

【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

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

20

【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】

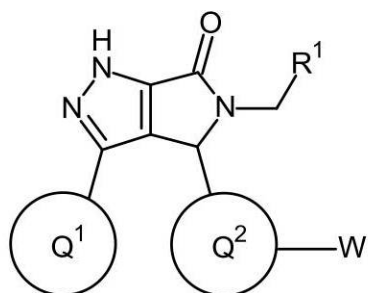
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

一般式 (1)

【化 1】

40



(1)

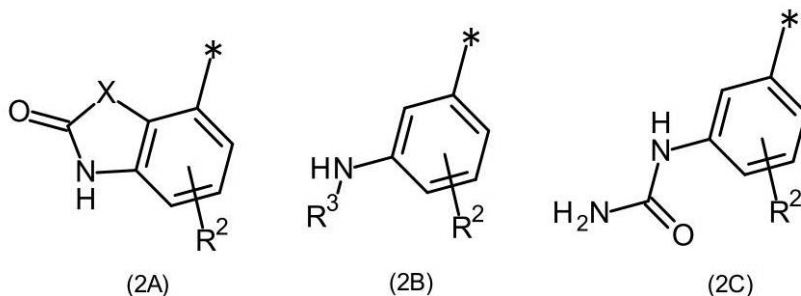
[式中、

50

R^1 は、ハロゲン C_{1-6} アルキル基、 C_{3-8} 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

(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、

R^3 は、 C_{1-6} アルカノイル基を示す。)

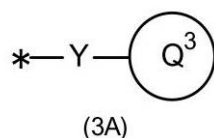
のいずれかを示し、

20

環 Q^2 は、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】



30

(式中、

$*$ は、結合手を示し、

Y は、酸素原子、単結合、硫黄原子、 $-NH-$ 、 $*-O-R^4-*$ (ここで、 $*$ は、環 Q^2 に結合し、 $**$ は、環 Q^3 に結合する。)、 C_{1-6} アルキレン基、 C_{1-6} アルコキシ C_{1-6} アルキレン基、またはハロゲン C_{1-6} 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 Q^3 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。)

40

を示し、

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

50

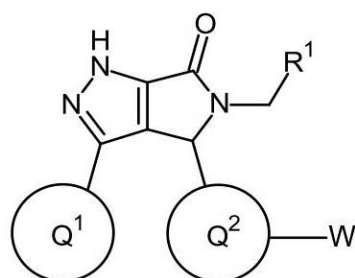
ロゲノ C₁ - 6 アルコキシ基、および C₃ - 8 シクロアルキル基からなる群を示し；

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】



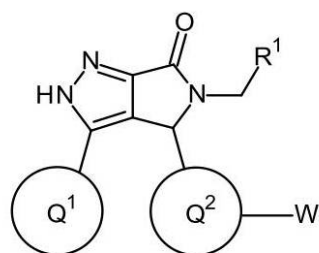
(1)

10

[式中、R¹、Q¹、Q² 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】



(1')

20

[式中、R¹、Q¹、Q² 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。

30

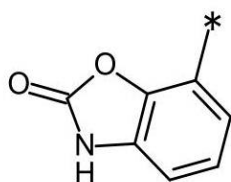
【請求項 2】

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。

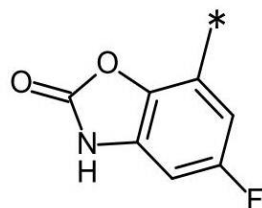
【請求項 3】

環 Q¹ が、式 (5A) または (5B)

【化 6】



(5A)



(5B)

40

[式中、* は、結合手を示す。]

