

【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6年1月16日(2024.1.16)

【国際公開番号】WO2021/142247
【公表番号】特表2023-510746(P2023-510746A)
【公表日】令和5年3月15日(2023.3.15)
【年通号数】公開公報(特許)2023-049
【出願番号】特願2022-541815(P2022-541815)

【国際特許分類】

C 0 7 K 5/06(2006.01)
A 6 1 P 35/00(2006.01)
A 6 1 P 43/00(2006.01)
A 6 1 K 38/05(2006.01)

10

【F I】

C 0 7 K 5/06
A 6 1 P 35/00
A 6 1 P 43/00 1 1 1
A 6 1 K 38/05

20

【手続補正書】

【提出日】令和6年1月5日(2024.1.5)

【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】

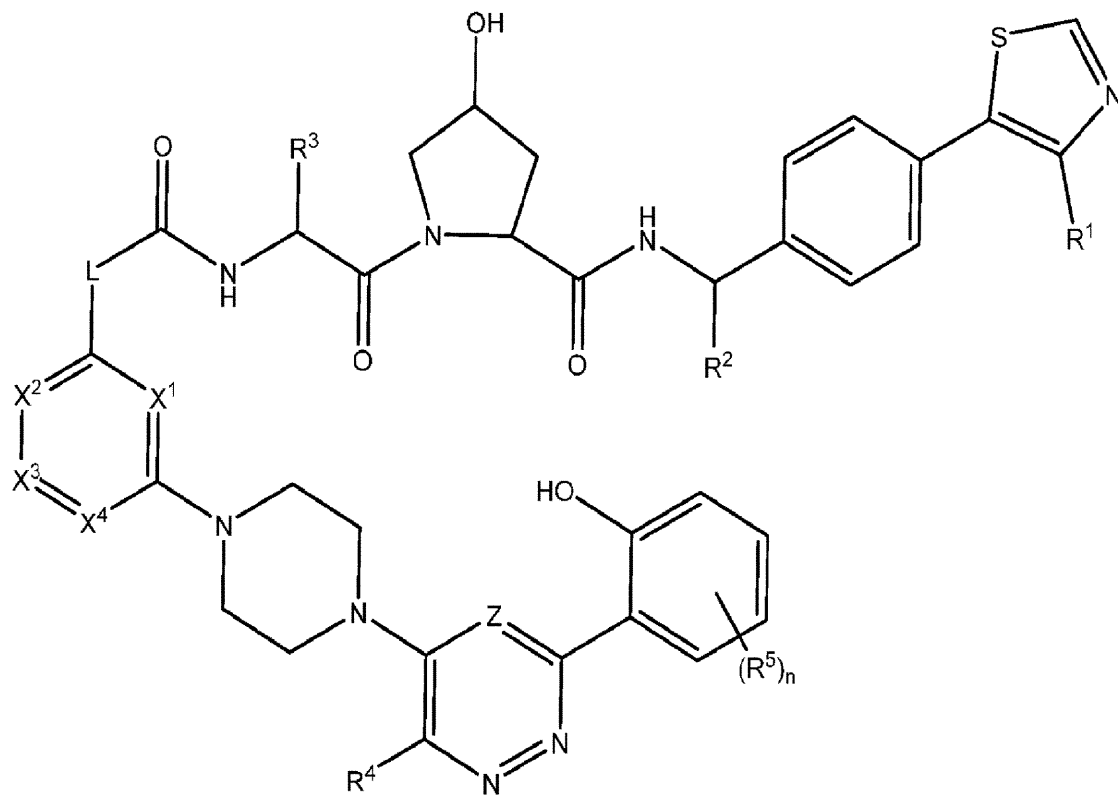
化合物又はその薬学的に許容される塩であって、前記化合物は、式(I)：

30

40

50

【化 1】



10

20

で表され、
式中、

R^1 は、水素、ハロゲン、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ヒドロキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり；

R^2 は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ヒドロキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、又はハロ $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

30

R^3 は、 $C(CH_3)_2R^{3a}$ 又は $C_3 \sim C_6$ シクロアルキルであり、ここで、前記シクロアルキルは、ハロゲン、ヒドロキシ、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ヒドロキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、ハロ $C_1 \sim C_6$ アルキル、 $C_1 \sim C_6$ アルコキシ、及びハロ $C_1 \sim C_6$ アルコキシからなる群から独立して選択される0、1、又は2個の基で任意選択的に置換されており、

