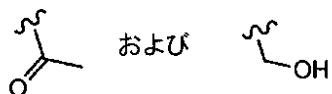


からなる群から選択される、請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

【請求項15】

 $R^3$ は、

【化181】

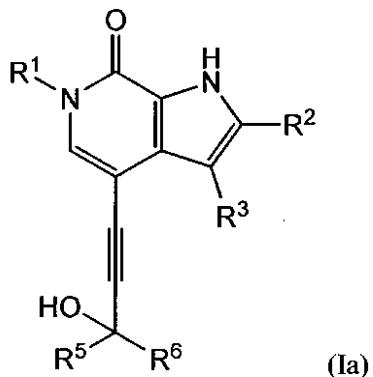


からなる群から選択される、請求項1～5のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

【請求項16】

式(Ia)：

## 【化182】



の化合物である、請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

## 【請求項17】

R<sup>4</sup>はHである、請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

## 【請求項18】

R<sup>4</sup>はヒドロキシルである、請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

## 【請求項19】

R<sup>4</sup>は、ハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたC<sub>1～6</sub>アルキルである、請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

## 【請求項20】

R<sup>5</sup>はHである、請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

## 【請求項21】

R<sup>5</sup>は、ハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたC<sub>1～6</sub>アルキルである、請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

## 【請求項22】

R<sup>6</sup>は、1つまたは複数のR<sup>g</sup>で任意選択的に置換されたC<sub>1～6</sub>アルキルである、請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

## 【請求項23】

R<sup>6</sup>は、1つまたは複数のR<sup>g</sup>で任意選択的に置換されたカルボシクリルである、請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

## 【請求項24】

R<sup>6</sup>は、1つまたは複数のR<sup>g</sup>で任意選択的に置換されたヘテロシクリルである、請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

## 【請求項25】

R<sup>6</sup>は、オキソおよび-N(R<sup>h</sup>)<sub>2</sub>で置換されて-C(=O)-N(R<sup>h</sup>)<sub>2</sub>基を形成したC<sub>1</sub>アルキルである、請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

## 【請求項26】

R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>が、それらが結合する炭素とともに、1つまたは複数のR<sup>g</sup>で任意選択的に置換されたカルボシクリルを形成する、請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

## 【請求項27】

R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>が、それらが結合する炭素とともに、1つまたは複数のR<sup>g</sup>で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成する、請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

## 【請求項28】

R<sup>4</sup>は存在せず；R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>が、それらが結合する炭素とともに、1つまたは複数の

$R^g$  で任意選択的に置換され、式(Ⅰ)の残部と芳香環の原子で連結したアリール環を形成する、請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

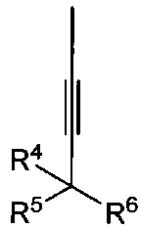
【請求項29】

$R^4$  は存在せず； $R^5$  および $R^6$  が、それらが結合する炭素とともに、1つまたは複数の $R^g$  で任意選択的に置換され、式(Ⅰ)の残部と芳香環の原子で連結したヘテロシクリルを形成する、請求項1～15のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

【請求項30】

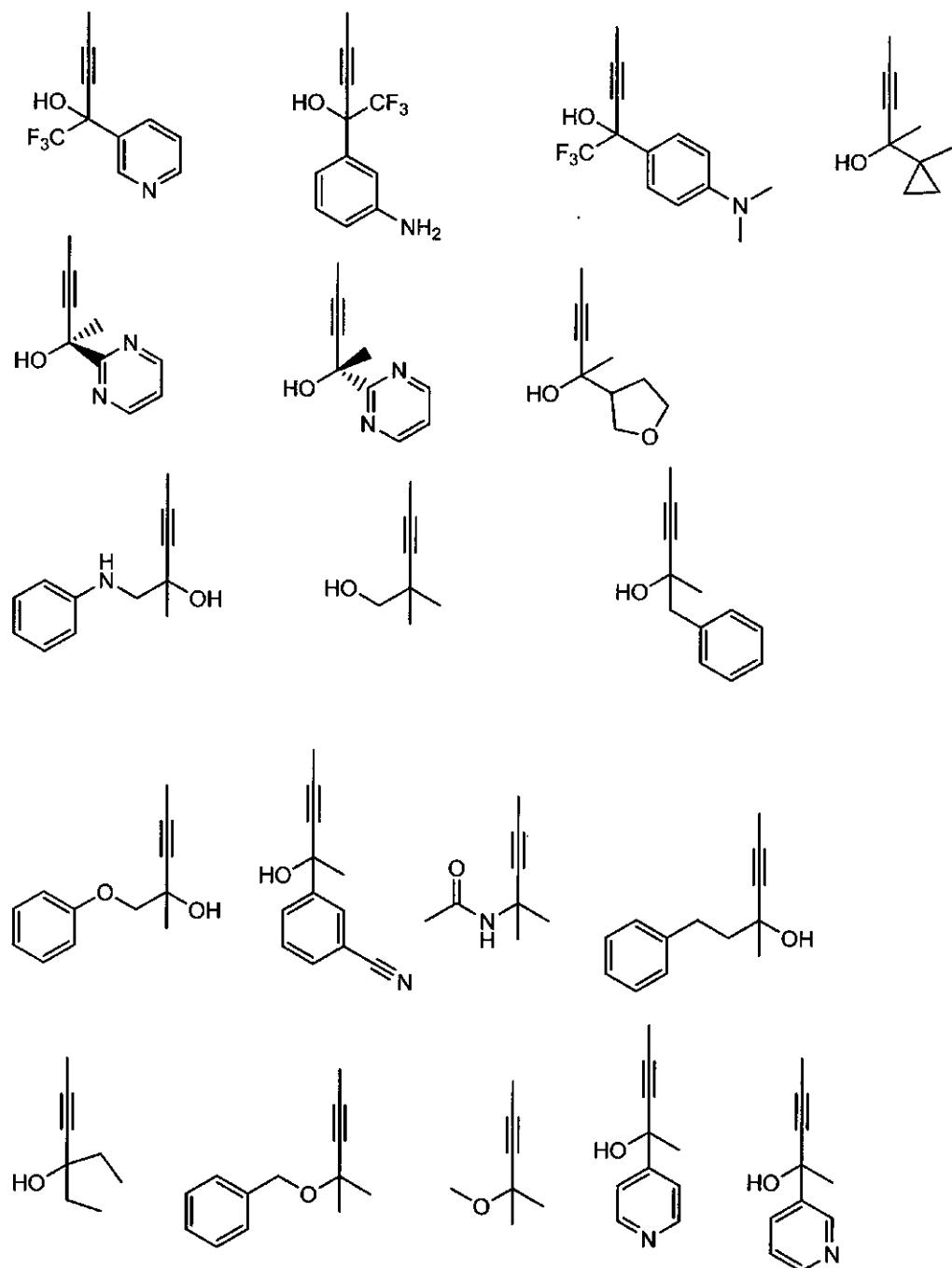
以下の基：

【化183】

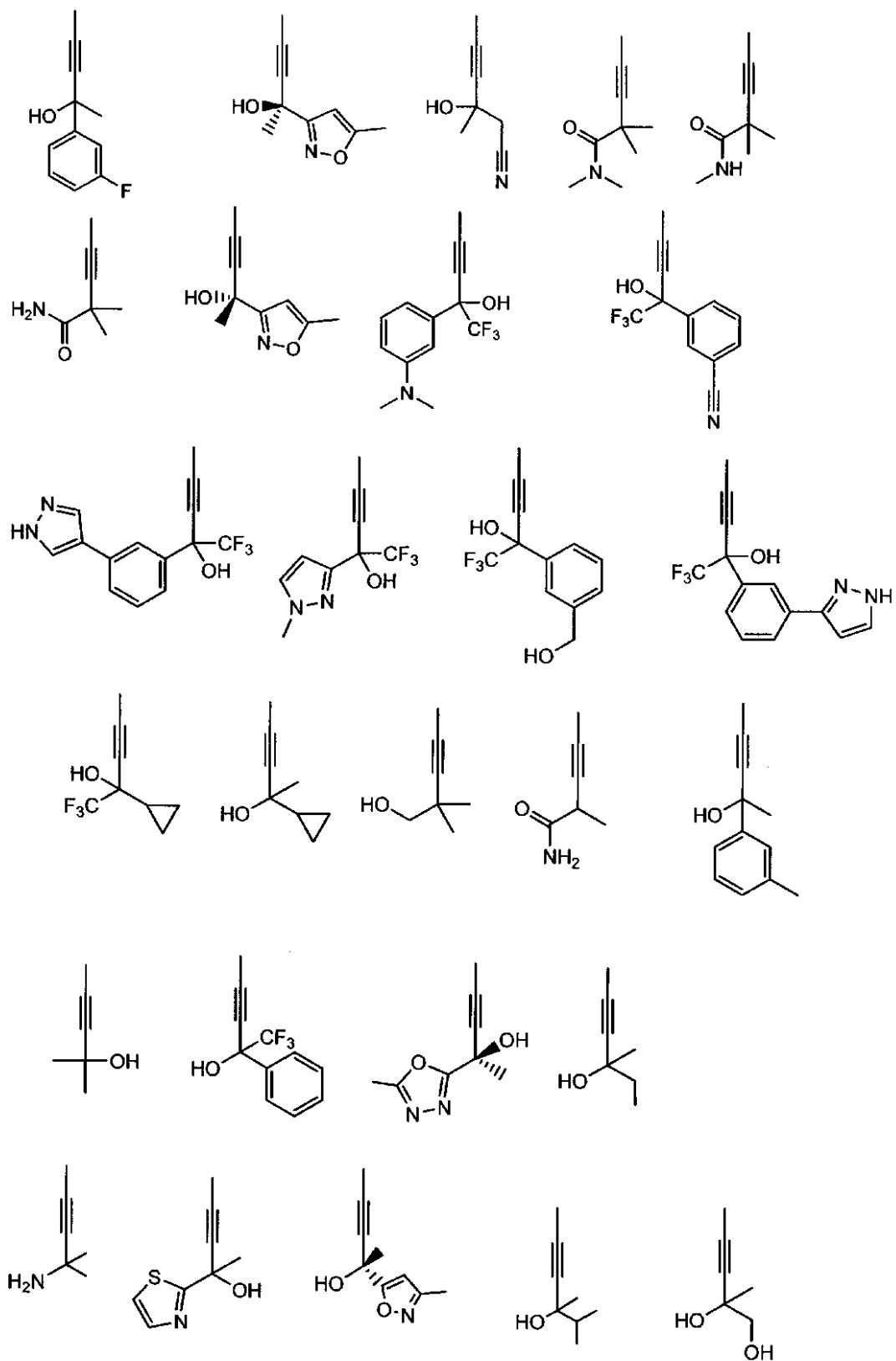


は、

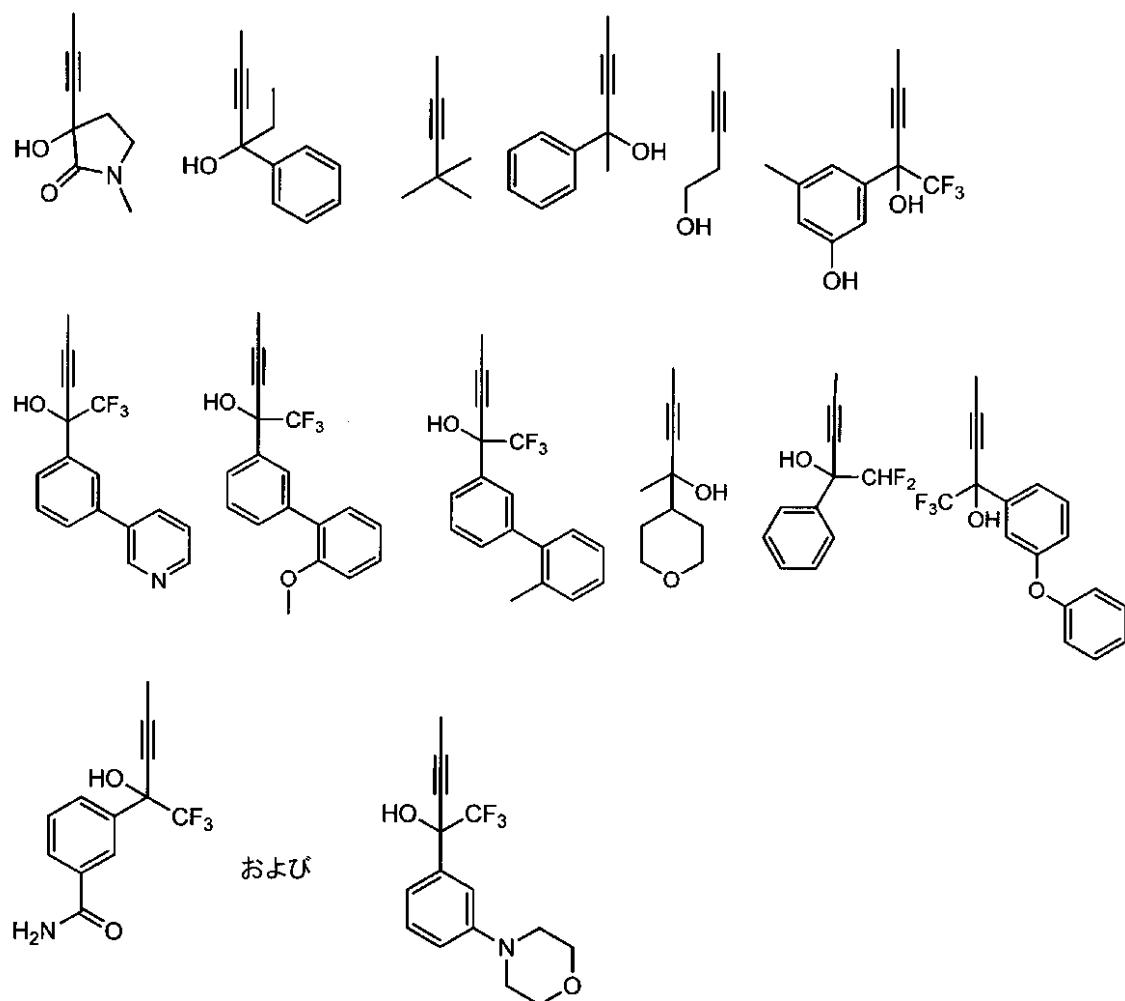
【化 184】



【化 1 8 5】



【化186】

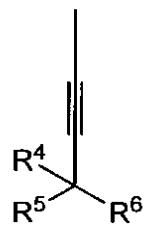


からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物またはその塩。

【請求項31】

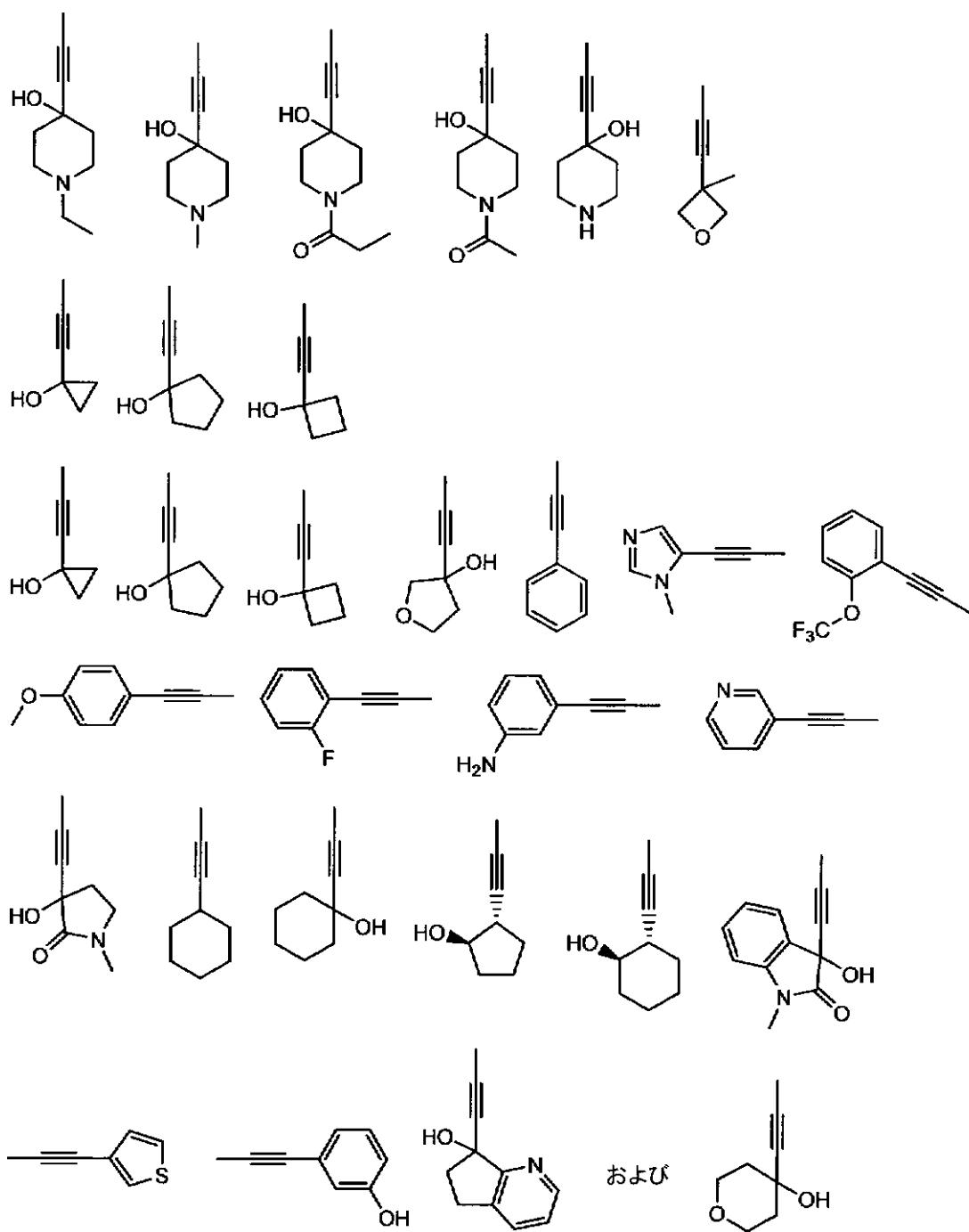
以下の基：

【化187】



は、

【化188】



からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物またはその塩。

【請求項32】

R<sup>1</sup>は、ハロ、シアノ、C<sub>1</sub>～<sub>3</sub>アルコキシ、およびC<sub>3</sub>～<sub>8</sub>カルボシクリル（前記C<sub>3</sub>～<sub>8</sub>カルボシクリルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルであり；

R<sup>2</sup>は、ハロ、シアノ、C<sub>1</sub>～<sub>3</sub>アルコキシ、およびC<sub>3</sub>～<sub>8</sub>カルボシクリル（前記C<sub>3</sub>～<sub>8</sub>カルボシクリルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルであり；

R<sup>3</sup>は、カルボシクリル、ヘテロシクリル、オキソ、ハロ、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>

、 - C N、 - C ( O ) - N ( R<sup>b</sup> )<sub>2</sub>、 - S ( O ) - N ( R<sup>b</sup> )<sub>2</sub>、 - S ( O )<sub>2</sub> - N ( R<sup>b</sup> )<sub>2</sub>、 - O - R<sup>b</sup>、 - S - R<sup>b</sup>、 - O - C ( O ) - R<sup>b</sup>、 - C ( O ) - O R<sup>b</sup>、 - S ( O ) - R<sup>b</sup>、 - S ( O )<sub>2</sub> - R<sup>b</sup>、 - N ( R<sup>b</sup> ) - C ( O ) - R<sup>b</sup>、 - N ( R<sup>b</sup> ) - S ( O ) - R<sup>b</sup>、 - N ( R<sup>b</sup> ) - C ( O ) - N ( R<sup>b</sup> )<sub>2</sub>、 および - N ( R<sup>b</sup> ) - S ( O )<sub>2</sub> - R<sup>b</sup> からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された C<sub>1</sub> ~<sub>6</sub> アルキルであり、任意のカルボシクリル、およびヘテロシクリルは、R<sup>f</sup>、オキソ、ハロ、- NO<sub>2</sub>、- N ( R<sup>b</sup> )<sub>2</sub>、- CN、- C ( O ) - N ( R<sup>b</sup> )<sub>2</sub>、- S ( O ) - N ( R<sup>b</sup> )<sub>2</sub>、- S ( O )<sub>2</sub> - N ( R<sup>b</sup> )<sub>2</sub>、- O - R<sup>b</sup>、- S - R<sup>b</sup>、- O - C ( O ) - R<sup>b</sup>、- C ( O ) - R<sup>b</sup>、- C ( O ) - O - R<sup>b</sup>、- S ( O ) - R<sup>b</sup>、- S ( O )<sub>2</sub> - R<sup>b</sup>、- N ( R<sup>b</sup> ) - C ( O ) - R<sup>b</sup>、- N ( R<sup>b</sup> ) - S ( O ) - R<sup>b</sup>、- N ( R<sup>b</sup> ) - C ( O ) - N ( R<sup>b</sup> )<sub>2</sub>、 および - N ( R<sup>b</sup> ) - S ( O )<sub>2</sub> - R<sup>b</sup> からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

### 【請求項 3 3】

R<sup>1</sup> は、ハロ、シアノ、C<sub>1</sub> ~<sub>3</sub> アルコキシ、および C<sub>3</sub> ~<sub>8</sub> カルボシクリル（前記 C<sub>3</sub> ~<sub>8</sub> カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された C<sub>1</sub> ~<sub>6</sub> アルキルであり；

R<sup>2</sup> は、ハロ、シアノ、C<sub>1</sub> ~<sub>3</sub> アルコキシ、および C<sub>3</sub> ~<sub>8</sub> カルボシクリル（前記 C<sub>3</sub> ~<sub>8</sub> カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された C<sub>1</sub> ~<sub>6</sub> アルキルであり；

R<sup>3</sup> は - N ( R<sup>b</sup> )<sub>2</sub> である、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

### 【請求項 3 4】

R<sup>1</sup> は、ハロ、シアノ、C<sub>1</sub> ~<sub>3</sub> アルコキシ、および C<sub>3</sub> ~<sub>8</sub> カルボシクリル（前記 C<sub>3</sub> ~<sub>8</sub> カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された C<sub>1</sub> ~<sub>6</sub> アルキルであり；

R<sup>2</sup> は、ハロ、シアノ、C<sub>1</sub> ~<sub>3</sub> アルコキシ、および C<sub>3</sub> ~<sub>8</sub> カルボシクリル（前記 C<sub>3</sub> ~<sub>8</sub> カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された C<sub>1</sub> ~<sub>6</sub> アルキルであり；

R<sup>3</sup> は - C ( = O ) OR<sup>a</sup> である、請求項 1 に記載の化合物またはその塩。

### 【請求項 3 5】

R<sup>1</sup> は、ハロ、シアノ、C<sub>1</sub> ~<sub>3</sub> アルコキシ、および C<sub>3</sub> ~<sub>8</sub> カルボシクリル（前記 C<sub>3</sub> ~<sub>8</sub> カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された C<sub>1</sub> ~<sub>6</sub> アルキルであり；

R<sup>2</sup> は、ハロ、シアノ、C<sub>1</sub> ~<sub>3</sub> アルコキシ、および C<sub>3</sub> ~<sub>8</sub> カルボシクリル（前記 C<sub>3</sub> ~<sub>8</sub> カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された C<sub>1</sub> ~<sub>6</sub> アルキルであり；

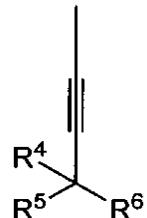
R<sup>3</sup> は、C<sub>1</sub> ~<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~<sub>6</sub> アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、オキソ、ハロ、- NO<sub>2</sub>、- N ( R<sup>b</sup> )<sub>2</sub>、- CN、- C ( O ) - N ( R<sup>b</sup> )<sub>2</sub>、- S ( O ) - N ( R<sup>b</sup> )<sub>2</sub>、- S - R<sup>b</sup>、- O - C ( O ) - R<sup>b</sup>、- C ( O ) - R<sup>b</sup>、- C ( O ) - O R<sup>b</sup>、- S ( O ) - R<sup>b</sup>、- S ( O )<sub>2</sub> - R<sup>b</sup>、- N ( R<sup>b</sup> ) - C ( O ) - N ( R<sup>b</sup> )<sub>2</sub>、 および - N ( R<sup>b</sup> ) - S ( O )<sub>2</sub> - R<sup>b</sup> からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された 5 ~ 6 員ヘテロアリール環であり、任意の C<sub>1</sub> ~<sub>6</sub> アルキル、C<sub>2</sub> ~<sub>6</sub> アルケニル、C<sub>2</sub> ~

<sub>6</sub> アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、R<sup>f</sup>、オキソ、ハロ、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-CN、-C(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-O-R<sup>b</sup>、-S-R<sup>b</sup>、-O-C(O)-R<sup>b</sup>、-C(O)-R<sup>b</sup>、-C(O)-O-R<sup>b</sup>、-S(O)-R<sup>b</sup>、-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>b</sup>、-N(R<sup>b</sup>)-C(O)-R<sup>b</sup>、-N(R<sup>b</sup>)-S(O)-R<sup>b</sup>、-N(R<sup>b</sup>)-C(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、および-N(R<sup>b</sup>)-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>b</sup>からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、請求項1に記載の化合物またはその塩。

