

【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 10 月 17 日(2023.10.17)

【国際公開番号】WO2021/069705  
 【公表番号】特表 2022-551185(P2022-551185A)  
 【公表日】令和 4 年 12 月 7 日(2022.12.7)  
 【年通号数】公開公報(特許)2022-225  
 【出願番号】特願 2022-521718(P2022-521718)  
 【国際特許分類】

10

C 0 7 D 4 0 1 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 K 4 5 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 4 3 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 P 3 5 / 0 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 K 3 1 / 4 5 4 ( 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 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 C 0 7 D 4 0 9 / 1 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 C 0 7 D 4 1 7 / 1 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 C 0 7 D 4 1 3 / 1 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 C 0 7 D 4 9 1 / 1 0 7 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 A 6 1 K 3 1 / 4 9 7 ( 2 0 0 6 . 0 1 )  
 C 0 7 D 4 0 7 / 1 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

20

【 F I 】

C 0 7 D 4 0 1 / 0 4                      C S P  
 A 6 1 K 4 5 / 0 0  
 A 6 1 P 4 3 / 0 0    1 2 1  
 A 6 1 P 4 3 / 0 0    1 1 1  
 A 6 1 P 3 5 / 0 0  
 A 6 1 K 3 1 / 4 5 4  
 A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7  
 C 0 7 D 4 0 1 / 1 4  
 C 0 7 D 4 0 9 / 1 4  
 C 0 7 D 4 1 7 / 1 4  
 C 0 7 D 4 1 3 / 1 4  
 C 0 7 D 4 9 1 / 1 0 7  
 A 6 1 K 3 1 / 4 9 7  
 C 0 7 D 4 0 7 / 1 4

30

【手続補正書】

40

【提出日】令和 5 年 10 月 6 日(2023.10.6)

【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】

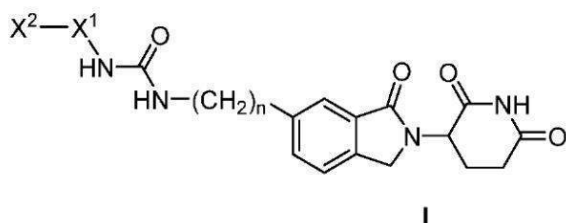
【特許請求の範囲】

【請求項 1】

式 I の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは立体異性体

50

## 【化 1 3 7】



であって、式中、

$X^1$  は直鎖状または分枝鎖状  $C_{1\sim 6}$  アルキル、 $C_{3\sim 6}$  シクロアルキル、 $-C_{1\sim 6}$  アルキル  $C_{3\sim 6}$  シクロアルキル、 $C_{6\sim 10}$  アリール、5～10員のヘテロアリール、 $C_{1\sim 6}$  アルキル  $C_{6\sim 10}$  アリール、 $C_{1\sim 6}$  アルキル 5～10員ヘテロアリールであり、 $X^1$  は無置換であるか、あるいはハロゲン、直鎖状もしくは分枝鎖状  $C_{1\sim 6}$  アルキル、直鎖状もしくは分枝鎖状  $C_{1\sim 6}$  ヘテロアルキル、 $CF_3$ 、 $CHF_2$ 、 $-O-CHF_2$ 、 $-O-(CH_2)_2-OMe$ 、 $OCF_3$ 、 $C_{1\sim 6}$  アルキルアミノ、 $-CN$ 、 $-N(H)C(O)-C_{1\sim 6}$  アルキル、 $-OC(O)-C_{1\sim 6}$  アルキル、 $-OC(O)-C_{1\sim 4}$  アルキルアミノ、 $-C(O)O-C_{1\sim 6}$  アルキル、 $-COOH$ 、 $-CHO$ 、 $-C_{1\sim 6}$  アルキル  $C(O)OH$ 、 $-C_{1\sim 6}$  アルキル  $C(O)O-C_{1\sim 6}$  アルキル、 $NH_2$ 、 $C_{1\sim 6}$  アルコキシまたは  $C_{1\sim 6}$  アルキルヒドロキシのうちの1つまたは複数により置換されており、

$X^2$  は水素、 $C_{6\sim 10}$  アリール、5～10員のヘテロアリール、 $-O-(5\sim 10$ 員のヘテロアリール)、4～8員のヘテロシクロアルキル、 $C_{1\sim 4}$  アルキル 4～8員ヘテロシクロアルキル、 $-O-(4\sim 8$ 員のヘテロシクロアルキル)、 $-O-C_{1\sim 4}$  アルキル  $-(4\sim 8$ 員のヘテロシクロアルキル)、 $-OC(O)-C_{1\sim 4}$  アルキル  $-4\sim 8$ 員ヘテロシクロアルキルまたは  $C_6$  アリールオキシであり、 $X^2$  は無置換であるか、あるいは直鎖状もしくは分枝鎖状  $C_{1\sim 6}$  アルキル、 $NH_2$ 、 $NMe_2$  または 5～6員のヘテロシクロアルキルのうちの1つまたは複数により置換されており、

