

【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4年11月11日(2022.11.11)

【国際公開番号】WO2020/179859

【出願番号】特願2021-503643(P2021-503643)

【国際特許分類】

C 07 D 487/04 (2006.01)

A 61 K 31/423 (2006.01)

A 61 P 43/00 (2006.01)

A 61 P 35/00 (2006.01)

A 61 K 31/427 (2006.01)

A 61 K 31/4439 (2006.01)

A 61 K 31/506 (2006.01)

A 61 K 31/497 (2006.01)

A 61 K 31/454 (2006.01)

10

【F I】

C 07 D 487/04 1 3 8

C 07 D 487/04 C S P

A 61 K 31/423

20

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 35/00

A 61 K 31/427

A 61 K 31/4439

A 61 K 31/506

A 61 K 31/497

A 61 K 31/454

【手続補正書】

【提出日】令和4年11月1日(2022.11.1)

30

【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】

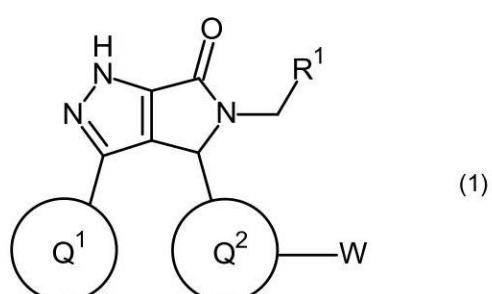
【特許請求の範囲】

【請求項1】

一般式(1)

【化1】

40



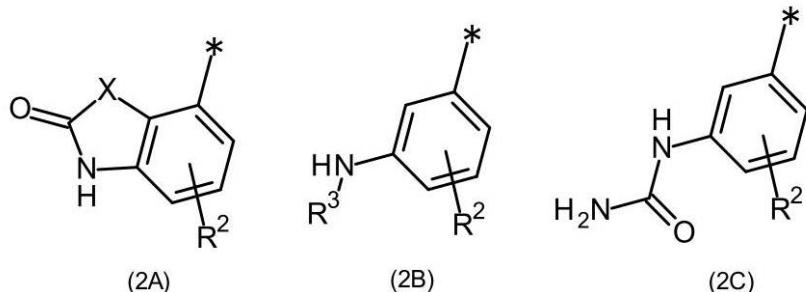
[式中、

50

R¹ は、ハロゲン C₁ - 6 アルキル基、C₃ - 8 シクロアルキル基、または 5 もしくは 6 員の芳香族複素環基を示し、

環 Q^1 は、式 (2A) から (2C)

【化 2】



10

20

30

(式中、

* は、結合手を示し、

X は、酸素原子、硫黄原子、または - NH - を示し、

R^2 は、水素原子、ハロゲン原子、またはフェノキシ基を示し、

R³ は、C₁₋₆ アルカノイル基を示す。)

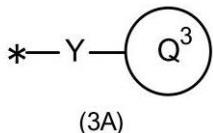
のいずれかを示し、

環 O^2 は、置換環

フェニレン基、置換基群 1 から独立に選択される置換基を 1 もしくは 2 個有していてもよい 6 員の芳香族複素環基、置換基群 1 から選択される置換基を 1 個有していてもよい 5 員の芳香族複素環基、または置換基群 1 から選択される置換基を 1 個有していてもよい 9 員の 2 環性の芳香族複素環基を示し、

W は、置換基群 1 から選択されるいずれかの置換基であるか、または式 (3A)

【化 3】



(式中、

* は、結合手を示し、

Y は、酸素原子、単結合、硫黄原子、-NH-、*-O-R⁴-** (ここで、*は、環Q²に結合し、**は、環Q³に結合する。)、C₁₋₆アルキレン基、C₁₋₆アルコキシC₁₋₆アルキレン基、またはハロゲンC₁₋₆アルキレン基を示し、

R^4 は、 C_{1-6} アルキレン基を示し、

環 Q³ は、置換基群 2 から独立に選択される置換基を 1 から 3 個有していてもよいフェニル基、置換基群 2 から独立に選択される置換基を 1 もしくは 2 個有していてもよい 6 員の芳香族複素環基、置換基群 2 から独立に選択される置換基を 1 もしくは 2 個有していてもよい 5 員の芳香族複素環基、置換基群 2 から独立に選択される置換基を 1 もしくは 2 個有していてもよい 3 から 8 員の飽和炭化水素環基、置換基群 2 から独立に選択される置換基を 1 もしくは 2 個有していてもよい 6 員の飽和複素環基、置換基群 2 から選択される置換基を 1 個有していてもよい 9 員の 2 環性の芳香族複素環基、または置換基群 2 から独立に選択される置換基を 1 から 4 個有していてもよい 10 員の 2 環性の部分不飽和複素環基を示す。)

