

【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3年1月21日(2021.1.21)

【公表番号】特表2020-503374(P2020-503374A)

【公表日】令和2年1月30日(2020.1.30)

【年通号数】公開・登録公報2020-004

【出願番号】特願2019-551728(P2019-551728)

【国際特許分類】

C 07 D 221/22	(2006.01)
A 61 P 43/00	(2006.01)
A 61 P 35/00	(2006.01)
A 61 P 35/02	(2006.01)
C 07 D 401/14	(2006.01)
A 61 K 31/506	(2006.01)
C 07 D 401/12	(2006.01)
C 07 D 498/08	(2006.01)
A 61 K 31/5386	(2006.01)
A 61 K 31/55	(2006.01)
C 07 D 471/10	(2006.01)
A 61 K 31/5377	(2006.01)
A 61 K 31/551	(2006.01)
C 07 D 471/04	(2006.01)
C 07 D 413/14	(2006.01)
C 07 D 453/06	(2006.01)
C 07 D 471/08	(2006.01)
C 07 D 491/113	(2006.01)
C 07 D 417/14	(2006.01)
A 61 K 31/541	(2006.01)
C 07 D 487/04	(2006.01)

【F I】

C 07 D 221/22	C S P
A 61 P 43/00	1 1 1
A 61 P 35/00	
A 61 P 35/02	
C 07 D 401/14	
A 61 K 31/506	
C 07 D 401/12	
C 07 D 498/08	
A 61 K 31/5386	
A 61 K 31/55	
C 07 D 471/10	1 0 1
A 61 K 31/5377	
A 61 K 31/551	
C 07 D 471/04	1 1 2 Z
C 07 D 413/14	
C 07 D 453/06	
C 07 D 471/08	
C 07 D 471/04	1 0 6 Z
C 07 D 491/113	

C 0 7 D	417/14	
A 6 1 K	31/541	
C 0 7 D	471/04	1 0 7 Z
C 0 7 D	471/04	1 0 1
C 0 7 D	487/04	1 3 7

## 【手続補正書】

【提出日】令和2年12月7日(2020.12.7)

## 【手続補正1】

【補正対象書類名】特許請求の範囲

【補正対象項目名】全文

【補正方法】変更

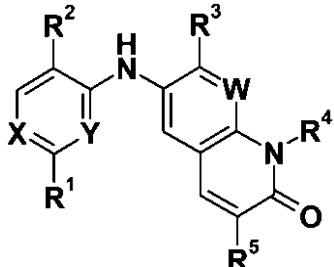
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

## 【請求項1】

式(I)

## 【化1】



(I)

(式中、

$R^1$ は、4～12員ヘテロシクリルおよび5～12員ヘテロアリールからなる群から選択され、前記ヘテロシクリルまたは前記ヘテロアリールは、少なくとも1個の窒素原子を含み且つ窒素を介して結合されており、前記ヘテロシクリル基は、 $R^7$ から独立して選択される1つまたは複数の同一の基または異なる基で独立して置換されていてもよく、前記ヘテロアリール基は、 $R^8$ から独立して選択される1つまたは複数の同一の基または異なる基で独立して置換されていてもよく、

$R^7$ は、=O、-CN、-CCH、-OH、-COOH、ハロゲン、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、-C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、5員または6員ヘテロアリール、フェニル、-N(R<sup>9</sup>R<sup>10</sup>)、-C(O)-R<sup>11</sup>、-C(O)N(R<sup>12</sup>R<sup>13</sup>)および5～8員ヘテロシクリルからなる群から選択され、前記ヘテロシクリルは、-C<sub>1-6</sub>アルキルから選択される1つの基で置換されていてもよく、

または $R^7$ は、-COOH、-OH、-COO(C<sub>1-6</sub>アルキル)、-CON(C<sub>1-3</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)<sub>2</sub>、フェニルおよび5員または6員ヘテロシクリルで置換されていてもよい-C<sub>1-6</sub>アルキルであり、前記ヘテロシクリルは、-C<sub>1-6</sub>アルキルから選択される1つの基で置換されていてもよく、

$R^9$ は、水素および-C<sub>1-4</sub>アルキルから選択され、

$R^{10}$ は、水素、-C<sub>1-4</sub>アルキル、-C<sub>1-4</sub>ハロアルキル、6員ヘテロシクリルおよび6員ヘテロアリールからなる群から選択され、

$R^{11}$ は、-C<sub>1-3</sub>アルキル-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)<sub>2</sub>および5員または6員ヘテロシクリルからなる群から選択され、前記ヘテロシクリルは、-C<sub>1-3</sub>アルキルから選択される1つの基で置換されていてもよく、

$R^{12}$ は、水素および-C<sub>1-3</sub>アルキルから選択され、

$R^{13}$ は、-NH<sub>2</sub>、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-NH<sub>2</sub>および-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-NH<sub>2</sub>で置換されていてもよい-C<sub>1-6</sub>アルキルから

選択され、

または  $R^{13}$  は、 -  $C_{1-3}$  アルキルで置換されていてもよい 6 員ヘテロシクリルであり、

、  $R^8$  は、 -  $COOH$ 、 -  $C_{1-6}$  アルキル、 -  $C(O) - R^{19}$ 、 -  $C(O)N(R^{20}R^{21})$  から選択され、

$R^{19}$  は、 -  $C_{1-3}$  アルキルで置換されていてもよい 6 員ヘテロシクリルであり、

$R^{20}$  および  $R^{21}$  は、水素および -  $C_{1-3}$  アルキルから独立して選択され、

$R^2$  は、塩素およびフッ素からなる群から選択され、

$R^3$  は、水素、 -  $C_{1-4}$  アルキル、 -  $O - C_{1-4}$  アルキルおよびハロゲンからなる群から選択され、

$R^4$  は、水素、 -  $C_{3-6}$  シクロアルキル、4 ~ 7 員ヘテロシクリルからなる群から選択され、各基は、 -  $C_{1-3}$  アルキルから選択される 1 つの基で置換されていてもよく、または

$R^4$  は、 -  $OH$ 、 -  $NH_2$ 、 -  $O - C_{1-4}$  アルキル、 -  $NH - C_{1-4}$  アルキル、 -  $N(C_{1-4} \text{ アルキル})_2$ 、 -  $C_{3-6}$  シクロアルキルおよび 4 ~ 7 員ヘテロシクリルから選択される 1 つの基で置換されていてもよい -  $C_{1-6}$  アルキルであり、各シクロアルキル基およびヘテロシクリル基は、 -  $C_{1-3}$  アルキルから選択される 1 つの基で独立して置換されていてもよく、

$R^5$  は、 -  $L_1 - C(R^{14}R^{15}) - R^{16}$  または -  $CH = CH - R^{16}$  であり、式中、

$L_1$  は、 -  $O$  - または -  $S$  - であり、

$R^{14}$  は、水素または  $C_{1-4}$  アルキルであり、

$R^{15}$  は、水素または  $C_{1-4}$  アルキルであり、

または  $R^{14}$  および  $R^{15}$  は一緒にになって -  $C_{3-5}$  シクロアルキルを形成し、

$R^{16}$  は、 -  $COOH$ 、 -  $CONH_2$ 、 -  $C(O)R^{17}$ 、 -  $C(O)OR^{17}$ 、 -  $C(O)NR^{17}R^{18}$ 、 -  $S(O) - C_{1-6}$  アルキル、 -  $S(O)_2 - C_{1-6}$  アルキル、 -  $P(O) - (C_{1-6} \text{ アルキル})_2$ 、 -  $C(NH)NH_2$  であり、

$R^{17}$  は、 -  $OH$ 、 -  $CF_3$ 、 -  $N(C_{1-4} \text{ アルキル})_2$ 、 -  $C_{3-6}$  シクロアルキル、3 ~ 6 員ヘテロシクリル、 -  $C_{2-4}$  アルケニル、 -  $C_{2-4}$  アルキニルから選択される 1 つまたは複数の同一の基または異なる基で置換されていてもよい 3 ~ 6 員ヘテロシクリルまたは -  $C_{1-4}$  アルキルであり、

$R^{18}$  は、水素または  $C_{1-4}$  アルキルであり、

$W$  は、窒素または  $CR^6$  であり、

$X$  は、窒素または  $CH$  であり、

$Y$  は、窒素または  $CH$  であり、

$X$  および  $Y$  のうちの少なくとも 1 つは窒素であり、

$R^6$  は、水素、 -  $C_{1-4}$  アルキル、 -  $O - C_{1-4}$  アルキル、 -  $O - C_{1-4}$  ハロアルキル、 -  $C_{1-4}$  ハロアルキルおよびハロゲンからなる群から選択される) の化合物またはその塩。

#### 【請求項 2】

$R^3$  が、水素、ハロゲンおよび -  $O - CH_3$  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 3】

$R^4$  が、 -  $OH$ 、 -  $C_{3-6}$  シクロアルキルおよび -  $N(C_{1-4} \text{ アルキル})_2$  から選択される 1 つの基で置換されていてもよい -  $C_{1-4}$  アルキルからなる群から選択される、請求項 1 または 2 に記載の化合物またはその塩。

#### 【請求項 4】

$R^4$  が、 -  $CH_3$ 、 -  $CH_2CH_3$ 、 -  $CH_2CH_2CH_3$ 、 -  $CH(CH_3)_2$ 、 -  $(CH_2)_3OH$ 、 -  $(CH_2)_2(CH_3)_2$ 、 -  $CH_2$  - シクロプロピルおよび -  $(CH_2)_2N(CH_3)_2$  からなる群から選択される、請求項 3 に記載の化合物またはその塩。

#### 【請求項 5】

$W$  が  $CR^6$  であり、且つ

$R^6$ が、水素、 $C_{1-4}$ アルキル、 $-O-C_{1-4}$ アルキル、 $-O-C_{1-4}$ ハロアルキルおよびハロゲンからなる群から選択される、請求項1から4までのいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

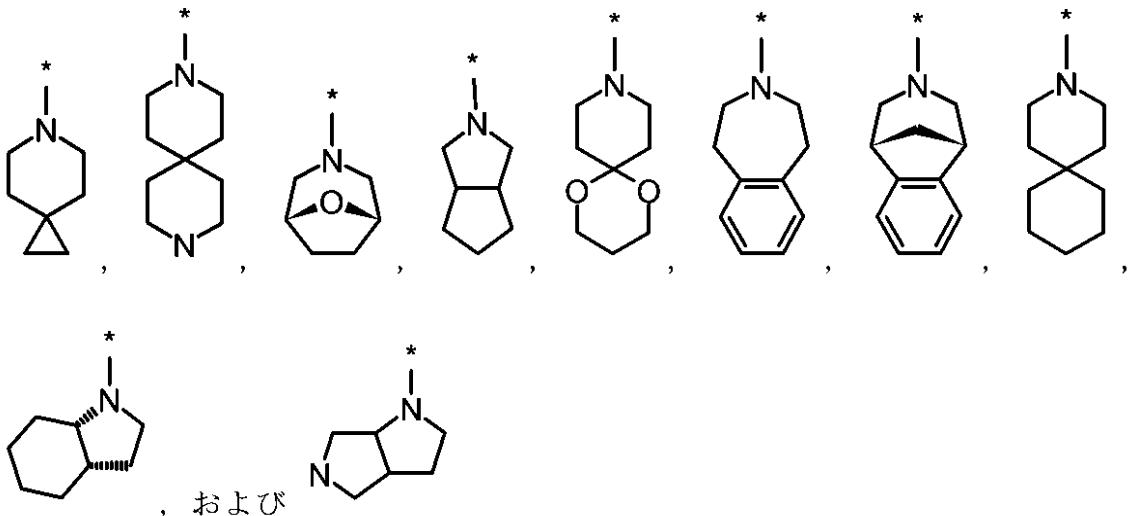
【請求項6】

$R^6$ が、水素、 $-O-CH_3$ からなる群から選択される、請求項5に記載の化合物またはその塩。

【請求項7】

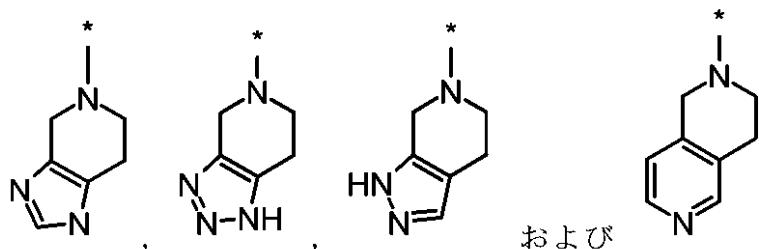
$R^1$ が、5～7員ヘテロシクリル、

【化2】



からなる群から選択されるヘテロシクリルであるか、  
または $R_1$ が、5～7員ヘテロアリール、

【化3】



からなる群から選択されるヘテロアリールであり、

前記ヘテロシクリルまたは前記ヘテロアリールが、少なくとも1個の窒素原子を含み且つ窒素を介して結合されており、前記ヘテロシクリル基が、 $R^7$ から独立して選択される1つまたは複数の同一の基または異なる基で独立して置換されていてもよく、前記ヘテロアリール基が、 $R^8$ から独立して選択される1つまたは複数の同一の基または異なる基で独立して置換されていてもよく、

$R^7$ が、=O、 $-CN$ 、 $-CCH$ 、 $-OH$ 、 $-COOH$ 、ハロゲン、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-C_{1-6}$ ハロアルキル、5員または6員ヘテロアリール、フェニル、 $-N(R^9R^{10})$ 、 $-C(O)-R^{11}$ 、 $-C(O)N(R^{12}R^{13})$ および5～8員ヘテロシクリルからなる群から選択され、前記ヘテロシクリルは、 $-C_{1-6}$ アルキルから選択される1つの基で置換されていてもよく、