$n$  は、0、1または2である、

化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは立体異性体。

## 【請求項 2】

$X^1$  が、直鎖状または分枝鎖状  $C_{1\sim 4}$  アルキル、 $C_{3\sim 6}$  シクロアルキル、 $-C_{1\sim 4}$  アルキル  $C_{3\sim 6}$  シクロアルキル、 $C_6$  アリール、5～10員のヘテロアリール、 $C_{1\sim 6}$  アルキル  $C_6$  アリール、 $C_{1\sim 6}$  アルキル 5～10員ヘテロアリールであり、 $X^1$  が無置換であるか、あるいはハロゲン、直鎖状もしくは分枝鎖状  $C_{1\sim 4}$  アルキル、直鎖状もしくは分枝鎖状  $C_{1\sim 6}$  ヘテロアルキル、 $CF_3$ 、 $CHF_2$ 、 $-O-CHF_2$ 、 $-O-(CH_2)_2-OMe$ 、 $OCF_3$ 、 $C_{1\sim 6}$  アルキルアミノ、 $-CN$ 、 $-N(H)C(O)-C_{1\sim 6}$  アルキル、 $-OC(O)-C_{1\sim 6}$  アルキル、 $-OC(O)-C_{1\sim 4}$  アルキルアミノ、 $-C(O)O-C_{1\sim 6}$  アルキル、 $-COOH$ 、 $-CHO$ 、 $-C_{1\sim 6}$  アルキル  $C(O)OH$ 、 $-C_{1\sim 6}$  アルキル  $C(O)O-C_{1\sim 6}$  アルキル、 $NH_2$ 、 $C_{1\sim 6}$  アルコキシまたは  $C_{1\sim 6}$  アルキルヒドロキシのうちの1つまたは複数により置換されており、

$X^2$  が、水素、 $C_6$  アリール、5～10員のヘテロアリール、 $-O-(5\sim 10$ 員のヘテロアリール)、4～8員のヘテロシクロアルキル、 $C_{1\sim 4}$  アルキル 4～8員ヘテロシクロアルキル、 $-O-(4\sim 8$ 員のヘテロシクロアルキル)、 $-O-C_{1\sim 4}$  アルキル  $-(4\sim 8$ 員のヘテロシクロアルキル)、 $-OC(O)-C_{1\sim 4}$  アルキル  $-4\sim 8$ 員ヘテロシクロアルキルまたは  $C_6$  アリールオキシであり、 $X^2$  が無置換であるか、あるいは直鎖状もしくは分枝鎖状  $C_{1\sim 6}$  アルキル、 $NH_2$ 、 $NMe_2$  または 5～6員のヘテロシクロアルキルのうちの1つまたは複数により置換されており、 $n$  が、0、1または2である、

請求項 1 に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは立体異性体。

n が 1 または 2、好ましくは 1 である、請求項 1 または 2 に記載の化合物。

式ⅠⅠの前記請求項のいずれかに記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは立体異性体

$$\text{Y}^2-\text{Y}^1-\text{M}(\text{R}^a\text{R}^b)_p-\text{NH}-\text{C}(=\text{O})-\text{NH}-(\text{CH}_2)_n-\text{C}_6\text{H}_4-\text{Indole-1-one}-\text{N}-\text{Piperidine-2-one}$$

10

Y<sup>1</sup>は水素、C<sub>6</sub>アリール、5～10員のヘテロアリールC<sub>3</sub>～<sub>6</sub>シクロアルキルであり、Y<sup>1</sup>は無置換であるか、あるいはハロゲン、好ましくはF、ClまたはBr、直鎖状もしくは分枝鎖状C<sub>1</sub>～<sub>4</sub>アルキル、直鎖状もしくは分枝鎖状C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>ヘテロアルキル、CF<sub>3</sub>、CHF<sub>2</sub>、-O-CHF<sub>2</sub>、-O-(CH<sub>2</sub>)<sub>2</sub>-OMe、OCF<sub>3</sub>、-CN、-N(H)C(O)-C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、-OC(O)-C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、-OC(O)-C<sub>1</sub>～<sub>4</sub>ヘテロアルキル、-C(O)O-C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、-COOH、-CHO、-C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルC(O)OH、-C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルC(O)O-C<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキル、NH<sub>2</sub>またはC<sub>1</sub>～<sub>6</sub>アルキルヒドロキシのうちの1つまたは複数により置換されており、ただし、pが0である場合、Y<sup>1</sup>は水素ではないことを条件とし、