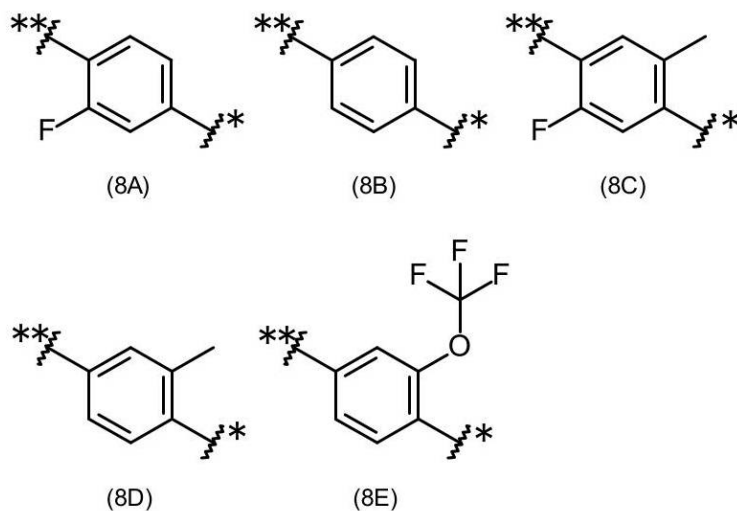
のいずれかを示す、請求項 1 または 2 に記載の化合物またはその薬学上許容される塩。

【請求項 4】

環 Q² が、式 (8A) から (8E)

50

【化 7】



10

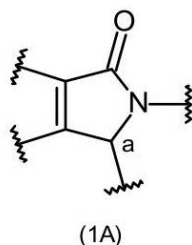
[式中、

* は、W に結合し、

* * は、式 (1) において、式 (1 A)

20

【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。]

30

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 (3 A) を示し；

式 (3 A) 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。

40

【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。

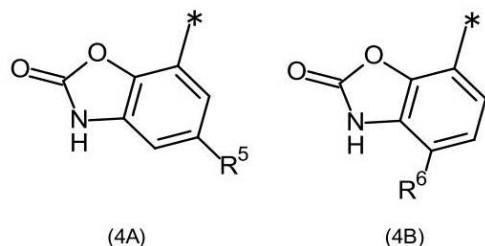
50

【請求項 7】

R¹ 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 Q¹ が、式 (4 A) または (4 B)

【化 9】



10

[式中、

* は、結合手を示し、

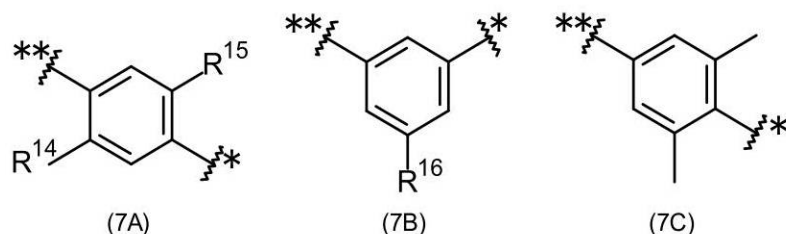
R⁵ は、水素原子またはハロゲン原子を示し、

R⁶ は、ハロゲン原子を示す。]

のいずれかを示し；

環 Q² が、式 (7 A) から (7 C)

【化 10】



30

[式中、

* は、W に結合し、

** は、a で示される炭素原子に結合し、

R¹⁴ は、水素原子、フッ素原子、塩素原子、またはメチル基を示し、

R¹⁵ 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 - トリフルオロブトキシ基、またはシクロプロピル基を示し、

R¹⁶ 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 - トリフルオロブトキシ基であるか、または、

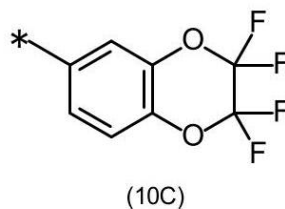
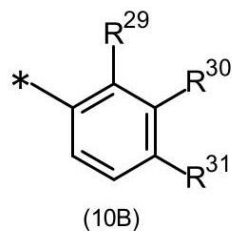
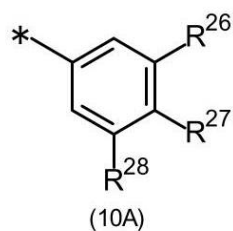
W が式 (3 A) を示し、

環 Q³ が、式 (10 A) から (10 C)