または $R^7$ が、 $-COOH$ 、 $-OH$ 、 $-COO(C_{1-6}$ アルキル)、 $-CON(C_{1-3}$ アルキル) $_2$ 、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-N(C_{1-3}$ アルキル) $_2$ 、フェニルおよび5員または6員ヘテロシクリルで置換されていてもよい、 $-C_{1-6}$ アルキルであり、前記ヘテロシクリルは、 $-C_{1-6}$ アルキルから選択される1つの基で置換されていてもよく、

$R^9$ が、水素および $-C_{1-4}$ アルキルから選択され、  
 $R^{10}$ が、水素、 $-C_{1-4}$ アルキル、 $-C_{1-4}$ ハロアルキル、6員ヘテロシクリルおよび6員ヘテロアリールからなる群から選択され、

$R^{11}$ が、 $-C_{1-3}$ アルキル- $N(C_{1-3}$ アルキル) $_2$ および5員または6員ヘテロシクリルからなる群から選択され、前記ヘテロシクリルは、 $-C_{1-3}$ アルキルから選択される1つの基で置換されていてもよく、

$R^{12}$ が、水素および $-C_{1-3}$ アルキルから選択され、

$R^{13}$ が、 $-NH_2$ 、 $-O-C_{1-6}$ アルキル、 $-O-C_{1-6}$ アルキル- $NH_2$ および $-O-C_{1-6}$ アルキル- $O-C_{1-6}$ アルキル- $NH_2$ で置換されていてもよい $-C_{1-6}$ アルキルから選択され、

または $R^{13}$ が、 $-C_{1-3}$ アルキルで置換されていてもよい6員ヘテロシクリルであり、

$R^8$ が、 $-COOH$ 、 $-C_{1-6}$ アルキル、 $-C(O)-R^{19}$ 、 $-C(O)N(R^{20}R^{21})$ から選択され、

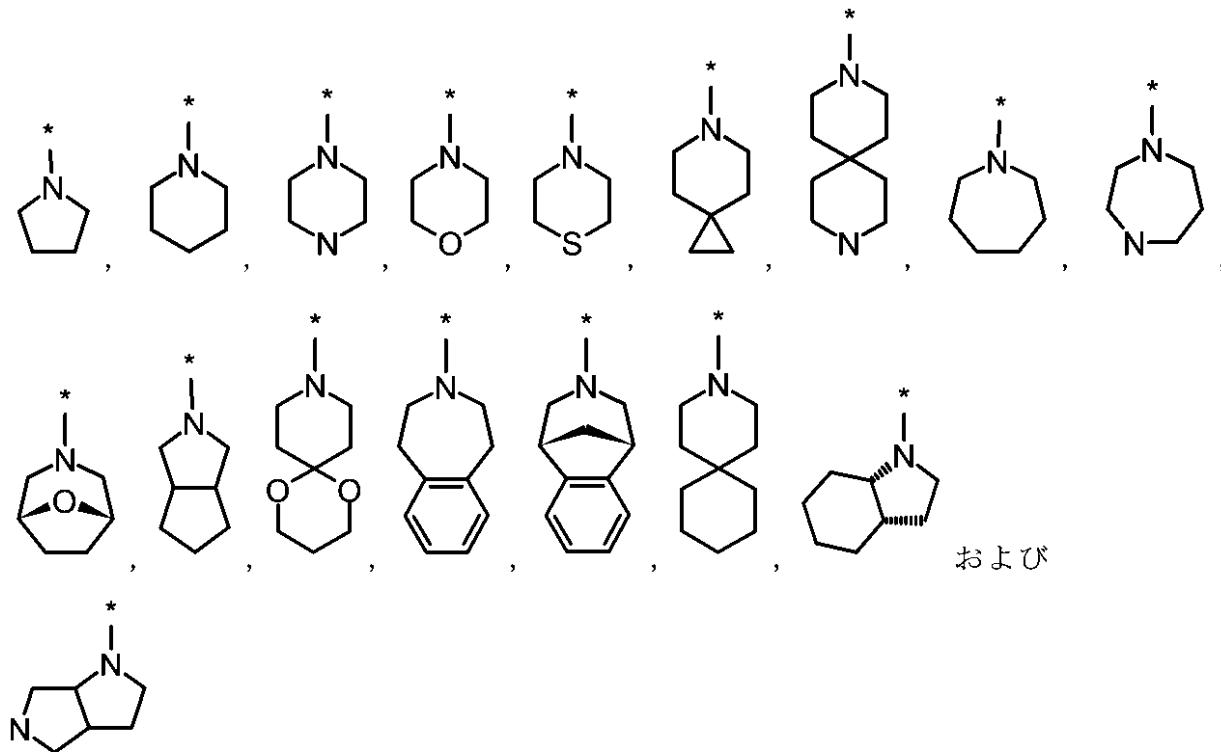
$R^{19}$ が、 $-C_{1-3}$ アルキルで置換されていてもよい6員ヘテロシクリルであり、

$R^{20}$ および $R^{21}$ が、水素および $-C_{1-3}$ アルキルから独立して選択される、請求項1から6までのいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

【請求項8】

$R^1$ が、

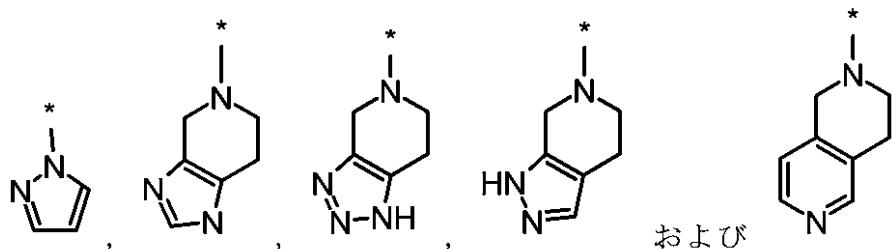
【化4】



から選択されるヘテロシクリルであり、前記ヘテロシクリルは、前記 $R^7$ 基から独立して選択される1つ、2つ、3つまたは4つの置換基で独立して置換されていてもよく、 $R^1$ が、3つまたは4つの独立して選択される $R^7$ で置換されている場合、それらのうちの少なくとも2つは前記 $-C_{1-3}$ アルキル基から独立して選択され、または

$R^1$ が、

## 【化5】



および

からなる群から選択されるヘテロアリールであり、前記ヘテロアリールは、前記R<sup>8</sup>基から独立して選択される1つまたは2つの置換基で独立して置換されていてもよく、

R<sup>7</sup>が、=O、-CCH、-CN、-OH、-COOH、ハロゲン、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、-C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、5員または6員ヘテロアリール、フェニル、-N(R<sup>9</sup>R<sup>10</sup>)、-C(O)-R<sup>11</sup>、-C(O)N(R<sup>12</sup>R<sup>13</sup>)および5~8員ヘテロシクリルからなる群から選択され、前記ヘテロシクリルは、-C<sub>1-3</sub>アルキルから選択される1つの基で置換されていてもよく、

またはR<sup>7</sup>が、-COOH、-OH、-COO(C<sub>1-6</sub>アルキル)、-CON(C<sub>1-3</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)<sub>2</sub>、フェニルおよび5員または6員ヘテロシクリルで置換されていてもよい-C<sub>1-6</sub>アルキルであり、前記ヘテロシクリルは、-C<sub>1-3</sub>アルキルから選択される1つの基で置換されていてもよく、

R<sup>9</sup>が、水素および-C<sub>1-4</sub>アルキルから選択され、

R<sup>10</sup>が、水素、-C<sub>1-4</sub>アルキル、-C<sub>1-4</sub>ハロアルキル、5員または6員ヘテロシクリルおよび6員ヘテロアリールからなる群から選択され、

R<sup>11</sup>が、-C<sub>1-3</sub>アルキル-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)<sub>2</sub>および5員または6員ヘテロシクリルからなる群から選択され、前記ヘテロシクリルは、-C<sub>1-3</sub>アルキルから選択される1つの基で置換されていてもよく、

R<sup>12</sup>が、水素および-C<sub>1-3</sub>アルキルから選択され、

R<sup>13</sup>が、-NH<sub>2</sub>、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-NH<sub>2</sub>および-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-NH<sub>2</sub>で置換されていてもよい-C<sub>1-6</sub>アルキルから選択され、

またはR<sup>13</sup>が、-C<sub>1-3</sub>アルキルで置換されていてもよい6員ヘテロシクリルであり、

R<sup>8</sup>が、-COOH、-C<sub>1-6</sub>アルキル、-C(O)-R<sup>19</sup>、-C(O)N(R<sup>20</sup>R<sup>21</sup>)から選択され、

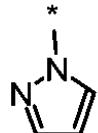
R<sup>19</sup>が、-C<sub>1-3</sub>アルキルで置換されていてもよい6員ヘテロシクリルであり、

R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>が、水素および-C<sub>1-3</sub>アルキルから独立して選択される、請求項1から7までのいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

## 【請求項9】

R<sup>1</sup>が、R<sup>8</sup>から独立して選択される1つまたは2つの基で置換されていてもよい下記の基：

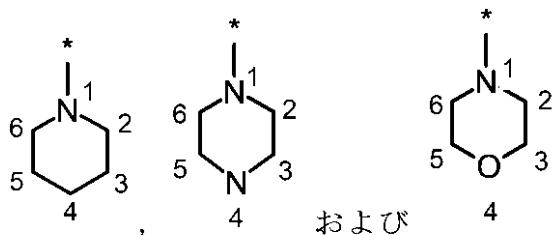
## 【化6】



であるか、または

R<sup>1</sup>が、

## 【化7】



からなる群から選択され、前記ピペリジニル基およびピペラジニル基が、3位、4位および／または5位において、且つ前記モルホリニル基が、3位および／または5位において、前記R<sup>7</sup>基から独立して選択される1つ、2つ、3つもしくは4つの置換基で独立して置換されていてもよく、且つR<sup>1</sup>が、3つまたは4つの独立して選択されるR<sup>7</sup>で置換されている場合、それらの置換基のうちの少なくとも2つは-C<sub>1-3</sub>アルキルであり、

R<sup>7</sup>が、=O、-CCH、-CN、-OH、-COOH、ハロゲン、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、-C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、5員または6員ヘテロアリール、フェニル、-N(R<sup>9</sup>R<sup>10</sup>)、-C(O)-R<sup>11</sup>、-C(O)N(R<sup>12</sup>R<sup>13</sup>)および5～8員ヘテロシクリルからなる群から選択され、前記ヘテロシクリルは、-C<sub>1-3</sub>アルキルから選択される1つの基で置換されていてもよく、

またはR<sup>7</sup>が、-COOH、-OH、-COO(C<sub>1-6</sub>アルキル)、-CON(C<sub>1-3</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)<sub>2</sub>、フェニルおよび5員または6員ヘテロシクリルで置換されていてもよい-C<sub>1-6</sub>アルキルであり、前記ヘテロシクリルは、-C<sub>1-3</sub>アルキルから選択される1つの基で置換されていてもよく、

R<sup>9</sup>が、水素および-C<sub>1-4</sub>アルキルから選択され、

R<sup>10</sup>が、水素、-C<sub>1-4</sub>アルキル、-C<sub>1-4</sub>ハロアルキル、6員ヘテロシクリルおよび6員ヘテロアリールからなる群から選択され、

R<sup>11</sup>が、-C<sub>1-3</sub>アルキル-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)<sub>2</sub>および5員または6員ヘテロシクリルからなる群から選択され、前記ヘテロシクリルは、-C<sub>1-3</sub>アルキルで置換されていてもよく、

R<sup>12</sup>が、水素および-C<sub>1-3</sub>アルキルから選択され、

R<sup>13</sup>が、-NH<sub>2</sub>、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-NH<sub>2</sub>および-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-NH<sub>2</sub>で置換されていてもよい-C<sub>1-6</sub>アルキルから選択され、

またはR<sup>13</sup>が、-C<sub>1-3</sub>アルキルで置換されていてもよい6員ヘテロシクリルであり、

R<sup>8</sup>が、-COOH、-C<sub>1-6</sub>アルキル、-C(O)-R<sup>19</sup>、-C(O)N(R<sup>20</sup>R<sup>21</sup>)から選択され、

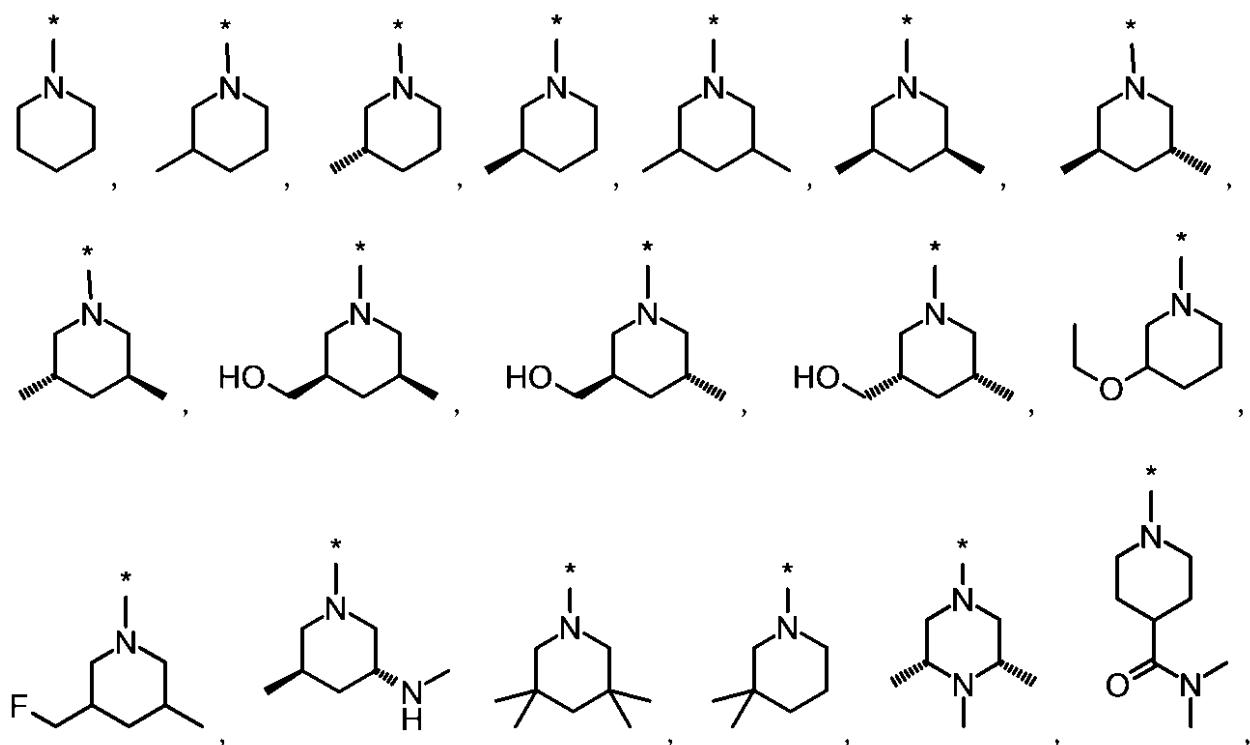
R<sup>19</sup>が、-C<sub>1-3</sub>アルキルで置換されていてもよい6員ヘテロシクリルであり、