20

Y<sup>2</sup>は水素、C<sub>6</sub>アリール、5～10員のヘテロアリール、-O-(5～10員のヘテロアリール)、4～8員のヘテロシクロアルキル、C<sub>1</sub>～4アルキル4～8員ヘテロシクロアルキル、-O-(4～8員のヘテロシクロアルキル)、-O-C<sub>1</sub>～4アルキル-(4～8員のヘテロシクロアルキル)、-OC(O)-C<sub>1</sub>～4アルキル-4～8員ヘテロシクロアルキルまたはC<sub>6</sub>アリールオキシであり、Y<sup>2</sup>は無置換であるか、あるいは直鎖状もしくは分枝鎖状C<sub>1</sub>～6アルキル、NH<sub>2</sub>、NMe<sub>2</sub>または5～6員のヘテロシクロアルキルのうちの1つまたは複数により置換されており、

30

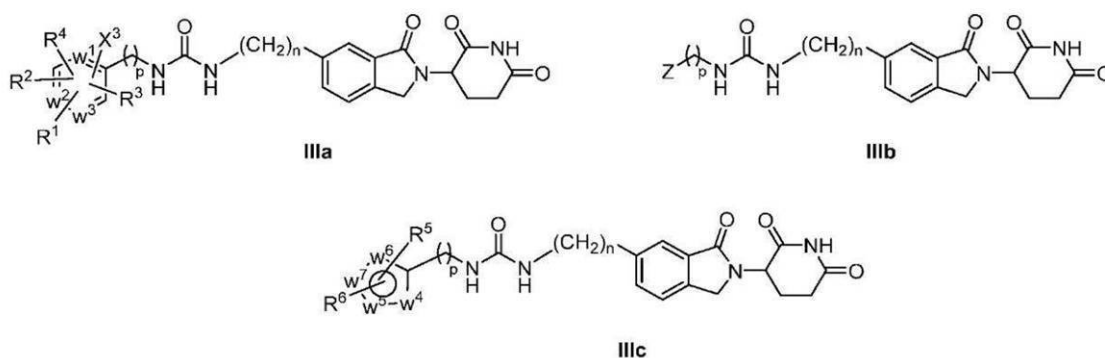
化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは立体異性体。

n が 1 である、請求項 4 に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは立体異性体。

## 40

式 I I I a'、I I I b' または I I I c の前記請求項のいずれかに記載の化合物、または薬学的に許容されるそれらの塩もしくは立体異性体

## 【化 1 3 9】



10

であって、式中、

$n$  は 1 または 2 であり、

$p$  は 0、1 または 2 であり、

$w^1$ 、 $w^2$  または  $w^3$  のうちの 1 つは、C および N から選択され、 $w^1$ 、 $w^2$  または  $w^3$  のうちの他の 2 つは C であり、

$w^4$ 、 $w^5$ 、 $w^6$ 、 $w^7$  のうちの 1 つまたは 2 つは、C、O、N、NMe、NH または S から選択される一方、 $w^4$ 、 $w^5$ 、 $w^6$  および  $w^7$  のうちの 2 つまたは 3 つは、C であり、

20

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  はそれぞれ、水素、直鎖状または分枝鎖状  $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{1-6}$  ヘテロアルキル、 $C_6$  アリール、好ましくはフェニル、 $CF_3$ 、 $CHF_2$ 、 $-O-CHF_2$ 、 $-O-(CH_2)_2-OMe$ 、 $OCF_3$ 、 $-CN$ 、 $-N(H)C(O)-C_{1-6}$  アルキル、 $-OC(O)-C_{1-4}$  アルキルアミノ、 $-OC(O)-C_{1-6}$  アルキル、 $-C(O)O-C_{1-6}$  アルキル、 $-COOH$ 、 $-CHO$ 、 $-C_{1-6}$  アルキル  $C(O)OH$ 、 $-C_{1-6}$  アルキル  $C(O)O-C_{1-6}$  アルキル、 $NH_2$ 、 $C_{1-4}$  アルキルヒドロキシ、ハロゲン、好ましくは F、Cl、Br、より好ましくは F または Cl から独立して選択される、および / または  $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$  のうちの 2 つは一緒になって、5 ~ 6 員のヘテロシクロアルキルもしくは 5 ~ 6 員のヘテロアリールを形成し、