R^{3a} は、水素、 $C_1 \sim C_6$ アルキル、ヒドロキシ $C_1 \sim C_6$ アルキル、又はハロ $C_1 \sim C_6$ アルキルであり；

L は、結合、又は二価の $C_1 \sim C_6$ アルカンジイルリンカーであり；

R^4 は、水素又はアミノであり；

R^5 は、各出現で、水素及びハロゲンから独立して選択され；

40

n は、0、1、2、又は3であり；

X^1 は、CH、N、O、若しくはSであり；

X^2 は、CH、N、O、若しくはSであり、ここで、 X^1 及び X^2 のうちの0若しくは1個は、酸素原子若しくは硫黄原子であり；

X^3 は、CH、N、若しくは不存在であり；

X^4 は、CH若しくはNであり、ここで、 X^3 は、 X^1 若しくは X^2 がO若しくはSである場合には不存在であり、 X^1 、 X^2 、 X^3 、及び X^4 のうちの少なくとも2つは、CH若しくは不存在であるか；又は

X^1 は、 $-C(H)=C(H)-$ であり；

X^2 は、CH若しくはNであり；

50

R⁴は、アミノである、請求項1～10のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項12】

nは、0である、請求項1～11のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項13】

nは、1であり、R⁵は、フルオロである、請求項1～11のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項14】

Zは、CHである、請求項1～13のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項15】

X¹、X²、X³、及びX⁴のそれぞれは、CHである、請求項1～14のいずれか一項に記載の化合物。

10

【請求項16】

X¹は、CH又はNであり；X²、X³、及びX⁴は、CHである、請求項1～14のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項17】

X¹は、Nであり；X²、X³、及びX⁴は、CHである、請求項1～14のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項18】

X⁴は、CH又はNであり；X¹、X²、及びX³は、CHである、請求項1～14のいずれか一項に記載の化合物。

20

【請求項19】

X⁴は、Nであり；X¹、X²、及びX³は、CHである、請求項1～14のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項20】

X¹は、CH、N、又はSであり；

X²は、CHであり；

X³は、不存在であり；

X⁴は、CH又はSであり、ここで、X¹及びX⁴のうちの少なくとも1つは、CHではなく、X¹及びX⁴のうちの少なくとも1つは、Sではない、

請求項1～14のいずれか一項に記載の化合物。

30

【請求項21】

X¹は、Nであり；X²は、CHであり；X³は、不存在であり、X⁴は、Sである、請求項20に記載の化合物。

【請求項22】

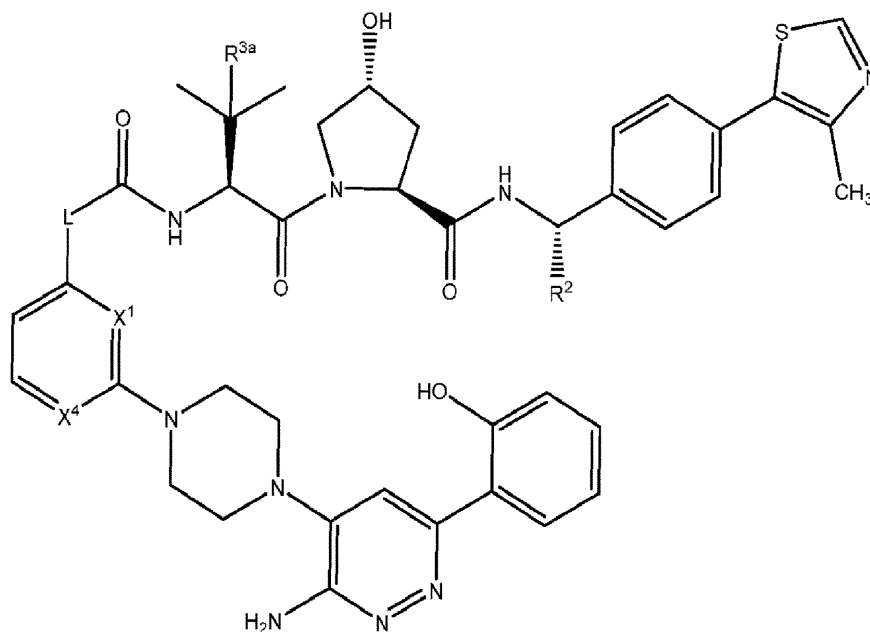
X¹は、Sであり；X²及びX⁴は、それぞれCHであり；X³は、不存在である、請求項20に記載の化合物。