R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>が、水素および-C<sub>1-3</sub>アルキルから独立して選択される、請求項1から8までのいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

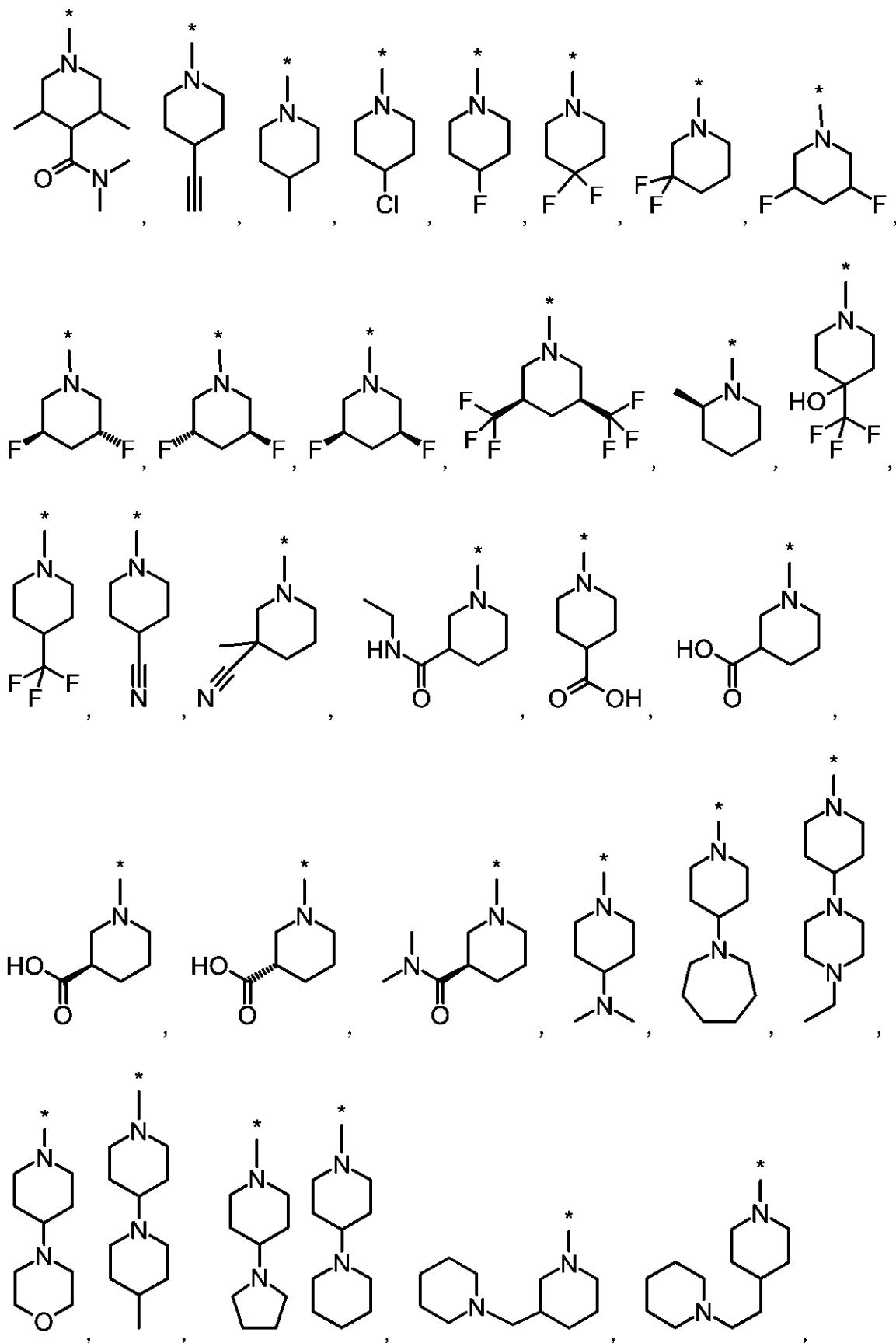
## 【請求項10】

R<sup>1</sup>が、

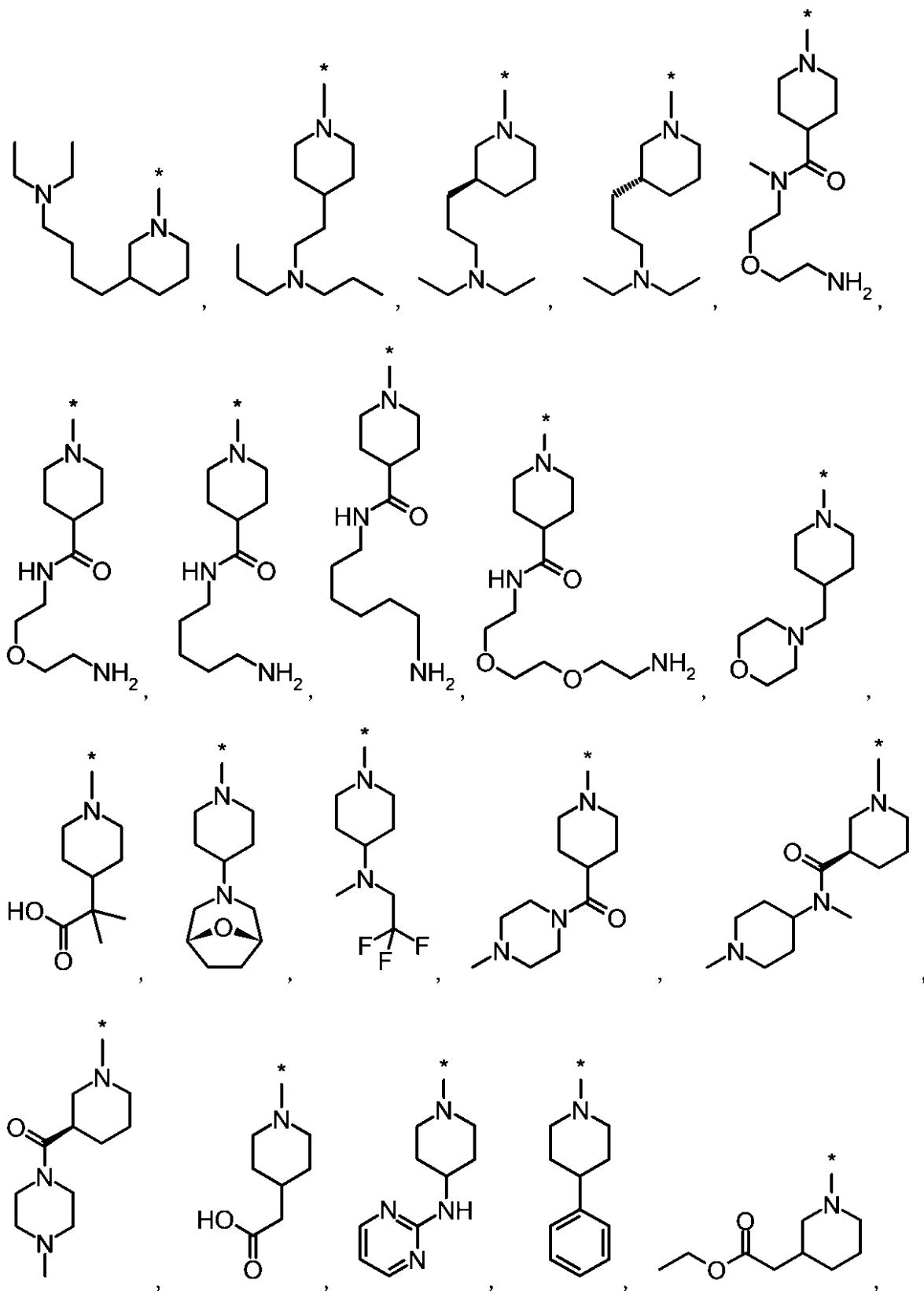
【化 8】



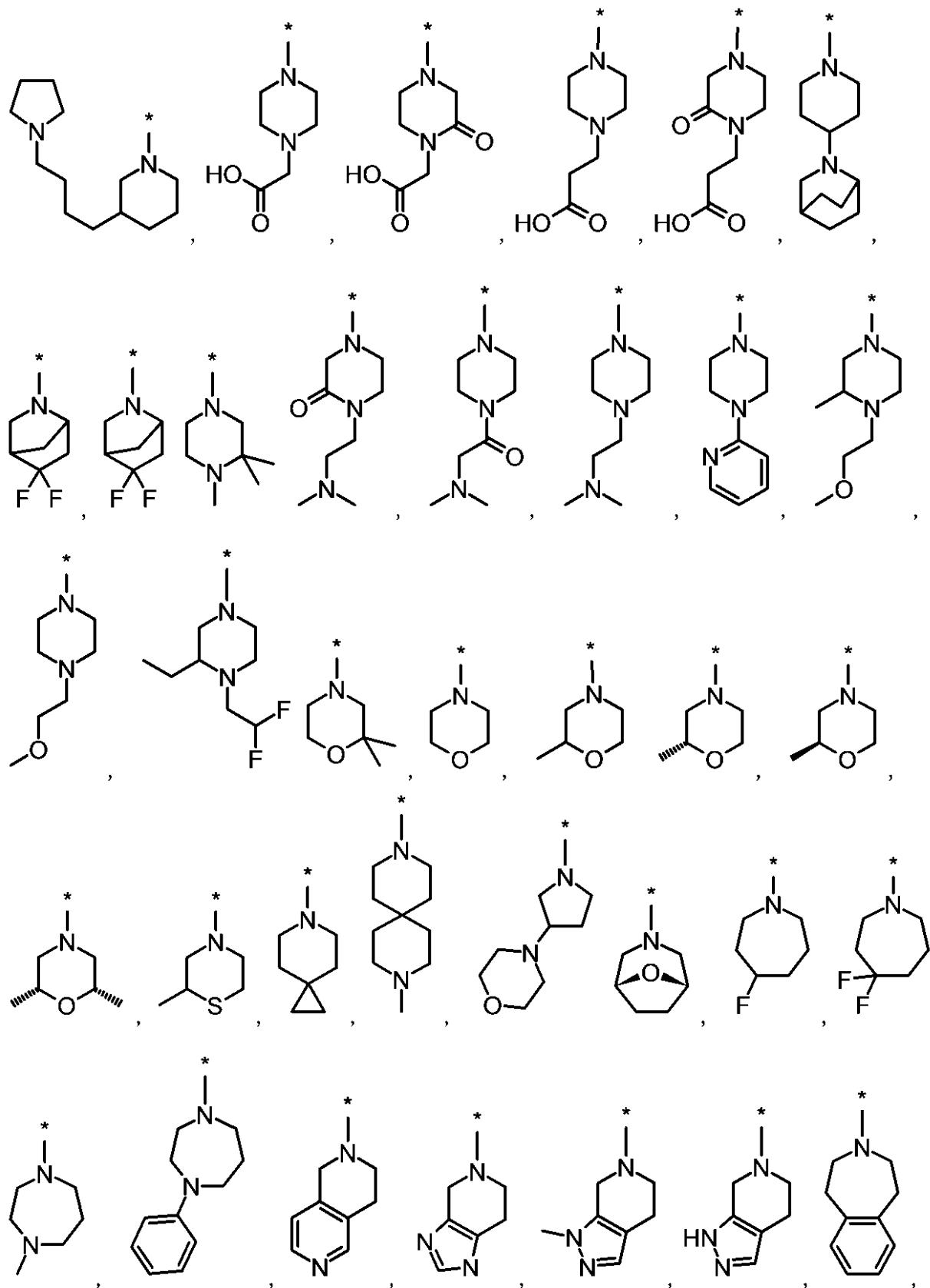
【化 9】



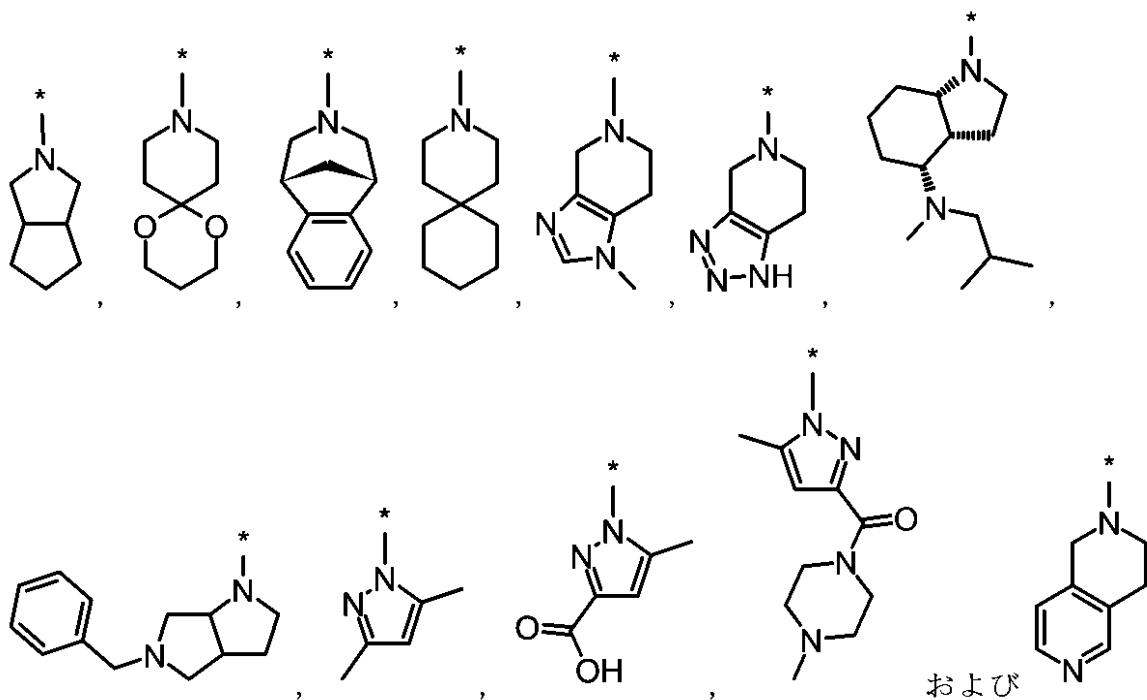
【化 1 0】



【化 11】



【化 1 2】

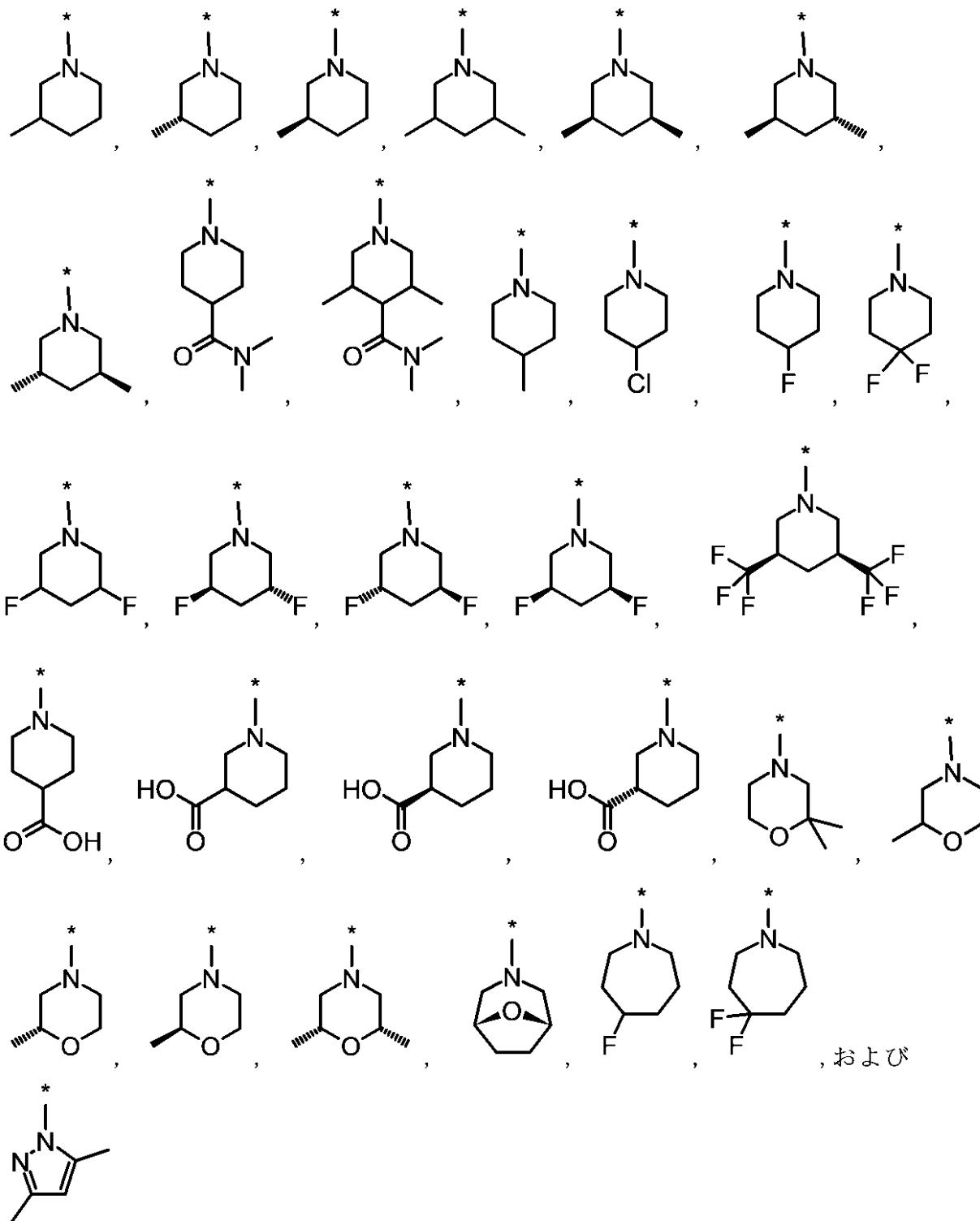


から選択される、請求項 1 から 8 までに記載の化合物またはその塩。

### 【請求項 11】

R<sup>1</sup> が、