## 【請求項36】

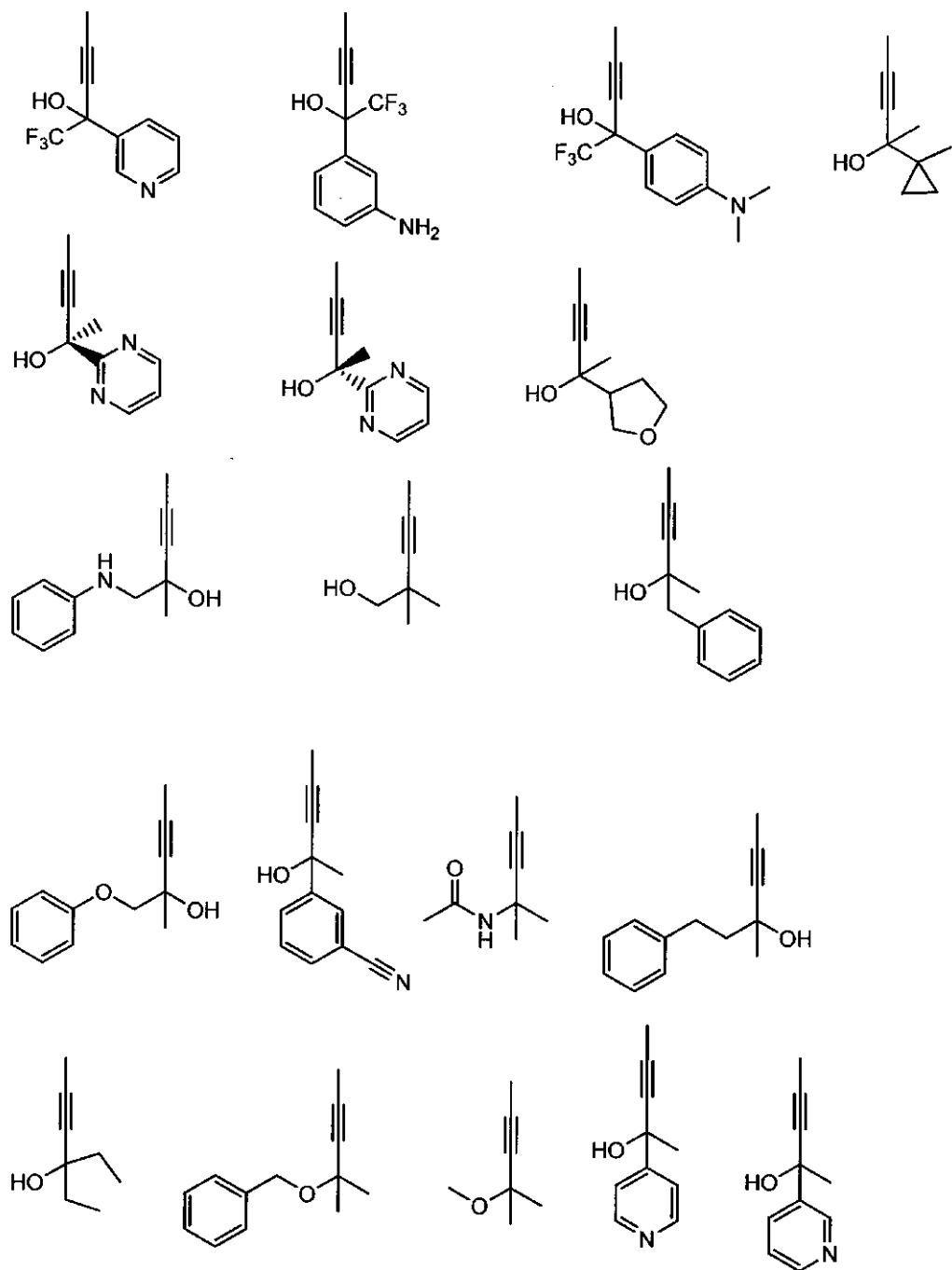
以下の基：

## 【化189】

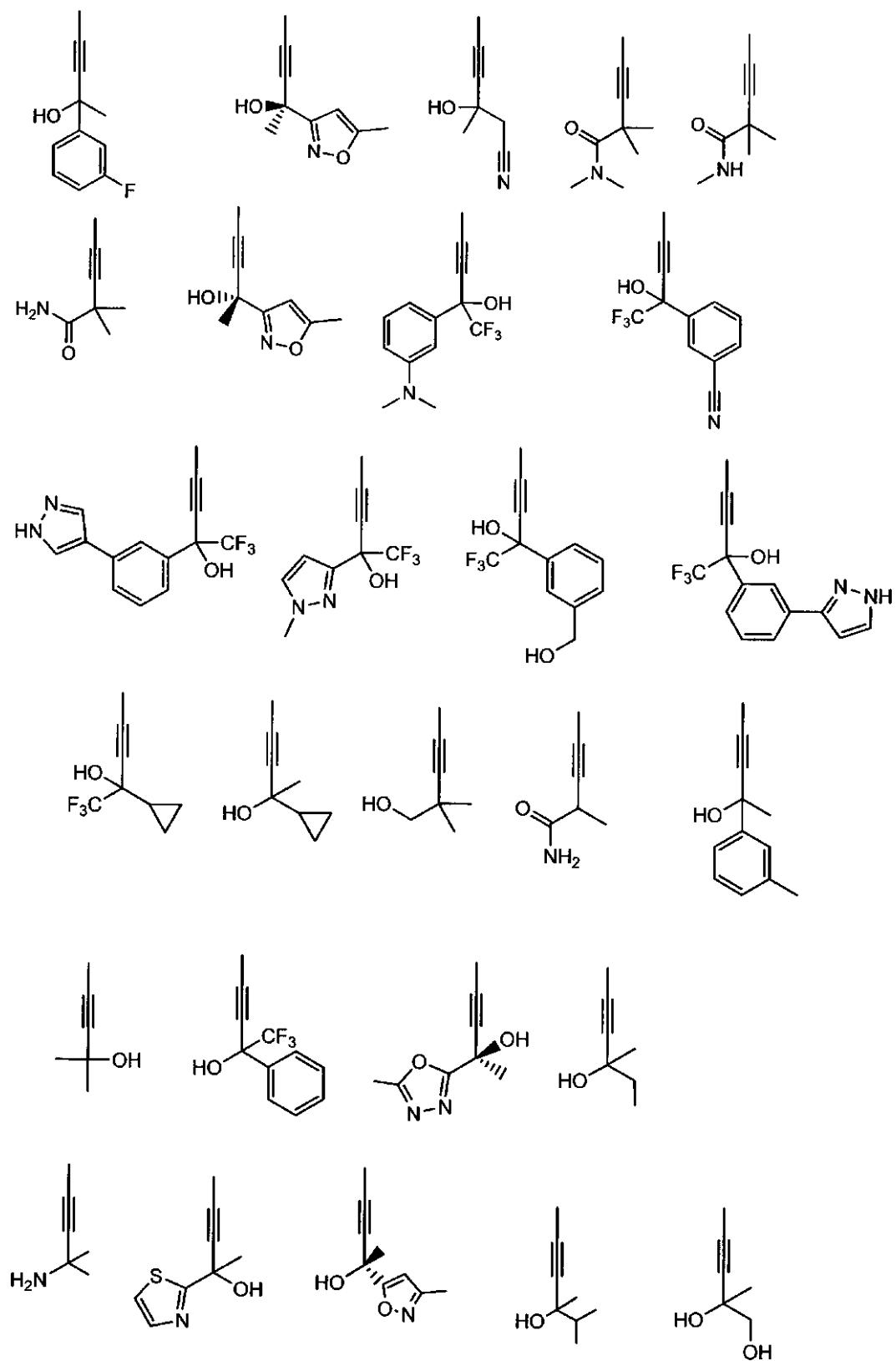


が、

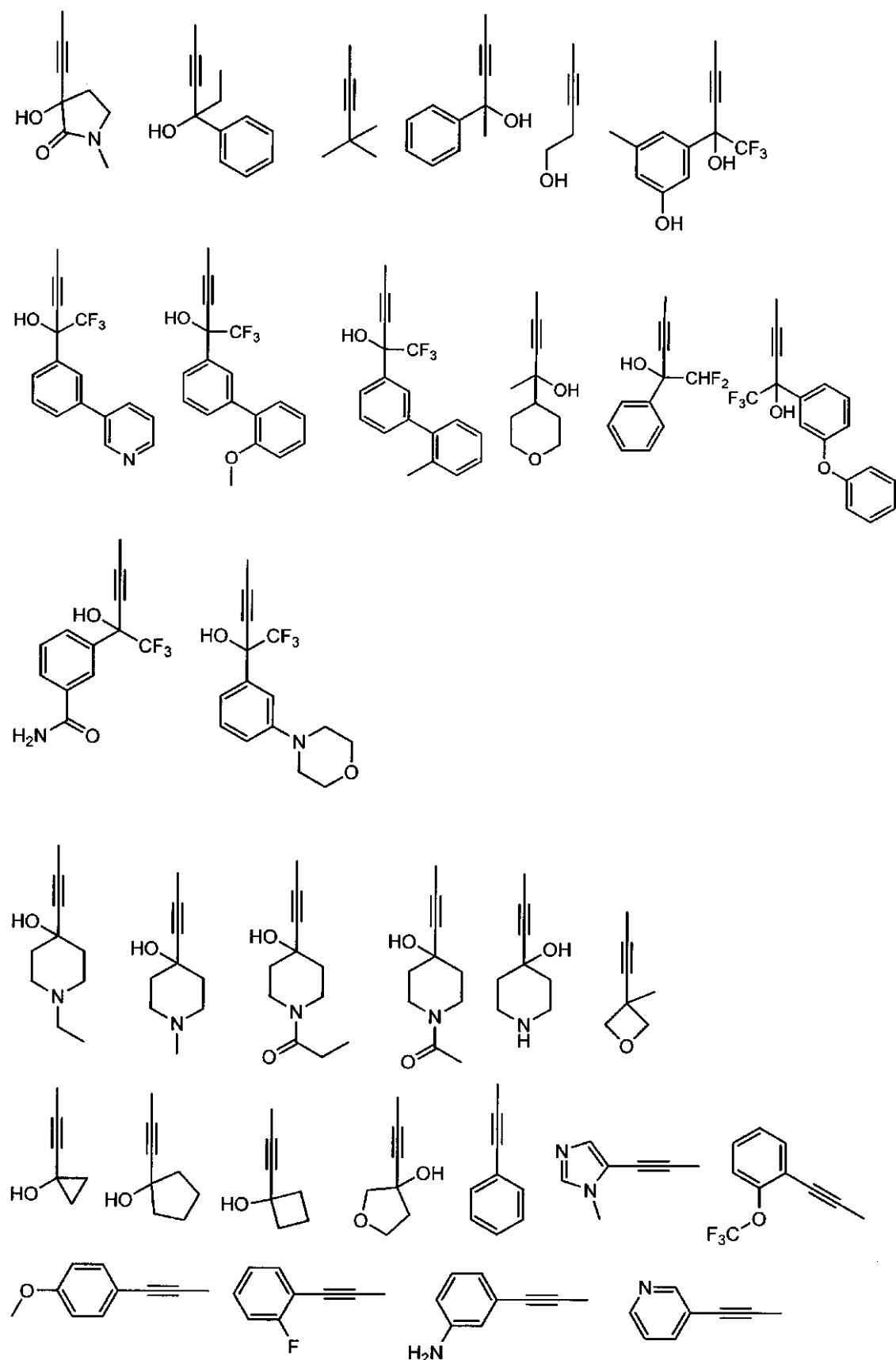
【化 1 9 0】



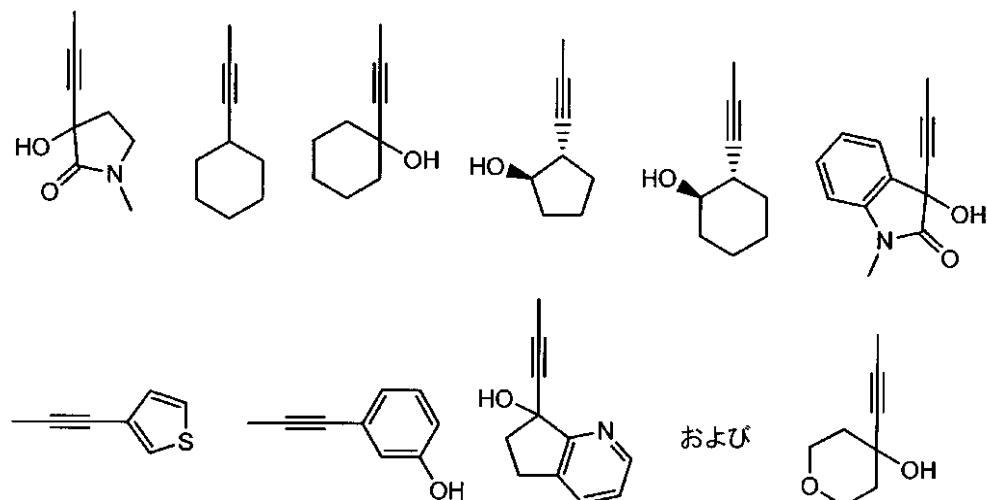
【化 1 9 1】



【化 1 9 2】



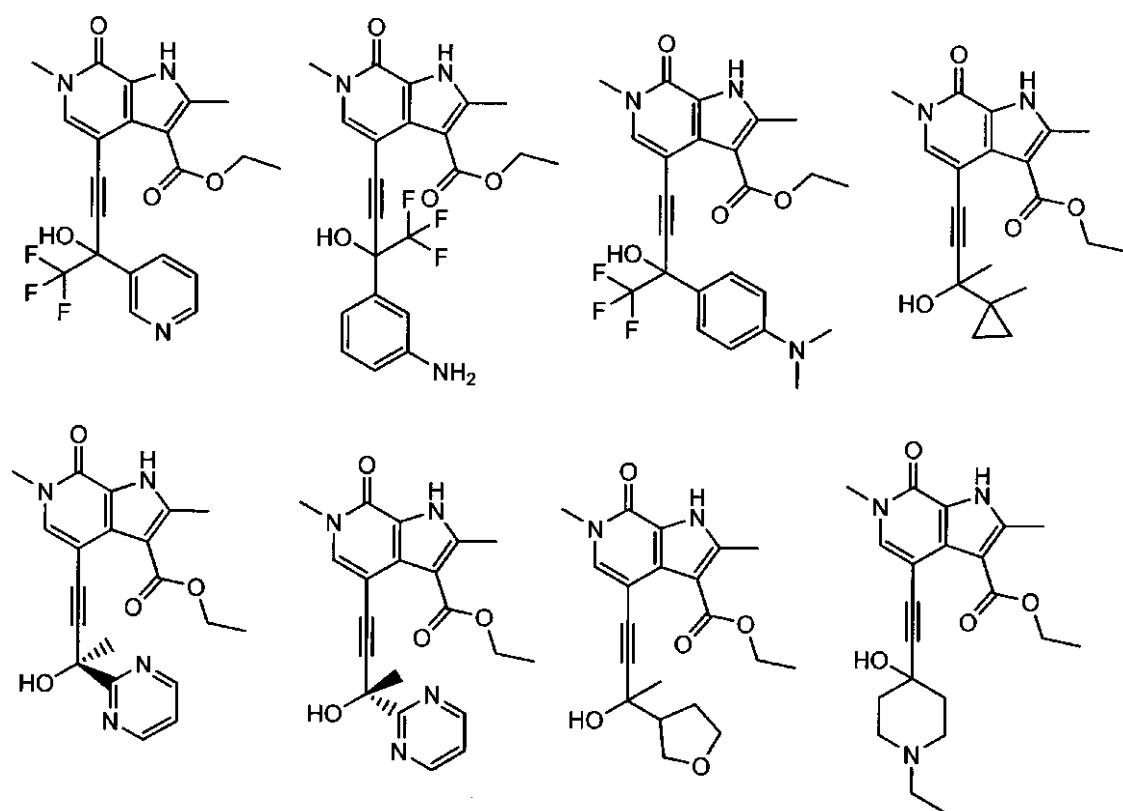
【化193】



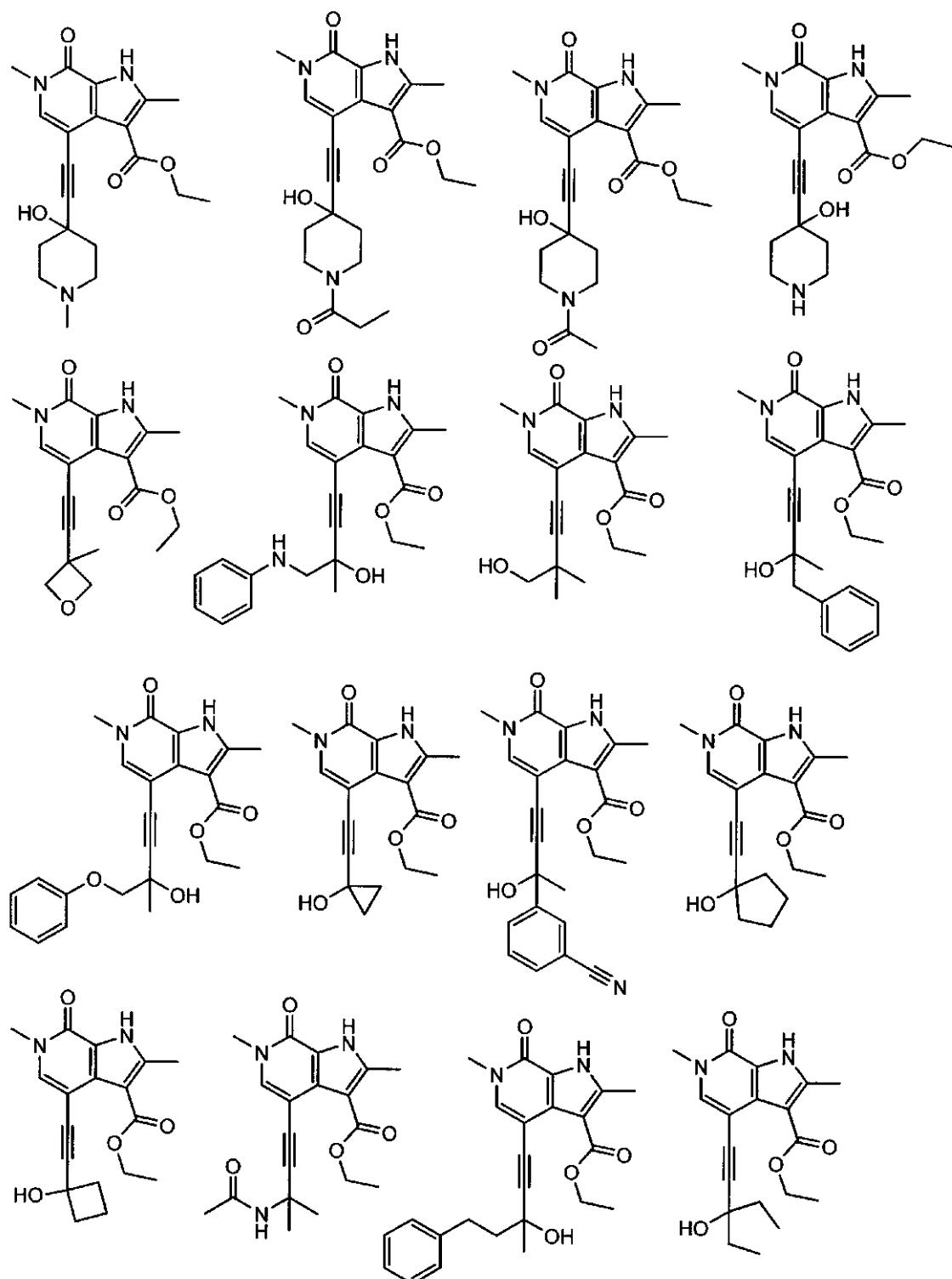
からなる群から選択される、請求項32～35のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