【請求項23】

前記化合物は、式III：

40

【化 3】



10

で表され、

20

式中、

R² は、水素又はメチルであり；

L は、結合、又は二価のメタンジイルであり；

R^{3a} は、水素又はメチルであり；

X¹ は、C H 又は N であり；

X⁴ は、C H 又は N であり、ここで、X¹ 及び X⁴ のうちの少なくとも 1 つは、C H である、

請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 2 4】

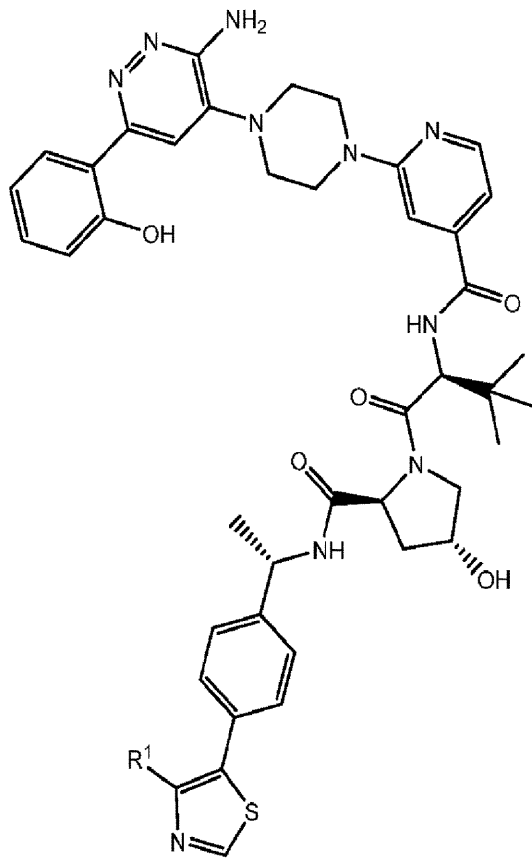
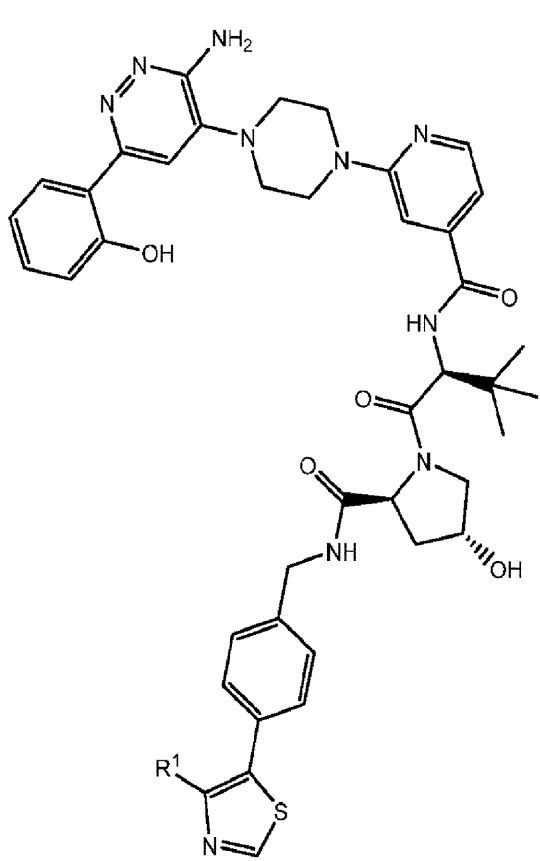
前記化合物は、