### 【化 1 3】

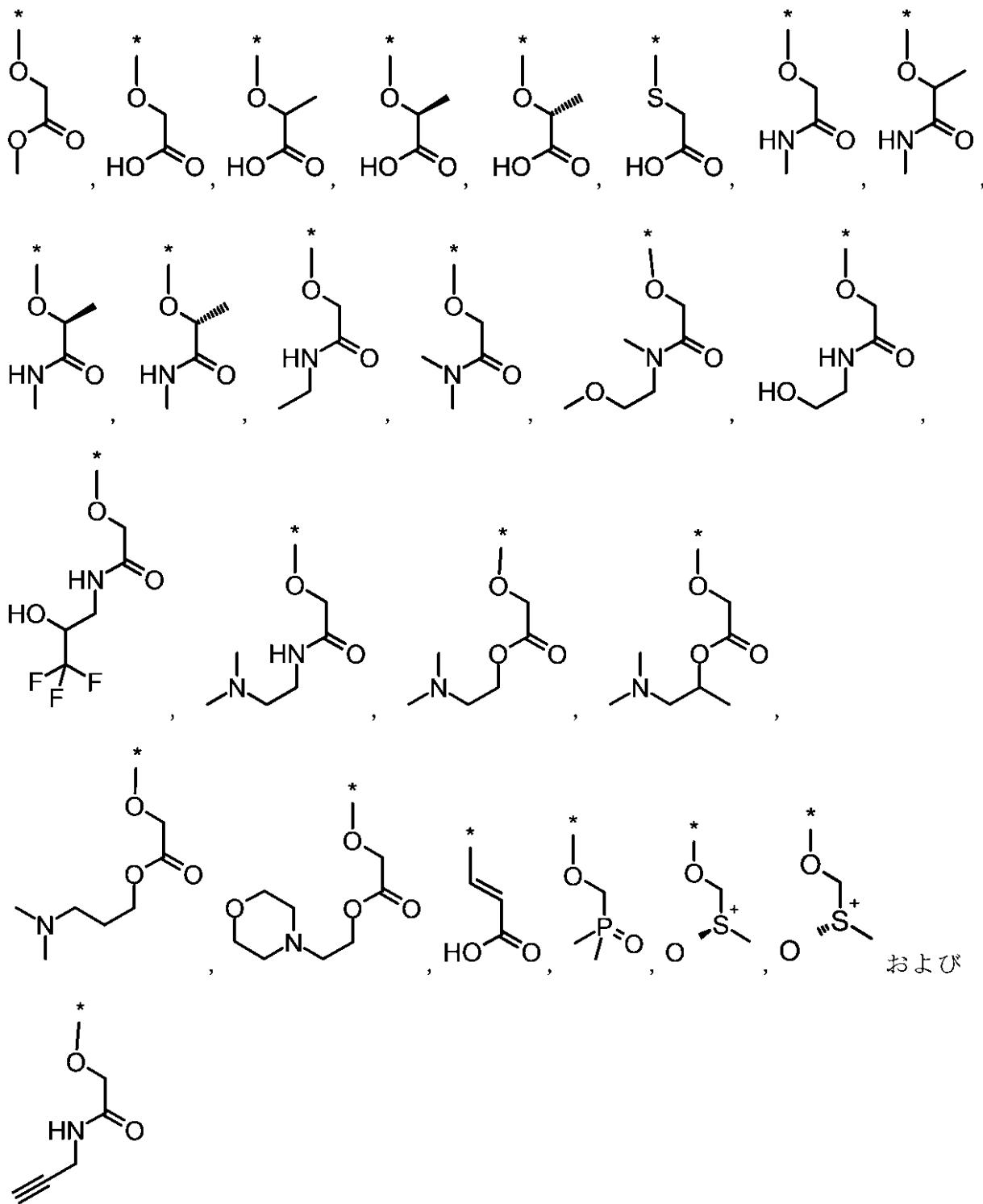


から選択される、請求項 1 から 8 までに記載の化合物またはその塩。

## 【請求項 1 2】

R<sup>5</sup> が、

【化 1 4】

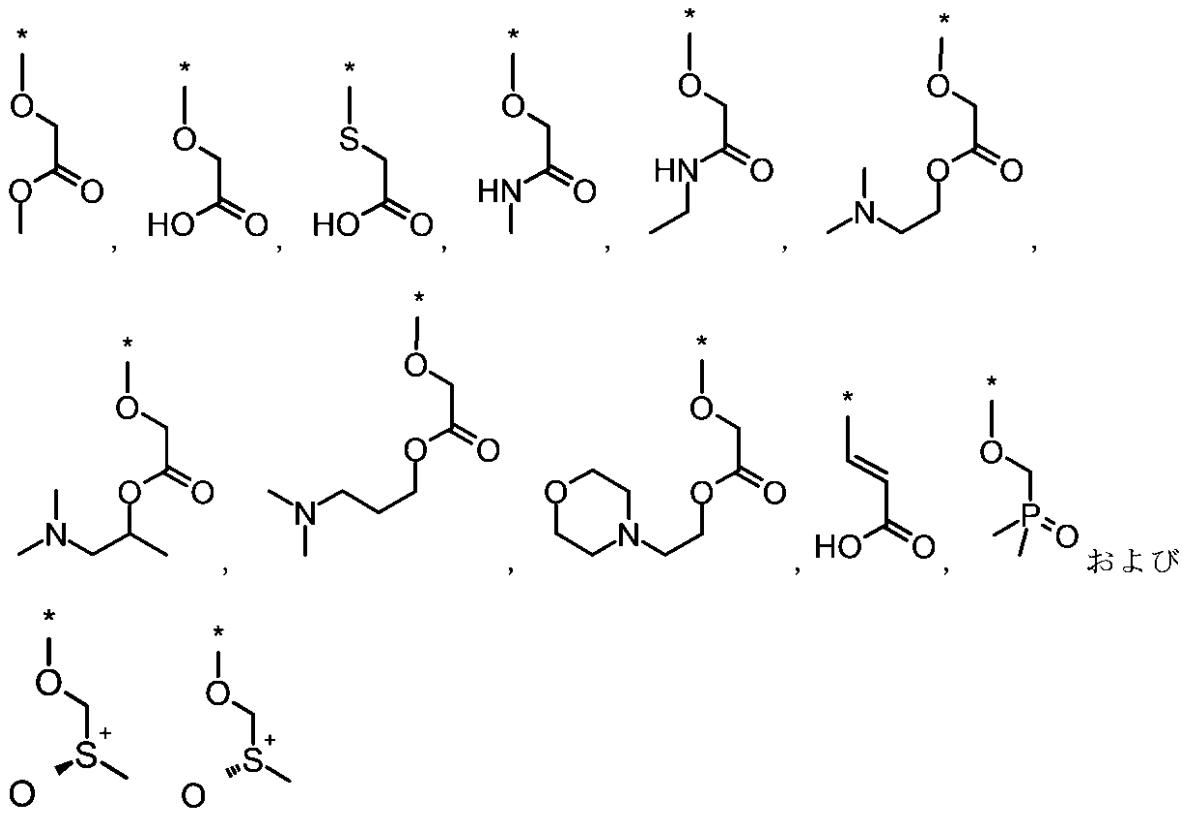


からなる群から選択される、請求項 1 から 11 までのいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

### 【請求項 13】

$R^5$  が、

## 【化15】



## 【請求項14】

請求項1から13までのいずれか1項に記載の化合物またはその塩を含む、医薬組成物。

## 【請求項15】

BCL6の阻害が治療上有益である疾患および/または状態を治療および/または予防するための、請求項14に記載の医薬組成物。

## 【請求項16】

BCL6の阻害が治療上有益である疾患および/または状態を治療および/または予防するための医薬の製造における、請求項1から13までのいずれか1項に記載の化合物またはその塩の使用。