を示す；

置換基群 1 は、ハロゲン原子、C₁ - 6 アルキル基、ハロゲン C₁ - 6 アルキル基、ハ

40

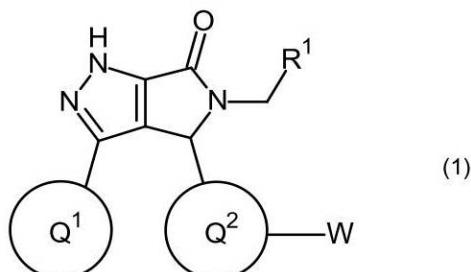
50

ロゲノ C₁ - 6 アルコキシ基、および C₃ - 8 シクロアルキル基からなる群を示し；置換基群 2 は、ハロゲン原子、C₁ - 6 アルキル基、ハロゲノ C₁ - 6 アルキル基、ハロゲノ C₁ - 6 アルコキシ基、ハロゲノ C₁ - 6 アルキルスルファニル基、およびハロゲノ C₁ - 6 アルキルスルホニル基からなる群を示す。】

で表される化合物またはその薬学上許容される塩

（ここで、式（1）

【化 4】

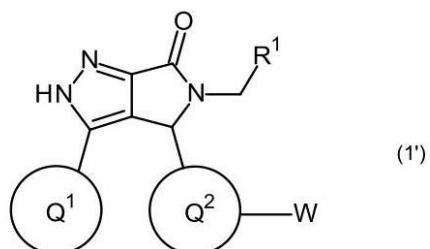


10

〔式中、 R^1 、 Q^1 、 Q^2 及び W は前記と同義である。〕

で表される化合物は、その互変異性体である式(1')。

【化 5 】



30

〔式中、 R^1 、 Q^1 、 Q^2 及び W は前記と同義である。〕

で表される化合物を任意の比率で含有していてもよく、また、式(1)で表される化合物の比率が100%であってもよく、式(1')で表される化合物の比率が100%であってもよい)。

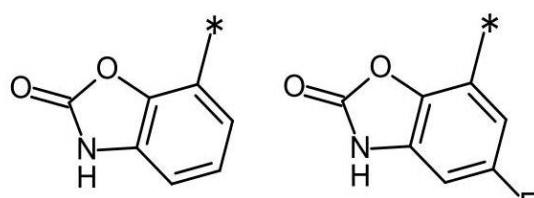
【請求項2】

R¹が、1,1-ジフルオロエチル基である、請求項1に記載の化合物またはその薬学上許容される塩。

【請求項3】

環 O^1 が、式 (5A) または (5B)

【化 6】



40

「式由 * は 結論を示す 」

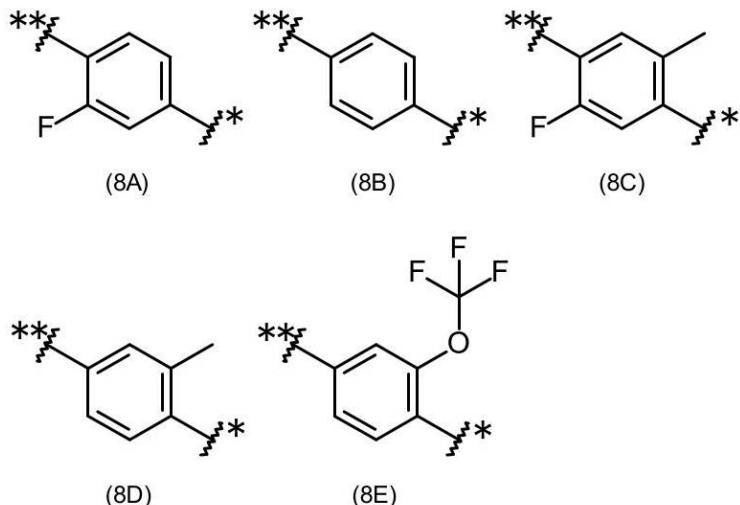
のいずれかを示す。請求項1または2に記載の化合物またはその医学上許容される塗

【請求項4】

環 O^2 が 式 (8 A) から (8 E)