30

40

50

【化 4】



10

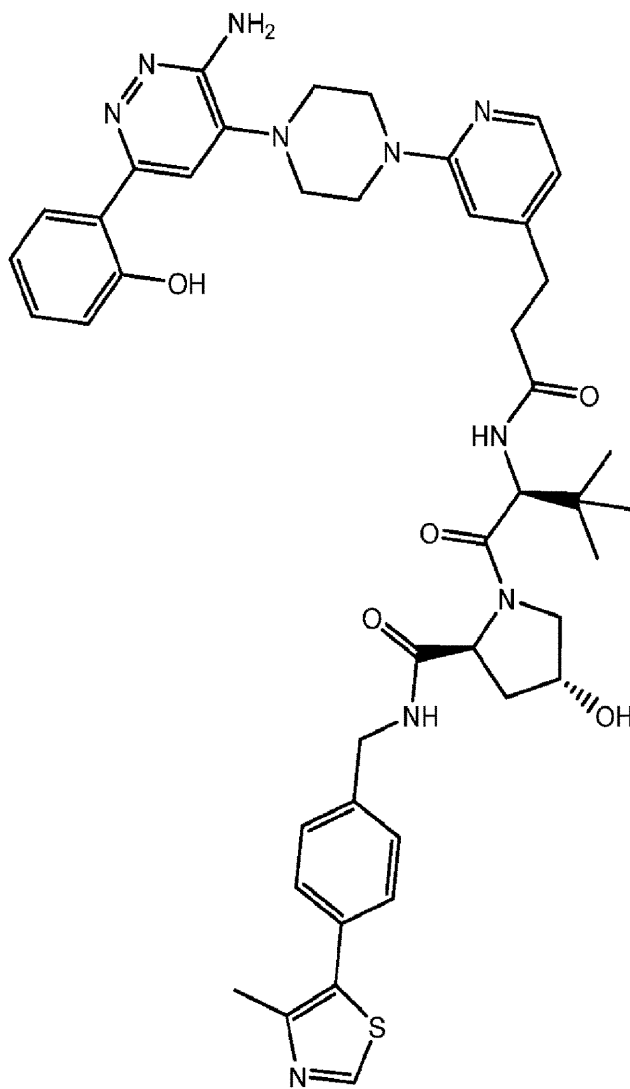
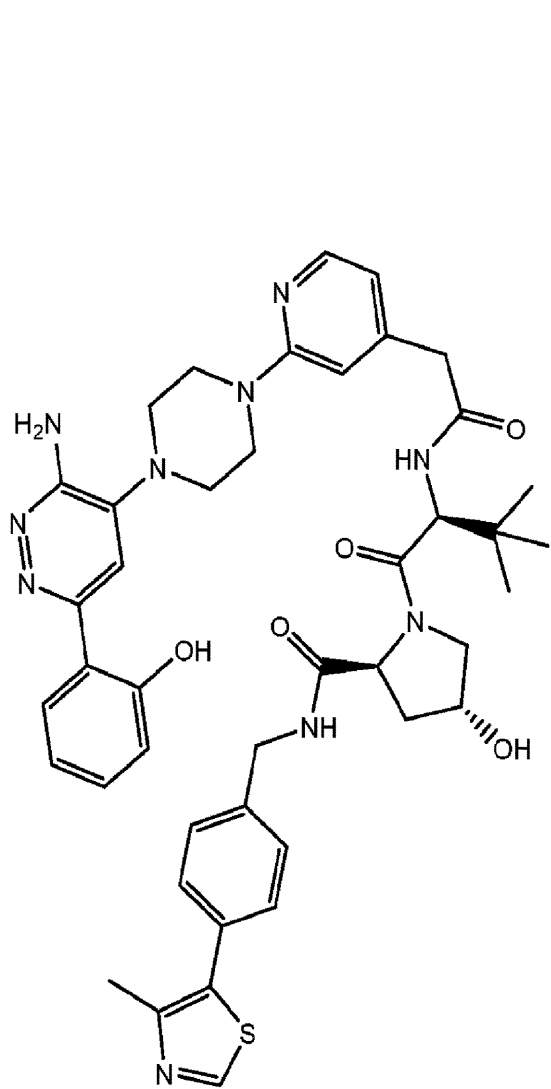
20