## 【請求項17】

がんの治療および/または予防における使用のための、請求項14に記載の医薬組成物。

## 【請求項18】

医薬的に許容される担体を更に含む、請求項14、15及び17のいずれか1項に記載の医薬組成物。

## 【請求項19】

少なくとも1つの他の細胞増殖抑制または細胞傷害活性物質の前、その後またはそれと共に投与される、請求項17に記載の医薬組成物。

## 【手続補正2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0320

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0320】

活性物質、ラクトースおよびセルロースを混ぜ合わせる。混合物をふるいにかけ、次い

で、水で湿らせ、混練し、湿式造粒し、乾燥させ、または乾式造粒し、またはステアリン酸マグネシウムと直接最終ブレンドし、適した形状およびサイズの錠剤に圧縮する。湿式造粒するとき、別のラクトースまたはセルロースおよびステアリン酸マグネシウムを加え、混合物を圧縮し、適した形状およびサイズの錠剤を生成する。

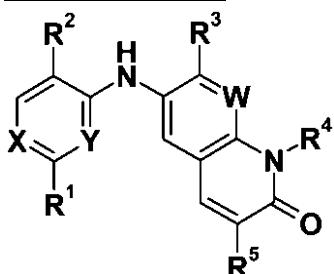
D ) アンプル溶液

式 ( I ) による活性物質	5 0 m g
塩化ナトリウム	5 0 m g
注射用水	5 m L

それ自体の pH または pH 5 . 5 ~ 6 . 5 でもよい水に活性物質を溶解させ、塩化ナトリウムを加えて等張にする。得られた溶液を濾過してパイロジエンフリーにし、濾液を無菌条件下でアンプルに移し、次いで、これを滅菌し、溶融密封する。アンプルには、5 m g 、 25 m g および 50 m g の活性物質が入っている。

本発明のまた別の態様は、以下のとおりであってもよい。

( 1 ) 式 ( I )



(I)

(式中、

R<sup>1</sup>は、4 ~ 12員ヘテロシクリルおよび5 ~ 12員ヘテロアリールからなる群から選択され、前記ヘテロシクリルまたは前記ヘテロアリールは、少なくとも1個の窒素原子を含み且つ窒素を介して結合されており、前記ヘテロシクリル基は、R<sup>7</sup>から独立して選択される1つまたは複数の同一の基または異なる基で独立して置換されていてもよく、前記ヘテロアリール基は、R<sup>8</sup>から独立して選択される1つまたは複数の同一の基または異なる基で独立して置換されていてもよく、

R<sup>7</sup>は、=O、-CN、-CCH、-OH、-COOH、ハロゲン、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、-C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、5員または6員ヘテロアリール、フェニル、-N(R<sup>9</sup>R<sup>10</sup>)、-C(O)-R<sup>11</sup>、-C(O)N(R<sup>12</sup>R<sup>13</sup>)および5 ~ 8員ヘテロシクリルからなる群から選択され、前記ヘテロシクリルは、-C<sub>1-6</sub>アルキルから選択される1つの基で置換されていてもよく、

またはR<sup>7</sup>は、-COOH、-OH、-COO(C<sub>1-6</sub>アルキル)、-CON(C<sub>1-3</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)<sub>2</sub>、フェニルおよび5員または6員ヘテロシクリルで置換されていてもよい-C<sub>1-6</sub>アルキルであり、前記ヘテロシクリルは、-C<sub>1-6</sub>アルキルから選択される1つの基で置換されていてもよく、

R<sup>9</sup>は、水素および-C<sub>1-4</sub>アルキルから選択され、

R<sup>10</sup>は、水素、-C<sub>1-4</sub>アルキル、-C<sub>1-4</sub>ハロアルキル、6員ヘテロシクリルおよび6員ヘテロアリールからなる群から選択され、

R<sup>11</sup>は、-C<sub>1-3</sub>アルキル-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)<sub>2</sub>および5員または6員ヘテロシクリルからなる群から選択され、前記ヘテロシクリルは、-C<sub>1-3</sub>アルキルから選択される1つの基で置換されていてもよく、

R<sup>12</sup>は、水素および-C<sub>1-3</sub>アルキルから選択され、

R<sup>13</sup>は、-NH<sub>2</sub>、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-NH<sub>2</sub>および-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-NH<sub>2</sub>で置換されていてもよい-C<sub>1-6</sub>アルキルから選択され、

またはR<sup>13</sup>は、-C<sub>1-3</sub>アルキルで置換されていてもよい6員ヘテロシクリルであり、

、

R<sup>8</sup>は、-COOH、-C<sub>1-6</sub>アルキル、-C(O)-R<sup>19</sup>、-C(O)N(R<sup>20</sup>R<sup>21</sup>)から選択され、

R<sup>19</sup>は、-C<sub>1-3</sub>アルキルで置換されていてもよい6員ヘテロシクリルであり、

R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>は、水素および-C<sub>1-3</sub>アルキルから独立して選択され、

R<sup>2</sup>は、塩素およびフッ素からなる群から選択され、

R<sup>3</sup>は、水素、-C<sub>1-4</sub>アルキル、-O-C<sub>1-4</sub>アルキルおよびハロゲンからなる群から選択され、

R<sup>4</sup>は、水素、-C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、4~7員ヘテロシクリルからなる群から選択され、各基は、-C<sub>1-3</sub>アルキルから選択される1つの基で置換されていてもよく、または

R<sup>4</sup>は、-OH、-NH<sub>2</sub>、-O-C<sub>1-4</sub>アルキル、-NH-C<sub>1-4</sub>アルキル、-N(C<sub>1-4</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-C<sub>3-6</sub>シクロアルキルおよび4~7員ヘテロシクリルから選択される1つの基で置換されていてもよい-C<sub>1-6</sub>アルキルであり、各シクロアルキル基およびヘテロシクリル基は、-C<sub>1-3</sub>アルキルから選択される1つの基で独立して置換されていてもよく、

R<sup>5</sup>は、-L<sub>1</sub>-C(R<sup>14</sup>R<sup>15</sup>)-R<sup>16</sup>または-CH=CH-R<sup>16</sup>であり、式中、

L<sub>1</sub>は、-O-または-S-であり、

R<sup>14</sup>は、水素またはC<sub>1-4</sub>アルキルであり、

R<sup>15</sup>は、水素またはC<sub>1-4</sub>アルキルであり、

またはR<sup>14</sup>およびR<sup>15</sup>は一緒にになって-C<sub>3-5</sub>シクロアルキルを形成し、

R<sup>16</sup>は、-COOH、-CONH<sub>2</sub>、-C(O)R<sup>17</sup>、-C(O)OR<sup>17</sup>、-C(O)NR<sup>17</sup>R<sup>18</sup>、-S(O)-C<sub>1-6</sub>アルキル、-S(O)<sub>2</sub>-C<sub>1-6</sub>アルキル、-P(O)-C<sub>1-6</sub>アルキル<sub>2</sub>、-C(NH)NH<sub>2</sub>であり、

R<sup>17</sup>は、-OH、-CF<sub>3</sub>、-N(C<sub>1-4</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-C<sub>3-6</sub>シクロアルキル、3~6員ヘテロシクリル、-C<sub>2-4</sub>アルケニル、-C<sub>2-4</sub>アルキニルから選択される1つまたは複数の同一の基または異なる基で置換されていてもよい3~6員ヘテロシクリルまたは-C<sub>1-4</sub>アルキルであり、

R<sup>18</sup>は、水素またはC<sub>1-4</sub>アルキルであり、

Wは、窒素またはCR<sup>6</sup>であり、

Xは、窒素またはCHであり、

Yは、窒素またはCHであり、

XおよびYのうちの少なくとも1つは窒素であり、

R<sup>6</sup>は、水素、-C<sub>1-4</sub>アルキル、-O-C<sub>1-4</sub>アルキル、-O-C<sub>1-4</sub>ハロアルキル、-C<sub>1-4</sub>ハロアルキルおよびハロゲンからなる群から選択される)の化合物またはその塩。

[2] R<sup>3</sup>が、水素、ハロゲンおよび-O-CH<sub>3</sub>からなる群から選択される、前記[1]に記載の化合物またはその塩。

[3] R<sup>4</sup>が、-OH、-C<sub>3-6</sub>シクロアルキルおよび-N(C<sub>1-4</sub>アルキル)<sub>2</sub>から選択される1つの基で置換されていてもよい-C<sub>1-4</sub>アルキルからなる群から選択される、前記[1]または[2]に記載の化合物またはその塩。

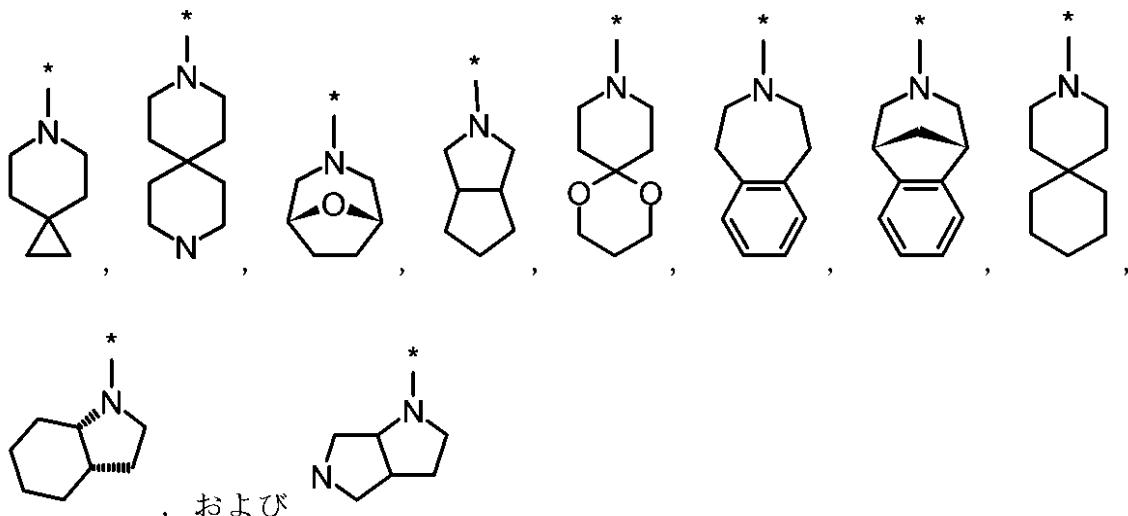
[4] R<sup>4</sup>が、-CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>3</sub>、-CH(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-(CH<sub>2</sub>)<sub>3</sub>OH、-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>、-CH<sub>2</sub>-シクロプロピルおよび-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>N(CH<sub>3</sub>)<sub>2</sub>からなる群から選択される、前記[3]に記載の化合物またはその塩。

[5] WがCR<sup>6</sup>であり、且つ

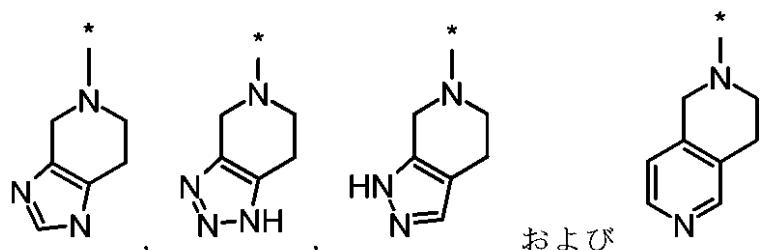
R<sup>6</sup>が、水素、C<sub>1-4</sub>アルキル、-O-C<sub>1-4</sub>アルキル、-O-C<sub>1-4</sub>ハロアルキルおよびハロゲンからなる群から選択される、前記[1]から[4]までのいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

[6] R<sup>6</sup>が、水素、-O-CH<sub>3</sub>からなる群から選択される、前記[5]に記載の化合物またはその塩。

[7] R<sup>1</sup>が、5~7員ヘテロシクリル、



からなる群から選択されるヘテロシクリルであるか、  
またはR<sub>1</sub>が、5～7員ヘテロアリール、



からなる群から選択されるヘテロアリールであり、

前記ヘテロシクリルまたは前記ヘテロアリールが、少なくとも 1 個の窒素原子を含み且つ窒素を介して結合されており、前記ヘテロシクリル基が、R<sup>7</sup>から独立して選択される 1 つまたは複数の同一の基または異なる基で独立して置換されていてもよく、前記ヘテロアリール基が、R<sup>8</sup>から独立して選択される 1 つまたは複数の同一の基または異なる基で独立して置換されていてもよく、

$R^7$  が、=O、-CN、-CCH、-OH、-COOH、ハロゲン、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、-C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、5員または6員ヘテロアリール、フェニル、-N(R<sup>9</sup>R<sup>10</sup>)、-C(O)-R<sup>11</sup>、-C(O)N(R<sup>12</sup>R<sup>13</sup>)および5~8員ヘテロシクリルからなる群から選択され、前記ヘテロシクリルは、-C<sub>1-6</sub>アルキルから選択される1つの基で置換されていてもよく。

またはR<sup>7</sup>が、-COOH、-OH、-COO(C<sub>1-6</sub>アルキル)、-CON(C<sub>1-3</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)<sub>2</sub>、フェニルおよび5員または6員ヘテロシクリルで置換されていてもよい-C<sub>1-6</sub>アルキルであり、前記ヘテロシクリルは、-C<sub>1-6</sub>アルキルから選択される1つの基で置換されていてもよく、

$R^9$  が、水素および  $-C_{1-4}$  アルキルから選択され、

R<sup>10</sup>が、水素、-C<sub>1-4</sub>アルキル、-C<sub>1-4</sub>ハロアルキル、6員ヘテロシクリルおよび6員ヘテロアリールからなる群から選択され、

R<sup>11</sup>が、-C<sub>1-3</sub>アルキル-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)<sub>2</sub>および5員または6員ヘテロシクリルからなる群から選択され、前記ヘテロシクリルは、-C<sub>1-3</sub>アルキルから選択される1つの基で置換されていてもよく。