50

【化7】

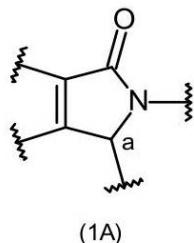


[式中、

*は、Wに結合し、

**は、式(1)において、式(1A)

【化8】



で示される部分のaで示される炭素原子(以下、「aで示される炭素原子」とする)に結合する。】

のいずれかを示す、請求項1から3のいずれか1項に記載の化合物またはその薬学上許容される塩。

【請求項5】

Wが式(3A)を示し；

式(3A)中、Yが前記と同義であり；

環Q³が、4-クロロフェニル基、4-(トリフルオロメトキシ)フェニル基、3,4-ジクロロフェニル基、4-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-(トリフルオロメチルスルファニル)フェニル基、3-クロロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル基、3,5-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基、3-メチル-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル基、3-クロロ-5-(トリフルオロメトキシ)フェニル基、3,5-ジクロロ-4-(トリフルオロメトキシ)フェニル基、3-クロロ-5-(トリフルオロメチル)フェニル基、4-(トリフルオロメトキシ)-3-(トリフルオロメチル)フェニル基、3,4-ビス(トリフルオロメチル)フェニル基、3-クロロ-2-(トリフルオロメトキシ)フェニル基、または2,2,3,3-テトラフルオロ-1,4-ベンゾジオキシン-6-イル基である、請求項1から4のいずれか1項に記載の化合物またはその薬学上許容される塩。

【請求項6】

Yが、酸素原子である、請求項1から5のいずれか1項に記載の化合物またはその薬学上許容される塩。

10

20

30

40

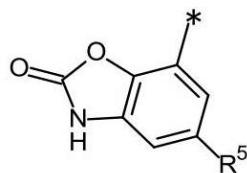
50

【請求項 7】

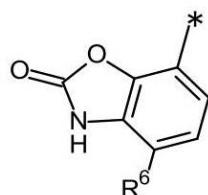
R^1 が、トリフルオロメチル基、1,1-ジフルオロエチル基、1,1-ジフルオロプロピル基、シクロプロピル基、2-ピリジル基、またはオキサゾール-2-イル基であり；

環 Q^1 が、式 (4A) または (4B)

【化 9】



(4A)



(4B)

10

[式中、

* は、結合手を示し、

R^5 は、水素原子またはハロゲン原子を示し、

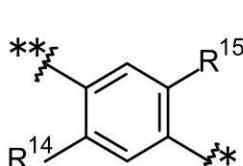
R^6 は、ハロゲン原子を示す。]

のいずれかを示し；

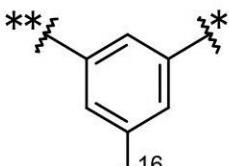
環 Q^2 が、式 (7A) から (7C)

20

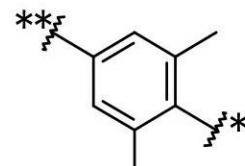
【化 10】



(7A)



(7B)



(7C)

30

[式中、

* は、W に結合し、

** は、a で示される炭素原子に結合し、

R^{14} は、水素原子、フッ素原子、塩素原子、またはメチル基を示し、

R^{15} は、水素原子、塩素原子、メチル基、エチル基、トリフルオロメチル基、トリフルオロメトキシ基、4,4,4-トリフルオロブロトキシ基、またはシクロプロピル基を示し、

R^{16} は、水素原子またはトリフルオロメチル基を示す。]

のいずれかを示し；

W が、フッ素原子、塩素原子、n-ブチル基、n-ヘキシル基、トリフルオロメチル基、トリフルオロメトキシ基、もしくは4,4,4-トリフルオロブロトキシ基であるか、または、