30

40

50

【化 5】



10

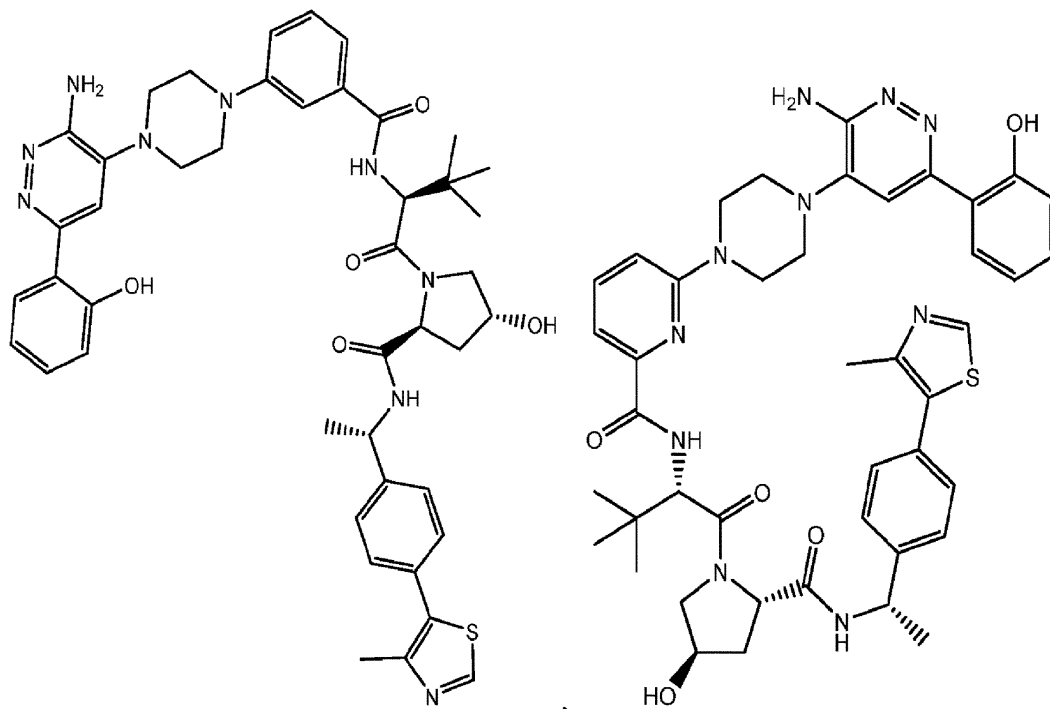
20

30

40

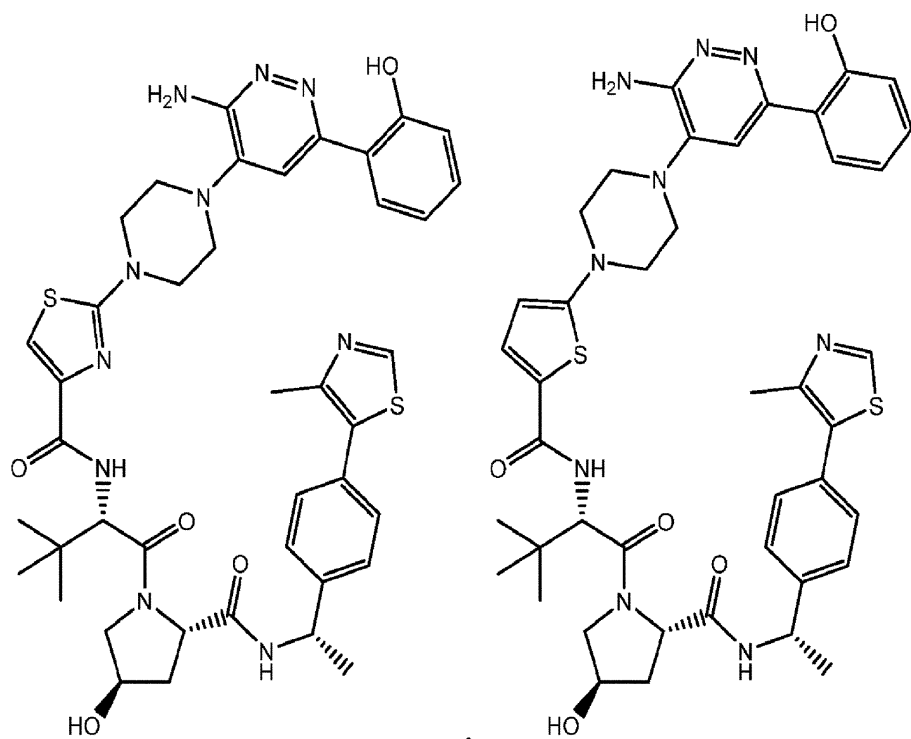