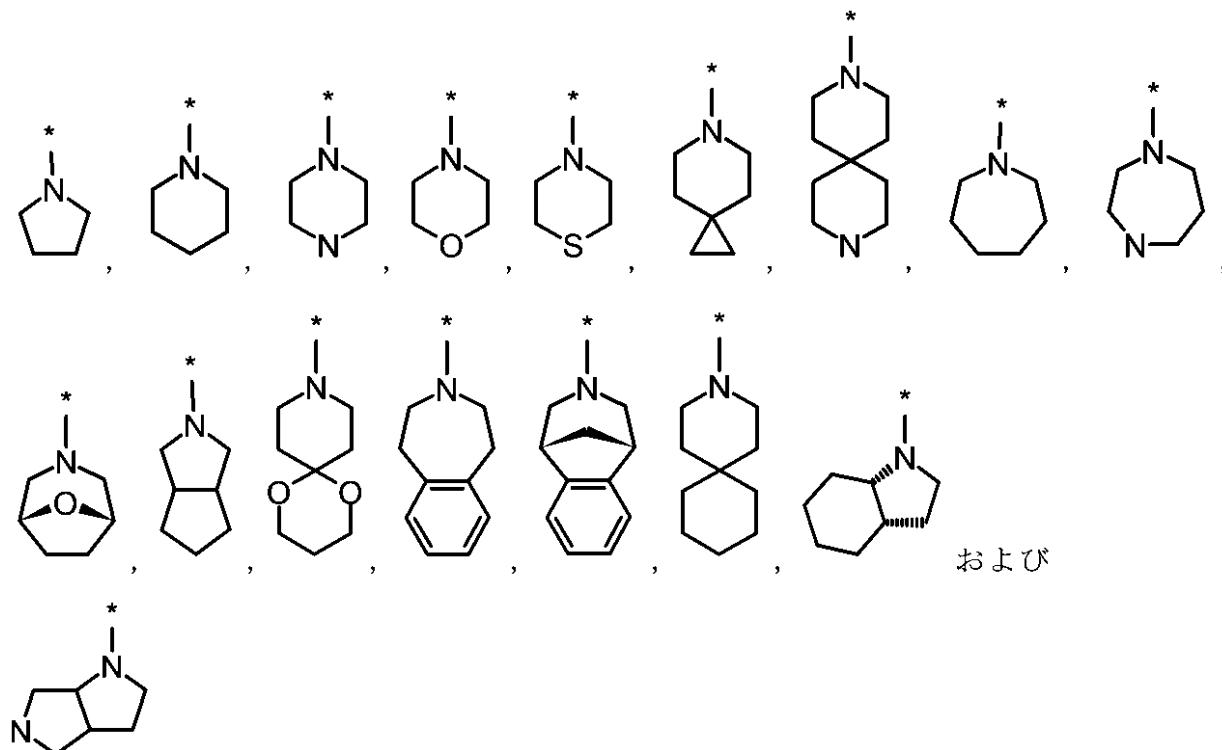
$\text{B}^{12}$ が、水素および $-\text{C}_2\text{H}_5$ アルキルから選択され、

$R^{13}$ が、-NH<sub>2</sub>、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-NH<sub>2</sub>および-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-NH<sub>2</sub>で置換されていてもよい-C<sub>1-6</sub>アルキルから選択され、

または  $R^{13}$  が、-  $C_{1-3}$  アルキルで置換されていてもよい 6 員ヘテロシクリルであり、  
 $R^8$  が、-  $COOH$ 、-  $C_{1-6}$  アルキル、-  $C(O)-R^{19}$ 、-  $C(O)N(R^{20}R^{21})$  から選択され、

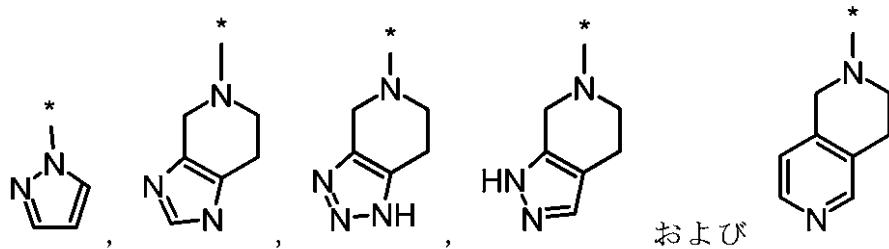
$R^{19}$  が、 $-C_{1-3}$  アルキルで置換されていてもよい 6 員ヘテロシクリルであり、  
 $R^{20}$  および  $R^{21}$  が、水素および  $-C_{1-3}$  アルキルから独立して選択される、前記〔1〕  
 から〔6〕までのいずれか 1 項に記載の化合物またはその塩。

[ 8 ]  $R^1$  が、



から選択されるヘテロシクリルであり、前記ヘテロシクリルは、前記R<sup>7</sup>基から独立して選択される1つ、2つ、3つまたは4つの置換基で独立して置換されていてもよく、R<sup>1</sup>が、3つまたは4つの独立して選択されるR<sup>7</sup>で置換されている場合、それらのうちの少なくとも2つは前記-C<sub>1-3</sub>アルキル基から独立して選択され、またはR<sup>1</sup>が

R<sup>1</sup> が、



からなる群から選択されるヘテロアリールであり、前記ヘテロアリールは、前記 R<sup>8</sup>基から独立して選択される 1 つまたは 2 つの置換基で独立して置換されていてもよく、

$R^7$  が、  $=O$ 、  $-CCH$ 、  $-CN$ 、  $-OH$ 、  $-COOH$ 、 ハロゲン、  $-O-C_{1-6}$  アルキル、  $-C_{1-6}$  ハロアルキル、 5員または6員ヘテロアリール、 フェニル、  $-N(R^9R^{10})$ 、  $-C(O)-R^{11}$ 、  $-C(O)N(R^{12}R^{13})$  および 5~8員ヘテロシクリルからなる群から選択され、 前記ヘテロシクリルは、  $-C_{1-3}$  アルキルから選択される 1つの基で置換されていてもよく、

またはR<sup>7</sup>が、-COOH、-OH、-COO(C<sub>1-6</sub>アルキル)、-CON(C<sub>1-3</sub>アルキル)<sub>2</sub>、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)<sub>2</sub>、フェニルおよび5員または

6員ヘテロシクリルで置換されていてもよい - C<sub>1-6</sub>アルキルであり、前記ヘテロシクリルは、 - C<sub>1-3</sub>アルキルから選択される1つの基で置換されていてもよく、

R<sup>9</sup>が、水素および - C<sub>1-4</sub>アルキルから選択され、

R<sup>10</sup>が、水素、 - C<sub>1-4</sub>アルキル、 - C<sub>1-4</sub>ハロアルキル、5員または6員ヘテロシクリルおよび6員ヘテロアリールからなる群から選択され、

R<sup>11</sup>が、 - C<sub>1-3</sub>アルキル - N ( C<sub>1-3</sub>アルキル) <sub>2</sub>および5員または6員ヘテロシクリルからなる群から選択され、前記ヘテロシクリルは、 - C<sub>1-3</sub>アルキルから選択される1つの基で置換されていてもよく、

R<sup>12</sup>が、水素および - C<sub>1-3</sub>アルキルから選択され、

R<sup>13</sup>が、 - NH<sub>2</sub>、 - O - C<sub>1-6</sub>アルキル、 - O - C<sub>1-6</sub>アルキル - NH<sub>2</sub>および - O - C<sub>1-6</sub>アルキル - O - C<sub>1-6</sub>アルキル - NH<sub>2</sub>で置換されていてもよい - C<sub>1-6</sub>アルキルから選択され、

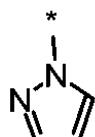
またはR<sup>13</sup>が、 - C<sub>1-3</sub>アルキルで置換されていてもよい6員ヘテロシクリルであり、

R<sup>8</sup>が、 - COOH、 - C<sub>1-6</sub>アルキル、 - C ( O ) - R<sup>19</sup>、 - C ( O ) N ( R<sup>20</sup> R<sup>21</sup> ) から選択され、

R<sup>19</sup>が、 - C<sub>1-3</sub>アルキルで置換されていてもよい6員ヘテロシクリルであり、

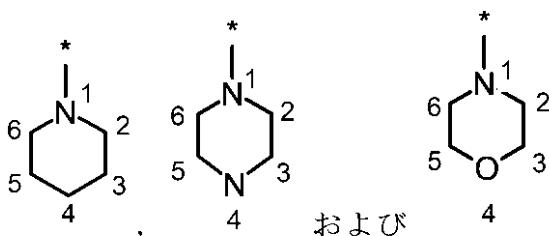
R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>が、水素および - C<sub>1-3</sub>アルキルから独立して選択される、前記〔1〕から〔7〕までのいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

〔9〕R<sup>1</sup>が、R<sup>8</sup>から独立して選択される1つまたは2つの基で置換されていてもよい下記の基：



であるか、または

R<sup>1</sup>が、



からなる群から選択され、

前記ピペリジニル基およびピペラジニル基が、3位、4位および/または5位において、且つ前記モルホリニル基が、3位および/または5位において、前記R<sup>7</sup>基から独立して選択される1つ、2つ、3つもしくは4つの置換基で独立して置換されてもよく、且つR<sup>1</sup>が、3つまたは4つの独立して選択されるR<sup>7</sup>で置換されている場合、それらの置換基のうちの少なくとも2つは - C<sub>1-3</sub>アルキルであり、

R<sup>7</sup>が、 = O、 - C C H、 - C N、 - OH、 - COOH、ハロゲン、 - O - C<sub>1-6</sub>アルキル、 - C<sub>1-6</sub>ハロアルキル、5員または6員ヘテロアリール、フェニル、 - N ( R<sup>9</sup> R<sup>10</sup> ) 、 - C ( O ) - R<sup>11</sup>、 - C ( O ) N ( R<sup>12</sup> R<sup>13</sup> ) および5~8員ヘテロシクリルからなる群から選択され、前記ヘテロシクリルは、 - C<sub>1-3</sub>アルキルから選択される1つの基で置換されていてもよく、

またはR<sup>7</sup>が、 - COOH、 - OH、 - COO ( C<sub>1-6</sub>アルキル) <sub>2</sub>、 - CON ( C<sub>1-3</sub>アルキル) <sub>2</sub>、 - O - C<sub>1-6</sub>アルキル、 - N ( C<sub>1-3</sub>アルキル) <sub>2</sub>、フェニルおよび5員または6員ヘテロシクリルで置換されていてもよい - C<sub>1-6</sub>アルキルであり、前記ヘテロシクリルは、 - C<sub>1-3</sub>アルキルから選択される1つの基で置換されていてもよく、

R<sup>9</sup>が、水素および-C<sub>1-4</sub>アルキルから選択され、

R<sup>10</sup>が、水素、-C<sub>1-4</sub>アルキル、-C<sub>1-4</sub>ハロアルキル、6員ヘテロシクリルおよび6員ヘテロアリールからなる群から選択され、

R<sup>11</sup>が、-C<sub>1-3</sub>アルキル-N(C<sub>1-3</sub>アルキル)<sub>2</sub>および5員または6員ヘテロシクリルからなる群から選択され、前記ヘテロシクリルは、-C<sub>1-3</sub>アルキルで置換されていてもよく、

R<sup>12</sup>が、水素および-C<sub>1-3</sub>アルキルから選択され、

R<sup>13</sup>が、-NH<sub>2</sub>、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル、-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-NH<sub>2</sub>および-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-O-C<sub>1-6</sub>アルキル-NH<sub>2</sub>で置換されていてもよい-C<sub>1-6</sub>アルキルから選択され、

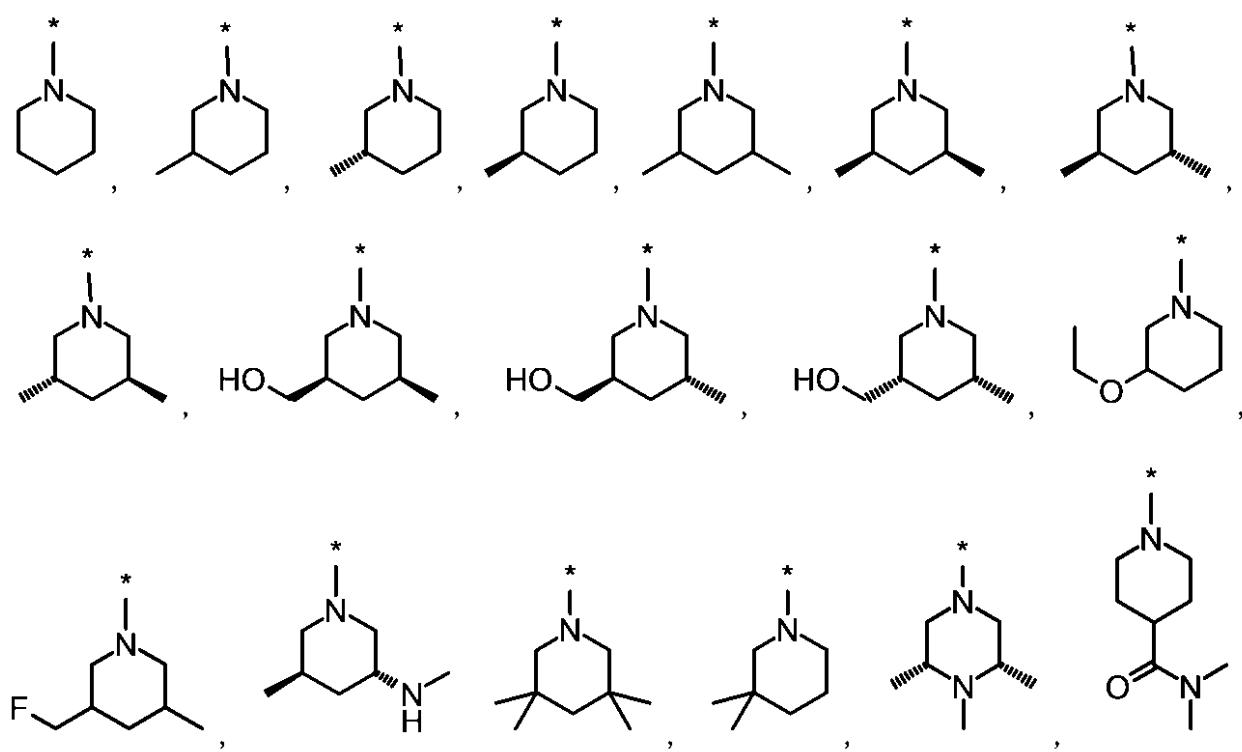
またはR<sup>13</sup>が、-C<sub>1-3</sub>アルキルで置換されていてもよい6員ヘテロシクリルであり、