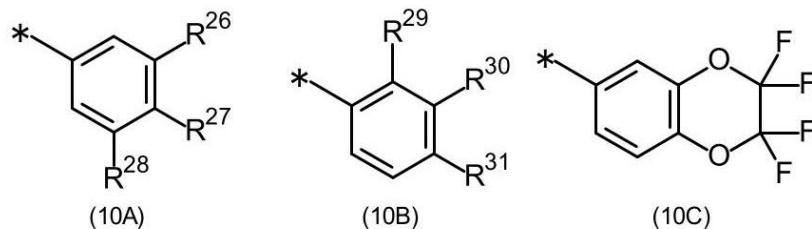
W が式 (3A) を示し、

環 Q^3 が、式 (10A) から (10C)

40

50

【化11】



[式中、

10

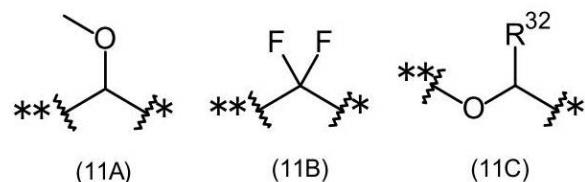
*は、結合手を示し、

R²⁶およびR²⁸は、各々独立に、水素原子、塩素原子、メチル基、トリフルオロメチル基、またはトリフルオロメトキシ基を示し、R²⁷は、水素原子、フッ素原子、塩素原子、トリフルオロメチル基、トリフルオロメトキシ基、トリフルオロメチルスルファニル基、またはトリフルオロメチルスルホニル基を示し、R²⁹は、フッ素原子、塩素原子、メチル基、トリフルオロメチル基、またはトリフルオロメトキシ基を示し、R³⁰は、水素原子または塩素原子を示し、R³¹は、水素原子、トリフルオロメチル基、またはトリフルオロメトキシ基を示す。】

20

のいずれかを示し、
Yが、酸素原子、単結合、硫黄原子、-NH-、メチレン基、または式(11A)から
(11C)。

【化12】



30

[式中、

*は、環Q³に結合し、**は、環Q²に結合し、R³²は、水素原子またはメチル基を示す。】

のいずれかを示す；

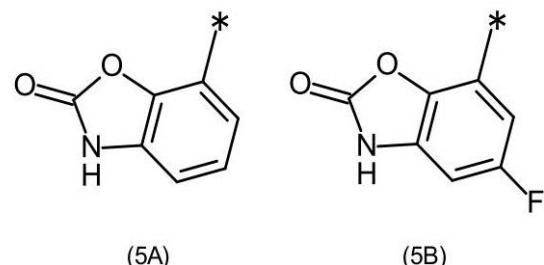
請求項1に記載の化合物またはその薬学上許容される塩。

【請求項8】

R¹が、1,1-ジフルオロエチル基であり；環Q¹が、式(5A)または(5B)

40

【化13】



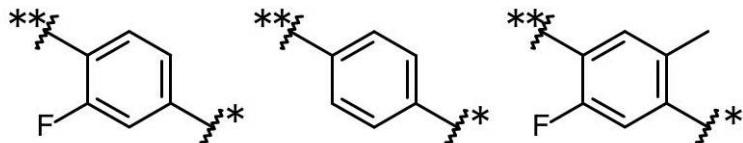
50

[式中、 * は、結合手を示す。]

のいずれかを示し；

環 Q² が、式 (8A) から (8E)

【化 14】

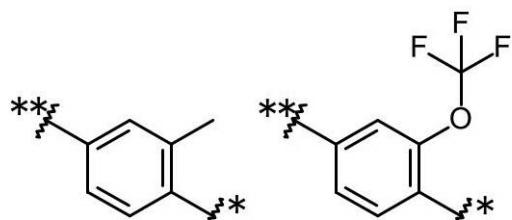


(8A)

(8B)

(8C)

10



(8D)

(8E)

20

[式中、

* は、W に結合し、

** は、a で示される炭素原子に結合する。]

のいずれかを示し；

W が式 (3A) を示し；

環 Q³ が、4 - クロロフェニル基、4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル基、3 , 4 - ジクロロフェニル基、4 - (トリフルオロメチル) フェニル基、4 - (トリフルオロメチルスルファニル) フェニル基、3 - クロロ - 4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル基、3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル基、3 - メチル - 4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル基、3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメトキシ) フェニル基、3 , 5 - ジクロロ - 4 - (トリフルオロメトキシ) フェニル基、3 - クロロ - 5 - (トリフルオロメチル) フェニル基、4 - (トリフルオロメトキシ) - 3 - (トリフルオロメチル) フェニル基、3 , 4 - ビス (トリフルオロメチル) フェニル基、3 - クロロ - 2 - (トリフルオロメトキシ) フェニル基、または2 , 2 , 3 , 3 - テトラフルオロ - 1 , 4 - ベンゾジオキシン - 6 - イル基であり；