30

$R^5$ 、 $R^6$  はそれぞれ、水素、直鎖状もしくは分枝鎖状  $C_{1-4}$  アルキル、 $CF_3$ 、 $CHF_2$ 、ハロゲン、好ましくは F、Cl、Br、より好ましくは F または Cl から独立して選択され、

$X^3$  は存在しない、水素または 4 ~ 8 員のヘテロシクロアルキル、 $C_{1-4}$  アルキル 4 ~ 8 員ヘテロシクロアルキル、 $-O-(4 \sim 8 \text{ 員のヘテロシクロアルキル})$ 、 $-C_{1-4}$  アルコキシ  $-(4 \sim 8 \text{ 員のヘテロシクロアルキル})$ 、5 ~ 10 員のヘテロアリール、 $-O-(5 \sim 10 \text{ 員のヘテロアリール})$ 、 $-OC(O)-C_{1-4}$  アルキル  $-4 \sim 8 \text{ 員ヘテロシクロアルキル}$  であり、 $X^3$  は無置換であるか、あるいは直鎖状もしくは分枝鎖状  $C_{1-6}$  アルキル、 $NH_2$ 、 $NMe_2$  または 5 ~ 6 員のヘテロシクロアルキルのうちの 1 つまたは複数により置換されており、

40

Z は、直鎖状もしくは分枝鎖状  $C_{1-6}$  アルキル、または  $C_{3-6}$  シクロアルキルまたは  $C_{1-4}$  アルコキシであり、Z は無置換であるか、または  $C_{1-4}$  アルキルにより置換されている、

化合物、または薬学的に許容されるそれらの塩もしくは立体異性体。

## 【請求項 7】

$n$  が 1 である、請求項 6 に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは立体異性体。

## 【請求項 8】

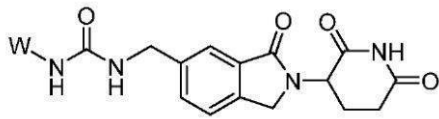
$p$  が 0 または 1 である、請求項 6 もしくは 7 に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは立体異性体。