【請求項37】

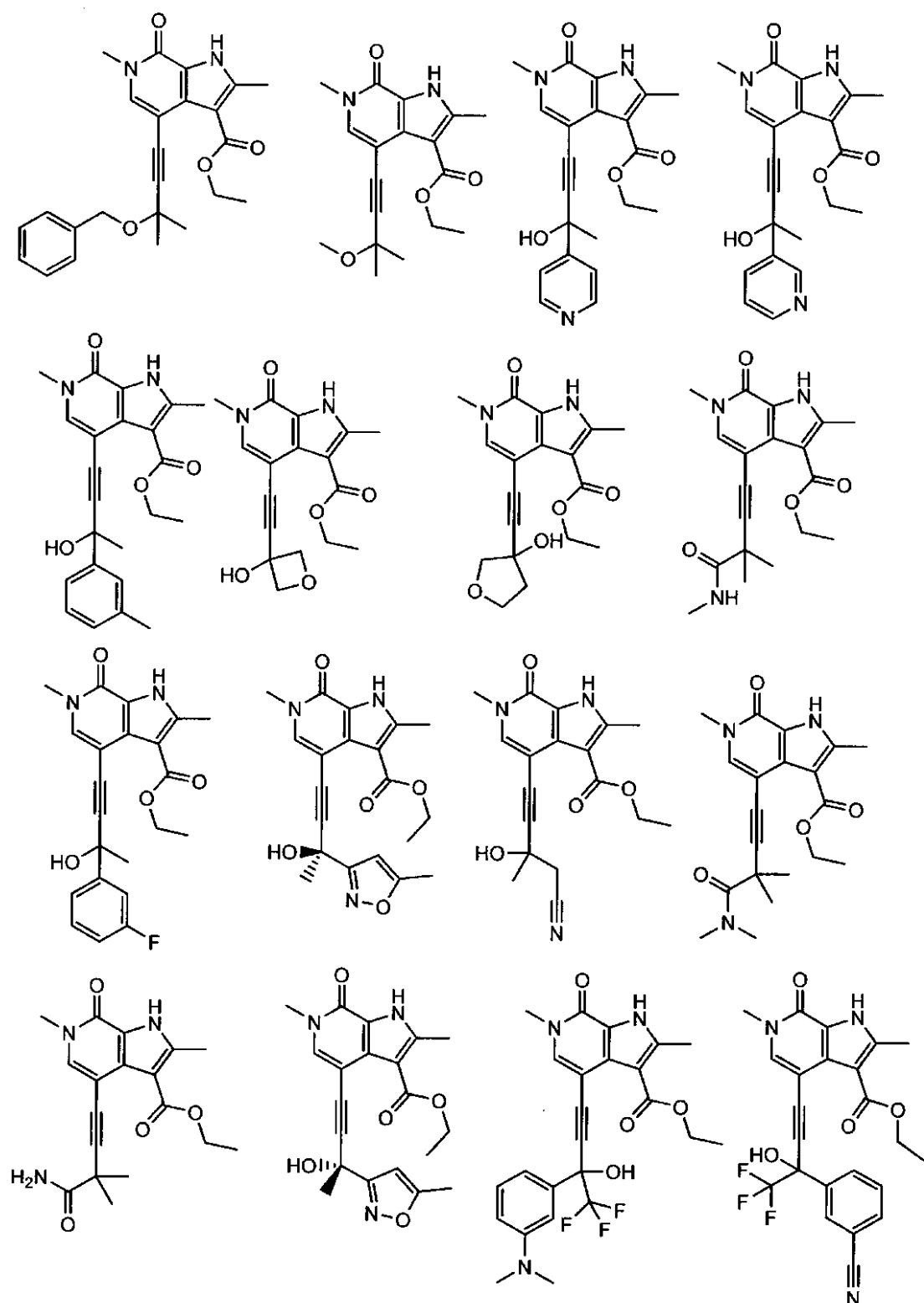
【化194】



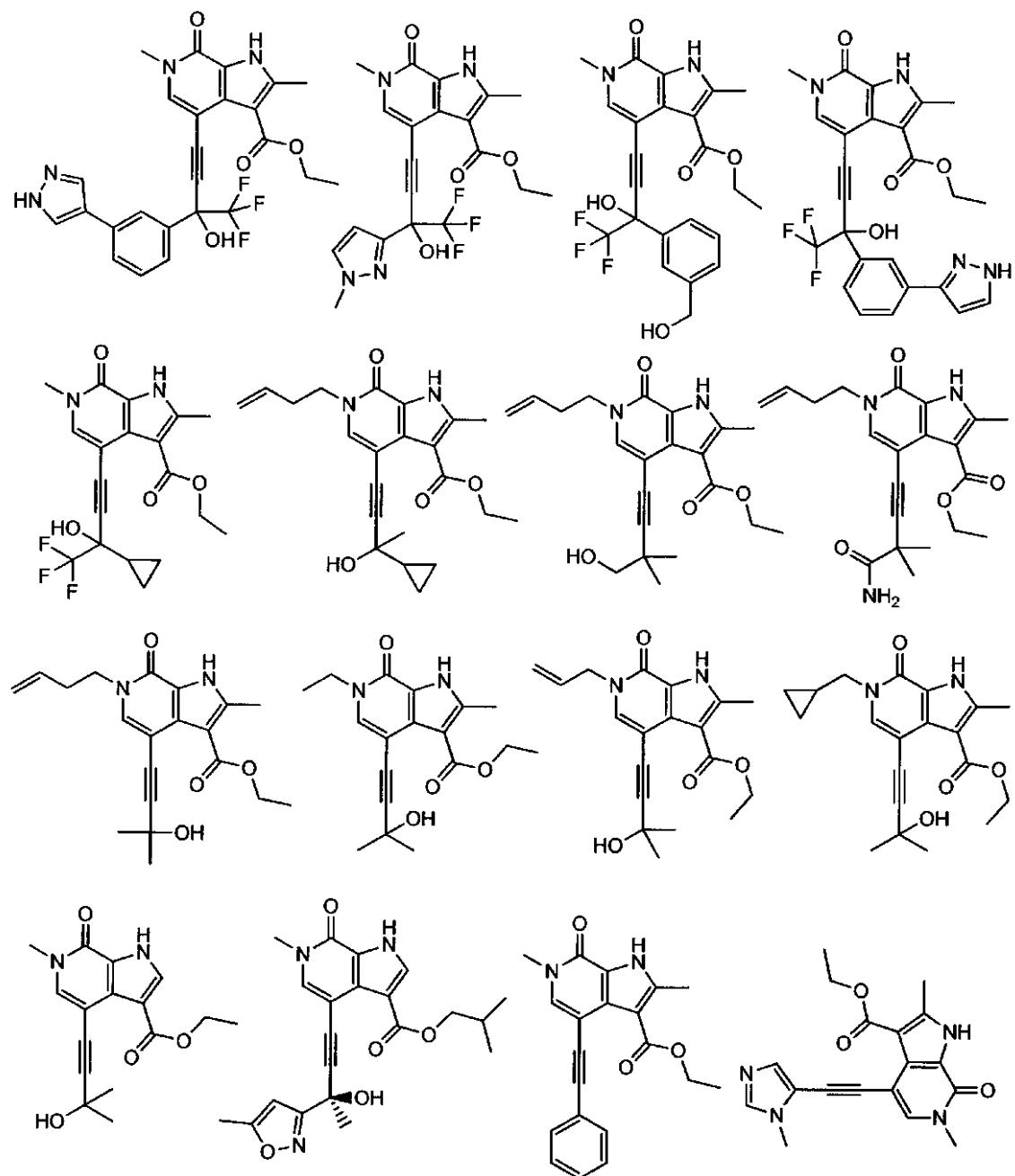
【化 1 9 5】



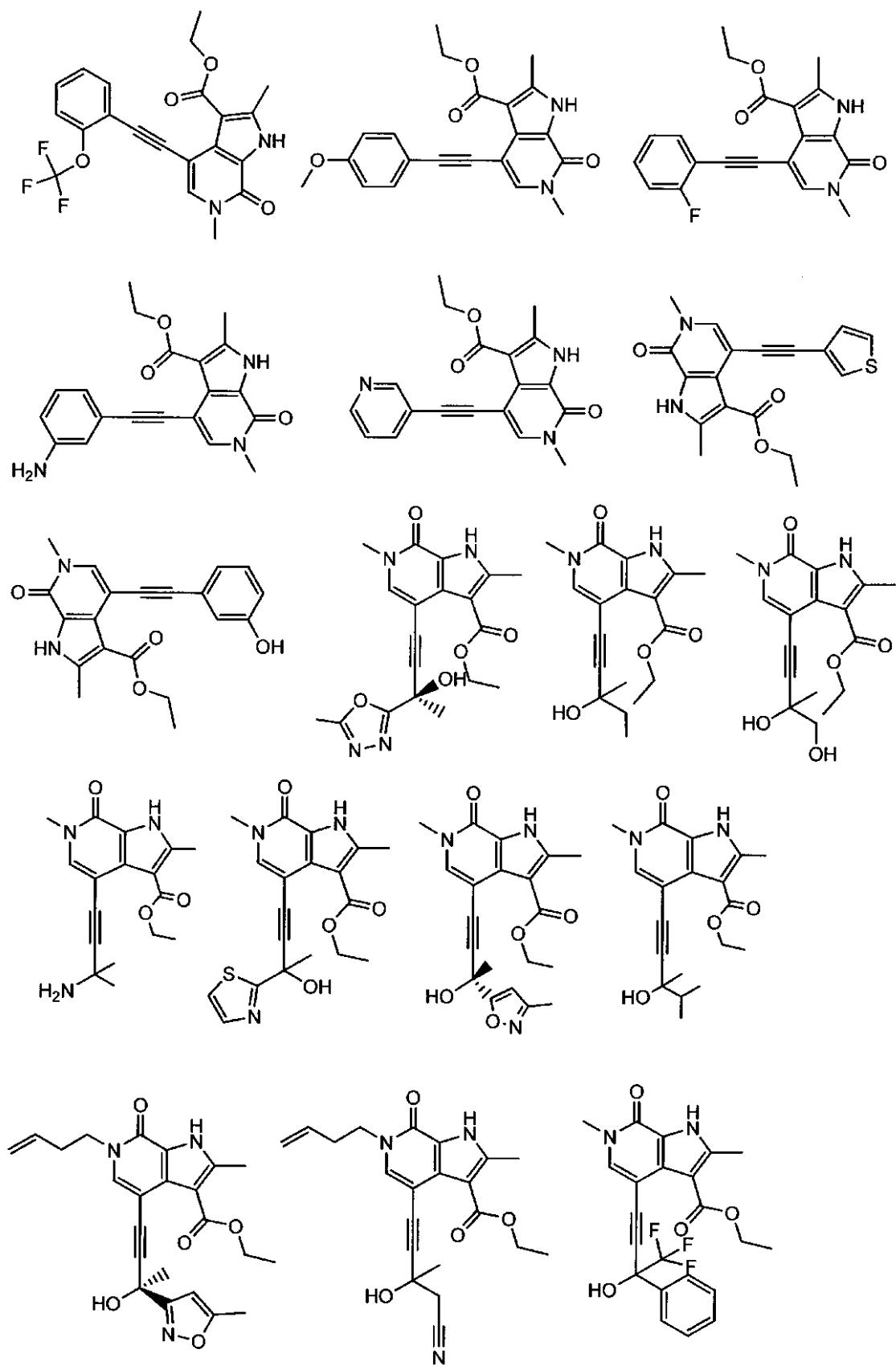
【化 1 9 6】



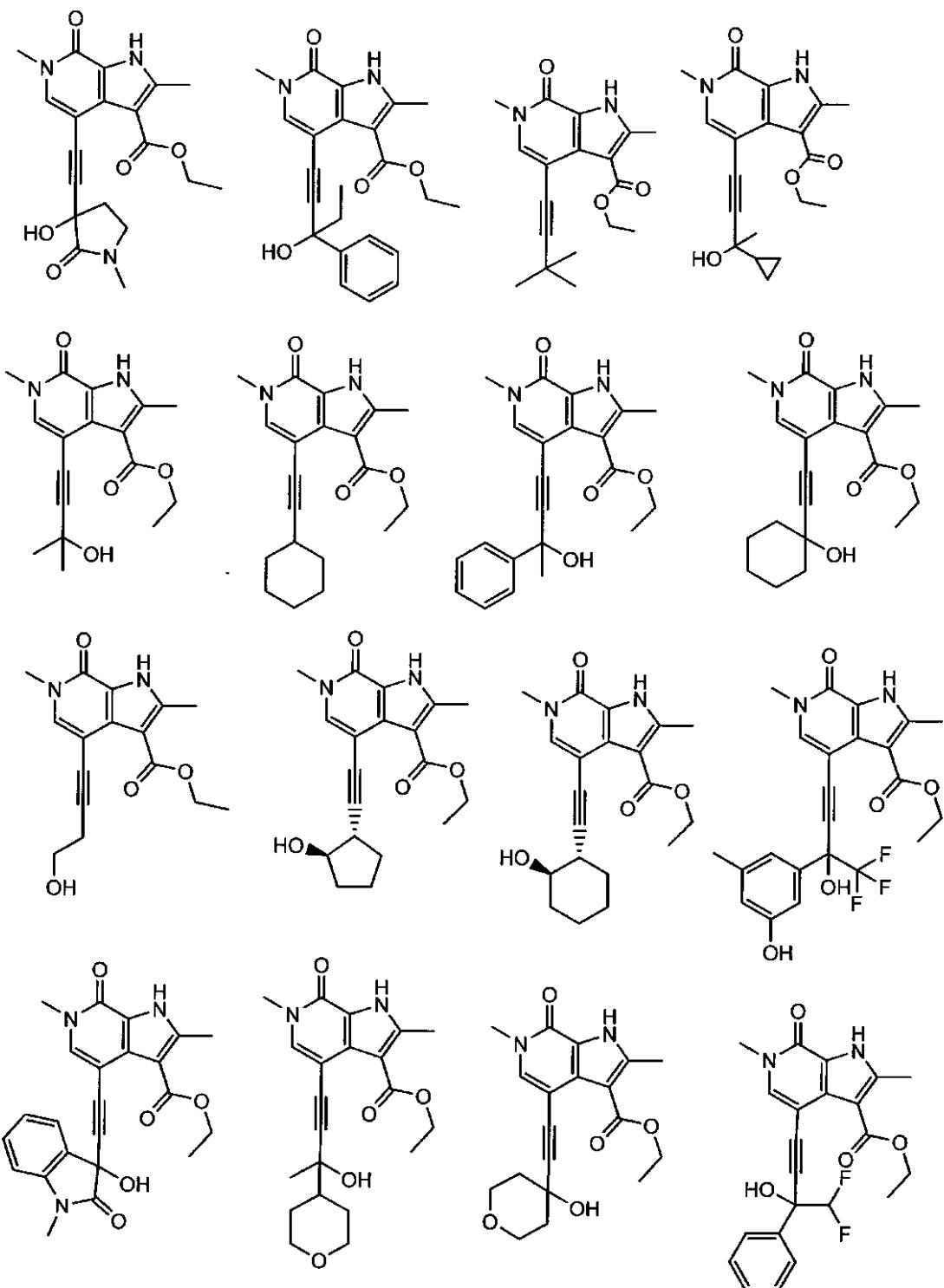
【化 197】



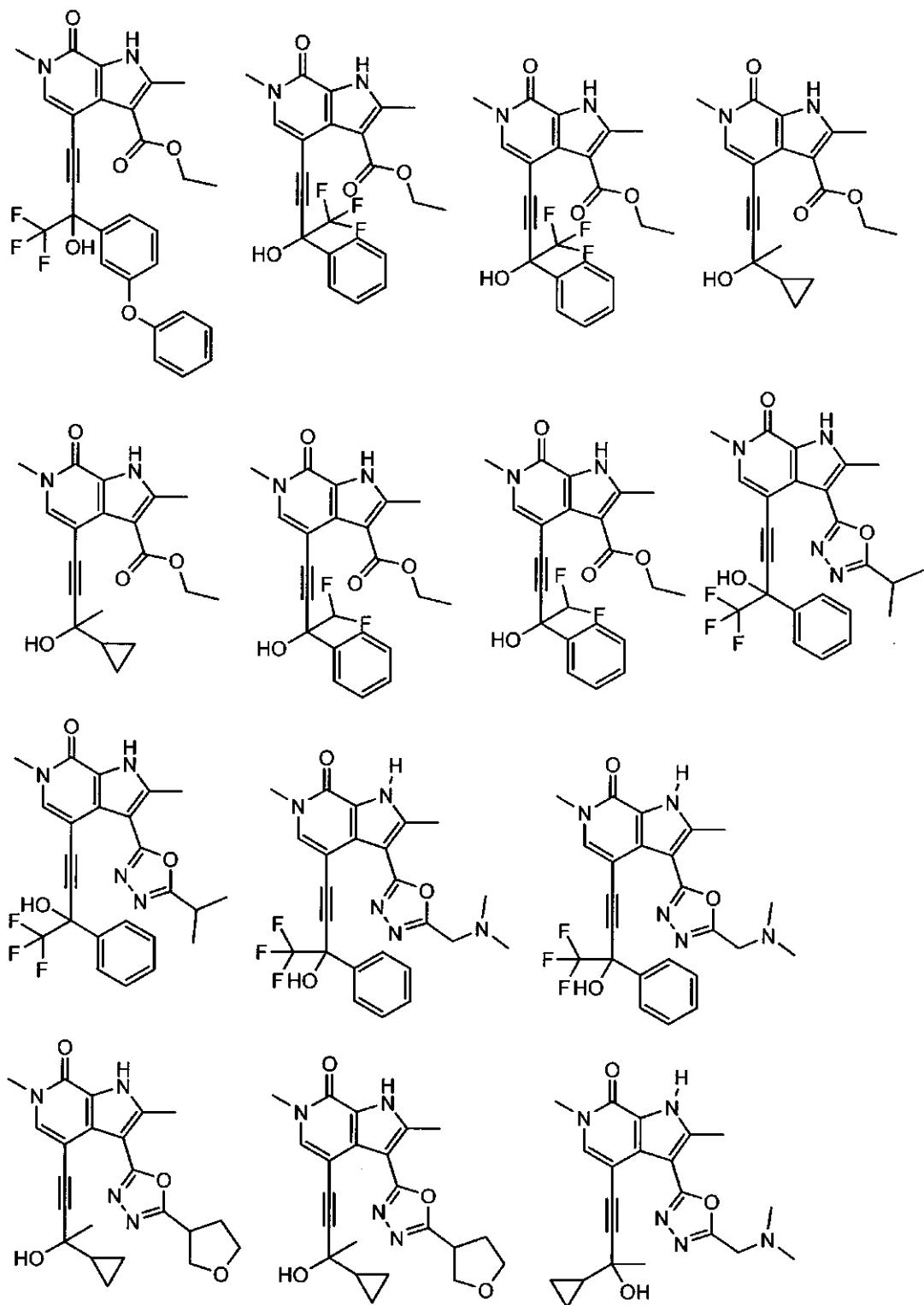
【化 1 9 8】



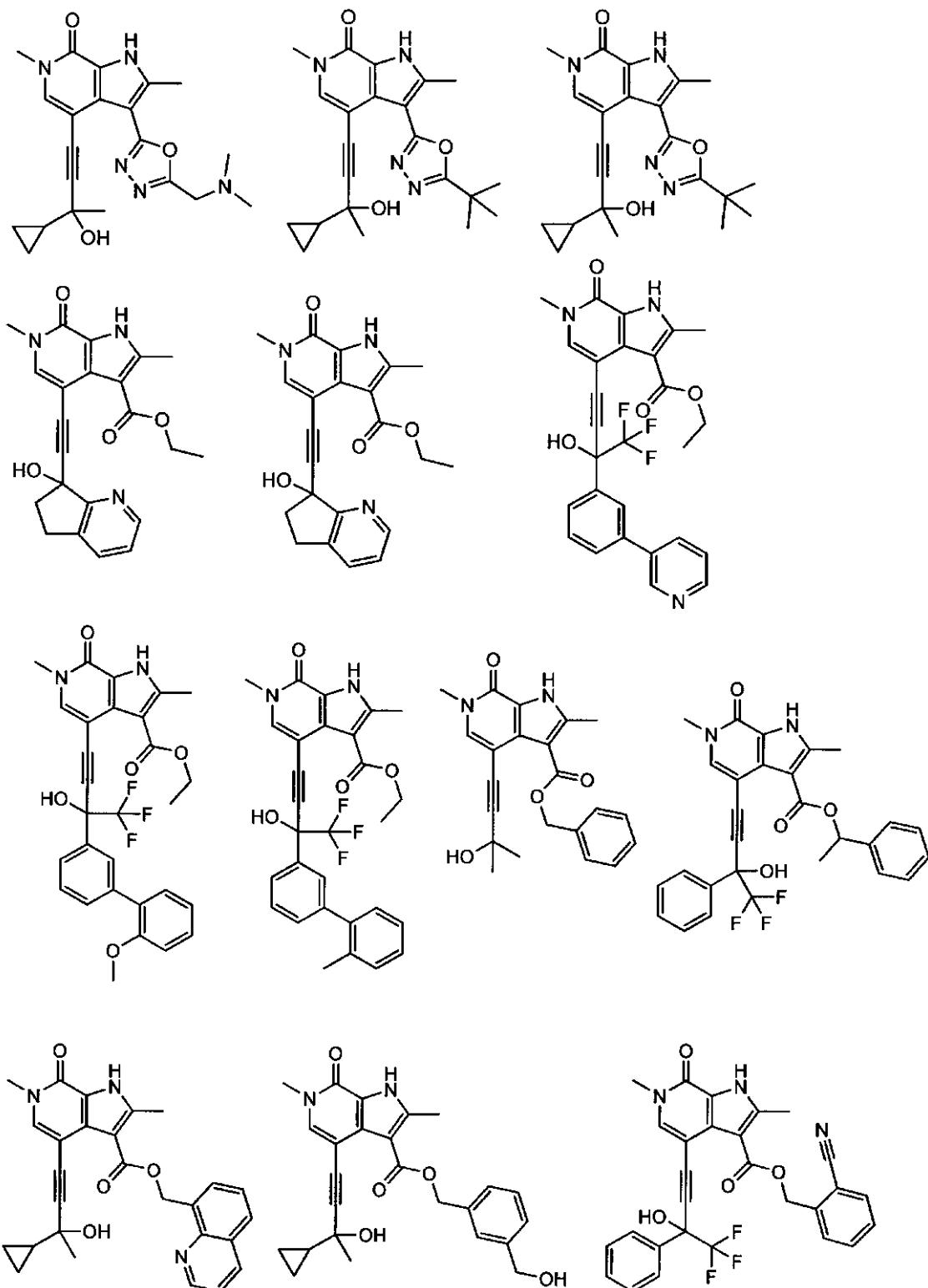
【化 1 9 9】



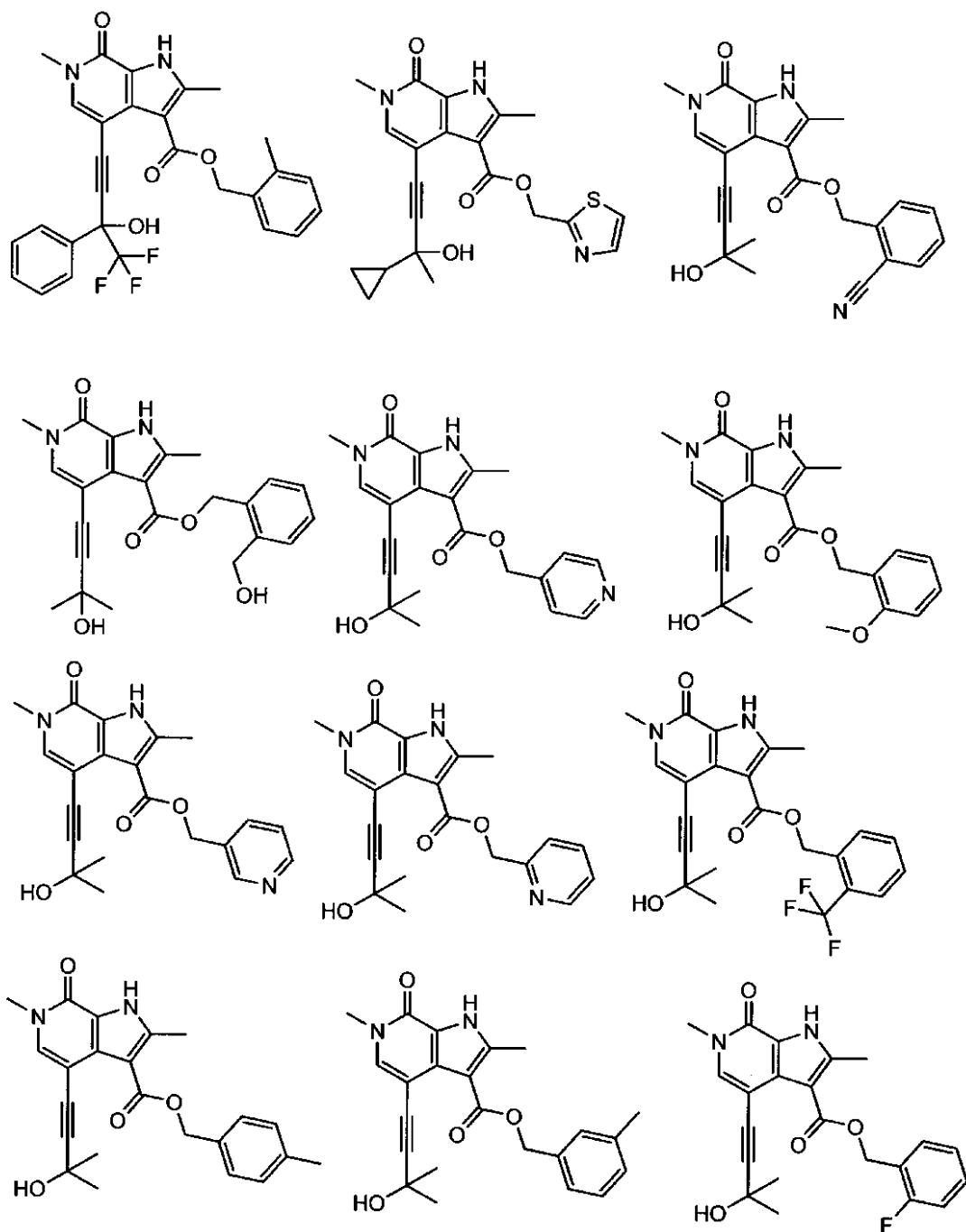
【化 2 0 0】



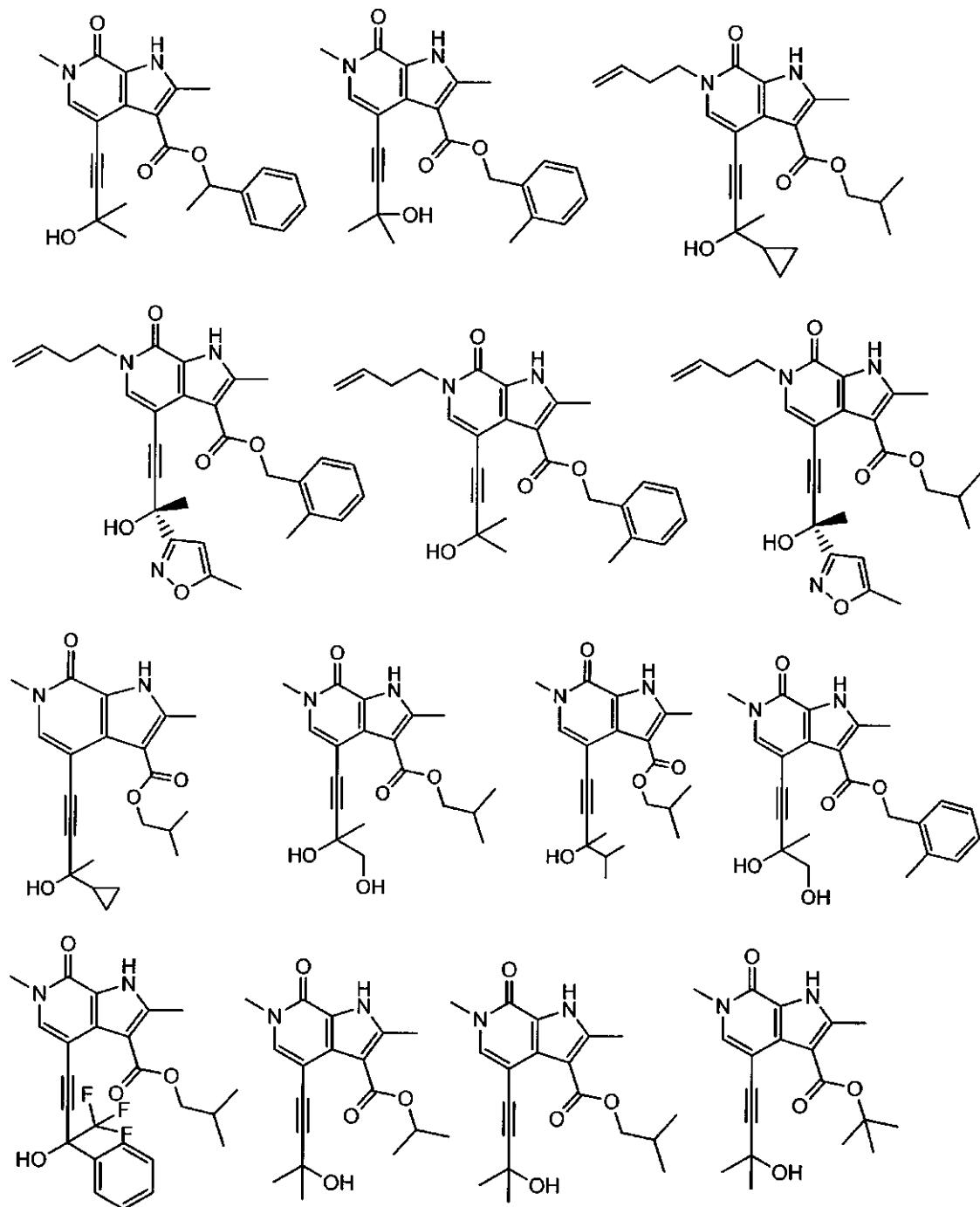
【化 2 0 1】



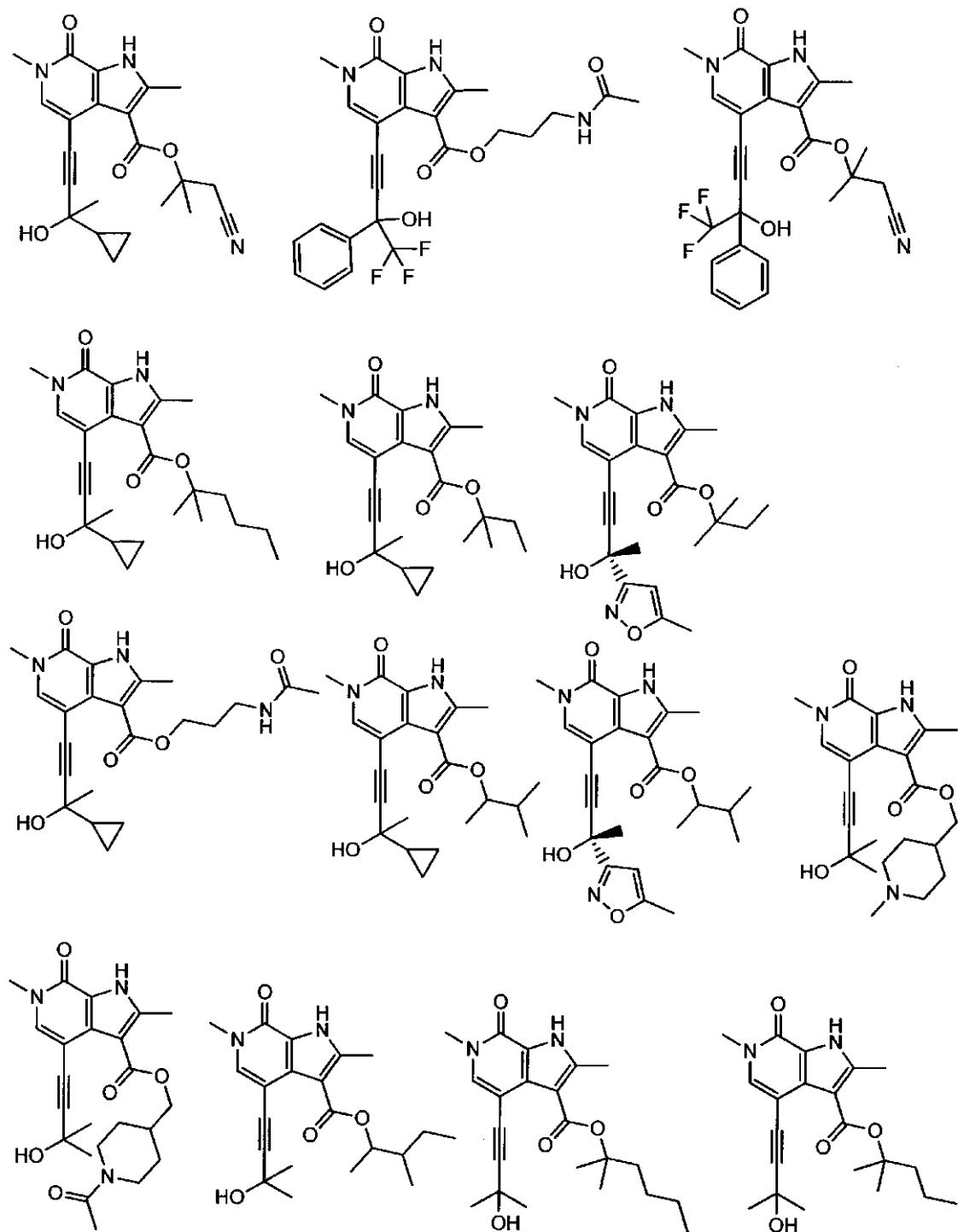
【化 2 0 2】



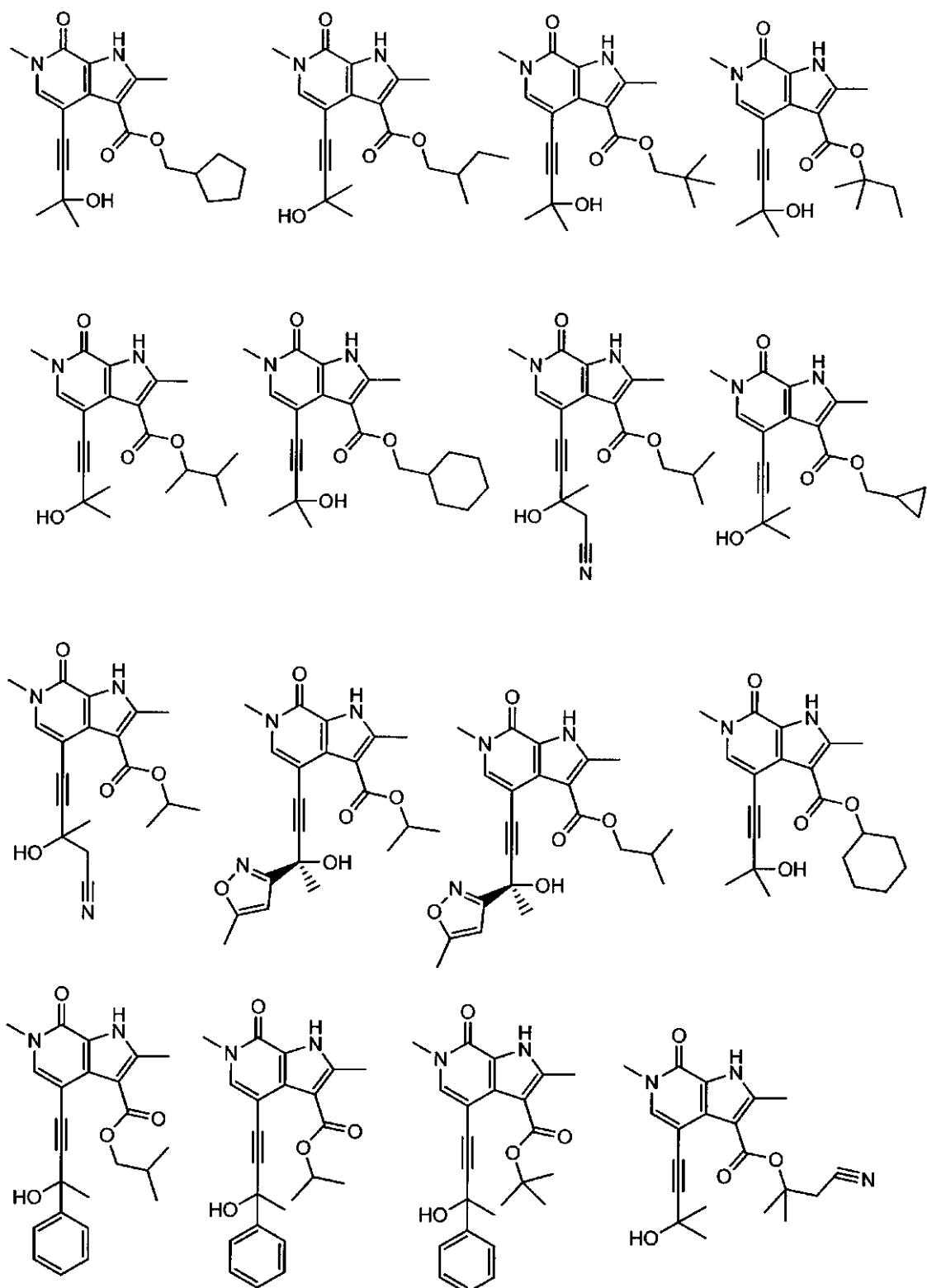
【化 2 0 3】



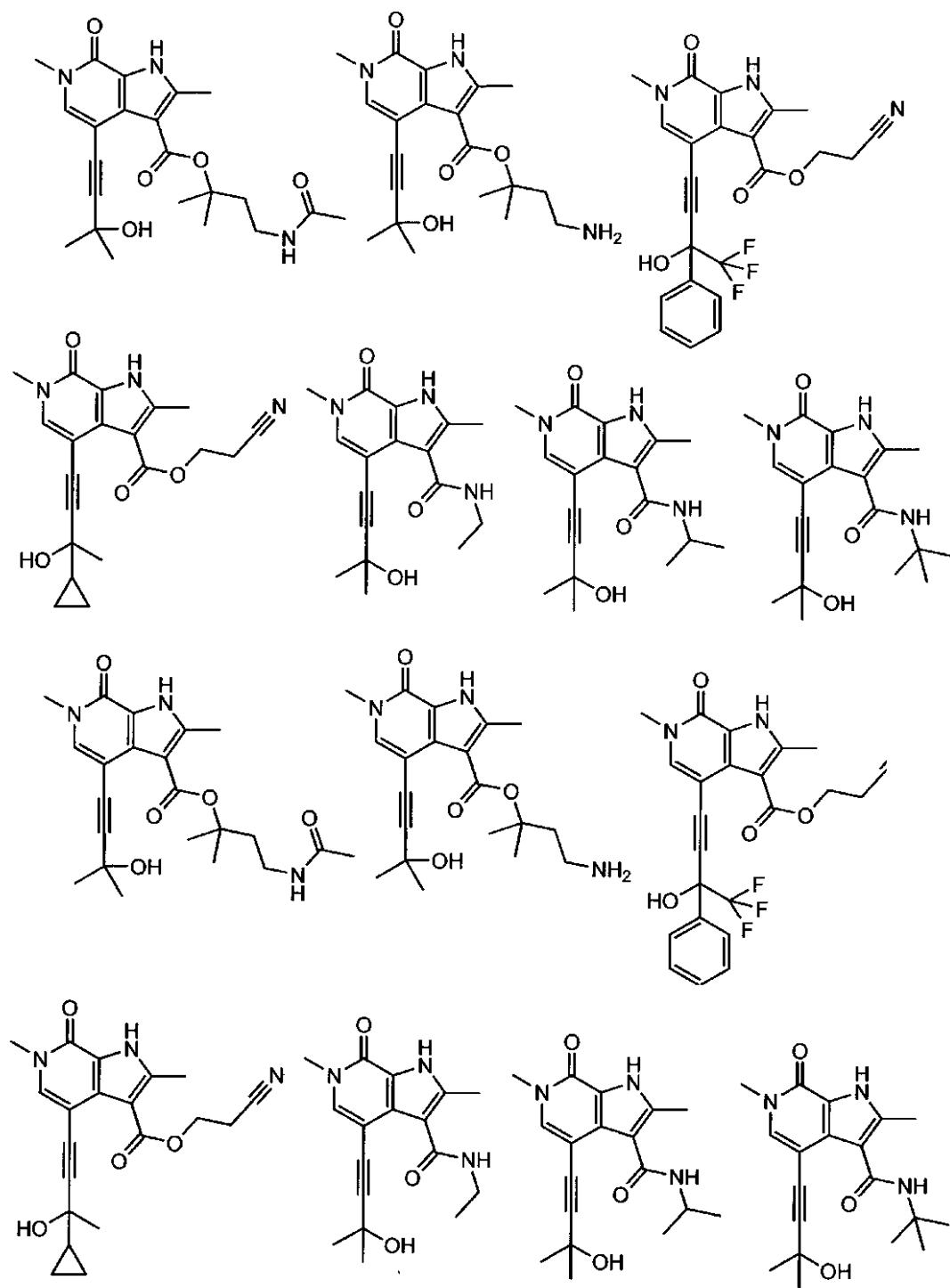
【化 2 0 4】



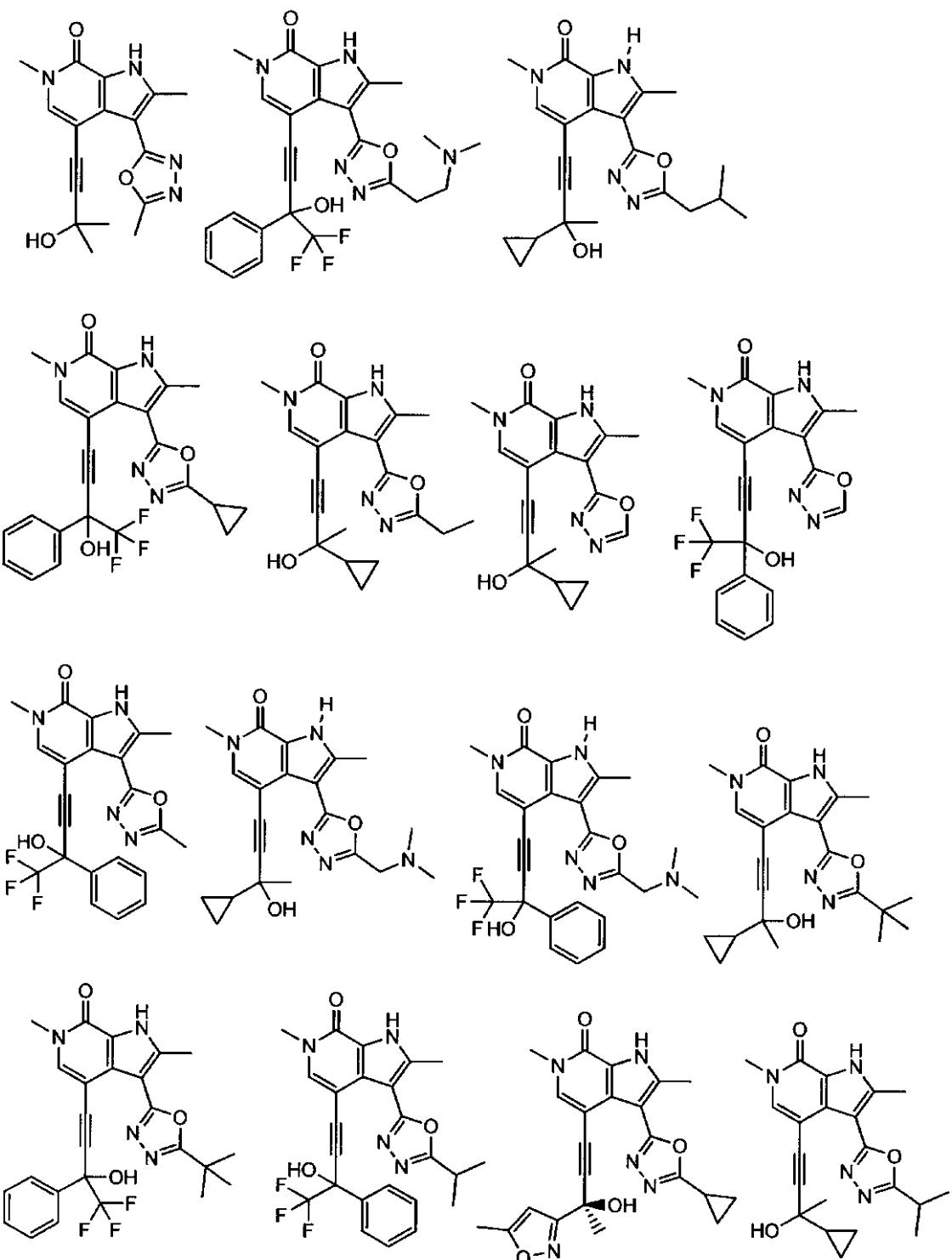
【化 2 0 5】



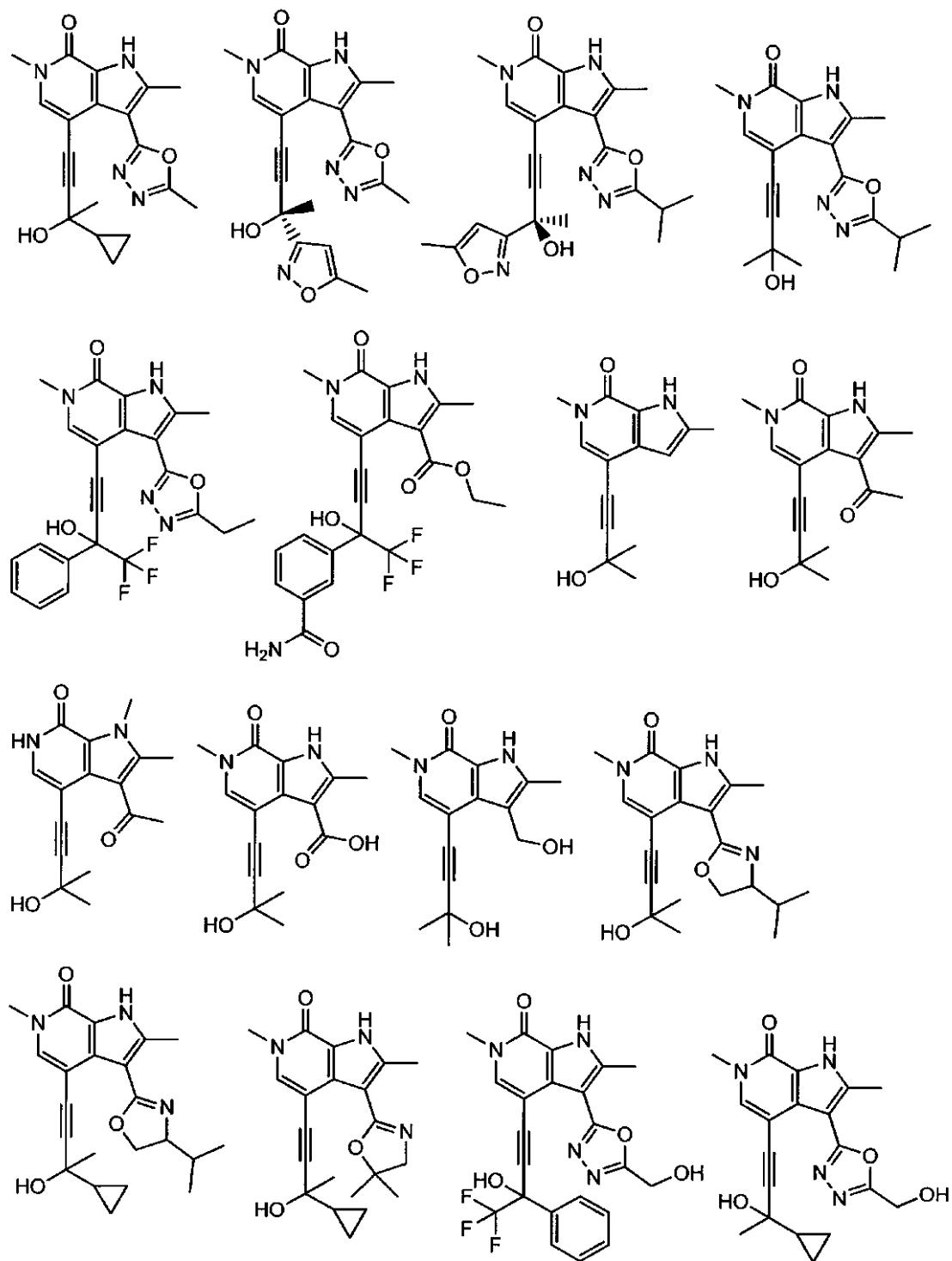
【化 2 0 6】



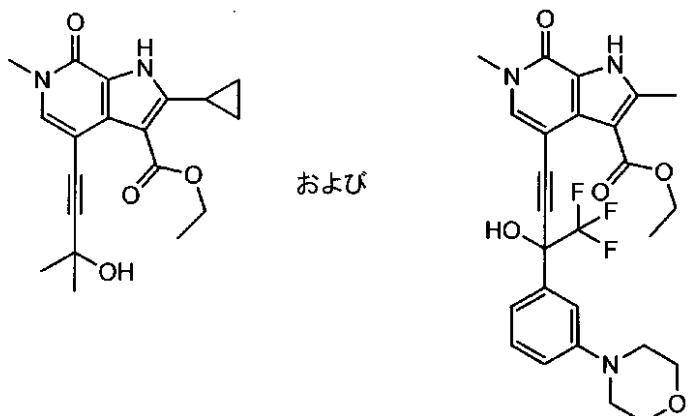
【化 2 0 7】



【化 2 0 8】



## 【化209】



からなる群から選択される、請求項1に記載の化合物またはその塩。

## 【請求項38】

請求項1～37のいずれか1項に記載の式(I)の化合物またはその薬学的に許容され得る塩および薬学的に許容され得るアジュvant、担体、またはビヒクルを含む組成物。

## 【請求項39】

さらなる治療剤をさらに含む、請求項38に記載の組成物。

## 【請求項40】

前記さらなる治療剤が化学療法剤である、請求項39に記載の組成物。

## 【請求項41】

動物におけるTAF1媒介障害を処置するための、請求項1～37のいずれか1項に記載の式(I)の化合物またはその塩を含む、組成物。

## 【請求項42】

前記障害が癌である、請求項41に記載の組成物。

## 【請求項43】

前記癌が、聴神経腫、急性白血病、急性リンパ球性白血病、急性骨髄球性白血病、急性T細胞白血病、基底細胞癌腫、胆管癌腫、膀胱癌、脳癌、乳癌、気管支原性癌腫、子宮頸癌、軟骨肉腫、脊索腫、絨毛癌腫、慢性白血病、慢性リンパ球性白血病、慢性骨髄球性白血病、慢性骨髓性白血病、結腸癌、結腸直腸癌、頭蓋咽頭腫、囊胞腺癌腫、びまん性大細胞型B細胞リンパ腫、増殖異常性変化、胎児性癌腫、子宮内膜癌、内皮肉腫、上衣腫、上皮癌腫、赤白血病、食道癌、エストロゲン-受容体陽性乳癌、本態性血小板血症、ユーイング腫瘍、線維肉腫、濾胞性リンパ腫、生殖細胞精巣癌、神経膠腫、膠芽腫、神経膠肉腫、重鎖病、頭頸部癌、血管芽細胞腫、ヘパトーム、肝細胞癌、ホルモン非感受性前立腺癌、平滑筋肉腫、白血病、脂肪肉腫、肺癌、リンパ管内皮肉腫、リンパ管肉腫、リンパ芽球性白血病、リンパ腫、T細胞またはB細胞起源のリンパ系悪性疾患、髄様癌腫、髄芽腫、黒色腫、髄膜腫、中皮腫、多発性骨髄腫、骨髄性白血病、骨髄腫、粘液肉腫、神経芽細胞腫、NUTミッドラインカルシノーマ(NMC)、非小細胞肺癌、乏突起膠腫、口腔癌、骨原性肉腫、卵巣癌、膵臓癌、乳頭腺癌腫、乳頭状癌腫、松果体腫、真性赤血球增加症、前立腺癌、直腸癌、腎細胞癌腫、網膜芽細胞腫、横紋筋肉腫、肉腫、脂腺癌腫、セミノーマ、皮膚癌、小細胞性肺癌腫、固形腫瘍(癌腫および肉腫)、小細胞肺癌、胃癌、扁平上皮癌腫、滑膜腫、汗腺癌腫、甲状腺癌、ワルデンシュトロームマクログロブリン血症、精巣腫瘍、子宮癌、およびウィルムス腫瘍から選択される、請求項42に記載の組成物。

## 【請求項44】

前記障害が癌であり、前記癌が肺癌、乳癌、膵臓癌、結腸直腸癌、および黒色腫から選択される、請求項42に記載の組成物。

## 【請求項45】

医薬療法における使用のための、請求項 1 ~ 3 7 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその塩を含む組成物。

【請求項 4 6】

TAF1 媒介障害の予防的処置または治療的処置のための、請求項 1 ~ 3 7 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその塩を含む組成物。

【請求項 4 7】

動物における TAF1 媒介障害を処置するための医薬を調製するための、請求項 1 ~ 3 7 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその塩の使用。

【請求項 4 8】

TAF1 の阻害を必要とする動物において TAF1 を阻害するための、請求項 1 ~ 3 7 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその塩を含む、組成物。

【請求項 4 9】

TAF1 を阻害するための、請求項 1 ~ 3 7 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその塩を含む組成物。

【請求項 5 0】

TAF1 の阻害を必要とする動物において TAF1 を阻害するための医薬を調製するための、請求項 1 ~ 3 7 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその塩の使用。

【請求項 5 1】

動物における癌を処置するための、TAF1 のインヒビターを含む、組成物。

【請求項 5 2】

前記癌が、聴神経腫、急性白血病、急性リンパ球性白血病、急性骨髄球性白血病、急性T細胞白血病、基底細胞癌腫、胆管癌腫、膀胱癌、脳癌、乳癌、気管支原性癌腫、子宮頸癌、軟骨肉腫、脊索腫、絨毛癌腫、慢性白血病、慢性リンパ球性白血病、慢性骨髄球性白血病、慢性骨髓性白血病、結腸癌、結腸直腸癌、頭蓋咽頭腫、囊胞腺癌腫、びまん性大細胞型B細胞リンパ腫、増殖異常性変化、胎児性癌腫、子宮内膜癌、内皮肉腫、上衣腫、上皮癌腫、赤白血病、食道癌、エストロゲン - 受容体陽性乳癌、本態性血小板血症、ユーイング腫瘍、線維肉腫、濾胞性リンパ腫、生殖細胞精巣癌、神経膠腫、膠芽腫、神経膠肉腫、重鎖病、頭頸部癌、血管芽細胞腫、ヘパトーム、肝細胞癌、ホルモン非感受性前立腺癌、平滑筋肉腫、白血病、脂肪肉腫、肺癌、リンパ管内皮肉腫、リンパ管肉腫、リンパ芽球性白血病、リンパ腫、T細胞またはB細胞起源のリンパ系悪性疾患、髄様癌腫、髄芽腫、黒色腫、髄膜腫、中皮腫、多発性骨髄腫、骨髓性白血病、骨髓腫、粘液肉腫、神経芽細胞腫、NUTミッドラインカルシノーマ (NMC)、非小細胞肺癌、乏突起膠腫、口腔癌、骨原性肉腫、卵巣癌、膀胱癌、乳頭腺癌腫、乳頭状癌腫、松果体腫、真性赤血球增加症、前立腺癌、直腸癌、腎細胞癌腫、網膜芽細胞腫、横紋筋肉腫、肉腫、脂腺癌腫、セミノーマ、皮膚癌、小細胞性肺癌腫、 固形腫瘍 (癌腫および肉腫)、小細胞性肺癌、胃癌、扁平上皮癌腫、滑膜腫、汗腺癌腫、甲状腺癌、ワルデンシュトトレームマクログロブリン血症、精巣腫瘍、子宮癌、およびウィルムス腫瘍から選択される、請求項 5 1 に記載の組成物。

【請求項 5 3】

前記 TAF1 のインヒビターが TAF1 に特異的に結合して TAF1 ブロモドメインの活性を阻害する、請求項 5 1 ~ 5 2 のいずれか 1 項に記載の組成物。

【請求項 5 4】

医薬療法における使用のための、TAF1 のインヒビターを含む組成物。

【請求項 5 5】

癌の予防的処置または治療的処置のための、TAF1 のインヒビターを含む組成物。

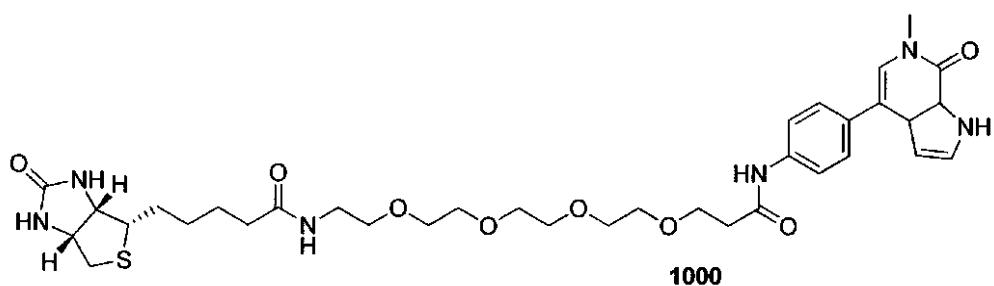
【請求項 5 6】

動物における癌を処置するための医薬を調製するための、TAF1 のインヒビターの使用。

【請求項 5 7】

化合物：

【化210】



またはその塩。

【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0314

【補正方法】変更

【補正の内容】

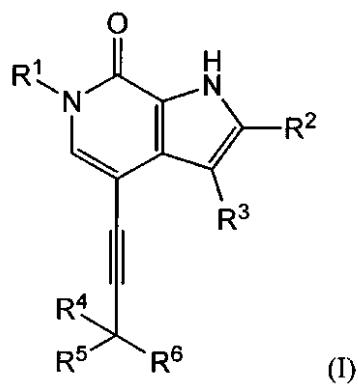
【0314】

多数の実施形態を記載しているが、これらの実施例を、本明細書中に記載の化合物および方法を利用する他の実施形態を得るために変更することができる。したがって、本発明の範囲を、例で示した特定の実施形態ではなく添付の特許請求の範囲によって定義すべきである。

本発明の実施形態の例として、以下の項目が挙げられる。

(項目1)式(I)：

【化176】

(式中、

R<sup>1</sup>は、C<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>2～6</sub>アルケニル、C<sub>2～6</sub>アルキニル、カルボシクリル、またはヘテロシクリルであり、前記C<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>2～6</sub>アルケニル、C<sub>2～6</sub>アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、ハロ、シアノ、C<sub>1～3</sub>アルコキシ、およびC<sub>3～8</sub>カルボシクリル（前記C<sub>3～8</sub>カルボシクリルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

R<sup>2</sup>は、C<sub>1～6</sub>アルキル、C<sub>2～6</sub>アルケニル、C<sub>2～6</sub>アルキニル、カルボシクリ

ル、またはヘテロシクリルであり、前記 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、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、ハロ、シアノ、C<sub>1</sub> ~ 3 アルコキシ、および C<sub>3</sub> ~ 8 カルボシクリル（前記 C<sub>3</sub> ~ 8 カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

R<sup>3</sup> は、H、C<sub>1</sub> ~ 6 アルキル、-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-C(=O)R<sup>a</sup>、-C(=O)O R<sup>a</sup>、または 5 ~ 6 員ヘテロアリール環であり、前記 C<sub>1</sub> ~ 6 アルキルおよび 5 ~ 6 員ヘテロアリール環は、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、カルボシクリル、ヘテロシクリル、オキソ、ハロ、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-CN、-C(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-O-O-R<sup>b</sup>、-S(O)-R<sup>b</sup>、-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>b</sup>、-N(R<sup>b</sup>)-C(O)-R<sup>b</sup>、-N(R<sup>b</sup>)-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>b</sup>、-N(R<sup>b</sup>)-C(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、および -N(R<sup>b</sup>)-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>b</sup> からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され、任意の 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、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、R<sup>f</sup>、オキソ、ハロ、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-CN、-C(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-O-O-R<sup>b</sup>、-S-R<sup>b</sup>、-O-C(O)-R<sup>b</sup>、-C(O)-R<sup>b</sup>、-C(O)-O-R<sup>b</sup>、-S(O)-R<sup>b</sup>、-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>b</sup>、-N(R<sup>b</sup>)-C(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、および -N(R<sup>b</sup>)-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>b</sup> からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

R<sup>a</sup> は、水素、C<sub>1</sub> ~ 10 アルキル、C<sub>2</sub> ~ 10 アルケニル、C<sub>2</sub> ~ 10 アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から選択され、任意の C<sub>1</sub> ~ 10 アルキル、C<sub>2</sub> ~ 10 アルケニル、C<sub>2</sub> ~ 10 アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、R<sup>d</sup>、オキソ、ハロ、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-CN、-C(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-O-O-R<sup>b</sup>、-S-R<sup>b</sup>、-O-C(O)-R<sup>b</sup>、-C(O)-R<sup>b</sup>、-C(O)-O-R<sup>b</sup>、-S(O)-R<sup>b</sup>、-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>b</sup>、-N(R<sup>b</sup>)-C(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、および -N(R<sup>b</sup>)-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>b</sup> からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；