40

50

【化 1 1】



[式中、

* 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、

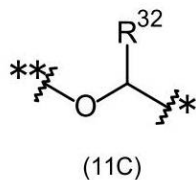
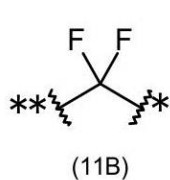
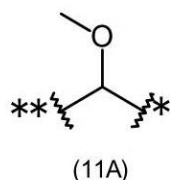
R³⁰ は、水素原子または塩素原子を示し、

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。]

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 1 2】



[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；

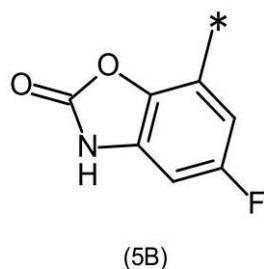
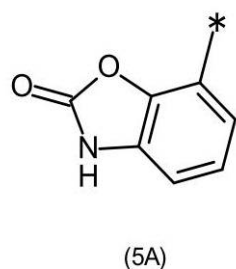
請求項 1 に記載の化合物またはその薬学上許容される塩。

【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)

【化 1 3】



10

20

30

40

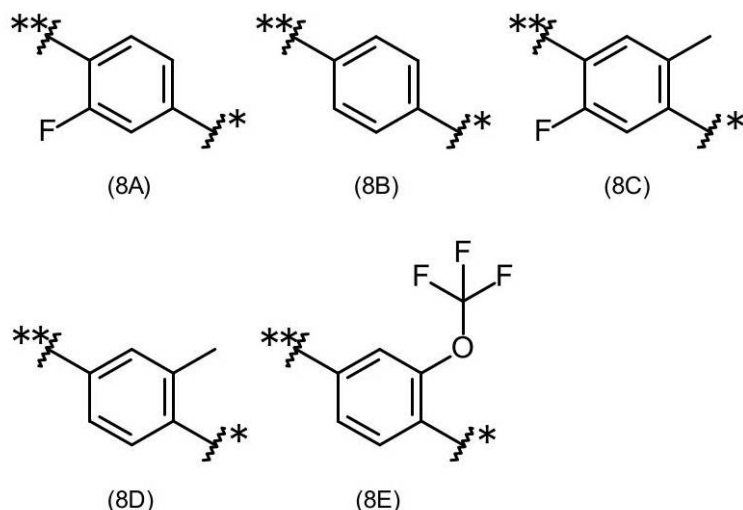
50

[式中、* は、結合手を示す。]

のいずれかを示し；

環 Q² が、式 (8 A) から (8 E)

【化 1 4】



10

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 (3 A) 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；

30

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。

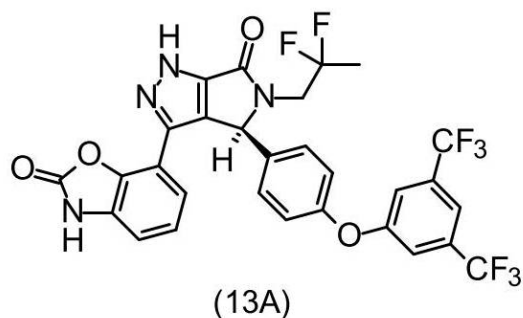
【請求項 9】

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 (1 3 A)

40

50

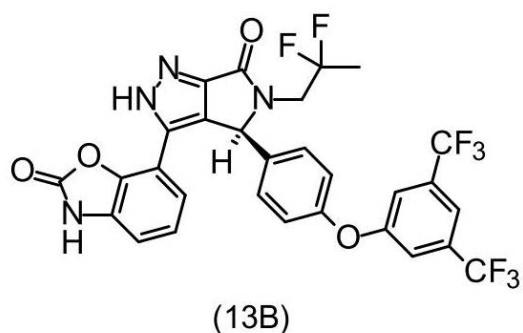
【化 1 5 - 1】



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 (1 3 B)