50

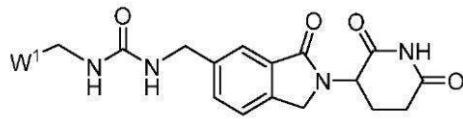
## 【請求項 9】

式 I V、V、V I および V I I の前記請求項のいずれかに記載の化合物、または薬学的に許容されるそれらの塩もしくは立体異性体

## 【化 1 4 0】

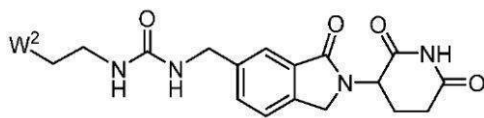


IV

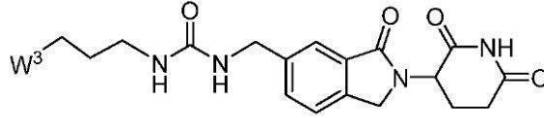


V

10



VI



VII

であって、式中、

W、W<sup>1</sup>、W<sup>2</sup>、W<sup>3</sup>は

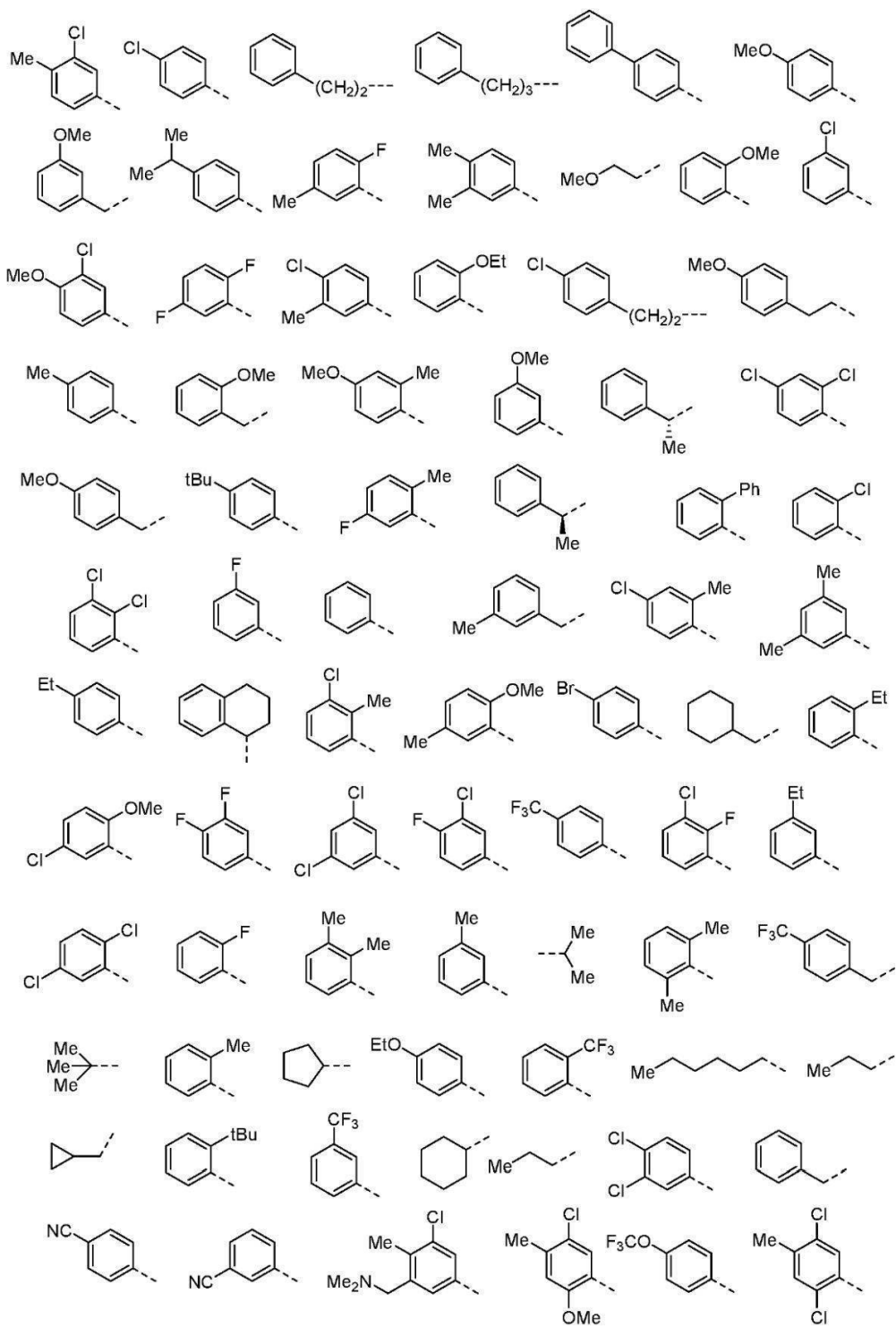
20

30

40

50

50



## 10

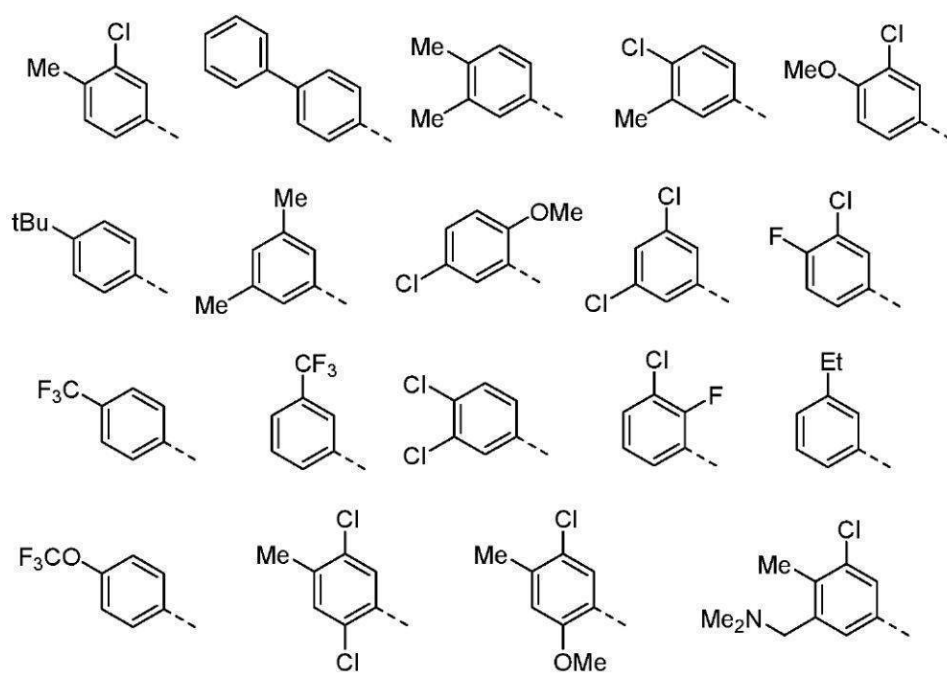


30

## 40

W が、

【化 1 4 3】



10

20

30

40

50

Chemical structures of 20 different ligands for the  $[Cu(OTf)_2]$  catalyst, labeled 1 through 20. The ligands are arranged in five rows of four. They include various substituted benzene rings, biphenyls, and complex polycyclic systems with different functional groups like chlorides, methoxy, dimethylamino, trifluoromethoxy, difluoromethyl, and various ether and amine moieties.