各々の R<sup>b</sup> は、水素、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> ~ 6 アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルから独立して選択され、各々の 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> ~ 6 アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、R<sup>c</sup>、オキソ、ハロ、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>c</sup>)<sub>2</sub>、-CN、-C(O)-N(R<sup>c</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)-N(R<sup>c</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>-N(R<sup>c</sup>)<sub>2</sub>、-O-O-R<sup>c</sup>、-S-R<sup>c</sup>、-O-C(O)-R<sup>c</sup>、-C(O)-R<sup>c</sup>、-C(O)-O-R<sup>c</sup>、-S(O)-R<sup>c</sup>、-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>c</sup>、-N(R<sup>c</sup>)-C(O)-N(R<sup>c</sup>)<sub>2</sub>、および -N(R<sup>c</sup>)-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>c</sup> からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；または、2 つの R<sup>b</sup> が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、および C<sub>1</sub> ~ 3 アルキル（前記 C<sub>1</sub> ~ 3 アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し；

各々の R<sup>c</sup> は、水素、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、カルボシクリル、およびヘテロシクリルから独立して選択され、各々の 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、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシ、C<sub>1</sub> ~ 6 アルコキシ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、および C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキル（前記 C<sub>1</sub> ~ C<sub>6</sub> アルキルは、オキソ

およびハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される)からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され;または、2つのR<sup>c</sup>が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、およびC<sub>1~3</sub>アルキル(前記C<sub>1~3</sub>アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される)からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し;

各々のR<sup>d</sup>は、C<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、C<sub>1~6</sub>アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、各々のC<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、C<sub>1~6</sub>アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、R<sup>e</sup>、オキソ、ハロ、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>e</sup>)<sub>2</sub>、-CN、-C(O)-N(R<sup>e</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)-N(R<sup>e</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>-N(R<sup>e</sup>)<sub>2</sub>、-N(R<sup>e</sup>)<sub>2</sub>、-O-R<sup>e</sup>、-S-R<sup>e</sup>、-O-C(O)-R<sup>e</sup>、-C(O)-R<sup>e</sup>、-C(O)-OR<sup>c</sup>、-S(O)-R<sup>c</sup>、-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>c</sup>、-N(R<sup>c</sup>)-C(O)-R<sup>c</sup>、-N(R<sup>c</sup>)-S(O)-R<sup>c</sup>、-N(R<sup>c</sup>)-C(O)-N(R<sup>c</sup>)<sub>2</sub>、および-N(R<sup>e</sup>)-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>e</sup>からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され、

各々のR<sup>e</sup>は、水素、C<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、C<sub>1~6</sub>アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、各々のC<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、C<sub>1~6</sub>アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシ、C<sub>1~6</sub>アルコキシ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、およびC<sub>1~6</sub>アルキル(前記C<sub>1~6</sub>アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される)からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され;または、2つのR<sup>e</sup>が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、およびC<sub>1~3</sub>アルキル(前記C<sub>1~3</sub>アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される)からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し;

各々のR<sup>f</sup>は、C<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、C<sub>1~6</sub>アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、各々のC<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、C<sub>1~6</sub>アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシ、C<sub>1~6</sub>アルコキシ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、およびC<sub>1~6</sub>アルキル(前記C<sub>1~6</sub>アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される)からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換され;

R<sup>4</sup>は存在しないか、H、ヒドロキシ、またはC<sub>1~6</sub>アルキル(前記C<sub>1~6</sub>アルキルは、ハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される)であり;

R<sup>5</sup>は、Hまたはハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたC<sub>1~6</sub>アルキルであり; R<sup>6</sup>は、C<sub>1~6</sub>アルキル、カルボシクリル、またはヘテロシクリルであり、前記C<sub>1~6</sub>アルキル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、1つまたは複数のR<sup>g</sup>で任意選択的に置換され;または、R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>が、それらが結合する炭素とともに、カルボシクリルまたはヘテロシクリルを形成し、前記カルボシクリルおよびヘテロシクリルは、1つまたは複数のR<sup>g</sup>で任意選択的に置換され;

各々のR<sup>g</sup>は、C<sub>1~6</sub>アルキル、C<sub>2~6</sub>アルケニル、C<sub>2~6</sub>アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリル、R<sup>k</sup>、ハロ、オキソ(=O)、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>h</sup>)<sub>2</sub>、-CN、-C(O)-N(R<sup>h</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)-N(R<sup>h</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>-N(R<sup>h</sup>)<sub>2</sub>、-O-R<sup>h</sup>、-S-R<sup>h</sup>、-O-C(O)-R<sup>h</sup>、-C(O)-R<sup>h</sup>、

- C ( O ) - OR<sup>h</sup>、 - S ( O ) - R<sup>h</sup>、 - S ( O )<sub>2</sub> - R<sup>h</sup>、 - N ( R<sup>h</sup> ) - C ( O ) - R<sup>h</sup>、 - N ( R<sup>h</sup> ) - S ( O ) - R<sup>h</sup>、 - N ( R<sup>h</sup> ) - C ( O ) - N ( R<sup>h</sup> )<sub>2</sub>、 および - N ( R<sup>h</sup> ) - S ( O )<sub>2</sub> - R<sup>h</sup> からなる群から独立して選択され；

各々の R<sup>h</sup> は、水素、C<sub>1 ~ 6</sub> アルキル、C<sub>2 ~ 6</sub> アルケニル、C<sub>2 ~ 6</sub> アルキニル、C<sub>1 ~ 6</sub> アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、各々の C<sub>1 ~ 6</sub> アルキル、C<sub>2 ~ 6</sub> アルケニル、C<sub>2 ~ 6</sub> アルキニル、C<sub>1 ~ 6</sub> アルコキシ、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、オキソ、ハロ、アミノ、ヒドロキシ、C<sub>1 ~ 6</sub> アルコキシ、カルボシクリル、ヘテロシクリル、および C<sub>1 ~ C<sub>6</sub></sub> アルキル（前記 C<sub>1 ~ C<sub>6</sub></sub> アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換され；または、2 つの R<sup>h</sup> が、それらが結合する窒素とともに、オキソ、ハロ、および C<sub>1 ~ 3</sub> アルキル（前記 C<sub>1 ~ 3</sub> アルキルは、オキソおよびハロからなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成し；

各々の R<sup>k</sup> は、C<sub>1 ~ 6</sub> アルキル、C<sub>2 ~ 6</sub> アルケニル、C<sub>2 ~ 6</sub> アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルからなる群から独立して選択され、前記 C<sub>1 ~ 6</sub> アルキル、C<sub>2 ~ 6</sub> アルケニル、C<sub>2 ~ 6</sub> アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、ハロ、- NO<sub>2</sub>、- N ( R<sup>h</sup> )<sub>2</sub>、- CN、- C ( O ) - N ( R<sup>h</sup> )<sub>2</sub>、- S ( O ) - N ( R<sup>h</sup> )<sub>2</sub>、- S ( O )<sub>2</sub> - N ( R<sup>h</sup> )<sub>2</sub>、- S ( O ) - N ( R<sup>h</sup> )<sub>2</sub>、- O - R<sup>h</sup>、- S - R<sup>h</sup>、- O - C ( O ) - R<sup>h</sup>、- C ( O ) - R<sup>h</sup>、- C ( O ) - OR<sup>h</sup>、- S ( O ) - R<sup>h</sup>、- S ( O ) - R<sup>h</sup>、- N ( R<sup>h</sup> )<sub>2</sub> - C ( O ) - N ( R<sup>h</sup> )<sub>2</sub>、および - N ( R<sup>h</sup> ) - S ( O )<sub>2</sub> - R<sup>h</sup> からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で置換される）の化合物またはその塩。