Y が、酸素原子である；

請求項 1 に記載の化合物またはその薬学上許容される塩。

【請求項 9】

請求項 1 に記載の (-) - 7 - [4 - { 4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フエノキシ] フェニル } - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3H) - オンまたはその薬学上許容される塩

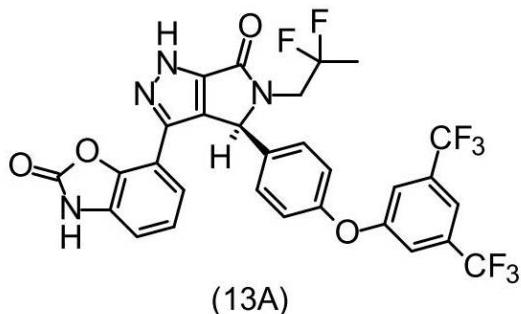
(ここで、式 (13A)

30

40

50

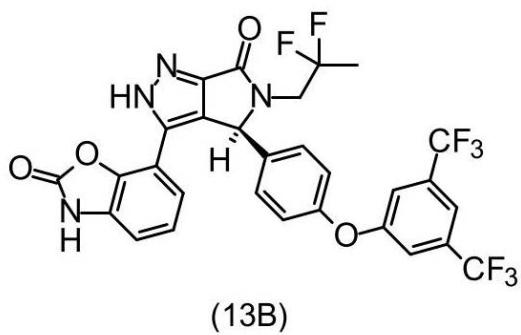
【化 1 5 - 1】



10

で表される (-) - 7 - [4 - { 4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル } - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンは、その互変異性体である式 (13 B)

【化 1 5 - 2】



20

で表される 7 - [(4 S) - 4 - { 4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル } - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 2 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンを任意の比率で含有していてもよく、また、式 (13 A) で表される化合物の比率が 100 % であってもよく、式 (13 B) で表される化合物の比率が 100 % であってもよい)。

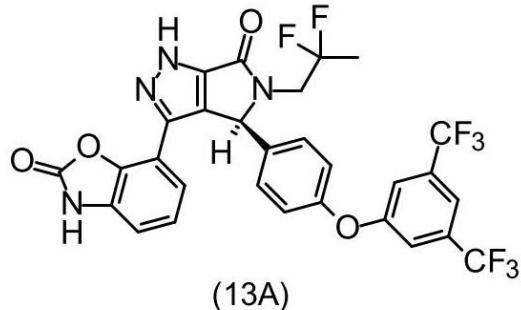
30

【請求項 1 0】

請求項 1 に記載の (-) - 7 - [4 - { 4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル } - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンまたはその薬学上許容される塩
 (ここで、式 (13 A)

40

【化 1 6 - 1】



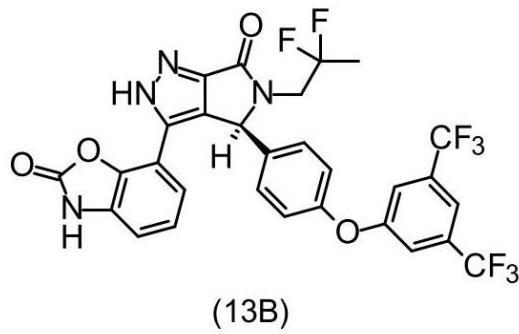
40

で表される (-) - 7 - [4 - { 4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェノキシ]

50

] フェニル} - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンは、その互変異性体である式 (13 B)

【化 16 - 2 】



10

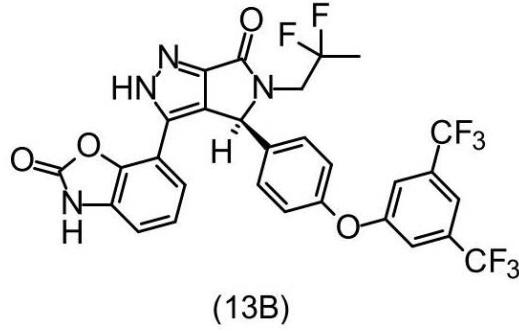
で表される 7 - [(4 S) - 4 - { 4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル } - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 2 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンを含有しない)。