50

【化 6】



10

20

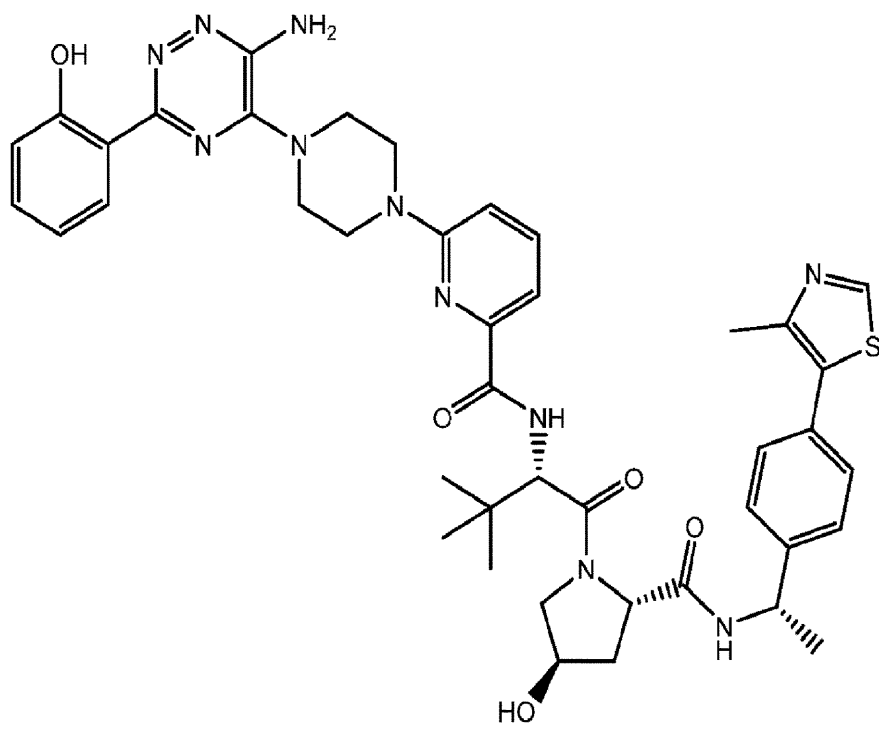
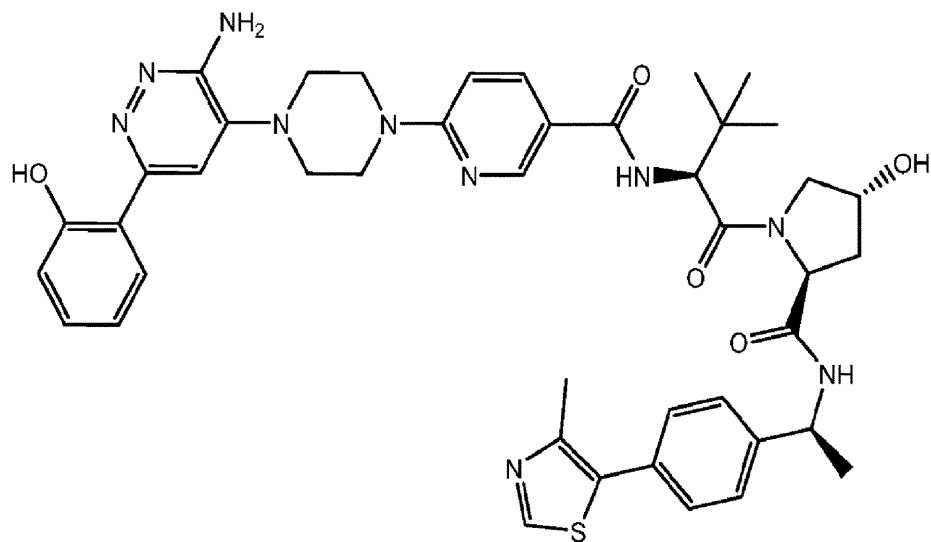