【化 1 5 - 2】



20

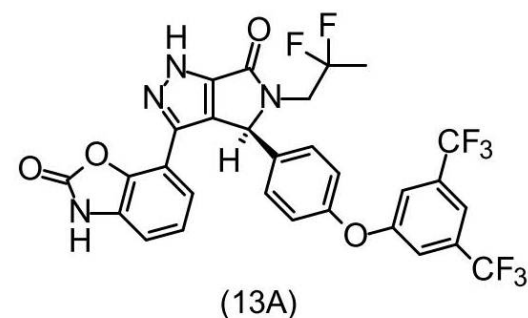
で表される 7 - [(4 S) - 4 - { 4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル } - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 2 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンを任意の比率で含有していてもよく、また、式 (1 3 A) で表される化合物の比率が 1 0 0 % であってもよく、式 (1 3 B) で表される化合物の比率が 1 0 0 % であってもよい。

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 (1 3 A)

【化 1 6 - 1】



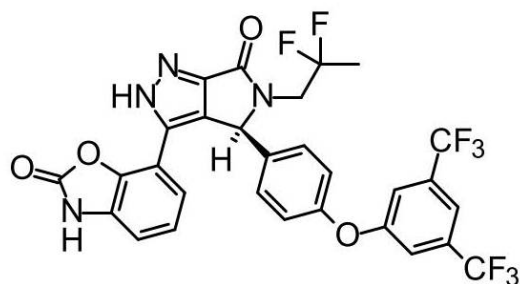
40

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 (1 3 B)

【化 1 6 - 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 1】

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

20

(ここで、式 (1 3 B)

【化 1 7 - 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 (1 3 A)

【化 1 7 - 2】

40



(13A)

50

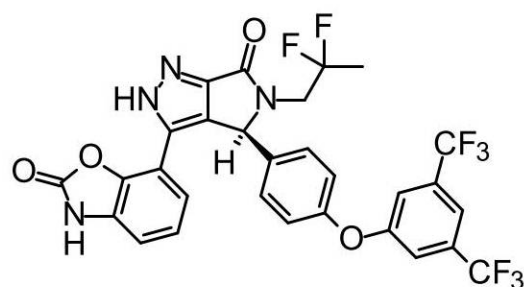
で表される (-) - 7 - [4 - { 4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル } - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンを任意の比率で含有していてもよく、また、式 (1 3 A) で表される化合物の比率が 1 0 0 % であってもよく、式 (1 3 B) で表される化合物の比率が 1 0 0 % であってもよい。

【請求項 1 2】

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 (1 3 B)

10

【化 1 8 - 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 (1 3 A)

【化 1 8 - 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。

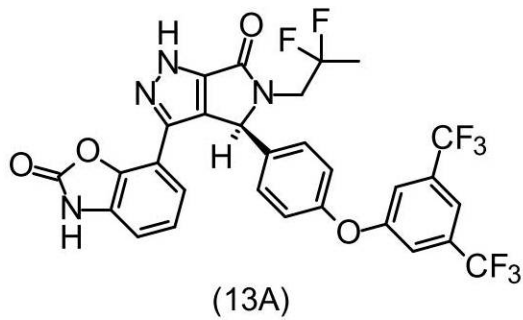
40

【請求項 1 3】

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 (1 3 A)

50

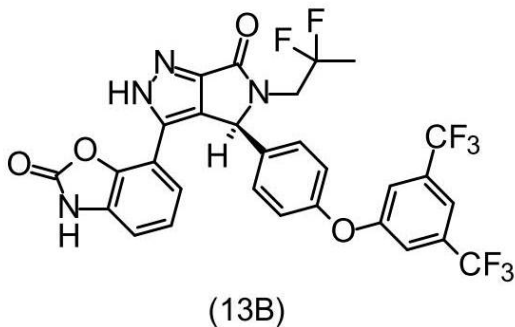
【化 19 - 1】



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 19 - 2】



20

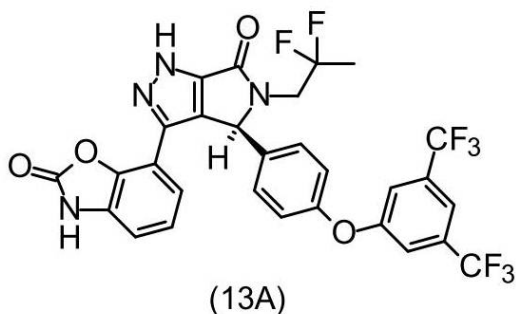
で表される 7 - [(4 S) - 4 - { 4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル } - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 2 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンを任意の比率で含有してもよく、また、式 (13 A) で表される化合物の比率が 100 % であってもよく、式 (13 B) で表される化合物の比率が 100 % であってもよい。