【請求項 11 】

請求項 1 に記載の 7 - [(4 S) - 4 - { 4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル } - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 2 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンまたはその薬学上許容される塩

(ここで、式 (13 B)

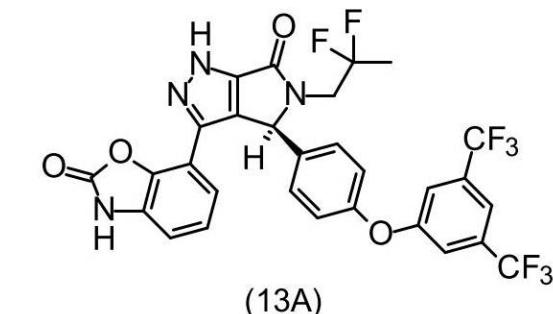
【化 17 - 1 】



30

で表される 7 - [(4 S) - 4 - { 4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル } - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 2 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンは、その互変異性体である式 (13 A)

【化 17 - 2 】



40

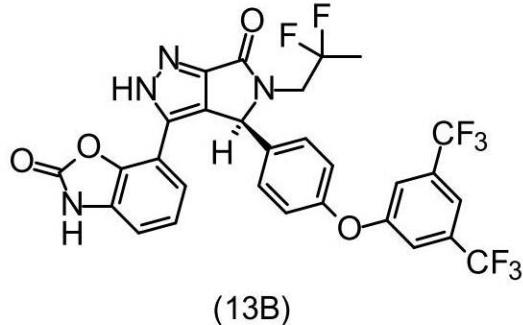
50

で表される(-) - 7 - [4 - { 4 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル} - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ[3 , 4 - c]ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンを任意の比率で含有していてもよく、また、式(13 A)で表される化合物の比率が 100 % であってもよく、式(13 B)で表される化合物の比率が 100 % であってもよい)。

【請求項 12】

請求項 1 に記載の 7 - [(4 S) - 4 - { 4 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル} - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 2 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ[3 , 4 - c]ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンまたはその薬学上許容される塩
 (ここで、式(13 B)

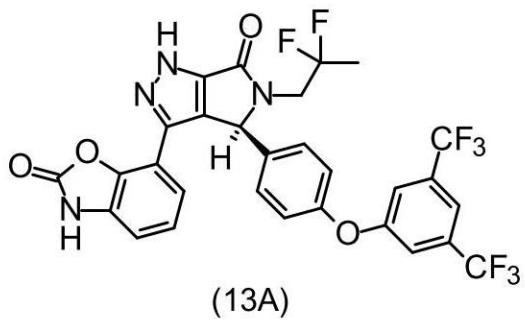
【化 18 - 1】



(13B)

で表される 7 - [(4 S) - 4 - { 4 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル} - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 2 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ[3 , 4 - c]ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンは、その互変異性体である式(13 A)

【化 18 - 2】



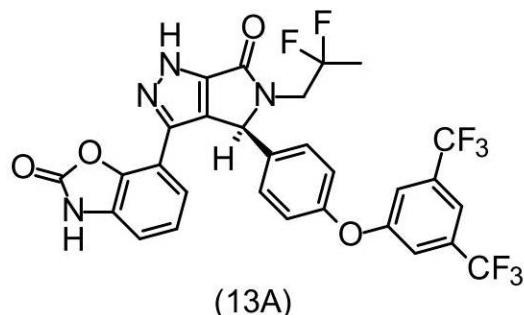
(13A)

で表される(-) - 7 - [4 - { 4 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル} - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ[3 , 4 - c]ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンを含有しない)。

【請求項 13】

請求項 1 に記載の(-) - 7 - [4 - { 4 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル} - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ[3 , 4 - c]ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オン 2 - メチルプロパン - 2 - アミン塩
 (ここで、式(13 A)

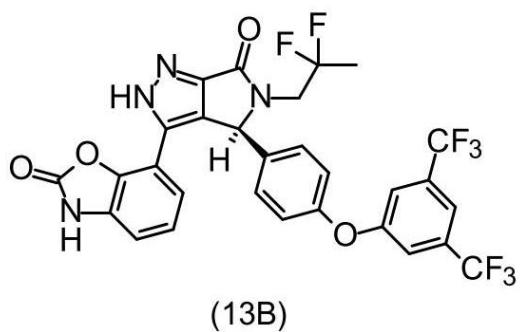
【化 1 9 - 1】



10

で表される (-) - 7 - [4 - { 4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル } - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンは、その互変異性体である式 (13B)