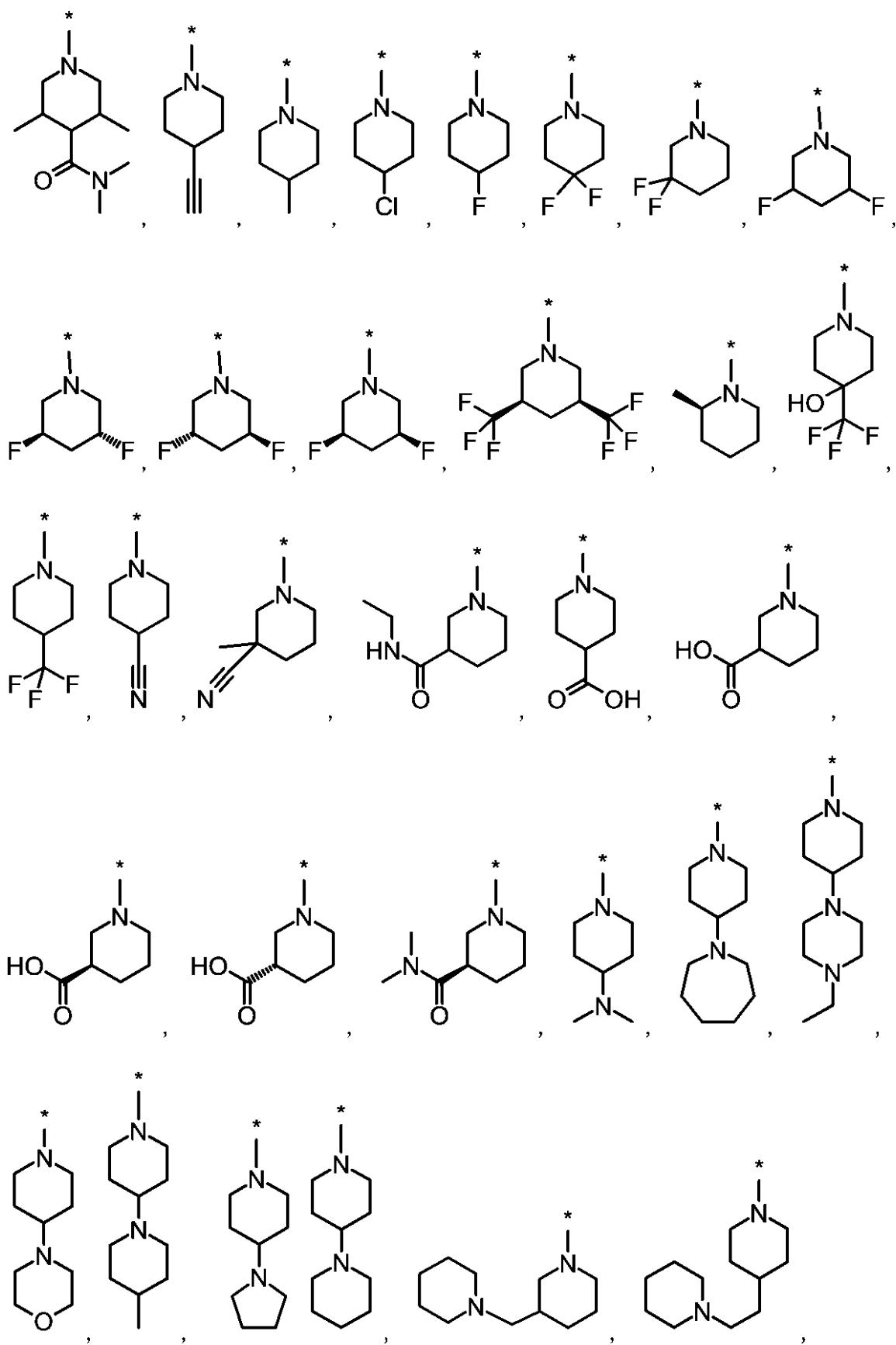
R<sup>8</sup>が、-COOH、-C<sub>1-6</sub>アルキル、-C(O)-R<sup>19</sup>、-C(O)N(R<sup>20</sup>R<sup>21</sup>)から選択され、

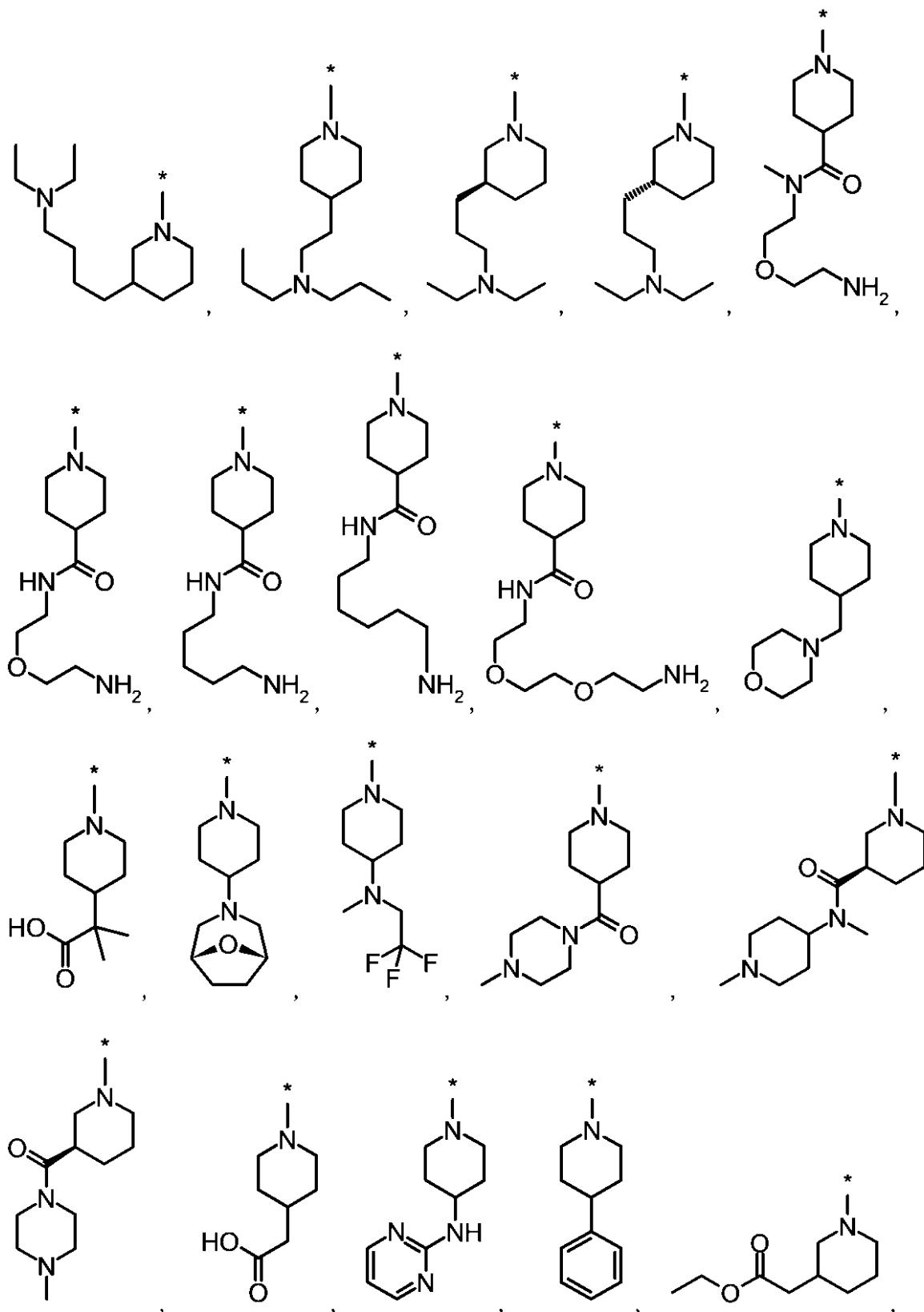
R<sup>19</sup>が、-C<sub>1-3</sub>アルキルで置換されていてもよい6員ヘテロシクリルであり、

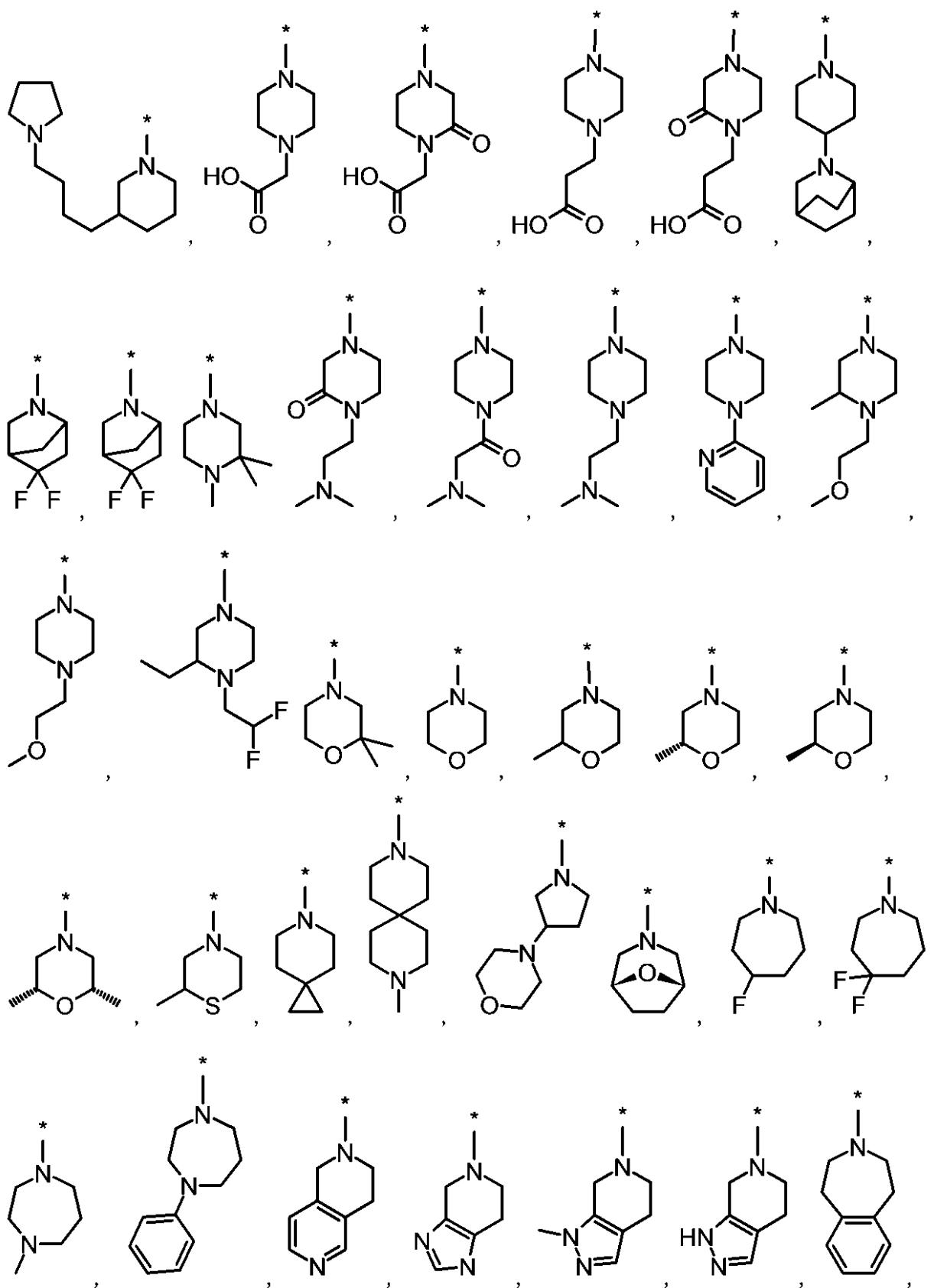
R<sup>20</sup>およびR<sup>21</sup>が、水素および-C<sub>1-3</sub>アルキルから独立して選択される、前記〔1〕から〔8〕までのいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