( 項目 2 )

R<sup>1</sup> は、ハロ、シアノ、C<sub>1 ~ 3</sub> アルコキシ、および C<sub>3 ~ 8</sub> カルボシクリル（前記 C<sub>3 ~ 8</sub> カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された C<sub>1 ~ 6</sub> アルキルである、項目 1 に記載の化合物。

( 項目 3 )

R<sup>1</sup> はメチルである、項目 1 に記載の化合物。

( 項目 4 )

R<sup>2</sup> は、ハロ、シアノ、C<sub>1 ~ 3</sub> アルコキシ、および C<sub>3 ~ 8</sub> カルボシクリル（前記 C<sub>3 ~ 8</sub> カルボシクリルは、ハロから独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された C<sub>1 ~ 6</sub> アルキルである、項目 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

( 項目 5 )

R<sup>2</sup> はメチルである、項目 1 ~ 3 のいずれか 1 項に記載の化合物。

( 項目 6 )

R<sup>3</sup> は H である、項目 1 ~ 5 のいずれか 1 項に記載の化合物。

( 項目 7 )

R<sup>3</sup> は、カルボシクリル、ヘテロシクリル、オキソ、ハロ、- NO<sub>2</sub>、- N ( R<sup>b</sup> )<sub>2</sub>、- CN、- C ( O ) - N ( R<sup>b</sup> )<sub>2</sub>、- S ( O ) - N ( R<sup>b</sup> )<sub>2</sub>、- S ( O )<sub>2</sub> - N ( R<sup>b</sup> )<sub>2</sub>、- O - R<sup>b</sup>、- S - R<sup>b</sup>、- O - C ( O ) - R<sup>b</sup>、- C ( O ) - R<sup>b</sup>、- C ( O ) - OR<sup>b</sup>、- S ( O ) - R<sup>b</sup>、- S ( O )<sub>2</sub> - R<sup>b</sup>、- N ( R<sup>b</sup> ) - C ( O ) - N ( R<sup>b</sup> )<sub>2</sub>、および - N ( R<sup>b</sup> ) - S ( O )<sub>2</sub> - R<sup>b</sup> からなる群から独立して選択される 1 つまたは複数の基で任意選択的に置換された C<sub>1 ~ 6</sub> アルキルであり、任意のカルボシクリル、およびヘテロシクリルは、R<sup>f</sup>、オキソ、ハロ、- NO<sub>2</sub>、- N ( R<sup>b</sup> )<sub>2</sub>、- CN、- C ( O ) - N ( R<sup>b</sup> )<sub>2</sub>、- S ( O ) - N ( R<sup>b</sup> )<sub>2</sub>、- S ( O )<sub>2</sub> - N ( R<sup>b</sup> )<sub>2</sub>、- O - R<sup>b</sup>、- S -

$R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-O-R^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)_2-R^b$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目1～5のいずれか1項に記載の化合物。

(項目8)

$R^3$ は $-N(R^b)_2$ である、項目1～5のいずれか1項に記載の化合物。

(項目9)

$R^3$ は $-C(=O)R^a$ である、項目1～5のいずれか1項に記載の化合物。

(項目10)

$R^3$ は $-C(=O)OR^a$ である、項目1～5のいずれか1項に記載の化合物。

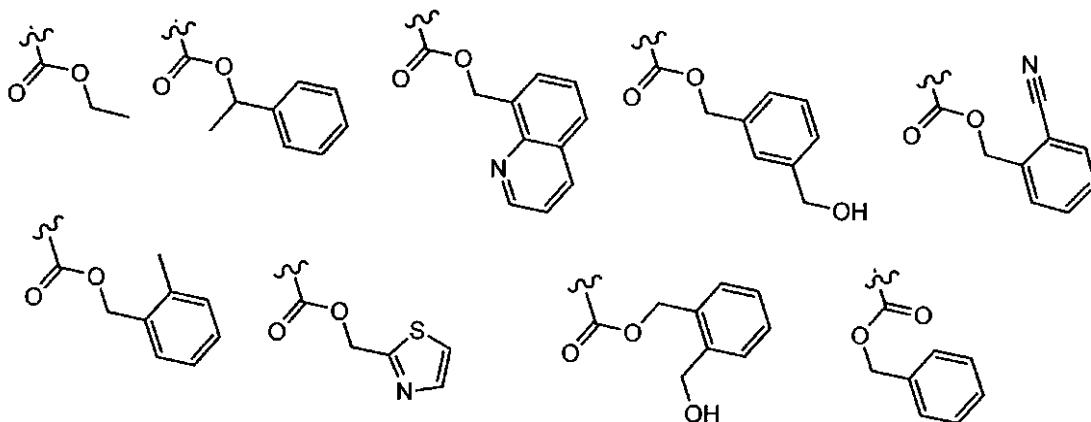
(項目11)

$R^3$ は、 $C_{1～6}$ アルキル、 $C_{2～6}$ アルケニル、 $C_{2～6}$ アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-OR^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-N(R^b)_2$ 、および $-N(R^b)-S(O)-R^b$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された5～6員ヘテロアリール環であり、任意の $C_{1～6}$ アルキル、 $C_{2～6}$ アルケニル、 $C_{2～6}$ アルキニル、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、 $R^f$ 、オキソ、ハロ、 $-NO_2$ 、 $-N(R^b)_2$ 、 $-CN$ 、 $-C(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)-N(R^b)_2$ 、 $-S(O)_2-N(R^b)_2$ 、 $-O-R^b$ 、 $-S-R^b$ 、 $-O-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-R^b$ 、 $-C(O)-O-R^b$ 、 $-S(O)-R^b$ 、 $-S(O)_2-R^b$ 、 $-N(R^b)-C(O)-R^b$ 、 $-N(R^b)-S(O)-R^b$ からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目1～5のいずれか1項に記載の化合物。

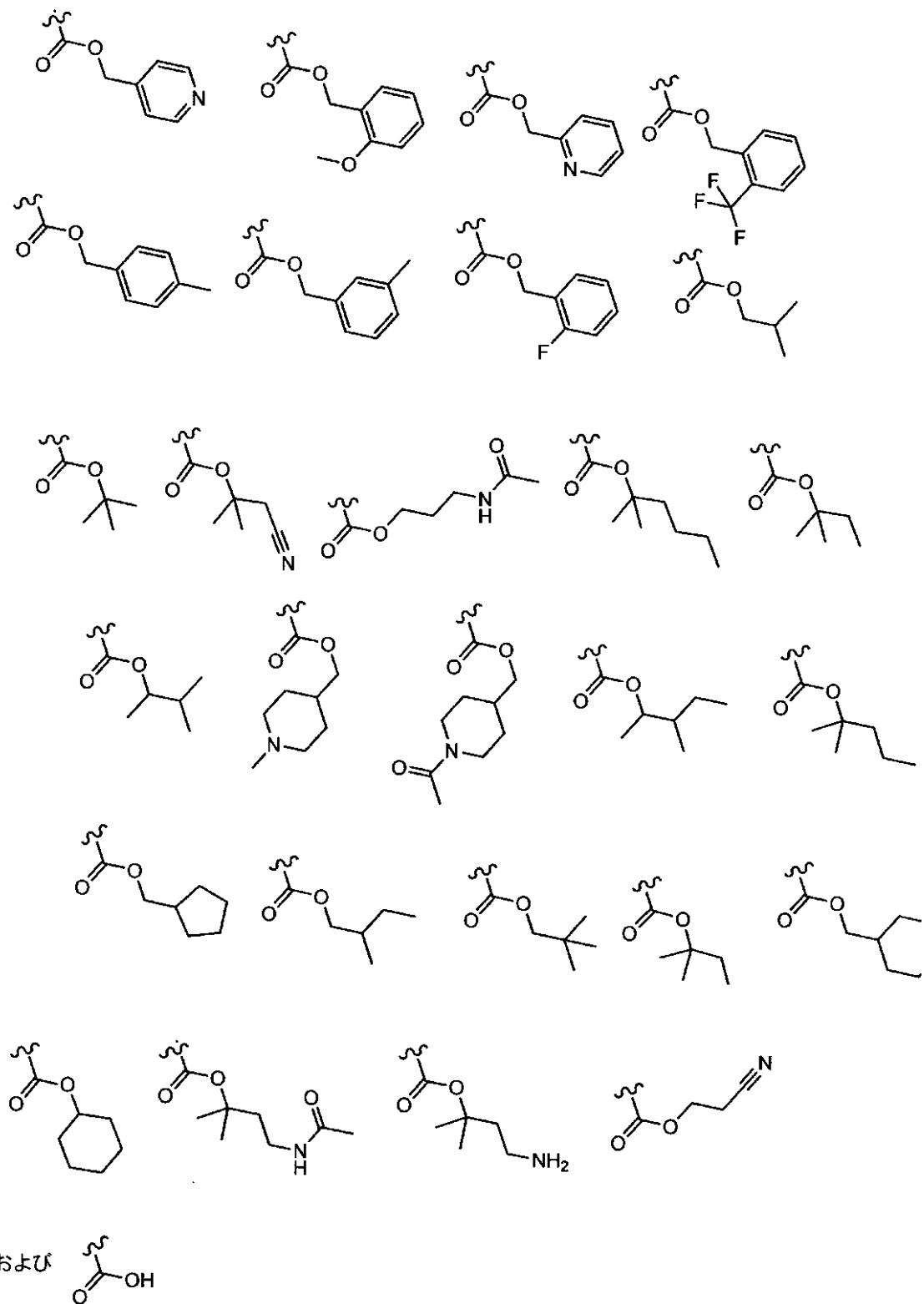
(項目12)

$R^3$ は、

【化177】



【化178】

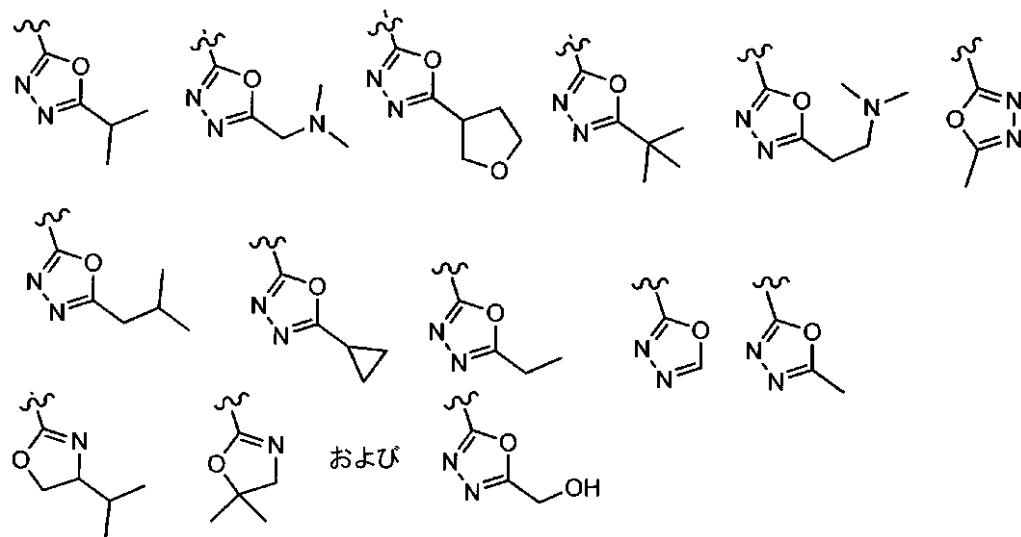


からなる群から選択される、項目1～5のいずれか1項に記載の化合物。

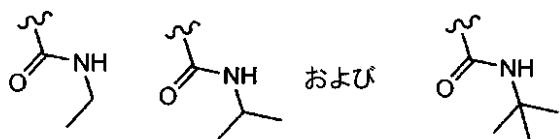
(項目13)

R<sup>3</sup>は、

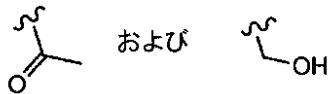
【化179】

からなる群から選択される、項目1～5のいずれか1項に記載の化合物。(項目14)R<sup>3</sup>は、

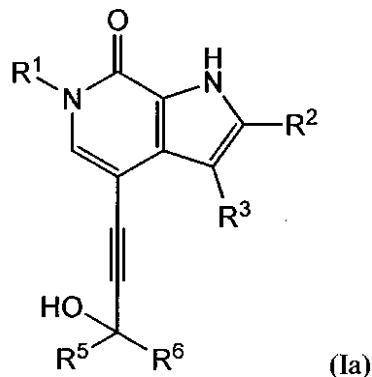
【化180】

からなる群から選択される、項目1～5のいずれか1項に記載の化合物。(項目15)R<sup>3</sup>は、

【化181】

からなる群から選択される、項目1～5のいずれか1項に記載の化合物。(項目16)式(Ia)：

【化182】



の化合物である、項目1～15のいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

(項目17)

R<sup>4</sup>はHである、項目1～15のいずれか1項に記載の化合物。

(項目18)

R<sup>4</sup>はヒドロキシルである、項目1～15のいずれか1項に記載の化合物。

(項目19)

R<sup>4</sup>は、ハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたC<sub>1～6</sub>アルキルである、項目1～15のいずれか1項に記載の化合物。

(項目20)

R<sup>5</sup>はHである、項目1～15のいずれか1項に記載の化合物。

(項目21)

R<sup>5</sup>は、ハロからなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたC<sub>1～6</sub>アルキルである、項目1～15のいずれか1項に記載の化合物。

(項目22)

R<sup>6</sup>は、1つまたは複数のR<sup>g</sup>で任意選択的に置換されたC<sub>1～6</sub>アルキルである、項目1～15のいずれか1項に記載の化合物。

(項目23)

R<sup>6</sup>は、1つまたは複数のR<sup>g</sup>で任意選択的に置換されたカルボシクリルである、項目1～15のいずれか1項に記載の化合物。

(項目24)

R<sup>6</sup>は、1つまたは複数のR<sup>g</sup>で任意選択的に置換されたヘテロシクリルである、項目1～15のいずれか1項に記載の化合物。

(項目25)

R<sup>6</sup>は、オキソおよび-N(R<sup>h</sup>)<sub>2</sub>で置換されて-C(=O)-N(R<sup>h</sup>)<sub>2</sub>基を形成したC<sub>1</sub>アルキルである、項目1～15のいずれか1項に記載の化合物。

(項目26)

R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>が、それらが結合する炭素とともに、1つまたは複数のR<sup>g</sup>で任意選択的に置換されたカルボシクリルを形成する、項目1～15のいずれか1項に記載の化合物。

(項目27)

R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>が、それらが結合する炭素とともに、1つまたは複数のR<sup>g</sup>で任意選択的に置換されたヘテロシクリルを形成する、項目1～15のいずれか1項に記載の化合物。

(項目28)

R<sup>4</sup>は存在せず；R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>が、それらが結合する炭素とともに、1つまたは複数のR<sup>g</sup>で任意選択的に置換され、式(I)の残部と芳香環の原子で連結したアリール環を形成する、項目1～15のいずれか1項に記載の化合物。

(項目29)

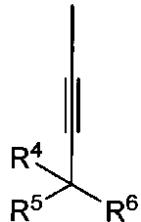
R<sup>4</sup>は存在せず；R<sup>5</sup>およびR<sup>6</sup>が、それらが結合する炭素とともに、1つまたは複数の

R<sup>g</sup>で任意選択的に置換され、式（I）の残部と芳香環の原子で連結したヘテロシクリルを形成する、項目1～15のいずれか1項に記載の化合物。

(項目30)

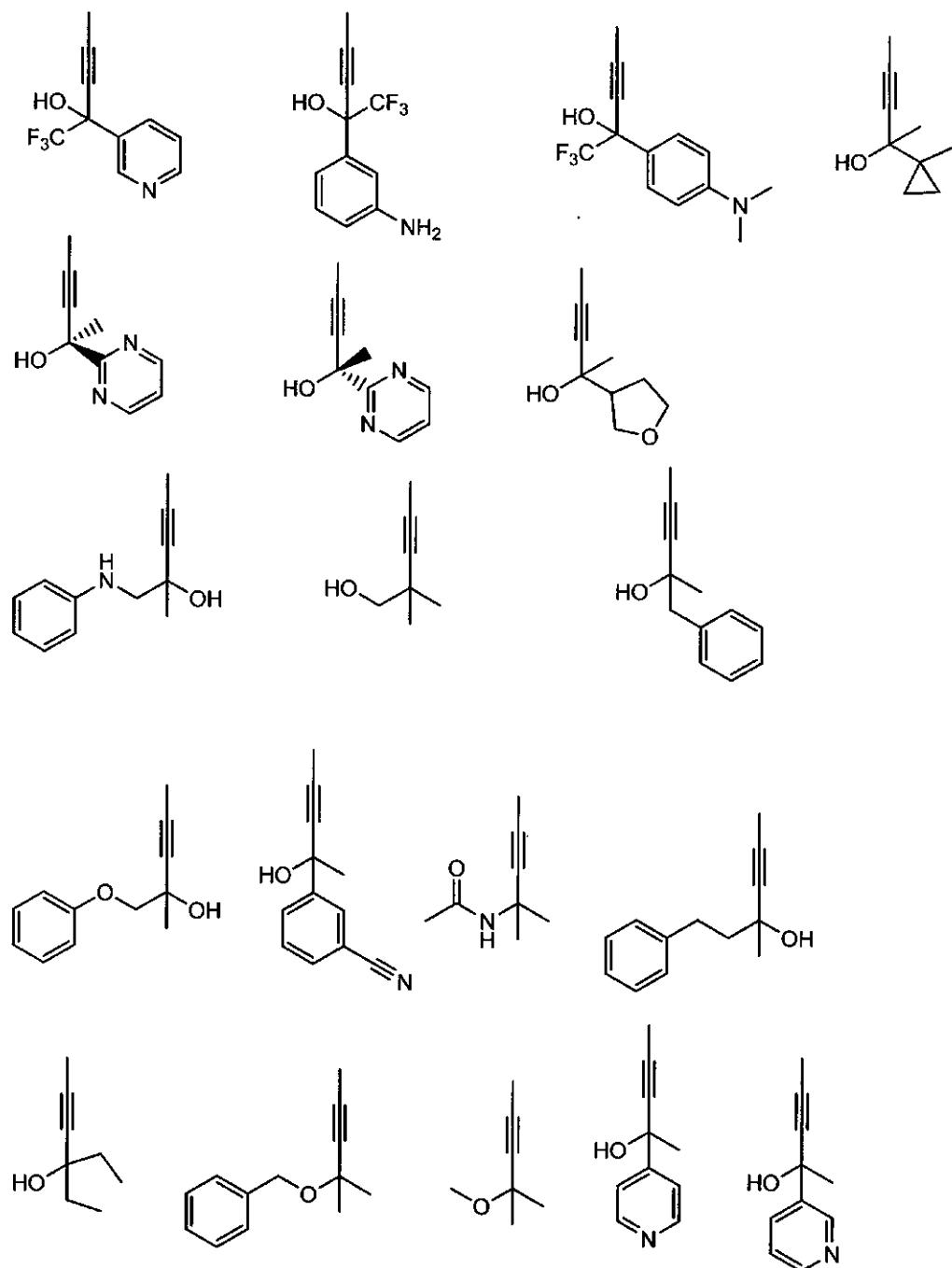
以下の基：

【化183】

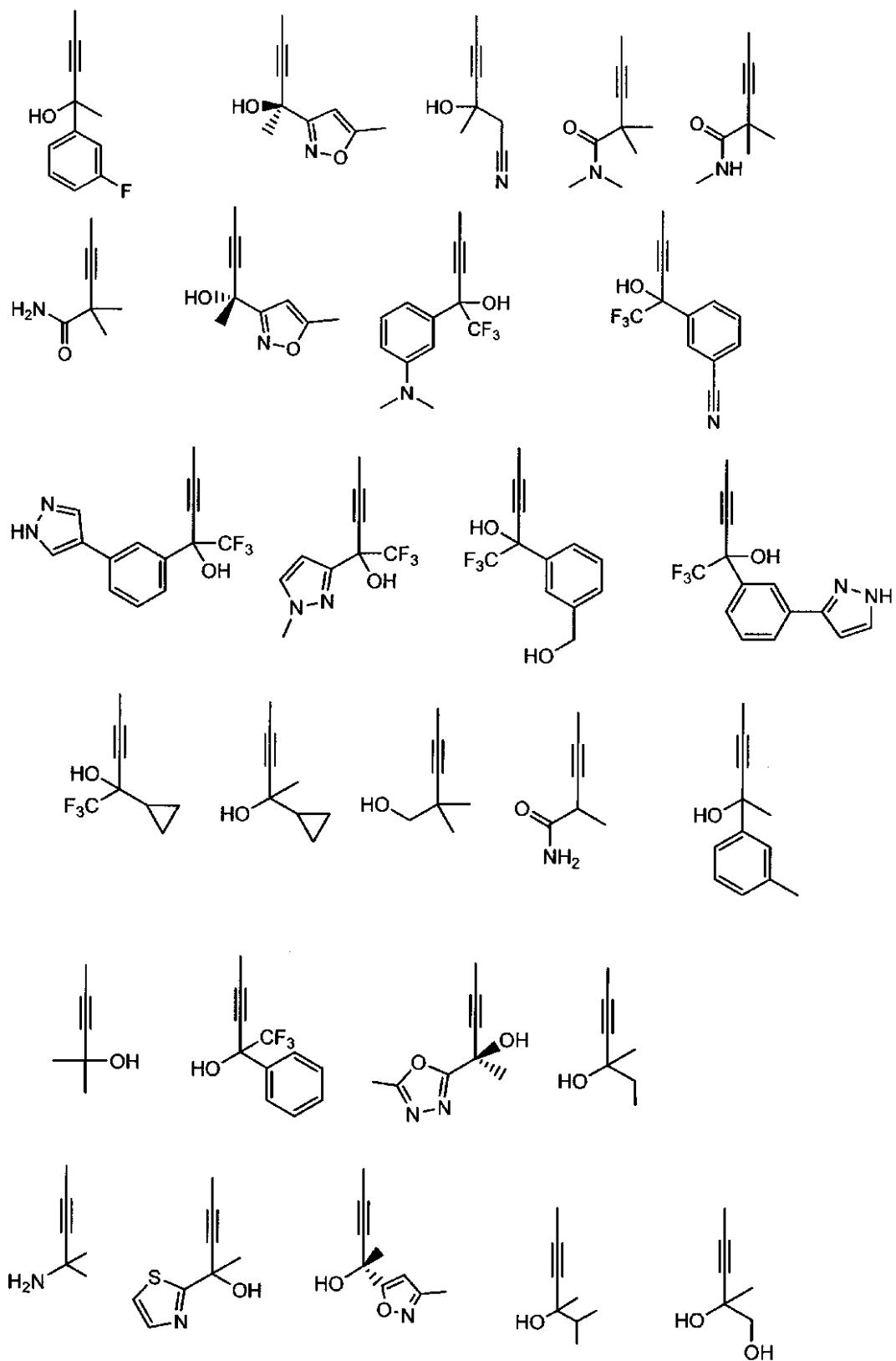


は、

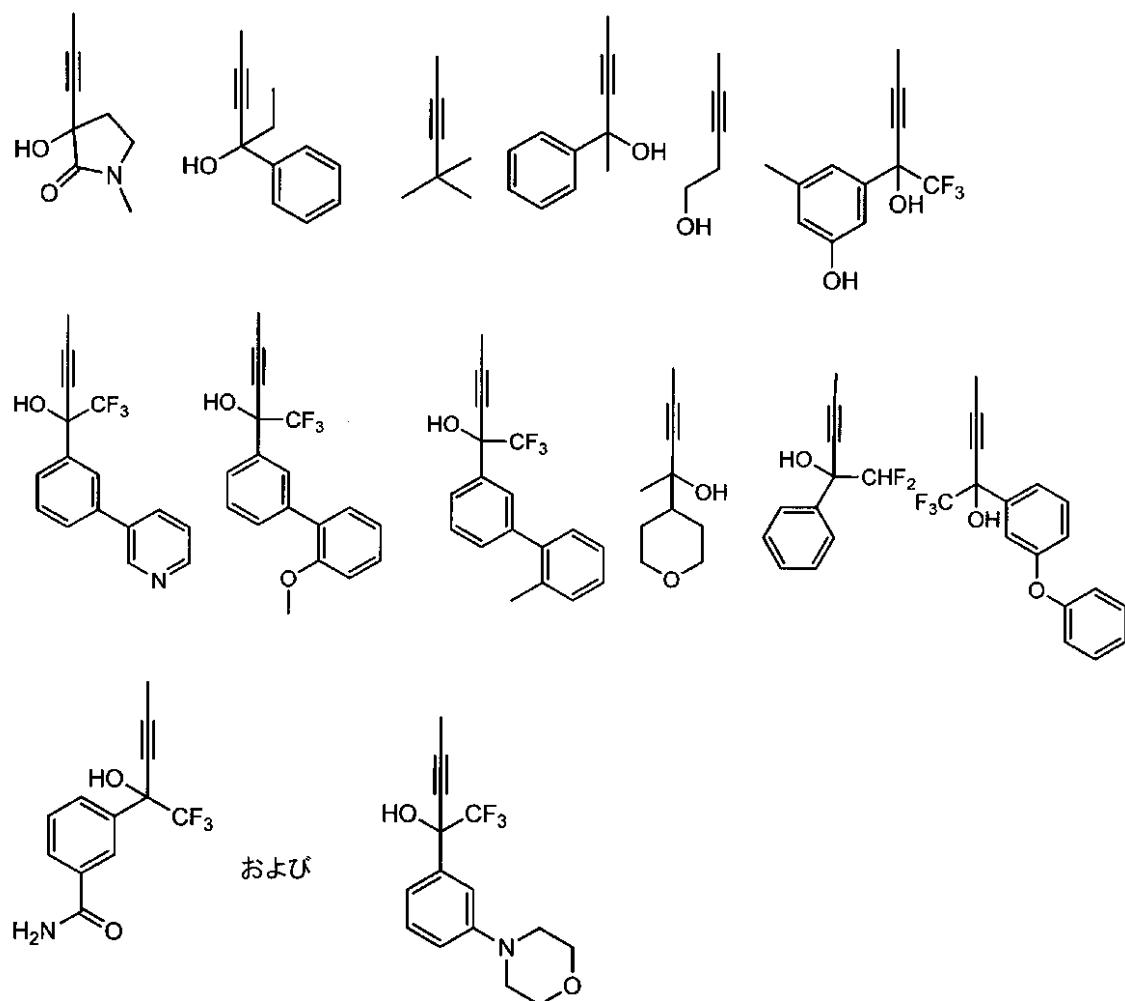
【化 1 8 4】



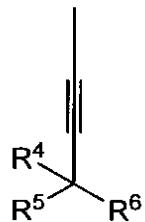
【化 1 8 5】



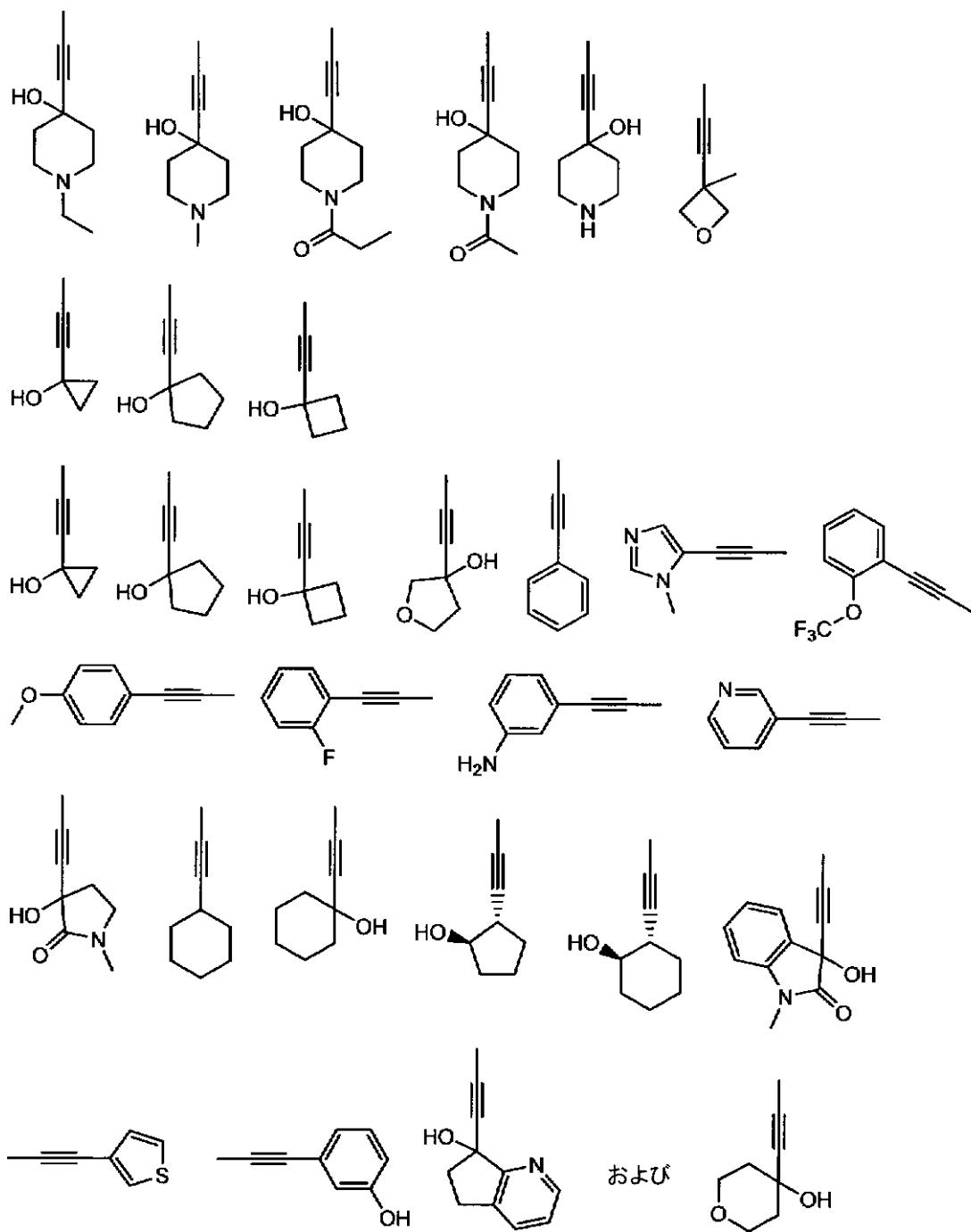
【化186】

からなる群から選択される、項目1に記載の化合物。(項目31)以下の基：

【化187】

は、

【化188】



からなる群から選択される、項目1に記載の化合物。

(項目32)