【化 1 9 - 2】



20

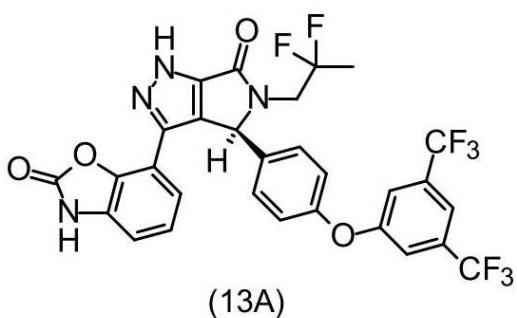
で表される 7 - [(4 S) - 4 - { 4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル } - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 2 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンを任意の比率で含有していてもよく、また、式 (13A) で表される化合物の比率が 100 % であってもよく、式 (13B) で表される化合物の比率が 100 % であってもよい)。

30

【請求項 1 4】

請求項 1 に記載の (-) - 7 - [4 - { 4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル } - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オン 2 - メチルプロパン - 2 - アミン塩
 (ここで、式 (13A)

【化 2 0 - 1】



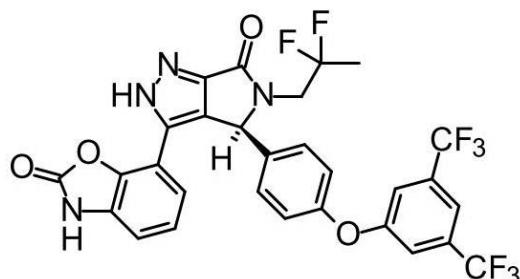
40

で表される (-) - 7 - [4 - { 4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェノキシ

50

] フェニル} - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンは、その互変異性体である式 (13 B)

【化 2 0 - 2 】



(13B)

10

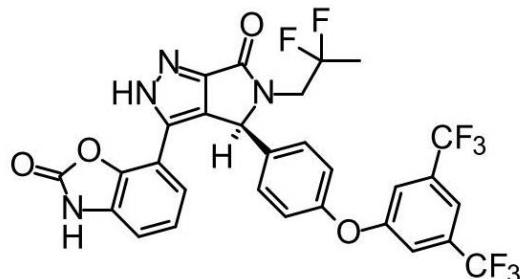
で表される 7 - [(4 S) - 4 - { 4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル } - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 2 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンを含有しない)。

【請求項 1 5 】

請求項 1 に記載の 7 - [(4 S) - 4 - { 4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル } - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 2 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オン 2 - メチルプロパン - 2 - アミン 塩

(ここで、式 (13 B)

【化 2 1 - 1 】



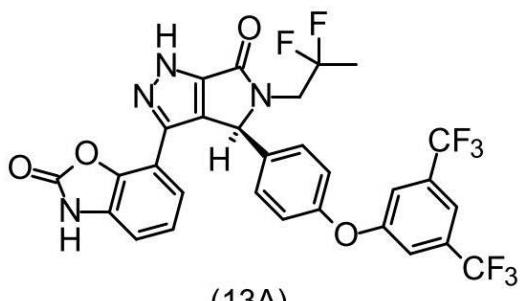
(13B)

30

で表される 7 - [(4 S) - 4 - { 4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル } - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 2 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンは、その互変異性体である式 (13 A)

【化 2 1 - 2 】

40



(13A)

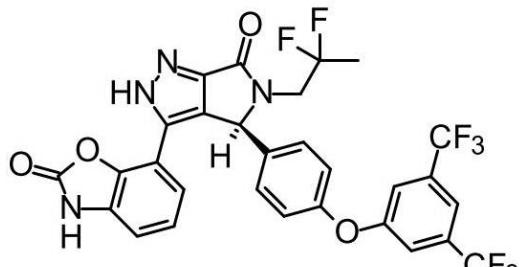
50

で表される(-) - 7 - [4 - { 4 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル} - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ[3 , 4 - c]ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンを任意の比率で含有していてもよく、また、式(13 A)で表される化合物の比率が 100 % であってもよく、式(13 B)で表される化合物の比率が 100 % であってもよい)。

