

【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 5 年 7 月 6 日(2023.7.6)

【公開番号】特開 2023-40165(P2023-40165A)

【公開日】令和 5 年 3 月 22 日(2023.3.22)

【年通号数】公開公報(特許)2023-053

【出願番号】特願 2023-1499(P2023-1499)

【国際特許分類】

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 (2 0 0 6 . 0 1)

10

A 6 1 P 3 5 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 P 4 3 / 0 0 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 4 0 5 / 1 4 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 4 9 6 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 4 0 5 / 1 2 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 2 0 9 / 0 8 (2 0 0 6 . 0 1)

A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7 (2 0 0 6 . 0 1)

C 0 7 D 4 0 1 / 1 2 (2 0 0 6 . 0 1)

【 F I 】

C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 0 4 Z

20

A 6 1 P 3 5 / 0 0 Z N A

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1

C 0 7 D 4 0 5 / 1 4 C S P

A 6 1 K 3 1 / 4 9 6

C 0 7 D 4 0 5 / 1 2

C 0 7 D 2 0 9 / 0 8

A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7

C 0 7 D 4 0 1 / 1 2

【手続補正書】

30

【提出日】令和 5 年 6 月 27 日(2023.6.27)

【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】

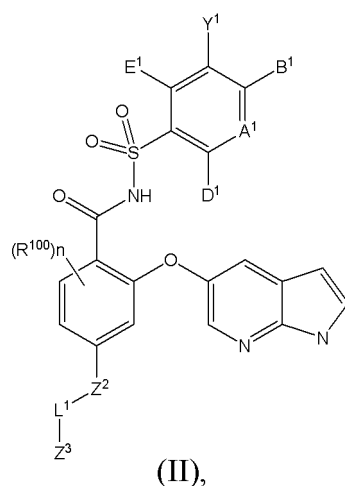
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

下記式 (I I) を有する化合物または該化合物の治療上許容される塩

40

【化 1】



10

[式中、

n は 0 であり；

A¹ は C (A²) であり；A²、D¹ および E¹ は、H であり；B¹ は、N H R¹ であり；Y¹ は、N O₂ であり；R¹ は、1 個のヘテロシクロアルキルで置換されているメチルであり；Z² は、ピペラジニルであり；L¹ は、メチレンであり；Z³ は、R^{5 7 A} および R^{5 7} で置換されているシクロアルケニルであり；R^{5 7 A} は、スピロアルキルであり；並びにR^{5 7} は、1 個の C₁ で置換されているフェニルである。]。

20

【請求項 2】

1 個のヘテロシクロアルキルが、テトラヒドロピラニルである、請求項 1 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

30

【請求項 3】

1 個のヘテロシクロアルキルが、1, 4 - ジオキサニルである、請求項 1 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 4】

R^{5 7 A} が、C₂ - C₅ - スピロアルキルである、請求項 1 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 5】

Z³ が、シクロヘキセニルである、請求項 1 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 6】

R^{5 7 A} が、C₂ - C₅ - スピロアルキルである、請求項 5 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

40

【請求項 7】

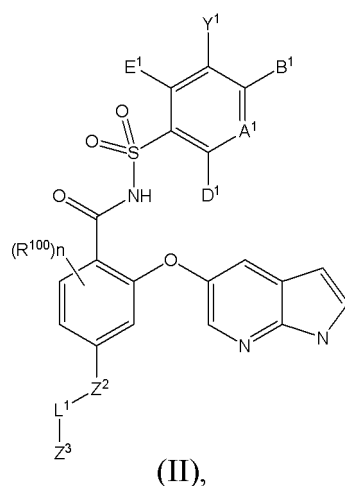
1 個のヘテロシクロアルキルが、1, 4 - ジオキサニルである、請求項 6 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 8】