R<sup>1</sup>は、ハロ、シアノ、C<sub>1</sub>～<sub>3</sub>アルコキシ、およびC<sub>3</sub>～<sub>8</sub>カルボシクリル（前記C<sub>3</sub>～<sub>8</sub>カルボシクリルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルであり；

R<sup>2</sup>は、ハロ、シアノ、C<sub>1</sub>～<sub>3</sub>アルコキシ、およびC<sub>3</sub>～<sub>8</sub>カルボシクリル（前記C<sub>3</sub>～<sub>8</sub>カルボシクリルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される）からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルであり；

R<sup>3</sup> は、カルボシクリル、ヘテロシクリル、オキソ、ハロ、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-CN、-C(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-O-R<sup>b</sup>、-S-R<sup>b</sup>、-O-C(O)-R<sup>b</sup>、-C(O)-R<sup>b</sup>、-C(O)-OR<sup>b</sup>、-S(O)-R<sup>b</sup>、-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>b</sup>、-N(R<sup>b</sup>)-C(O)-R<sup>b</sup>、-N(R<sup>b</sup>)-S(O)-R<sup>b</sup>、-N(R<sup>b</sup>)-C(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、および-N(R<sup>b</sup>)-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>b</sup>からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキルであり、任意のカルボシクリル、およびヘテロシクリルは、R<sup>f</sup>、オキソ、ハロ、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-CN、-C(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-O-R<sup>b</sup>、-S-R<sup>b</sup>、-O-C(O)-R<sup>b</sup>、-C(O)-R<sup>b</sup>、-C(O)-OR<sup>b</sup>、-S(O)-R<sup>b</sup>、-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>b</sup>、-N(R<sup>b</sup>)-C(O)-R<sup>b</sup>、-N(R<sup>b</sup>)-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>b</sup>からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目1に記載の化合物またはその塩。

(項目33)

R<sup>1</sup> は、ハロ、シアノ、C<sub>1</sub>~<sub>3</sub>アルコキシ、およびC<sub>3</sub>~<sub>8</sub>カルボシクリル(前記C<sub>3</sub>~<sub>8</sub>カルボシクリルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される)からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキルであり;

R<sup>2</sup> は、ハロ、シアノ、C<sub>1</sub>~<sub>3</sub>アルコキシ、およびC<sub>3</sub>~<sub>8</sub>カルボシクリル(前記C<sub>3</sub>~<sub>8</sub>カルボシクリルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される)からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキルであり;

R<sup>3</sup> は -N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>である、項目1に記載の化合物またはその塩。

(項目34)

R<sup>1</sup> は、ハロ、シアノ、C<sub>1</sub>~<sub>3</sub>アルコキシ、およびC<sub>3</sub>~<sub>8</sub>カルボシクリル(前記C<sub>3</sub>~<sub>8</sub>カルボシクリルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される)からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキルであり;

R<sup>2</sup> は、ハロ、シアノ、C<sub>1</sub>~<sub>3</sub>アルコキシ、およびC<sub>3</sub>~<sub>8</sub>カルボシクリル(前記C<sub>3</sub>~<sub>8</sub>カルボシクリルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される)からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキルであり;

R<sup>3</sup> は -C(=O)OR<sup>a</sup>である、項目1に記載の化合物またはその塩。

(項目35)

R<sup>1</sup> は、ハロ、シアノ、C<sub>1</sub>~<sub>3</sub>アルコキシ、およびC<sub>3</sub>~<sub>8</sub>カルボシクリル(前記C<sub>3</sub>~<sub>8</sub>カルボシクリルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される)からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキルであり;

R<sup>2</sup> は、ハロ、シアノ、C<sub>1</sub>~<sub>3</sub>アルコキシ、およびC<sub>3</sub>~<sub>8</sub>カルボシクリル(前記C<sub>3</sub>~<sub>8</sub>カルボシクリルは、ハロから独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される)からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換されたC<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキルであり;

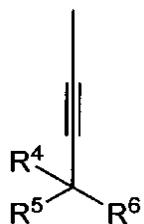
R<sup>3</sup> は、C<sub>1</sub>~<sub>6</sub>アルキル、C<sub>2</sub>~<sub>6</sub>アルケニル、C<sub>2</sub>~<sub>6</sub>アルキニル、カルボシクリル、ヘテロシクリル、オキソ、ハロ、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-CN、-C(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-O-R<sup>b</sup>、-S-R<sup>b</sup>、-O-C(O)-R<sup>b</sup>、-C(O)-R<sup>b</sup>、-C(O)-OR<sup>b</sup>、-S(O)-R<sup>b</sup>、-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>b</sup>、-N(R<sup>b</sup>)-C(O)-R<sup>b</sup>、-N(R<sup>b</sup>)-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>b</sup>、および-N(R<sup>b</sup>)-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>b</sup>からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換された5

~ 6 員ヘテロアリール環であり、任意の 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、カルボシクリル、およびヘテロシクリルは、R<sup>f</sup>、オキソ、ハロ、-NO<sub>2</sub>、-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-CN、-C(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-S(O)<sub>2</sub>-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、-O-R<sup>b</sup>、-S-R<sup>b</sup>、-O-C(O)-R<sup>b</sup>、-C(O)-R<sup>b</sup>、-C(O)-O-R<sup>b</sup>、-S(O)-R<sup>b</sup>、-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>b</sup>、-N(R<sup>b</sup>)-C(O)-R<sup>b</sup>、-N(R<sup>b</sup>)-S(O)-R<sup>b</sup>、-N(R<sup>b</sup>)-C(O)-N(R<sup>b</sup>)<sub>2</sub>、および-N(R<sup>b</sup>)-S(O)<sub>2</sub>-R<sup>b</sup>からなる群から独立して選択される1つまたは複数の基で任意選択的に置換される、項目1に記載の化合物またはその塩。

(項目36)

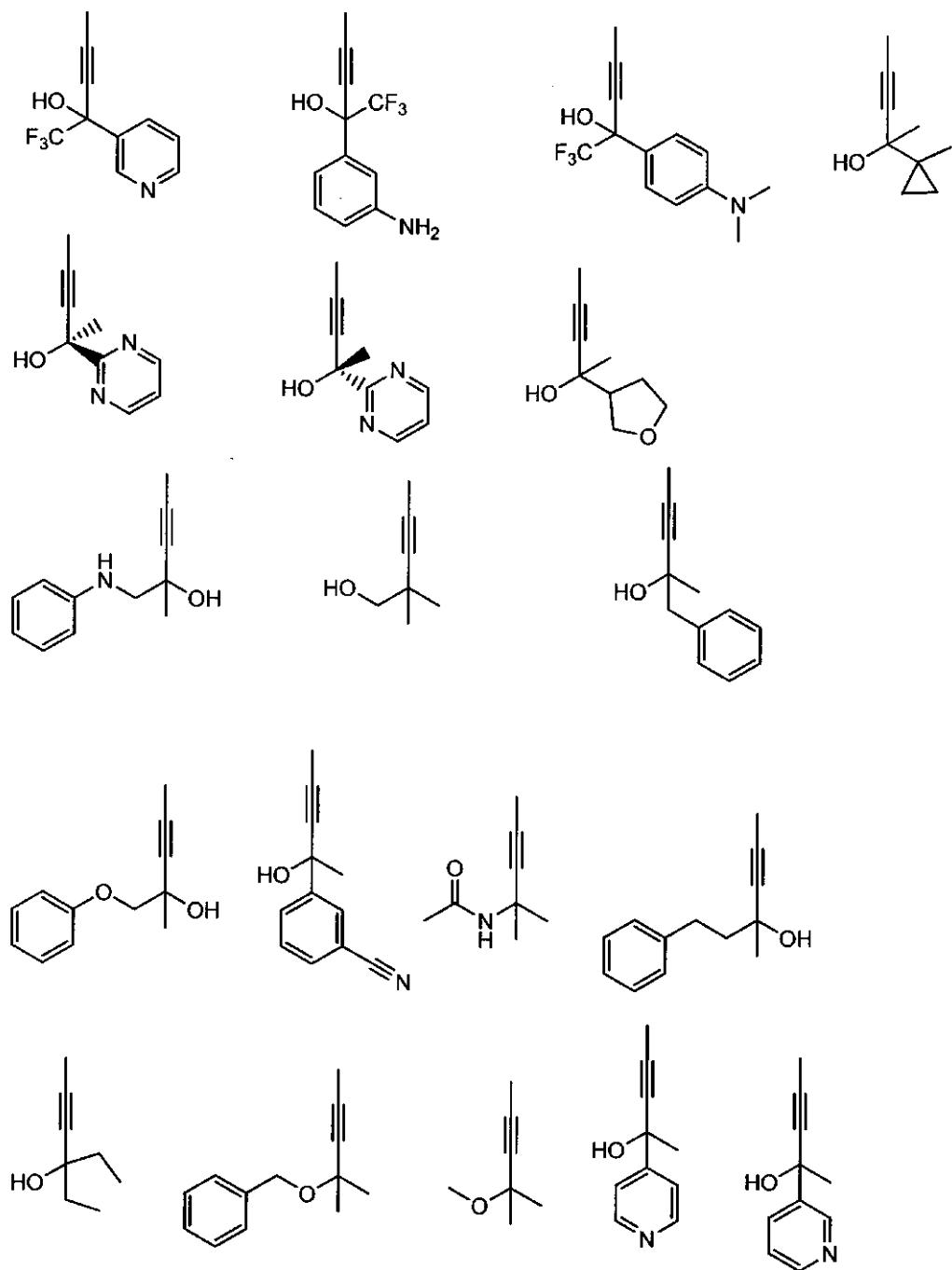
以下の基：

【化189】

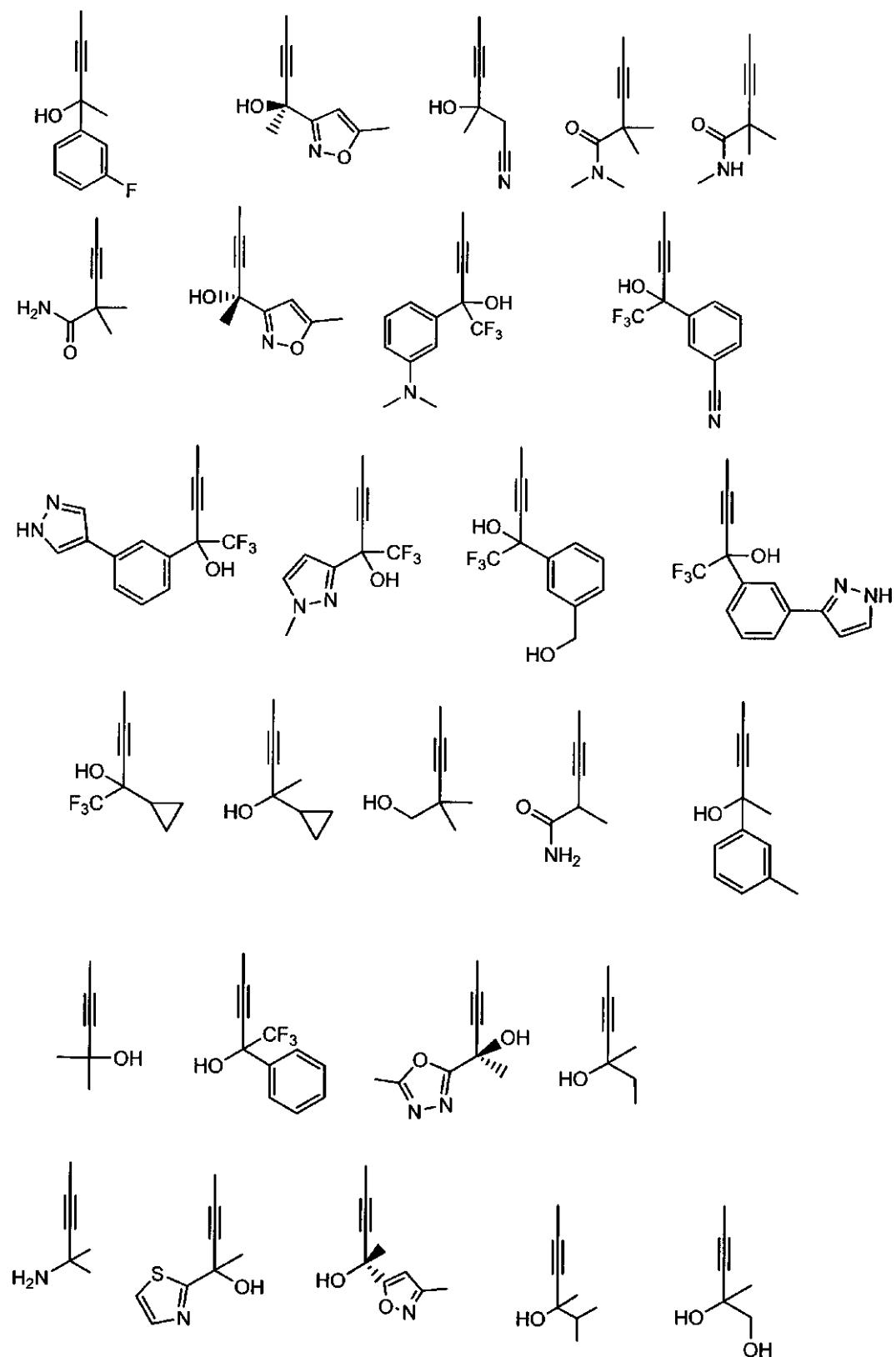


が、

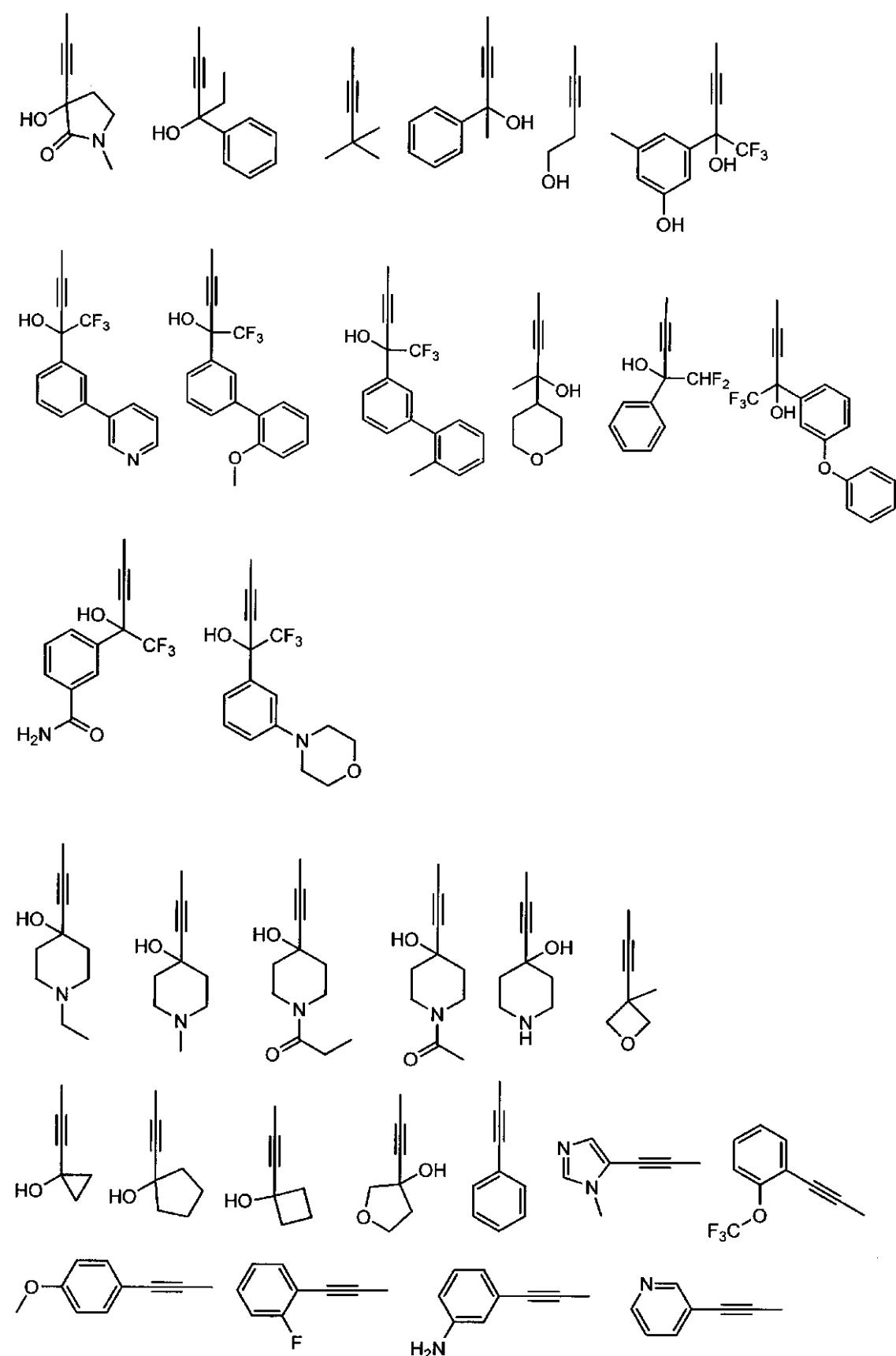
【化 1 9 0】



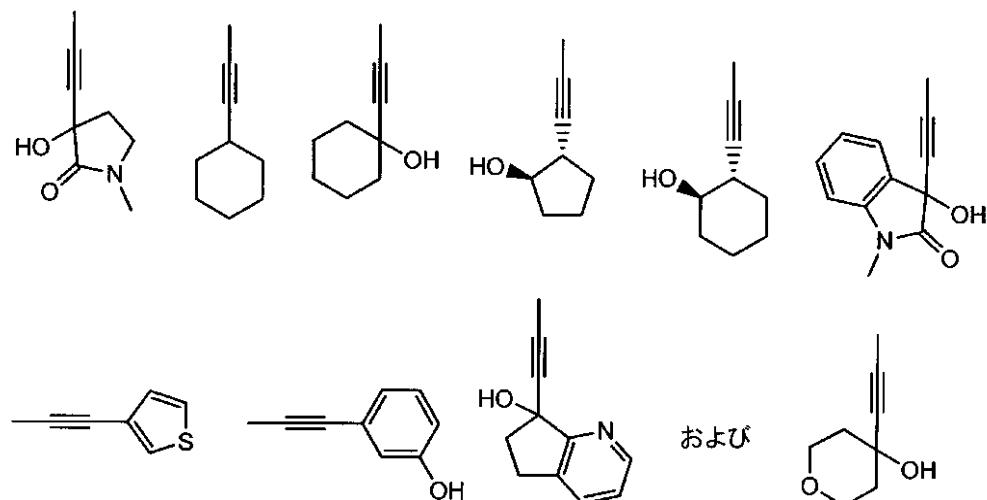
【化 1 9 1】



【化 1 9 2】



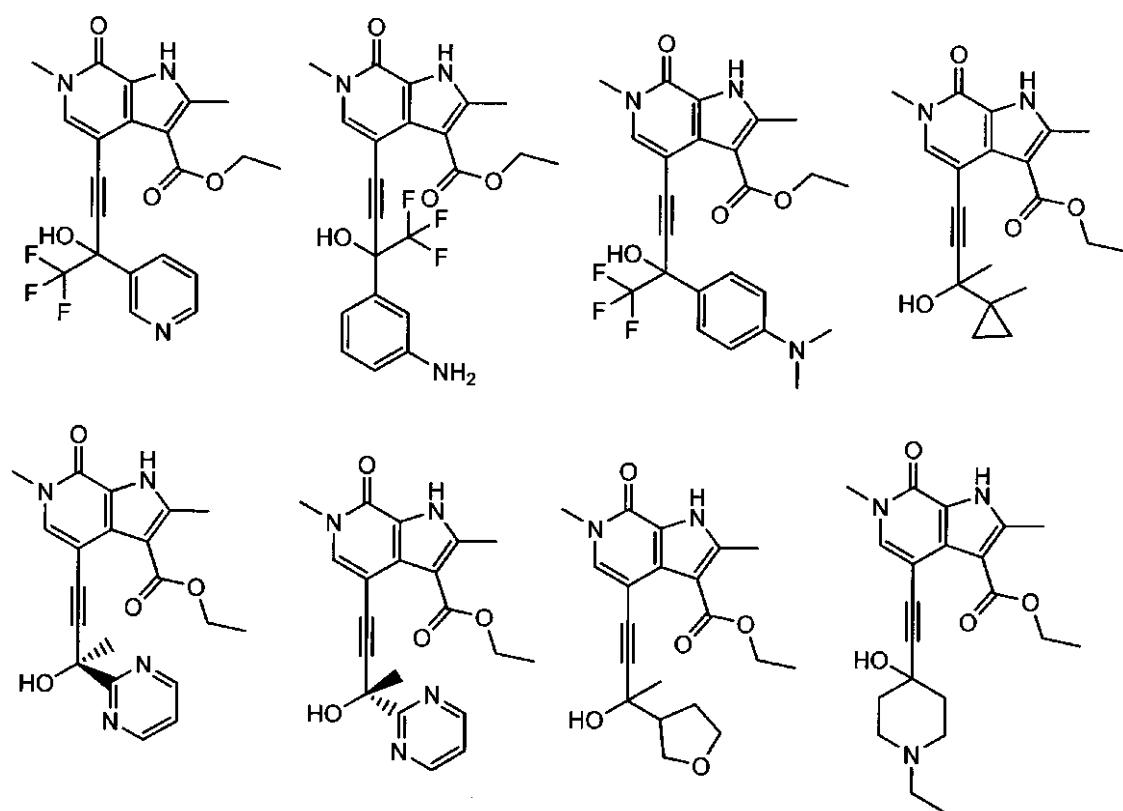
【化193】



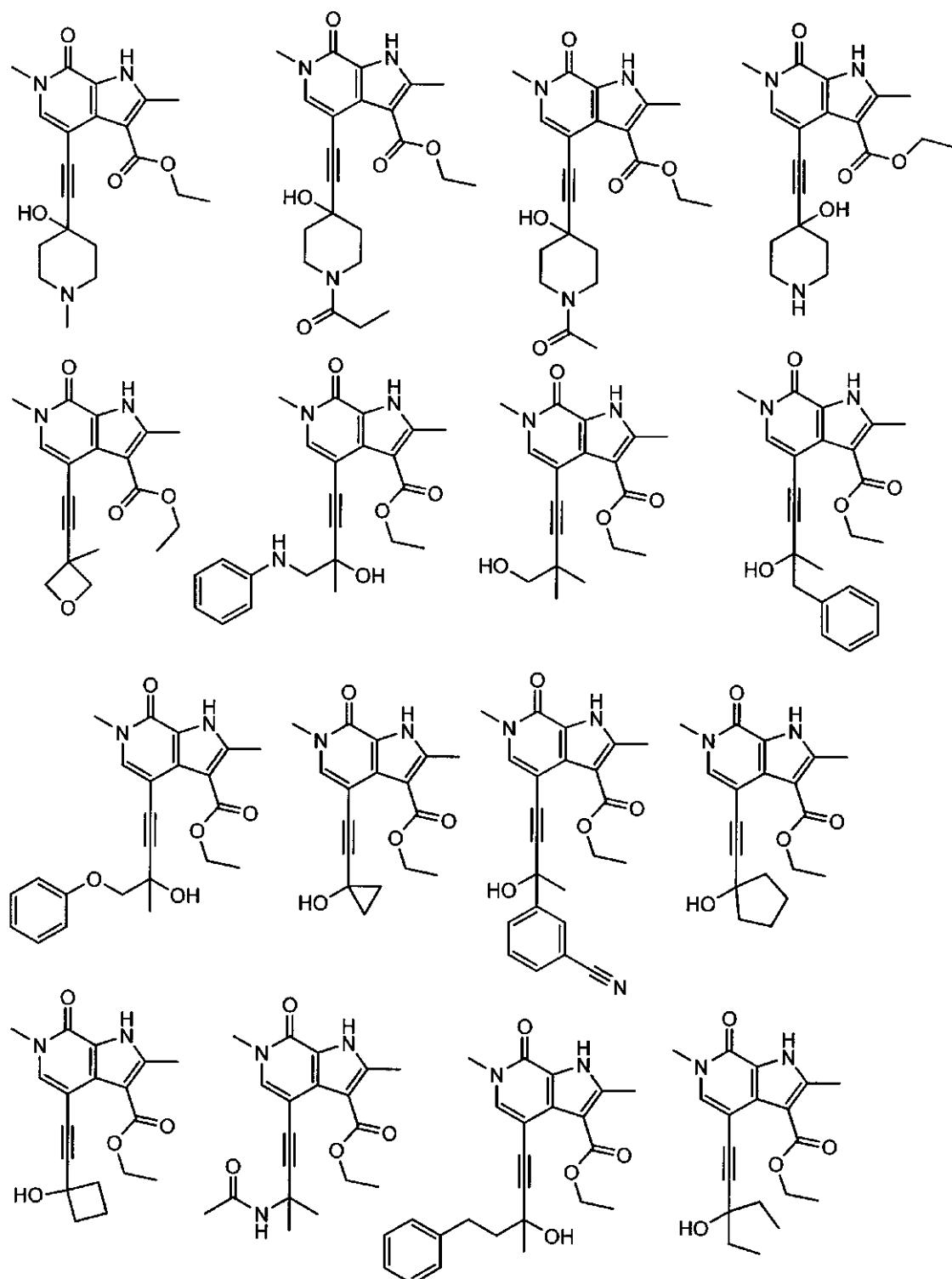
からなる群から選択される、項目32～35のいずれか1項に記載の化合物。

(項目37)