30

【請求項 14】

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 20 - 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 (1 3 B)

【化 2 0 - 2 】



(13B)

10

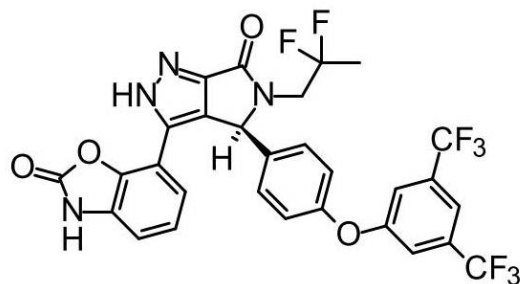
で表される 7 - [(4 S) - 4 - { 4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル } - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 2 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンを含有しない。

【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 (1 3 B)

20

【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 (1 3 A)

【化 2 1 - 2 】



(13A)

40

50

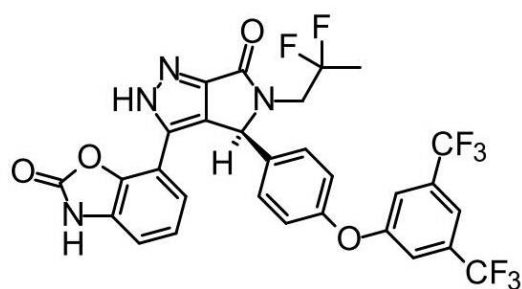
で表される (-) - 7 - [4 - { 4 - [3 , 5 - ビス (トリフルオロメチル) フェノキシ] フェニル } - 5 - (2 , 2 - ジフルオロプロピル) - 6 - オキソ - 1 , 4 , 5 , 6 - テトラヒドロピロロ [3 , 4 - c] ピラゾール - 3 - イル] - 1 , 3 - ベンゾオキサゾール - 2 (3 H) - オンを任意の比率で含有していてもよく、また、式 (1 3 A) で表される化合物の比率が 1 0 0 % であってもよく、式 (1 3 B) で表される化合物の比率が 1 0 0 % であってもよい。

【請求項 1 6】

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 (1 3 B)

10

【化 2 2 - 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 (1 3 A)

【化 2 2 - 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。

40

【請求項 1 7】

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 ($\lambda = 1.54$ 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 . 4 4 \pm 0 . 2、1 0 . 4 6 \pm 0 . 2、1 3 . 0 4 \pm 0 . 2、1 6 . 0 0 \pm 0 . 2、1 9 . 2 0 \pm 0 . 2、2 1 . 0 2 \pm 0 . 2、2 2 . 1 8 \pm 0 . 2、2 3 . 5 4 \pm 0 . 2、2

50

4.46 ± 0.2、25.88 ± 0.2 から選択される回折角度 (2θ) 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】

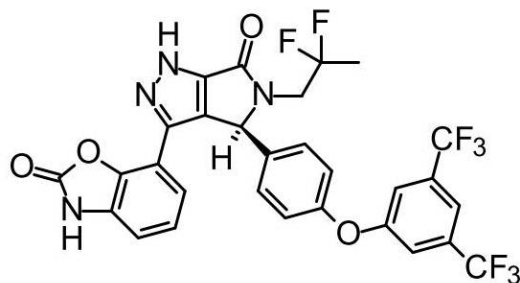


(13B)

10

で表される 7 - [(4S) - 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 (3H) - オンは、その互変異性体である式 (13A)

【化 23-2】



(13A)

20

で表される (S) - 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 (3H) - オンを含む。

30

【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む医薬組成物。

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。