【請求項 16】

がん、特に乳がんの処置に使用するための、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の化合物を含む組成物または請求項 11 ~ 13 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 17】

対象において、セレブロンに結合させるための、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の化合物を含む組成物または請求項 11 もしくは 12 に記載の組成物。

【請求項 18】

がん、特に乳がんを処置するための、請求項 17 に記載の組成物。

【請求項 19】

対象においてがんを処置するための、請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の化合物を含む組成物または請求項 11 もしくは 12 のいずれか一項に記載の組成物。

10

【請求項 20】

請求項 1 ~ 10 のいずれか一項に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは立体異性体が前記セレブロンに結合する、請求項 19 に記載の組成物。

【手続補正 2】

【補正対象書類名】明細書

【補正対象項目名】0025

【補正方法】変更

【補正の内容】

【0025】

第 6 の態様では、本開示は、対象におけるがんを処置する方法であって、対象に、治療有効量の本明細書に記載されている実施形態のいずれかの化合物または組成物を投与するステップを含む、方法を対象とする。

20

一部の実施形態では、本方法は、セレブロンに結合する、本明細書に記載されている実施形態のいずれかによる化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは立体異性体を含む。

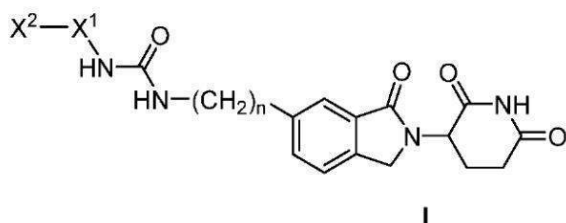
本発明は、例えば、以下の項目を提供する。

(項目 1)

式 I の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは立体異性体

【化 137】

30



であって、式中、

$X^1$  は直鎖状または分枝鎖状  $C_{1-6}$  アルキル、 $C_{3-6}$  シクロアルキル、 $-C_{1-6}$  アルキル  $C_{3-6}$  シクロアルキル、 $C_{6-10}$  アリール、5 ~ 10 員のヘテロアリール、 $C_{1-6}$  アルキル  $C_{6-10}$  アリール、 $C_{1-6}$  アルキル 5 ~ 10 員ヘテロアリールであり、 $X^1$  は無置換であるか、あるいはハロゲン、直鎖状もしくは分枝鎖状  $C_{1-6}$  アルキル、直鎖状もしくは分枝鎖状  $C_{1-6}$  ヘテロアルキル、 $CF_3$ 、 $CHF_2$ 、 $-O-CHF_2$ 、 $-O-(CH_2)_2-OMe$ 、 $OCF_3$ 、 $C_{1-6}$  アルキルアミノ、 $-CN$ 、 $-N(H)C(O)-C_{1-6}$  アルキル、 $-OC(O)-C_{1-6}$  アルキル、 $-OC(O)-C_{1-4}$  アルキルアミノ、 $-C(O)O-C_{1-6}$  アルキル、 $-COOH$ 、 $-CHO$ 、 $-C_{1-6}$  アルキル  $C(O)OH$ 、 $-C_{1-6}$  アルキル  $C(O)O-C_{1-6}$  アルキル、 $NH_2$ 、 $C_{1-6}$  アルコキシまたは  $C_{1-6}$  アルキルヒドロキシのうちの 1 つまたは複数により置換されており、

$X^2$  は水素、 $C_{6-10}$  アリール、5 ~ 10 員のヘテロアリール、 $-O-(5 \sim 10 \text{ 員})$

50

のヘテロアリール)、4～8員のヘテロシクロアルキル、 $C_{1\sim4}$ アルキル4～8員ヘテロシクロアルキル、 $-O-$ (4～8員のヘテロシクロアルキル)、 $-O-C_{1\sim4}$ アルキル-(4～8員のヘテロシクロアルキル)、 $-OC(O)-C_{1\sim4}$ アルキル-4～8員ヘテロシクロアルキルまたは $C_6$ アリールオキシであり、 $X^2$ は無置換であるか、あるいは直鎖状もしくは分枝鎖状 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $NH_2$ 、 $NMe_2$ または5～6員のヘテロシクロアルキルのうちの1つまたは複数により置換されており、