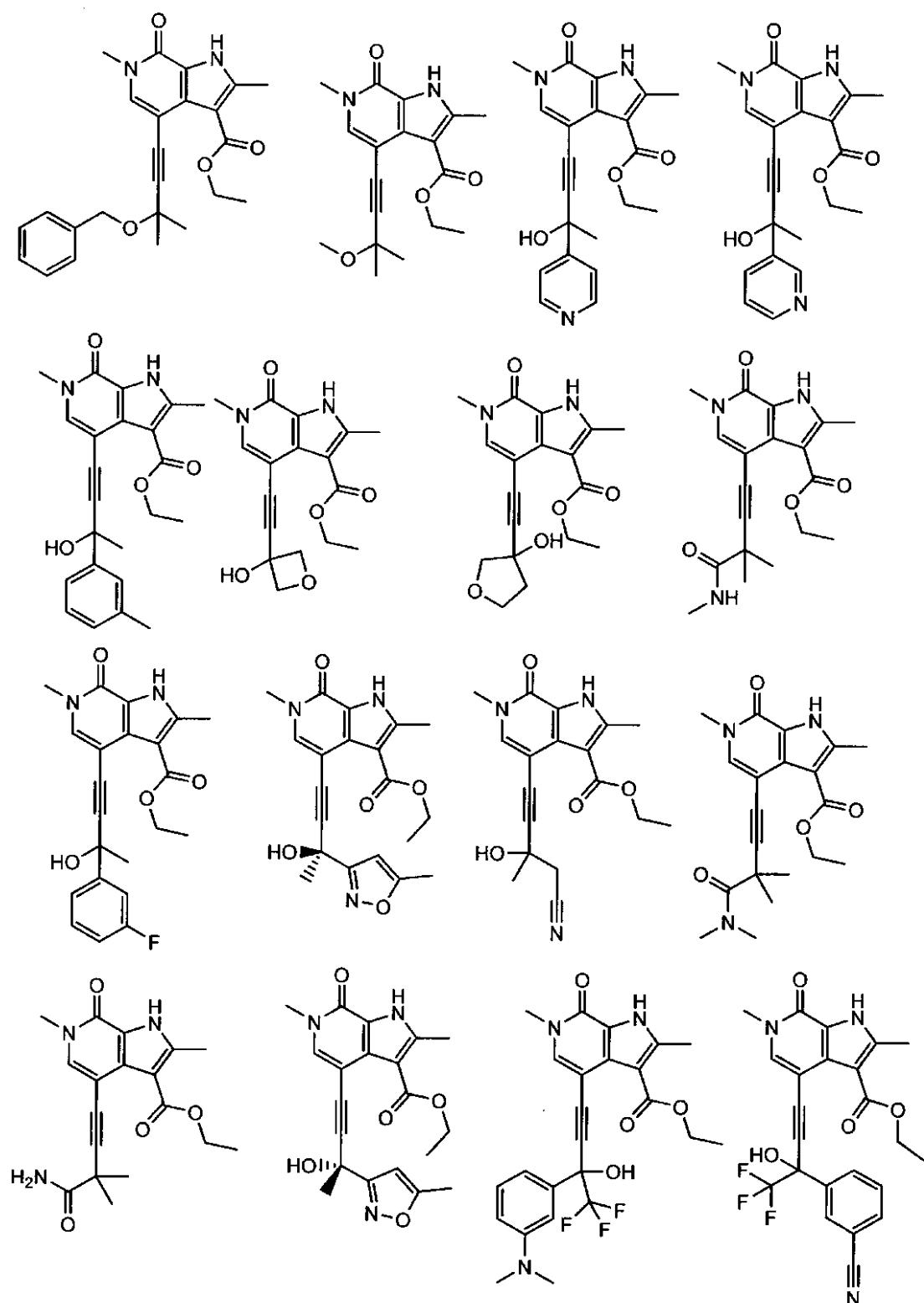
【化194】



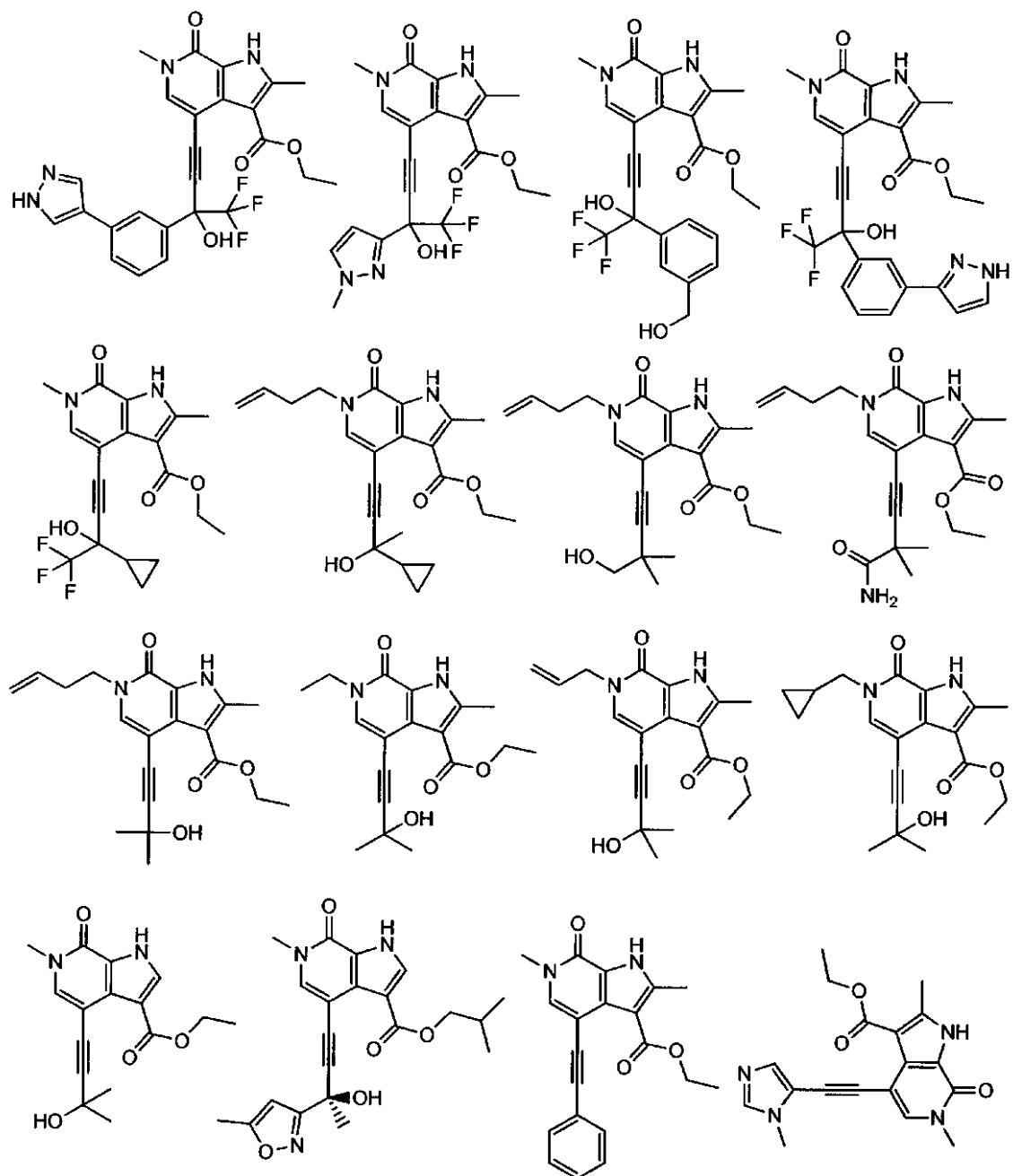
【化 1 9 5】



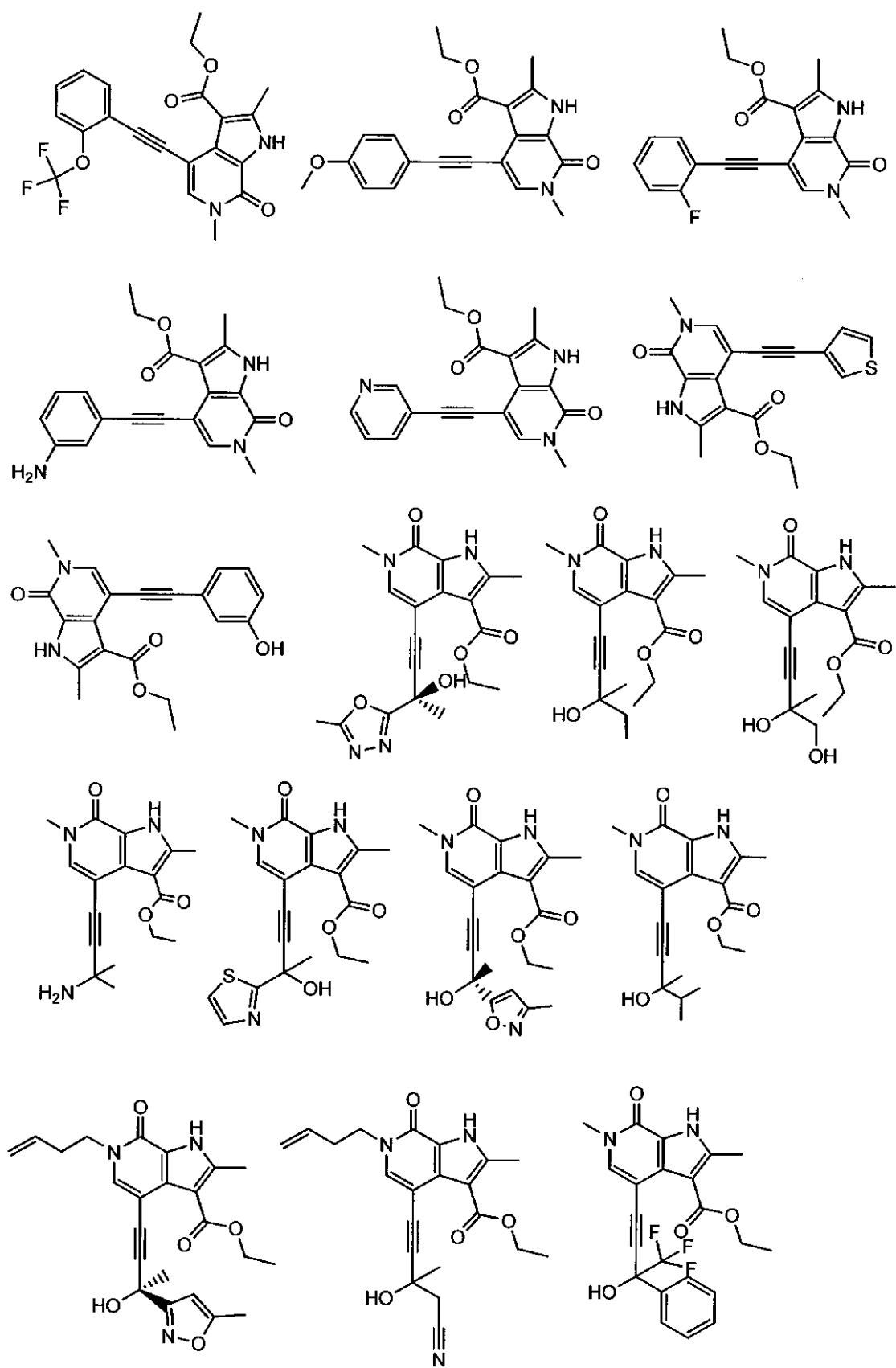
【化 1 9 6】



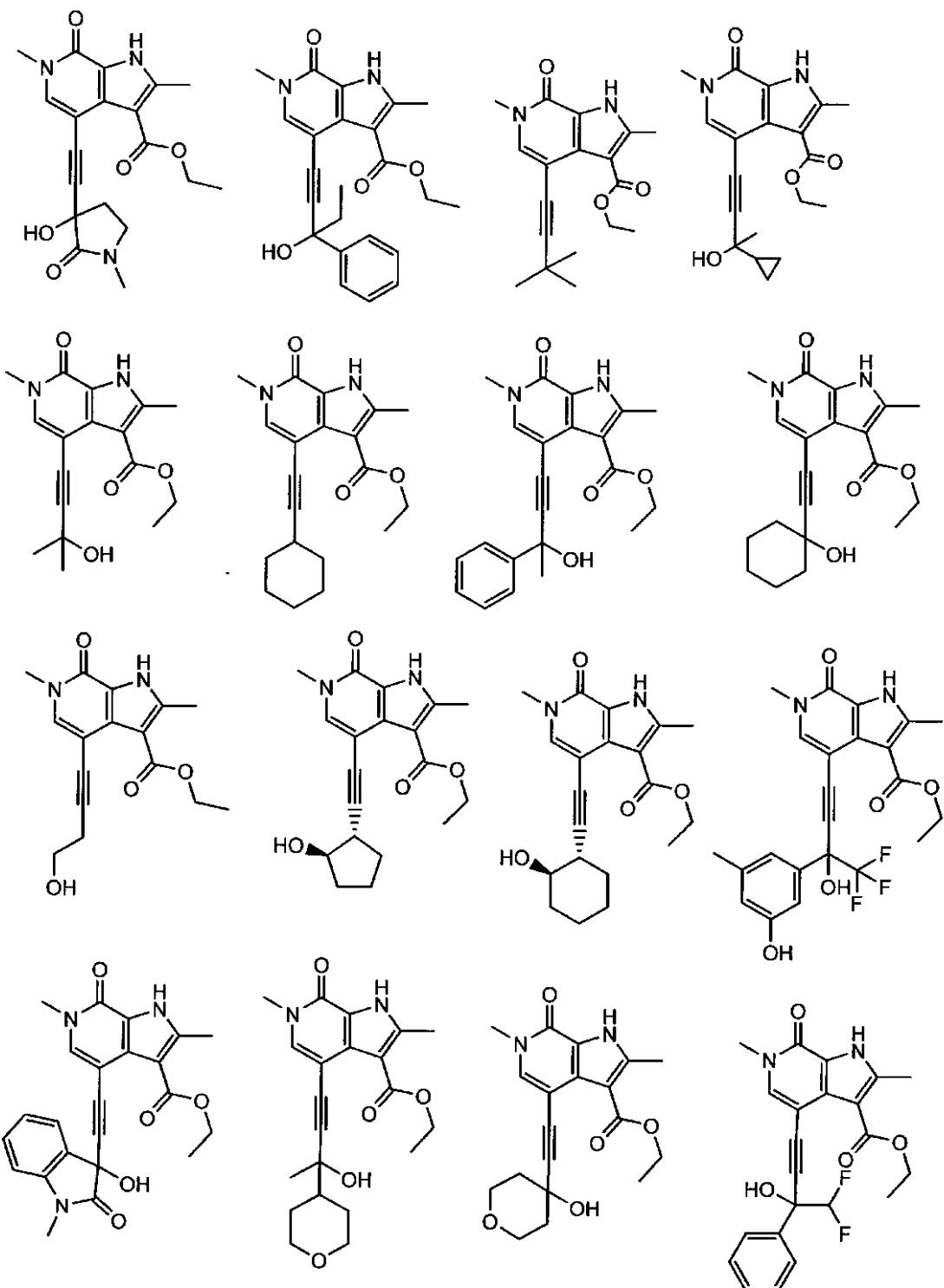
【化 197】



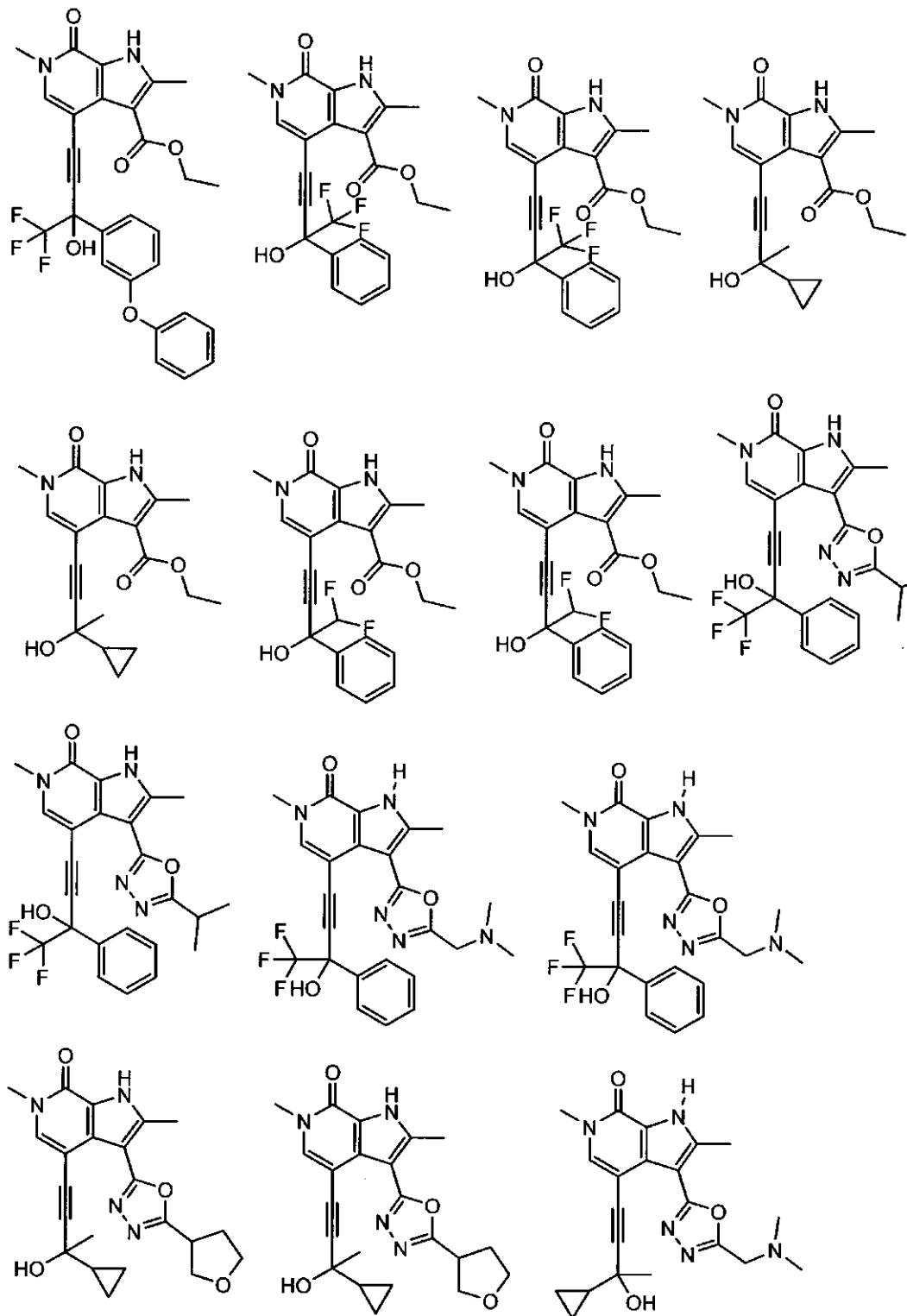
【化 1 9 8】



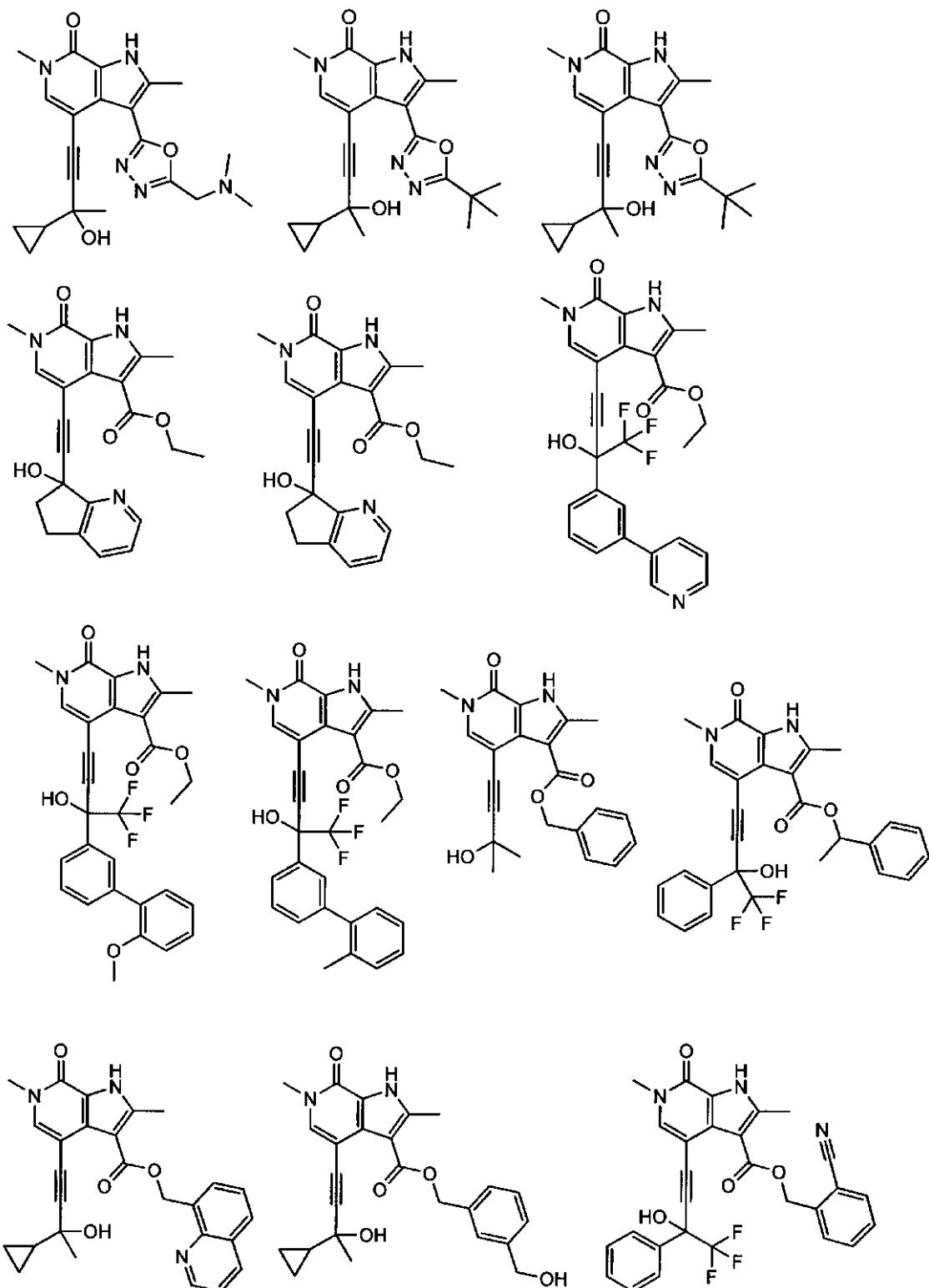
【化 1 9 9】



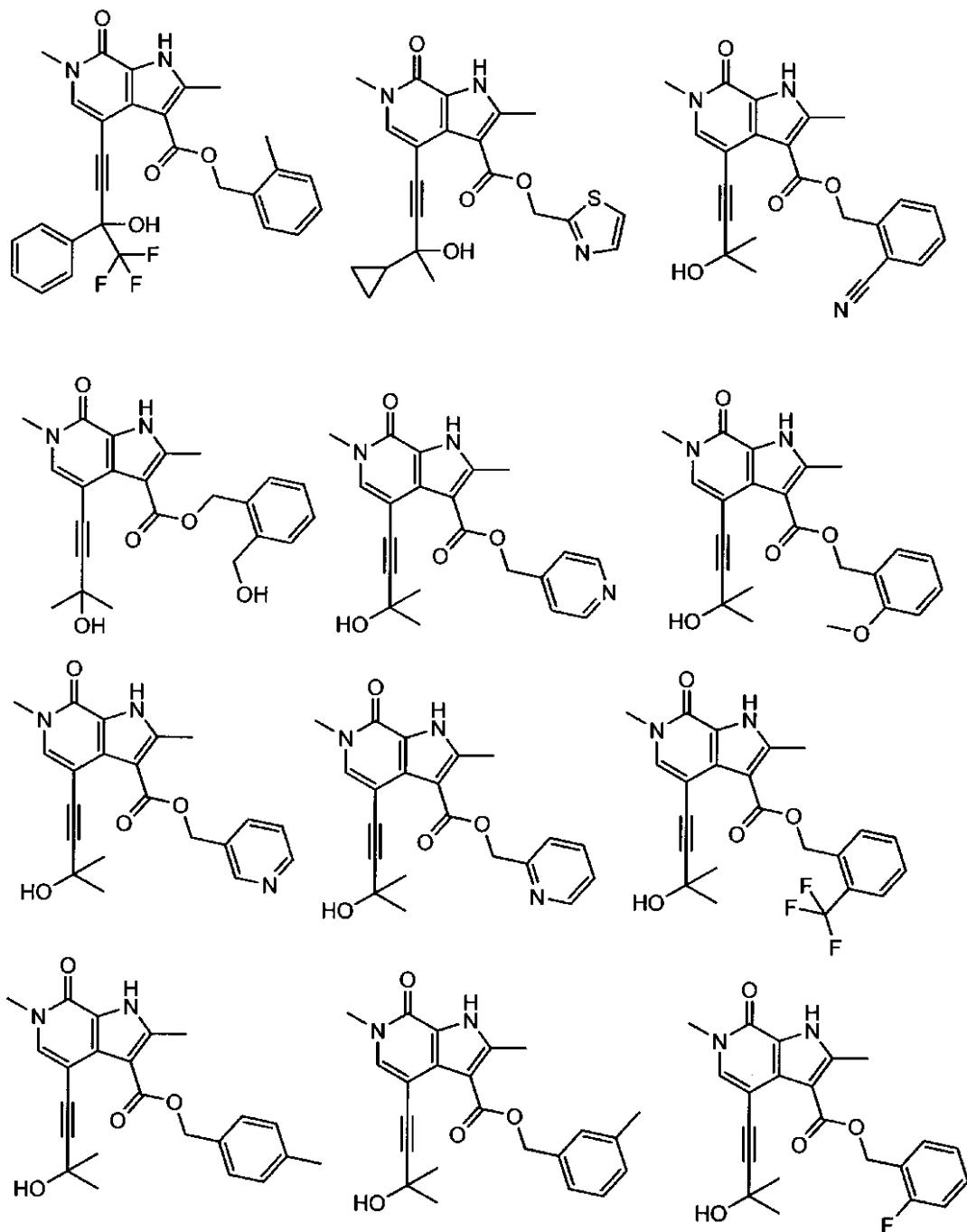
【化 2 0 0】



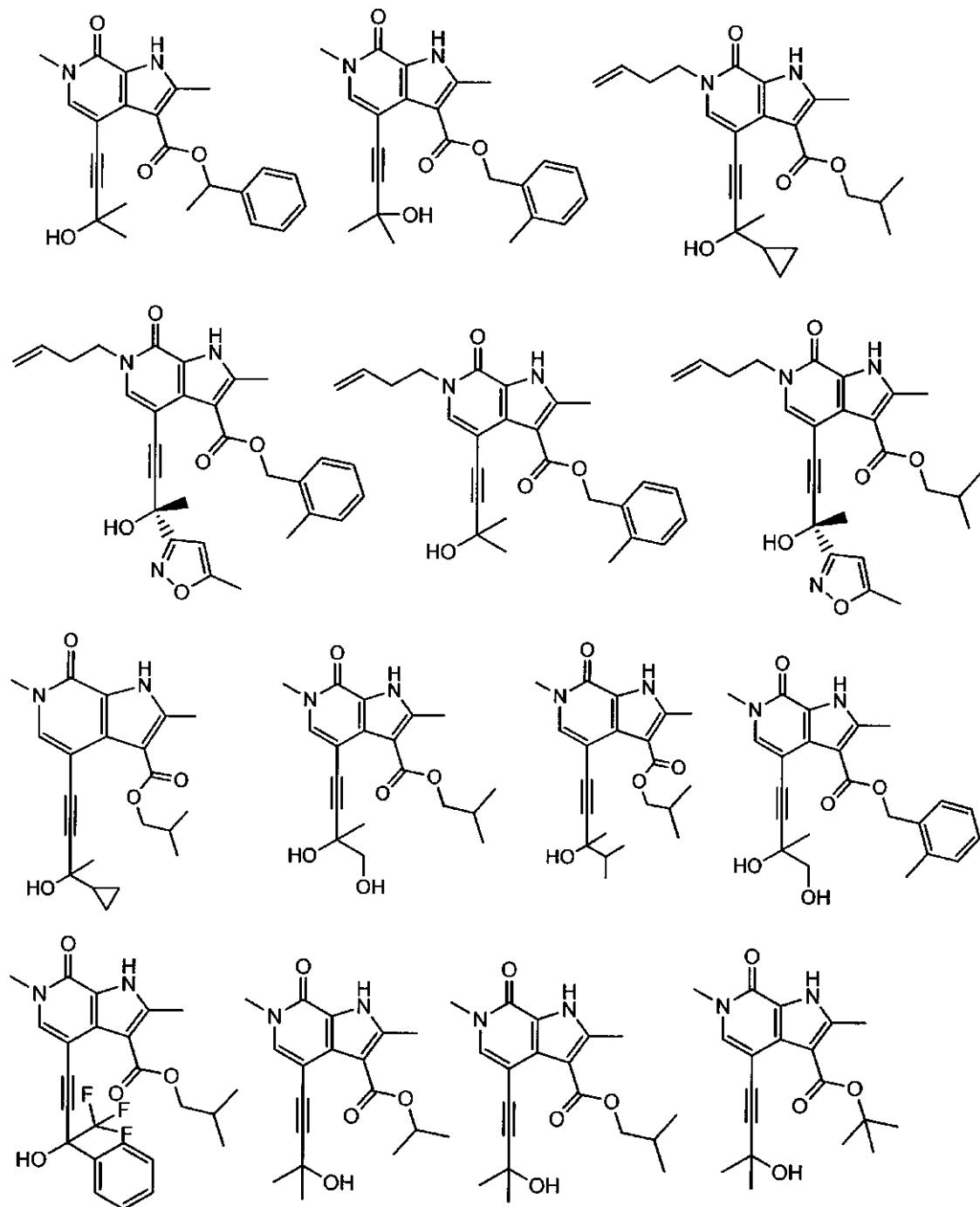
【化 2 0 1】



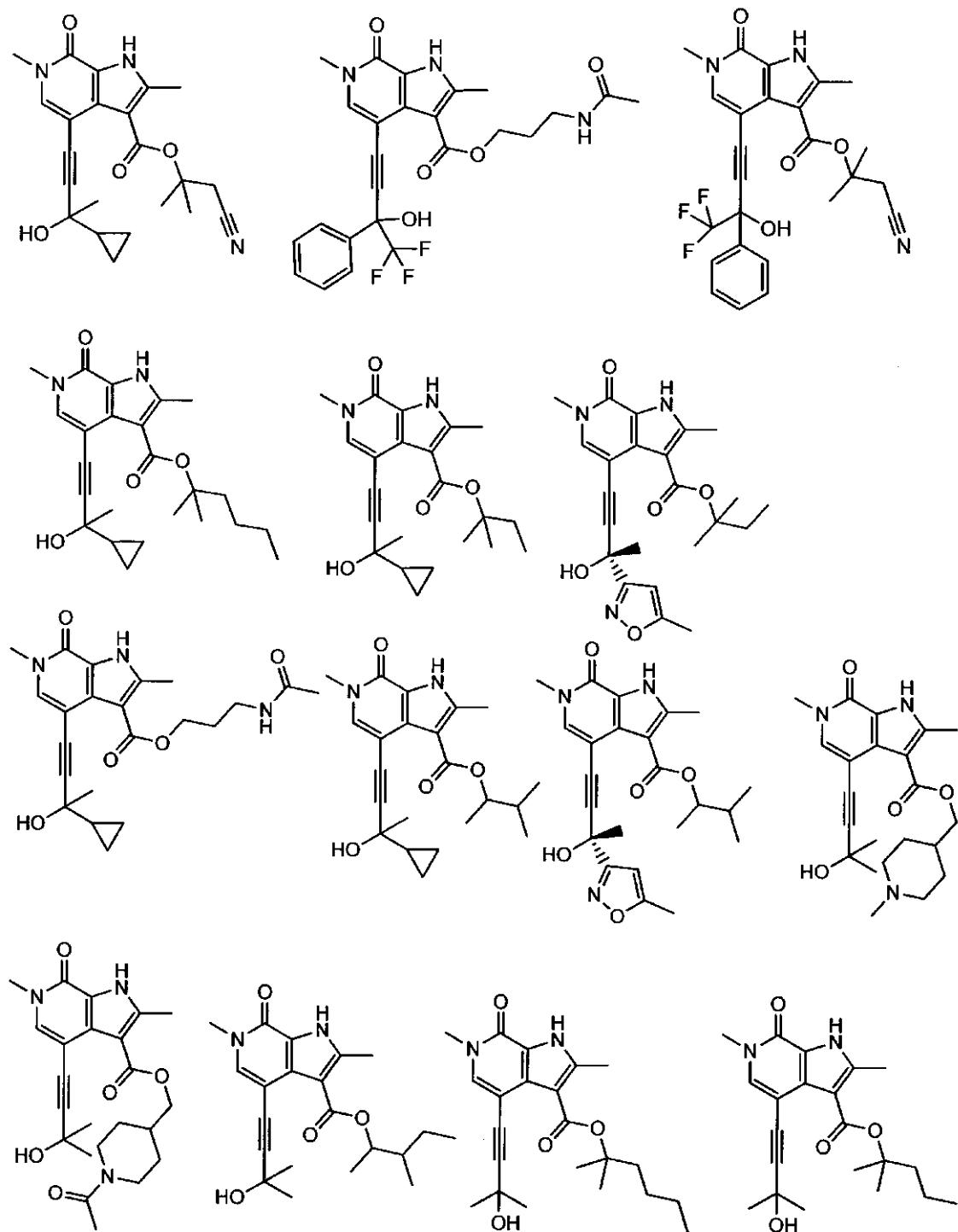
【化 2 0 2】



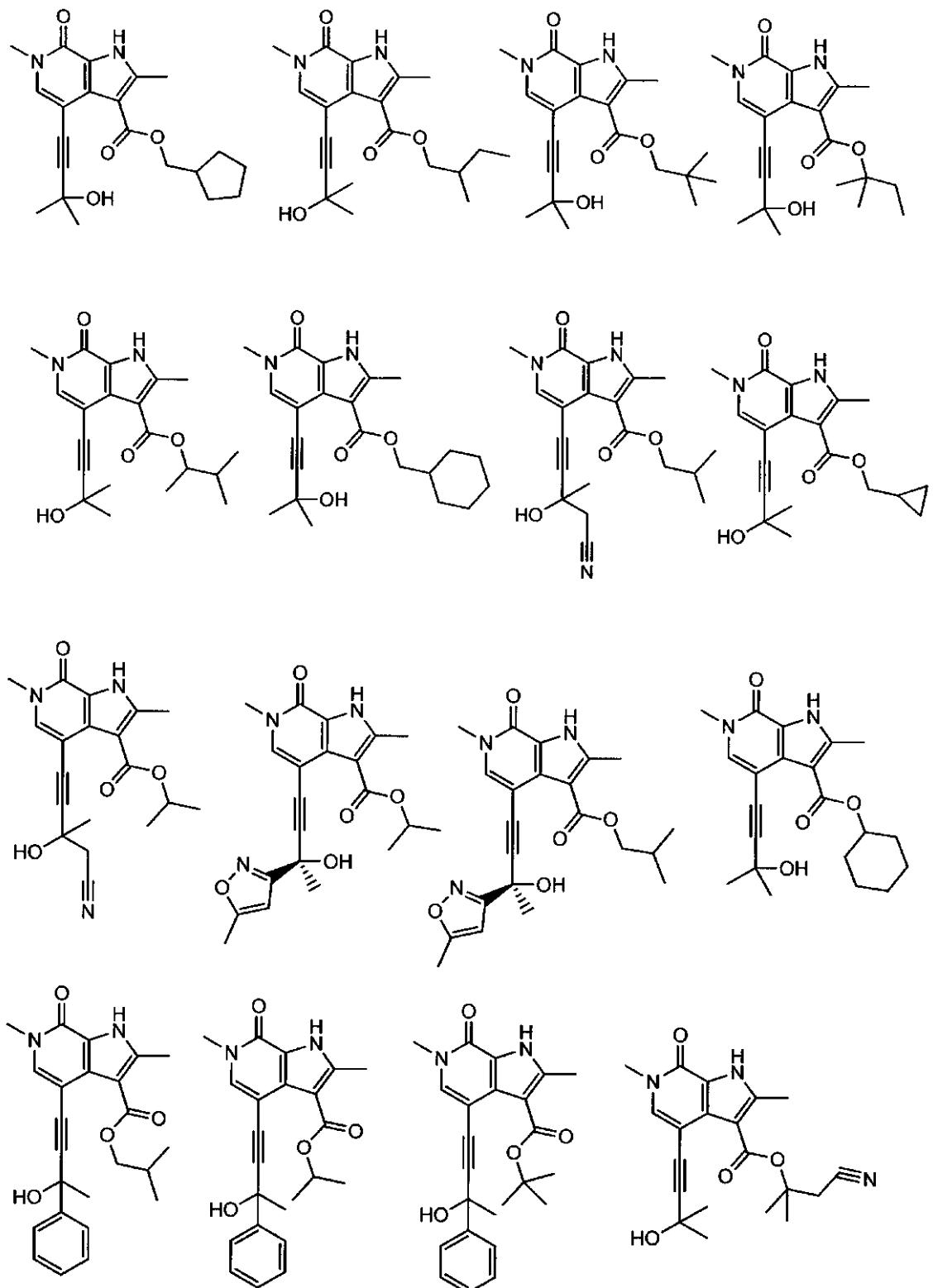
【化 2 0 3】



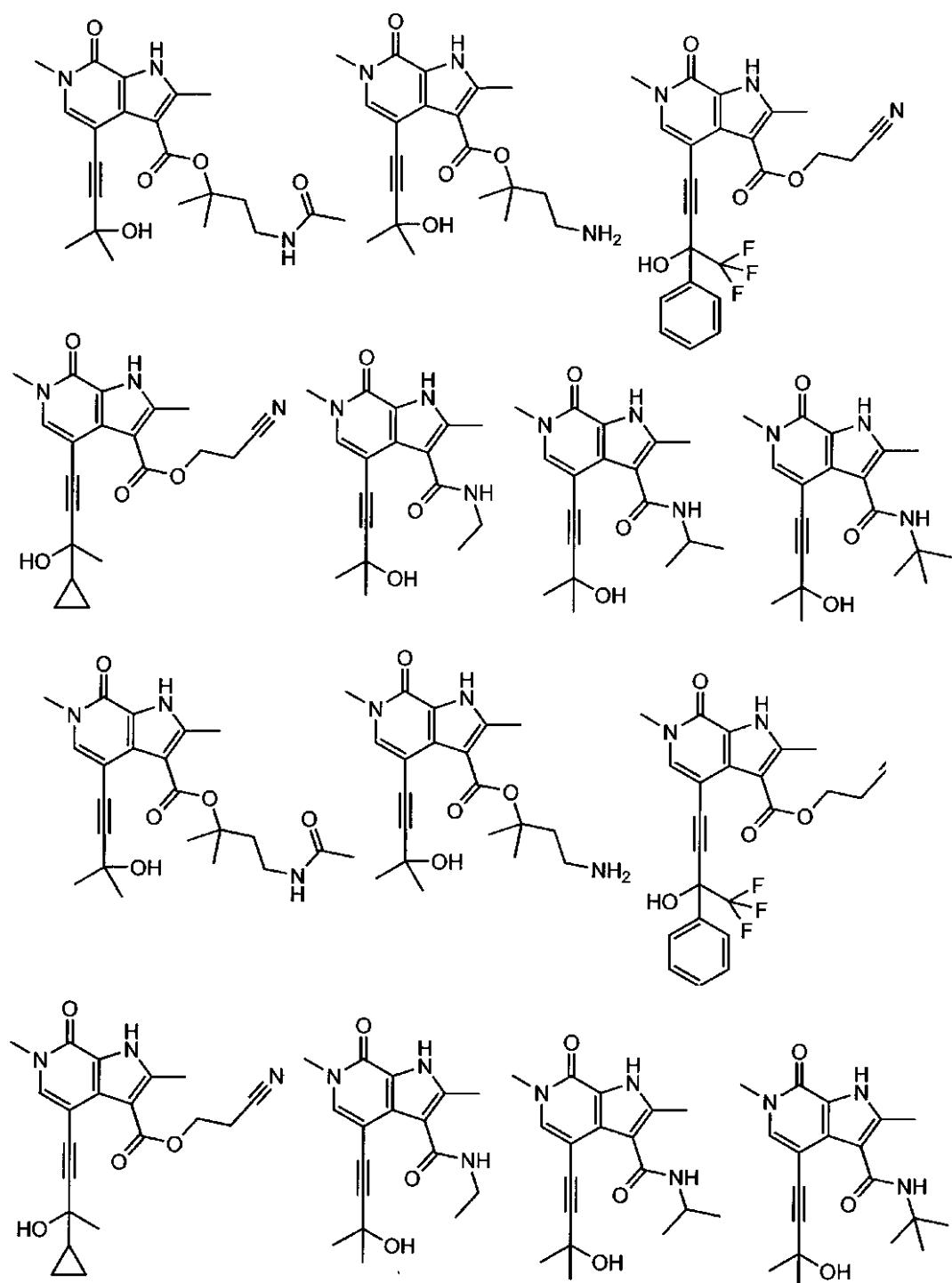
【化 2 0 4】



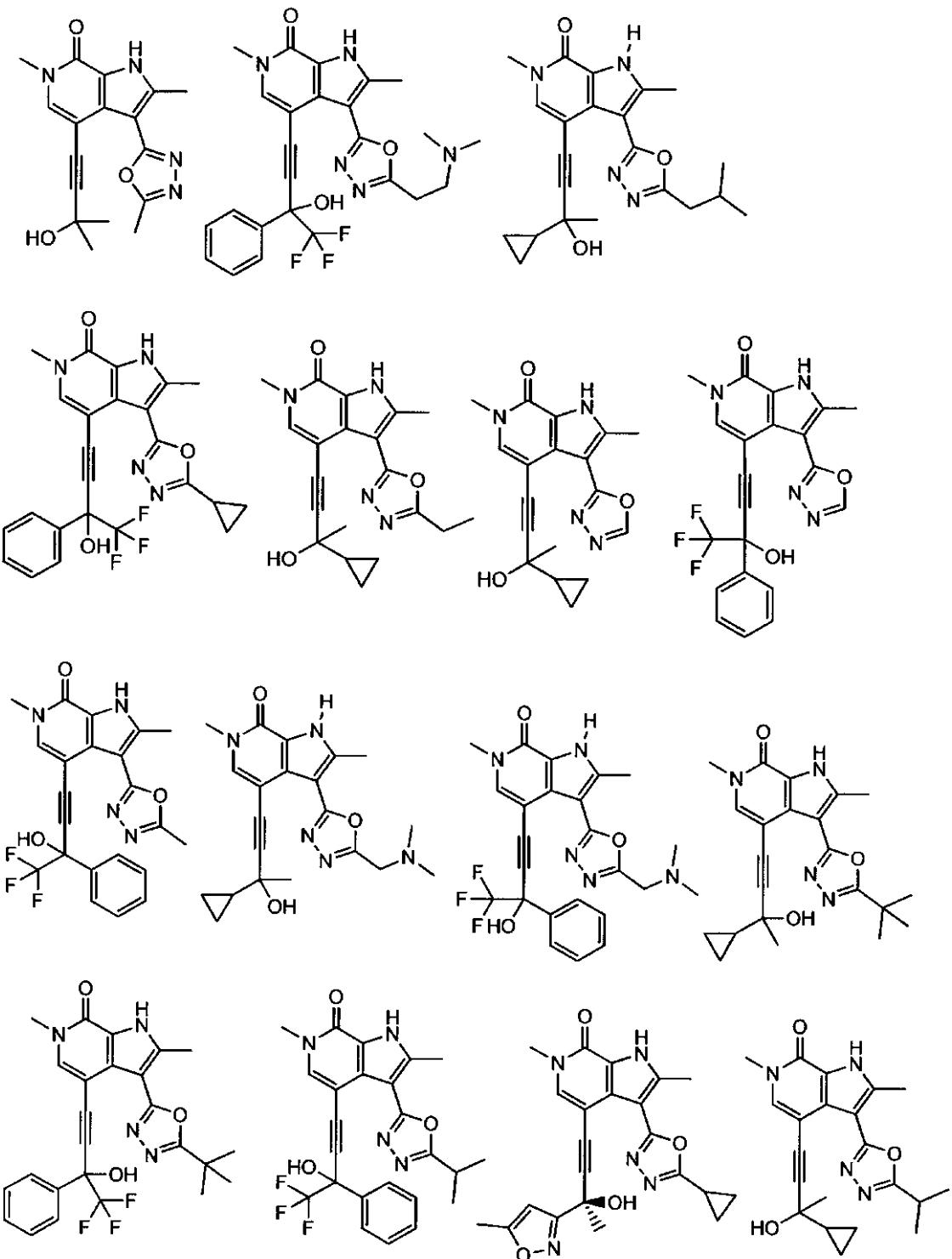
【化 2 0 5】



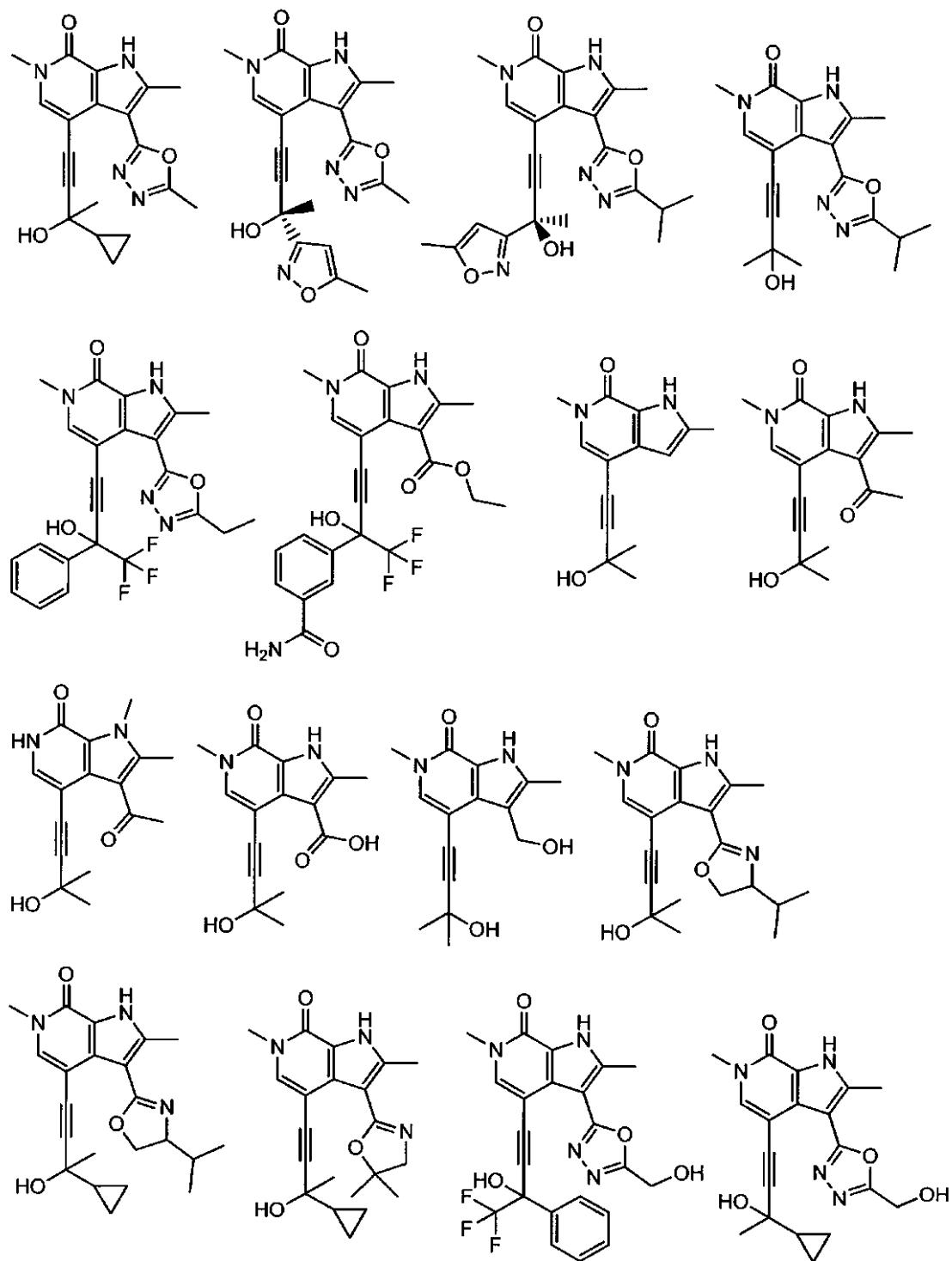
【化 2 0 6】



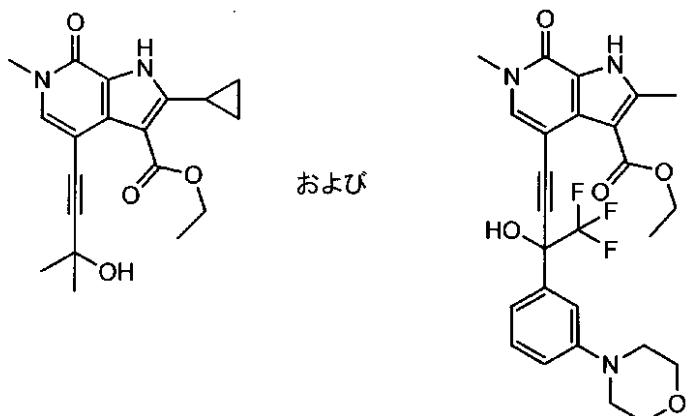
【化 2 0 7】



【化 2 0 8】



## 【化209】



ならびにその塩からなる群から選択される、項目1に記載の化合物。

(項目38)

項目1～37のいずれか1項に記載の式(I)の化合物またはその薬学的に許容され得る塩および薬学的に許容され得るアジュバント、担体、またはビヒクルを含む組成物。

(項目39)

さらなる治療剤をさらに含む、項目38に記載の組成物。

(項目40)

前記さらなる治療剤が化学療法剤である、項目39に記載の組成物。

(項目41)

動物におけるTAF1媒介障害を処置する方法であって、項目1～37のいずれか1項に記載の式(I)の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を前記動物に投与することを含む、方法。

(項目42)

前記障害が癌である、項目41に記載の方法。

(項目43)

前記癌が、聴神経腫、急性白血病、急性リンパ球性白血病、急性骨髓球性白血病、急性T細胞白血病、基底細胞癌腫、胆管癌腫、膀胱癌、脳癌、乳癌、気管支原性癌腫、子宮頸癌、軟骨肉腫、脊索腫、絨毛癌腫、慢性白血病、慢性リンパ球性白血病、慢性骨髓球性白血病、慢性骨髓性白血病、結腸癌、結腸直腸癌、頭蓋咽頭腫、囊胞腺癌腫、びまん性大細胞型B細胞リンパ腫、増殖異常性変化、胎児性癌腫、子宮内膜癌、内皮肉腫、上衣腫、上皮癌腫、赤白血病、食道癌、エストロゲン-受容体陽性乳癌、本態性血小板血症、ユーリング腫瘍、線維肉腫、濾胞性リンパ腫、生殖細胞精巣癌、神経膠腫、膠芽腫、神経膠肉腫、重鎖病、頭頸部癌、血管芽細胞腫、ヘパトーム、肝細胞癌、ホルモン非感受性前立腺癌、平滑筋肉腫、白血病、脂肪肉腫、肺癌、リンパ管内皮肉腫、リンパ管肉腫、リンパ芽球性白血病、リンパ腫、T細胞またはB細胞起源のリンパ系悪性疾患、髄様癌腫、髄芽腫、黒色腫、髄膜腫、中皮腫、多発性骨髓腫、骨髓性白血病、骨髓腫、粘液肉腫、神経芽細胞腫、NUTミッドラインカルシノーマ(NMC)、非小細胞肺癌、乏突起膠腫、口腔癌、骨原性肉腫、卵巣癌、脾臓癌、乳頭腺癌腫、乳頭状癌腫、松果体腫、真性赤血球增加症、前立腺癌、直腸癌、腎細胞癌腫、網膜芽細胞腫、横紋筋肉腫、肉腫、脂腺癌腫、セミノーマ、皮膚癌、小細胞性肺癌腫、固形腫瘍(癌腫および肉腫)、小細胞性肺癌、胃癌、扁平上皮癌腫、滑膜腫、汗腺癌腫、甲状腺癌、ワルデンシュトライムマクログロブリン血症、精巣腫瘍、子宮癌、およびウィルムス腫瘍から選択される、項目42に記載の方法。

(項目44)