【請求項 16】

請求項 1 に記載の 7 - [(4 S) - 4 - { 4 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル} - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 2 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ[3 , 4 - c]ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オン 2 - メチルプロパン - 2 - アミン塩
〔ここで、式(13 B)

【化 22 - 1】

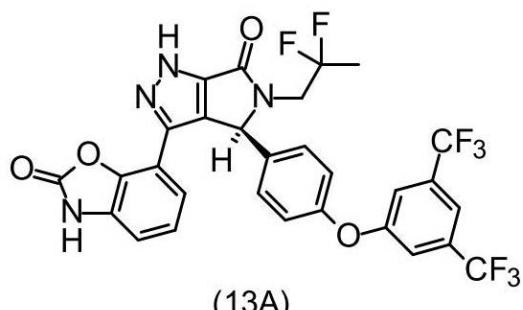


(13B)

20

で表される 7 - [(4 S) - 4 - { 4 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル} - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 2 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ[3 , 4 - c]ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンは、その互変異性体である式(13 A)

【化 22 - 2】



(13A)

30

で表される(-) - 7 - [4 - { 4 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル} - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ[3 , 4 - c]ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンを含有しない)。

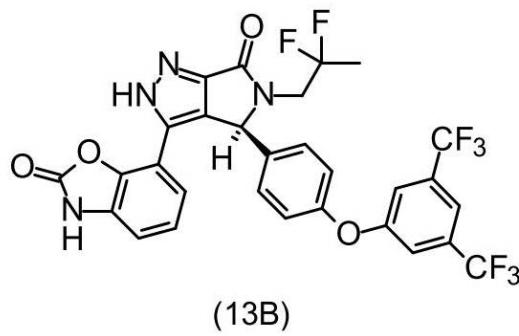
【請求項 17】

請求項 1 に記載の 7 - [(4 S) - 4 - { 4 - [3 , 5 - ビス(トリフルオロメチル)フェノキシ]フェニル} - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 2 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ[3 , 4 - c]ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オン 2 - メチルプロパン - 2 - アミン塩の結晶であって、銅の K 線 (= 1 . 54 オングストローム) の照射で得られる粉末 X 線回折図において、
3 . 444 ± 0 . 2 、 10 . 46 ± 0 . 2 、 13 . 04 ± 0 . 2 、 16 . 00 ± 0 . 2 、 1
9 . 20 ± 0 . 2 、 21 . 02 ± 0 . 2 、 22 . 18 ± 0 . 2 、 23 . 54 ± 0 . 2 、 2
JP WO2020/179859 A5 2022.11.11 40 50

4 . 4 6 ± 0 . 2 、 2 5 . 8 8 ± 0 . 2 から選択される回折角度 (2) に、少なくとも 5 つのピークを有する結晶

(ここで、式 (13B))

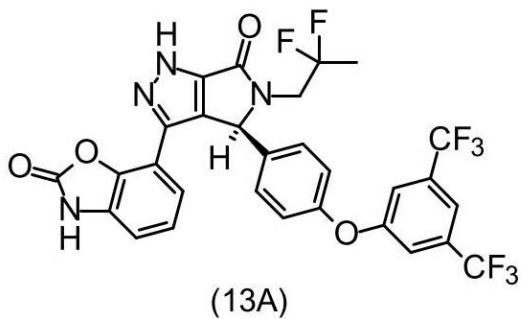
【化 23-1】



10

で表される 7 - [(4S) - 4 - { 4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フエノキシ] フエニル } - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 2 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンは、その互変異性体である式 (13A)

【化 23-2】



20

で表される (-) - 7 - [4 - { 4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フエノキシ] フエニル } - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンを含有しない)。

【請求項 18】

請求項 1 から 16 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくはその薬学上許容される塩または請求項 17 に記載の結晶を有効成分とする、ホスファチジルセリンシンターゼ 1 の阻害剤。

【請求項 19】

請求項 1 から 16 のいずれか 1 項に記載の化合物もしくはその薬学上許容される塩または請求項 17 に記載の結晶、および薬学上許容される担体を含有する医薬組成物。

30

40

【請求項 20】

がんの治療のための、請求項 19 に記載の医薬組成物。

50