$n$ は、0、1または2である、

化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは立体異性体。

(項目2)

$X^1$ が、直鎖状または分枝鎖状 $C_{1\sim4}$ アルキル、 $C_{3\sim6}$ シクロアルキル、 $-C_{1\sim4}$ アルキル $C_{3\sim6}$ シクロアルキル、 $C_6$ アリール、5～10員のヘテロアリール、 $C_{1\sim6}$ アルキル $C_6$ アリール、 $C_{1\sim6}$ アルキル5～10員ヘテロアリールであり、 $X^1$ が無置換であるか、あるいはハロゲン、直鎖状もしくは分枝鎖状 $C_{1\sim4}$ アルキル、直鎖状もしくは分枝鎖状 $C_{1\sim6}$ ヘテロアルキル、 $CF_3$ 、 $CHF_2$ 、 $-O-CHF_2$ 、 $-O-(CH_2)_2-OMe$ 、 $OCF_3$ 、 $C_{1\sim6}$ アルキルアミノ、 $-CN$ 、 $-N(H)C(O)-C_{1\sim6}$ アルキル、 $-OC(O)-C_{1\sim6}$ アルキル、 $-OC(O)-C_{1\sim4}$ アルキルアミノ、 $-C(O)O-C_{1\sim6}$ アルキル、 $-COOH$ 、 $-CHO$ 、 $-C_{1\sim6}$ アルキル $C(O)OH$ 、 $-C_{1\sim6}$ アルキル $C(O)O-C_{1\sim6}$ アルキル、 $NH_2$ 、 $C_{1\sim6}$ アルコキシまたは $C_{1\sim6}$ アルキルヒドロキシのうちの1つまたは複数により置換されており、

$X^2$ が、水素、 $C_6$ アリール、5～10員のヘテロアリール、 $-O-(5\sim10$ 員のヘテロアリール)、4～8員のヘテロシクロアルキル、 $C_{1\sim4}$ アルキル4～8員ヘテロシクロアルキル、 $-O-(4\sim8$ 員のヘテロシクロアルキル)、 $-O-C_{1\sim4}$ アルキル-(4～8員のヘテロシクロアルキル)、 $-OC(O)-C_{1\sim4}$ アルキル-4～8員ヘテロシクロアルキルまたは $C_6$ アリールオキシであり、 $X^2$ が無置換であるか、あるいは直鎖状もしくは分枝鎖状 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $NH_2$ 、 $NMe_2$ または5～6員のヘテロシクロアルキルのうちの1つまたは複数により置換されており、 $n$ が、0、1または2である

項目1に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは立体異性体。

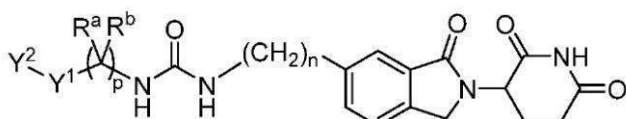
(項目3)

$n$ が1または2、好ましくは1である、項目1または2に記載の化合物。

(項目4)

式IIの前記項目のいずれかに記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは立体異性体

【化138】



II

であって、式中、

$n$ は1または2であり、

$p$ は0、1、2、3、4、5、6であり、

$Y^1$ は水素、 $C_6$ アリール、5～10員のヘテロアリール $C_{3\sim6}$ シクロアルキルであり、 $Y^1$ は無置換であるか、あるいはハロゲン、好ましくはF、ClまたはBr、直鎖状もしくは分枝鎖状 $C_{1\sim4}$ アルキル、直鎖状もしくは分枝鎖状 $C_{1\sim6}$ ヘテロアルキル、 $CF_3$ 、 $CHF_2$ 、 $-O-CHF_2$ 、 $-O-(CH_2)_2-OMe$ 、 $OCF_3$ 、 $-CN$ 、 $-N(H)C(O)-C_{1\sim6}$ アルキル、 $-OC(O)-C_{1\sim6}$ アルキル、 $-OC(O)-$

) -  $C_{1 \sim 4}$ ヘテロアルキル、-  $C(O)O - C_{1 \sim 6}$ アルキル、-  $COOH$ 、-  $CHO$ 、  
 -  $C_{1 \sim 6}$ アルキル $C(O)OH$ 、-  $C_{1 \sim 6}$ アルキル $C(O)O - C_{1 \sim 6}$ アルキル、  
 $NH_2$ または $C_{1 \sim 6}$ アルキルヒドロキシのうちの1つまたは複数により置換されており、  
 ただし、 $p$ が0である場合、 $Y^1$ は水素ではないことを条件とし、