前記障害が癌であり、前記癌が肺癌、乳癌、脾臓癌、結腸直腸癌、および黒色腫から選択

される、項目 4 2 に記載の方法。

(項目 4 5 )

医薬療法における使用のための、項目 1 ~ 3 7 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

(項目 4 6 )

T A F 1 媒介障害の予防的処置または治療的処置のための、項目 1 ~ 3 7 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

(項目 4 7 )

動物における T A F 1 媒介障害を処置するための医薬を調製するための、項目 1 ~ 3 7 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の使用。

(項目 4 8 )

T A F 1 の阻害を必要とする動物において T A F 1 を阻害する方法であって、項目 1 ~ 3 7 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその薬学的に許容され得る塩を前記動物に投与することを含む、方法。

(項目 4 9 )

T A F 1 を阻害するための、項目 1 ~ 3 7 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその薬学的に許容され得る塩。

(項目 5 0 )

T A F 1 の阻害を必要とする動物において T A F 1 を阻害するための医薬を調製するための、項目 1 ~ 3 7 のいずれか 1 項に記載の式 (I) の化合物またはその薬学的に許容され得る塩の使用。

(項目 5 1 )

動物における癌を処置する方法であって、有効量の T A F 1 のインヒビターを前記動物に投与することを含む、方法。

(項目 5 2 )

前記癌が、聴神経腫、急性白血病、急性リンパ球性白血病、急性骨髄球性白血病、急性 T 細胞白血病、基底細胞癌腫、胆管癌腫、膀胱癌、脳癌、乳癌、気管支原性癌腫、子宮頸癌、軟骨肉腫、脊索腫、絨毛癌腫、慢性白血病、慢性リンパ球性白血病、慢性骨髄球性白血病、慢性骨髓性白血病、結腸癌、結腸直腸癌、頭蓋咽頭腫、囊胞腺癌腫、びまん性大細胞型 B 細胞リンパ腫、増殖異常性変化、胎児性癌腫、子宮内膜癌、内皮肉腫、上衣腫、上皮癌腫、赤白血病、食道癌、エストロゲン - 受容体陽性乳癌、本態性血小板血症、ユーイング腫瘍、線維肉腫、濾胞性リンパ腫、生殖細胞精巣癌、神経膠腫、膠芽腫、神経膠肉腫、重鎖病、頭頸部癌、血管芽細胞腫、ヘパトーム、肝細胞癌、ホルモン非感受性前立腺癌、平滑筋肉腫、白血病、脂肪肉腫、肺癌、リンパ管内皮肉腫、リンパ管肉腫、リンパ芽球性白血病、リンパ腫、T 細胞または B 細胞起源のリンパ系悪性疾患、髄様癌腫、髄芽腫、黒色腫、髄膜腫、中皮腫、多発性骨髄腫、骨髓性白血病、骨髄腫、粘液肉腫、神経芽細胞腫、N U T ミッドラインカルシノーマ (N M C) 、非小細胞肺癌、乏突起膠腫、口腔癌、骨原性肉腫、卵巣癌、膵臓癌、乳頭腺癌腫、乳頭状癌腫、松果体腫、真性赤血球增加症、前立腺癌、直腸癌、腎細胞癌腫、網膜芽細胞腫、横紋筋肉腫、肉腫、脂腺癌腫、セミノーマ、皮膚癌、小細胞性肺癌腫、固形腫瘍（癌腫および肉腫）、小細胞性肺癌、胃癌、扁平上皮癌腫、滑膜腫、汗腺癌腫、甲状腺癌、ワルデンシュトレームマクログロブリン血症、精巣腫瘍、子宮癌、およびウィルムス腫瘍から選択される、項目 5 1 に記載の方法。

(項目 5 3 )

前記 T A F 1 のインヒビターが T A F 1 に特異的に結合して T A F 1 プロモドメインの活性を阻害する、項目 5 1 ~ 5 2 のいずれか 1 項に記載の方法。

(項目 5 4 )

医薬療法における使用のための、T A F 1 のインヒビター。

(項目 5 5 )

癌の予防的処置または治療的処置のための、T A F 1 のインヒビター。

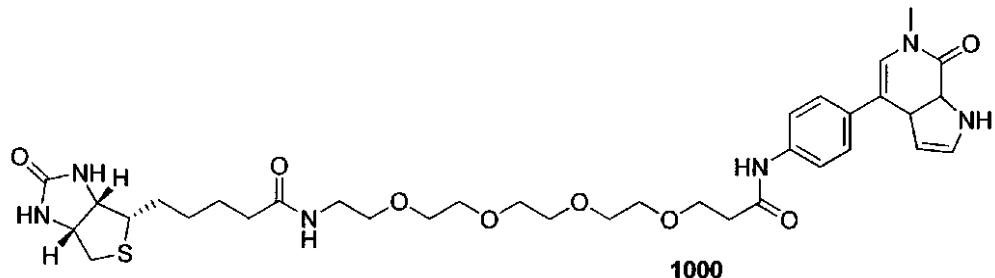
(項目 5 6 )

動物における癌を処置するための医薬を調製するための、TAF1のインヒビターの使用。

(項目57)

化合物：

【化210】



またはその塩。