30

40

50

【化 7】



10

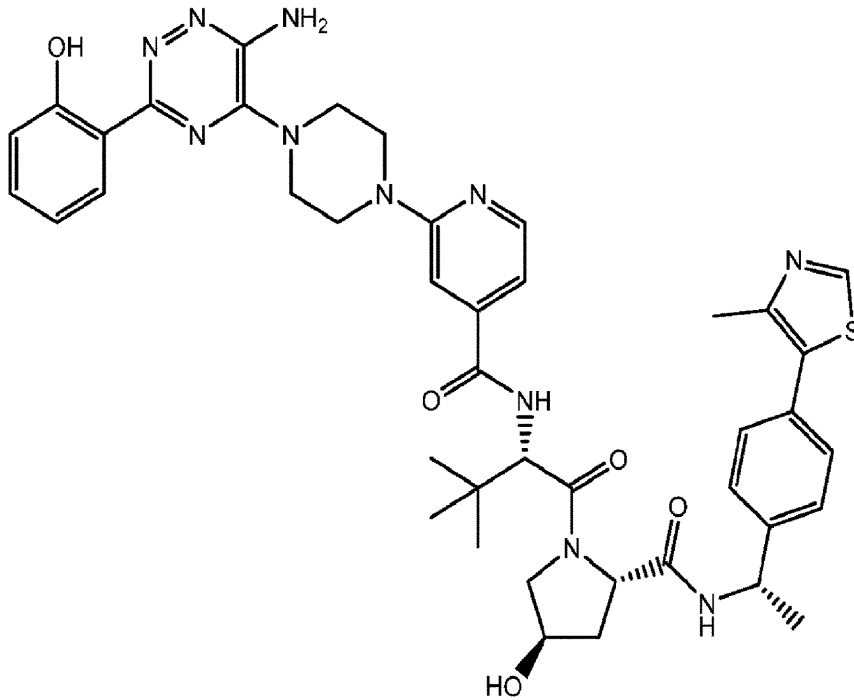
20

30

40

50

【化 8】



10

20

からなる群から選択される、請求項 1 に記載の化合物又はその薬学的に許容される塩。

【請求項 25】

薬学的に許容される塩の形態である請求項 1 ~ 14 のいずれか一項に記載の化合物。

【請求項 26】

薬学的に許容される賦形剤、担体、又はアジュバントと、請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の少なくとも 1 種の化合物とを含む医薬組成物。

【請求項 27】

哺乳動物において、SMARCA2 及び / 又は SMARCA4 により媒介される疾患又は障害を処置するための医薬組成物であって、治療上有効な量の請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の少なくとも 1 種の化合物又はその塩若しくはその薬学的な塩を含む、医薬組成物。

30

【請求項 28】

哺乳動物において、SMARCA4 の欠乏又は変異により媒介される疾患又は障害を処置するための医薬組成物であって、治療上有効な量の請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の少なくとも 1 種の化合物又はその薬学的な塩を含む、医薬組成物。

【請求項 29】

前記疾患又は障害は、ヒト癌腫である、請求項 28 に記載の医薬組成物。

【請求項 30】

前記ヒト癌腫は、肺癌、膵癌、前立腺癌、結腸癌、乳癌、子宮癌、子宮頸癌、食道癌、腎癌、及びラブドイド癌からなる群から選択される、請求項 29 に記載の医薬組成物。

40

【請求項 31】

前記ヒト癌腫は、肺癌及び子宮癌から選択される、請求項 30 に記載の医薬組成物。

【請求項 32】

哺乳動物において、SMARCA2 及び / 又は SMARCA4 の活性を調節するための方法において使用するための医薬組成物であって、ある量の請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の少なくとも 1 種の化合物又はその薬学的な塩を含み、前記方法は、前記医薬組成物を前記哺乳動物に投与して、前記哺乳動物において SMARCA2 及び / 又は SMARCA4 の活性を調節することを含む、医薬組成物。

【請求項 33】

50

ヒト癌腫を処置するための薬剤の製造のための請求項 1 ~ 15 のいずれか一項に記載の化合物の使用。

【請求項 34】

肺癌、膵癌、前立腺癌、結腸癌、乳癌、子宮癌、子宮頸癌、食道癌、腎癌、及びラブroid癌を処置するための薬剤の製造のための請求項 33 に記載の使用。

【請求項 35】

肺癌及び子宮癌を処置するための薬剤の製造のための請求項 34 に記載の使用。

10

20

30

40

50