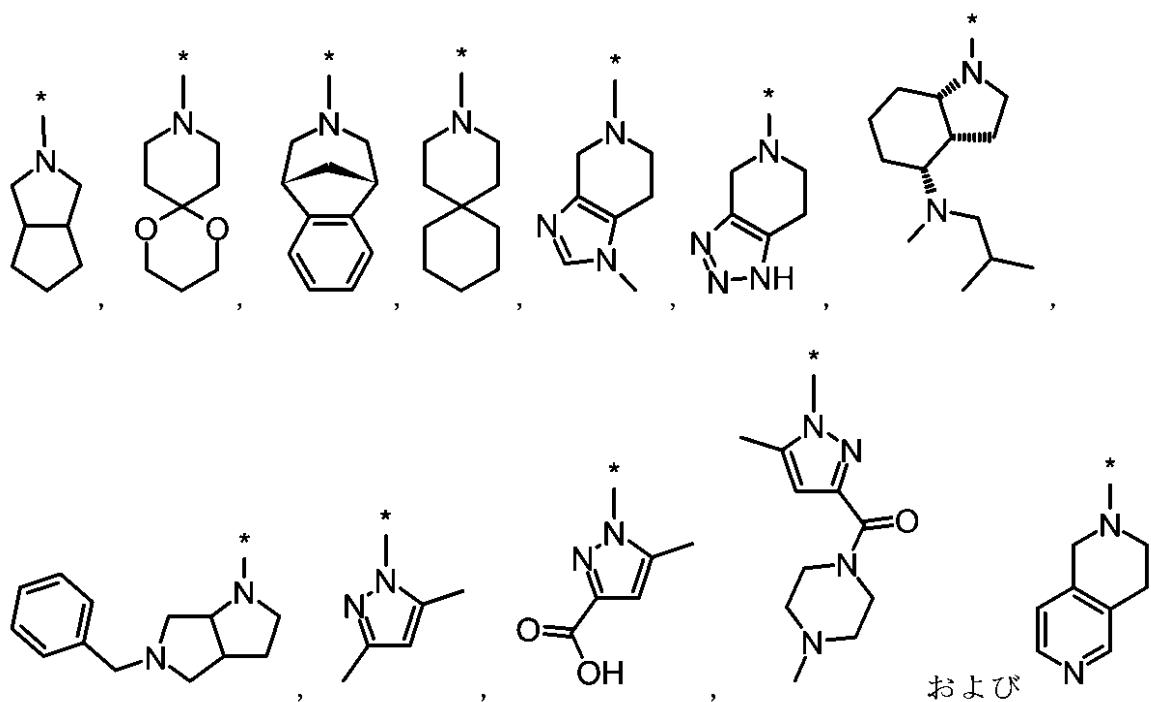
〔10〕R<sup>1</sup>が、





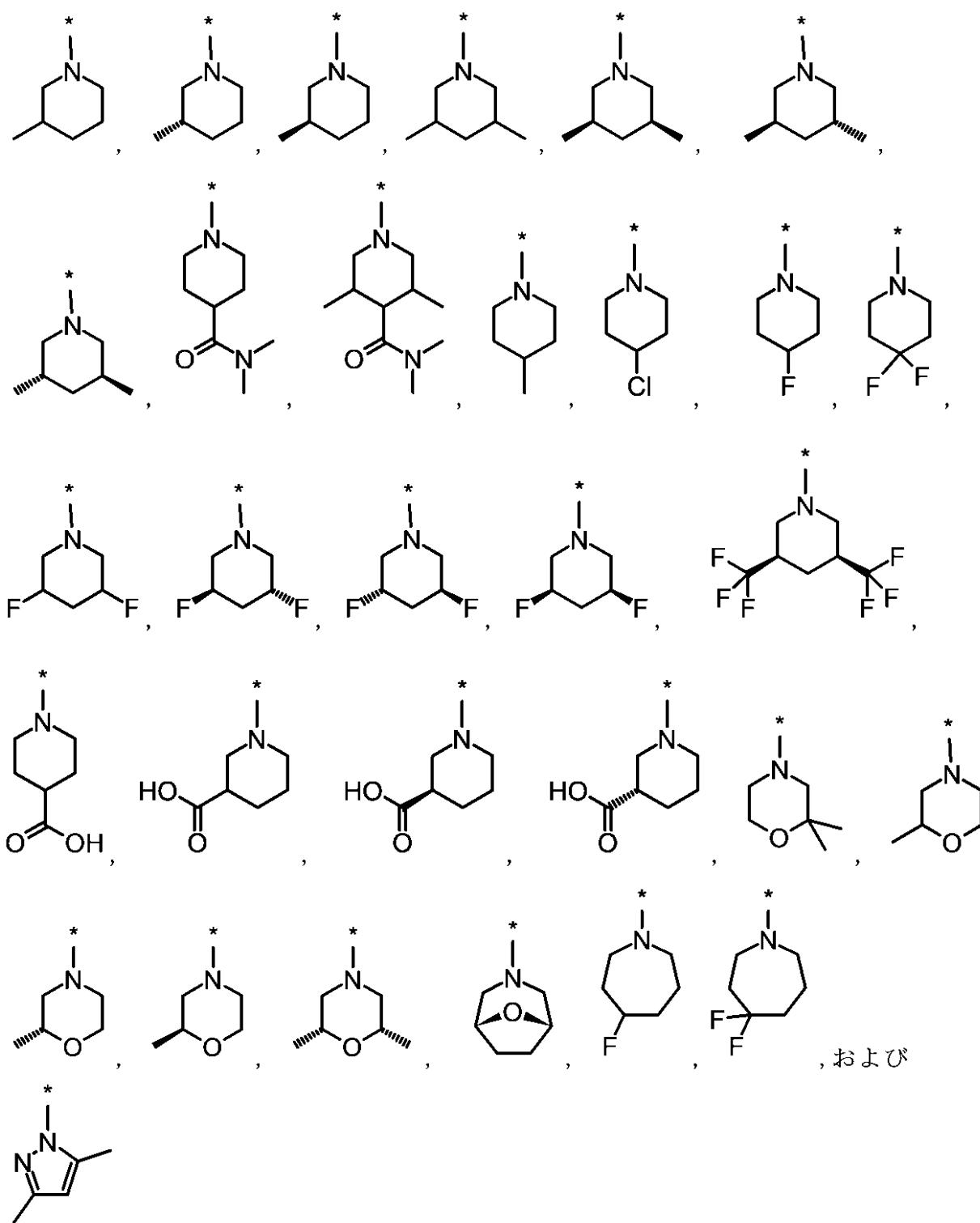






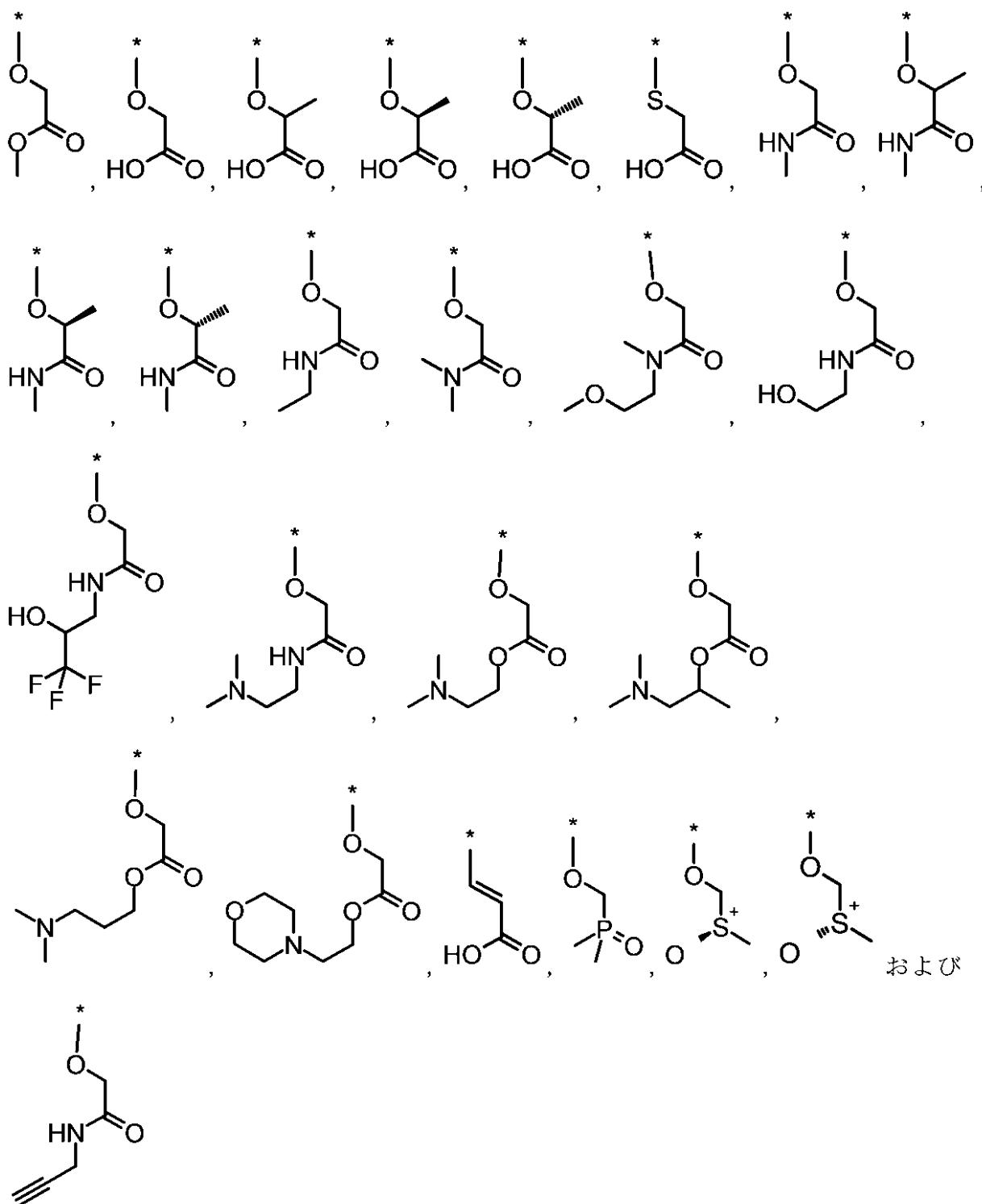
から選択される、前記〔1〕から〔8〕までに記載の化合物またはその塩。

〔11〕R<sup>1</sup>が、



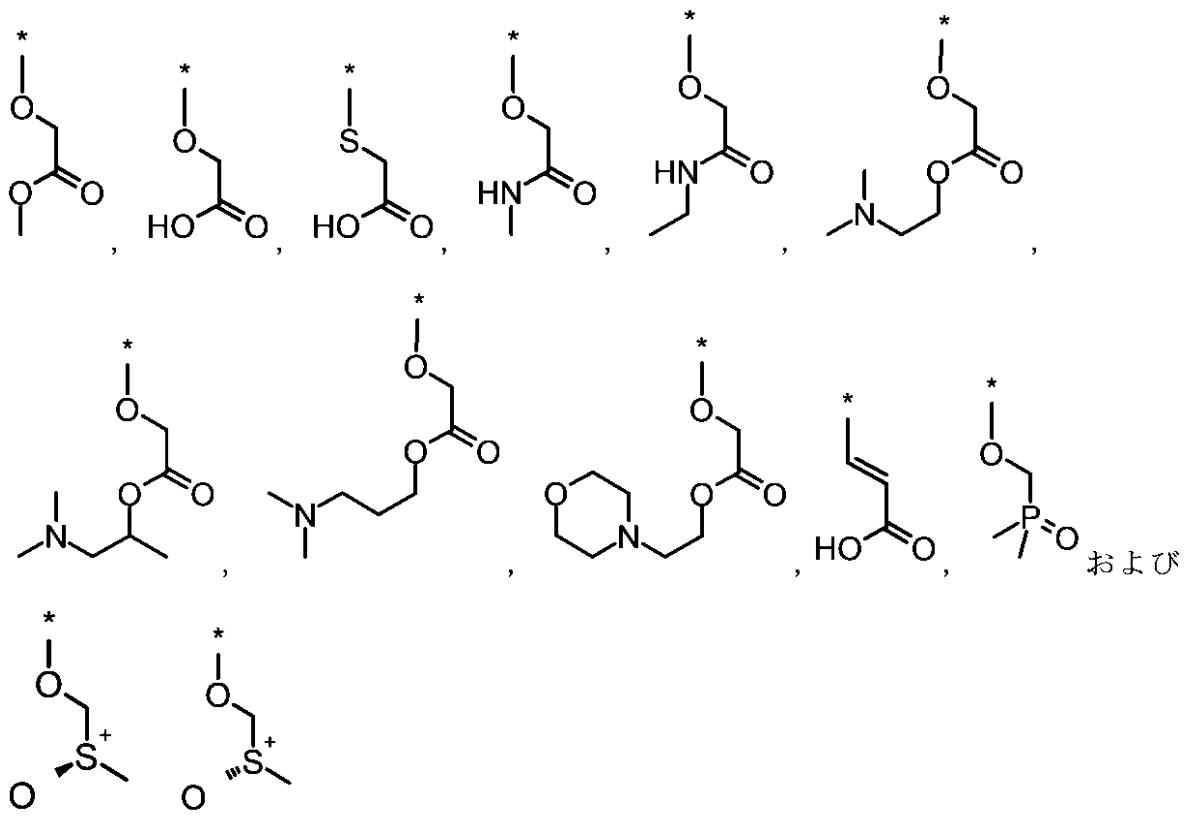
から選択される、前記〔1〕から〔8〕までに記載の化合物またはその塩。

[ 1 2 ]  $R^5$  が、



からなる群から選択される、前記〔1〕から〔11〕までのいずれか1項に記載の化合物  
またはその塩。

〔13〕R<sup>5</sup>が、



からなる群から選択される、前記〔12〕に記載の化合物またはその塩。

〔14〕医薬品としての使用のための、前記〔1〕から〔13〕までのいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

〔15〕治療有効量の前記〔1〕から〔13〕までのいずれか1項に記載の化合物またはその塩をヒトに投与する工程を含む、BCL6の阻害が治療上有益である疾患および/または状態の治療および/または予防のための方法。

〔16〕BCL6の前記阻害が治療上有益である疾患および/または状態の前記治療および/または予防における使用のための、前記〔1〕から〔13〕までのいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

〔17〕がんの治療および/または予防における使用のための、前記〔1〕から〔13〕までのいずれか1項に記載の化合物またはその塩。

〔18〕前記〔1〕から〔13〕までのいずれか1項に記載の化合物またはその医薬的に許容される塩と、医薬的に許容される担体とを含む、医薬組成物。

〔19〕がんの前記治療および/または予防における使用のための、前記〔1〕から〔13〕までのいずれか1項に記載の化合物またはその塩であって、少なくとも1つの他の細胞増殖抑制または細胞傷害活性物質の前、その後またはそれと共に投与される、化合物またはその塩。