下記式 (I I) を有する化合物または該化合物の治療上許容される塩

50

【化 2】



10

(II),

[式中、

n は 0 であり；

A¹ は C (A²) であり；A²、D¹ および E¹ は、H であり；B¹ は、O R¹ または N H R¹ であり；

20

Y¹ は、N O₂ であり；R¹ は、1 個の R¹⁰ で置換されているメチルであり；

R¹⁰ は、シクロアルキルまたはヘテロシクロアルキルであり、ここで、R¹⁰ は、置換されていないか、さらに置換されていないか、シクロアルキル、ヘテロシクロアルキル、アルキル、アルコキシ、O H または F から独立に選択される 1 個または 2 個で置換されているか、またはさらに置換されており；

Z² は、ピペラジニルであり；L¹ は、メチレンであり；Z³ は、R^{57A} および R⁵⁷ で置換されているシクロアルケニルであり；R^{57A} は、スピロアルキルであり；並びに

30

R⁵⁷ は、1 個の C 1 で置換されているフェニルである。]。

【請求項 9】

B¹ が、O R¹ である、請求項 8 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 10】

B¹ が、N H R¹ である、請求項 8 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 11】

R¹⁰ が、シクロアルキルである、請求項 8 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 12】

R¹⁰ が、シクロヘキシルである、請求項 8 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

40

【請求項 13】

R¹⁰ が、ヘテロシクロアルキルである、請求項 8 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 14】

R¹⁰ が、テトラヒドロピラニルである、請求項 8 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 15】

R¹⁰ が、1, 4 - ジオキサニルである、請求項 8 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

50

【請求項 16】

R^{57A} が、 $C_2 - C_5$ - スピロアルキルである、請求項 8 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 17】

Z^3 が、シクロヘキセニルである、請求項 8 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 18】

R^{57A} が、 $C_2 - C_5$ - スピロアルキルである、請求項 17 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 19】

B^1 が、 OR^1 である、請求項 18 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

10

【請求項 20】

B^1 が、 NHR^1 である、請求項 18 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 21】

R^{10} が、シクロアルキルである、請求項 20 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 22】

R^{10} が、シクロヘキシルである、請求項 21 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 23】

R^{10} が、ヘテロシクロアルキルである、請求項 20 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

20

【請求項 24】

R^{10} が、テトラヒドロピラニルである、請求項 23 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 25】

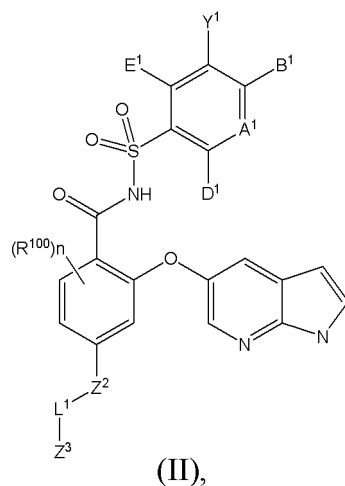
R^{10} が、1,4 - ジオキサニルである、請求項 23 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 26】

下記式 (II) を有する化合物または該化合物の治療上許容される塩

30

【化 3】



40

[式中、

n は 0 であり；

A^1 は $C(A^2)$ であり；

A^2 は、H であり；

B^1 は、 NHR^1 であり；

50

D¹ は、H であり；

E¹ は、H であり；及び

Y¹ は、NO₂ であり；

R¹ は、R⁵ であり；

R⁵ は、1 個の R⁷ で置換されているメチルであり；

R⁷ は、R¹⁰ であり；

R¹⁰ は、それぞれ縮合していないか R^{10A} と縮合しているシクロアルキル、シクロアルケニル、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロシクロアルケニルであり；R^{10A} はベンゼン、ヘテロアレーン、シクロアルカン、シクロアルケン、ヘテロシクロアルカンまたはヘテロシクロアルケンであり；

ここで、R¹⁰ は、置換されていないか、または OH、OR⁵⁷、F、Cl、Br または I から独立に選択される 1 個もしくは 2 個もしくは 3 個もしくは 4 個もしくは 5 個で置換されており；

Z² は、R³⁰ であり；

R³⁰ は、縮合していないか R^{30A} と縮合しているヘテロシクロアルキレンであり；

R^{30A} はシクロアルカンであり；

L¹ は、R³⁷ であり；

R³⁷ は、結合または R^{37A} であり；

R^{37A} は、アルキレンであり；

Z³ は、R⁴⁰ であり；

R⁴⁰ は、ヘテロシクロアルキルまたはヘテロシクロアルケニルであり；

ここで、R⁴⁰ は、1 個もしくは 2 個もしくは 3 個の R⁵⁷ で置換されており；

R⁵⁷ は、R⁵⁸ または R⁶¹ であり；

R⁵⁸ は、フェニルであり；

R⁶¹ は、アルキルであり；

ここで、R⁵⁸ は、クロロまたは 1 個の R⁷² で置換されており；並びに

R⁷² は、アルキルである。】。

【請求項 27】

R¹⁰ が、シクロアルキルである、請求項 26 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 28】

R¹⁰ が、シクロヘキシルである、請求項 27 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 29】

R¹⁰ が、1 個のメチル及び 1 個の OH で置換されている、請求項 28 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 30】

R³⁰ が、R^{30A} と縮合しているヘテロシクロアルキレンであり；R^{30A} はシクロアルカンである、請求項 26 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 31】

R³⁰ が、ヘテロシクロアルキレンである、請求項 26 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 32】

R³⁷ が、結合である、請求項 26 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 33】

R^{37A} が、メチレンである、請求項 26 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 34】

R⁴⁰ が、ヘテロシクロアルキルである、請求項 26 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

10

20

30

40

50

【請求項 35】

R⁴⁰が、ヘテロシクロアルケニルである、請求項 26 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 36】

R⁴⁰が、ピロリジニルである、請求項 26 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 37】

R⁵⁸が、R⁷²で置換されており；ここで、R⁷²が、アルキルである、請求項 26 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 38】

R⁵⁸が、クロロで置換されている、請求項 26 の化合物または該化合物の治療上許容される塩。

【請求項 39】

請求項 1 ～ 38 のいずれか一項に記載の化合物又は治療上許容される塩、及び製薬上許容される賦形剤を含有する医薬組成物。

【請求項 40】

賦形剤と、治療上有効量の請求項 1 ～ 38 のいずれか一項に記載の化合物もしくは治療上許容される塩とを含む組成物であって、膀胱癌、脳腫瘍、乳癌、骨髄癌、子宮頸癌、慢性リンパ球性白血病、結腸直腸癌、食道癌、肝細胞癌、リンパ芽球性白血病、濾胞性リンパ腫、T細胞もしくはB細胞起源のリンパ性悪性疾患、メラノーマ、骨髄性白血病、骨髄腫、口腔癌、卵巣癌、非小細胞肺癌、前立腺癌、小細胞肺癌または脾臓癌を治療するための、前記組成物。

【請求項 41】

治療上有効量の請求項 1 ～ 38 のいずれか一項に記載の化合物もしくは治療上許容される塩を含む組成物であって、患者における膀胱癌、脳腫瘍、乳癌、骨髄癌、子宮頸癌、慢性リンパ球性白血病、結腸直腸癌、食道癌、肝細胞癌、リンパ芽球性白血病、濾胞性リンパ腫、T細胞もしくはB細胞起源のリンパ性悪性疾患、メラノーマ、骨髄性白血病、骨髄腫、口腔癌、卵巣癌、非小細胞肺癌、前立腺癌、小細胞肺癌または脾臓癌の治療に使用するための、前記組成物。

【請求項 42】

治療上有効量の請求項 1 ～ 38 のいずれか一項に記載の化合物もしくは治療上許容される塩と、治療上有効量の 1 種類の別の治療薬もしくは複数の別の治療薬とを含む組成物であって、患者における膀胱癌、脳腫瘍、乳癌、骨髄癌、子宮頸癌、慢性リンパ球性白血病、結腸直腸癌、食道癌、肝細胞癌、リンパ芽球性白血病、濾胞性リンパ腫、T細胞もしくはB細胞起源のリンパ性悪性疾患、メラノーマ、骨髄性白血病、骨髄腫、口腔癌、卵巣癌、非小細胞肺癌、前立腺癌、小細胞肺癌または脾臓癌の治療に使用するための、前記組成物。

10

20

30

40

50