$Y^2$ は水素、 $C_6$ アリール、5～10員のヘテロアリール、-  $O - (5 \sim 10$ 員のヘテ  
 ロアリール)、4～8員のヘテロシクロアルキル、 $C_{1 \sim 4}$ アルキル4～8員ヘテロシク  
 ロアルキル、-  $O - (4 \sim 8$ 員のヘテロシクロアルキル)、-  $O - C_{1 \sim 4}$ アルキル - (  
 4～8員のヘテロシクロアルキル)、-  $OC(O) - C_{1 \sim 4}$ アルキル - 4～8員ヘテロ  
 シクロアルキルまたは $C_6$ アリールオキシであり、 $Y^2$ は無置換であるか、あるいは直鎖  
 状もしくは分枝鎖状 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $NH_2$ 、 $NMe_2$ または5～6員のヘテロシクロ  
 アルキルのうちの1つまたは複数により置換されており、

10

$R^a$ 、 $R^b$ はそれぞれ、水素および直鎖状または分枝鎖状 $C_{1 \sim 4}$ アルキル、好ましくは  
 水素およびメチルから独立して選択される、

化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは立体異性体。

(項目5)

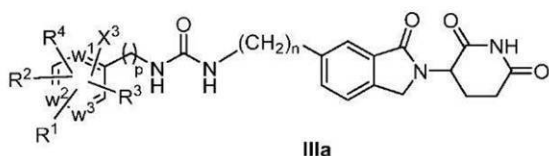
$n$ が1である、項目4に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは立体  
 異性体。

(項目6)

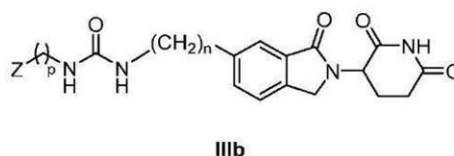
式IIIa'、IIIb'またはIIIcの前記項目のいずれかに記載の化合物、または  
 薬学的に許容されるそれらの塩もしくは立体異性体

20

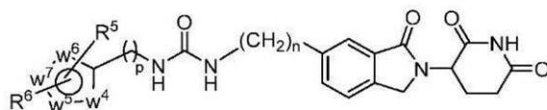
【化139】



IIIa



IIIb



IIIc

30

であって、式中、

$n$ は1または2であり、

$p$ は0、1または2であり、

$w^1$ 、 $w^2$ または $w^3$ のうちの1つは、 $C$ および $N$ から選択され、 $w^1$ 、 $w^2$ または $w^3$   
 のうちの他の2つは $C$ であり、

$w^4$ 、 $w^5$ 、 $w^6$ 、 $w^7$ のうちの1つまたは2つは、 $C$ 、 $O$ 、 $N$ 、 $NMe$ 、 $NH$ または  
 $S$ から選択される一方、 $w^4$ 、 $w^5$ 、 $w^6$ および $w^7$ のうちの2つまたは3つは、 $C$ であ  
 り、

40

$R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ はそれぞれ、水素、直鎖状または分枝鎖状 $C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $C_{1 \sim 6}$   
 ヘテロアルキル、 $C_6$ アリール、好ましくはフェニル、 $CF_3$ 、 $CHF_2$ 、-  $O -$   
 $CHF_2$  -  $O - (CH_2)_2 - OMe$ 、 $OCF_3$ 、-  $CN$ 、-  $N(H)C(O) - C_{1 \sim 6}$   
 アルキル、-  $OC(O) - C_{1 \sim 4}$ アルキルアミノ、-  $OC(O) - C_{1 \sim 6}$ アルキル、  
 -  $C(O)O - C_{1 \sim 6}$ アルキル、-  $COOH$ 、-  $CHO$ 、-  $C_{1 \sim 6}$ アルキル $C(O)$   
 $OH$ 、-  $C_{1 \sim 6}$ アルキル $C(O)O - C_{1 \sim 6}$ アルキル、 $NH_2$ 、 $C_{1 \sim 4}$ アルキルヒド  
 ロキシ、ハロゲン、好ましくは $F$ 、 $Cl$ 、 $Br$ 、より好ましくは $F$ または $Cl$ から独立し  
 て選択される、および/または $R^1$ 、 $R^2$ 、 $R^3$ 、 $R^4$ のうちの2つは一緒になって、5  
 ～6員のヘテロシクロアルキルもしくは5～6員のヘテロアリールを形成し、

50

$R^5$ 、 $R^6$ はそれぞれ、水素、直鎖状もしくは分枝鎖状 $C_{1\sim4}$ アルキル、 $CF_3$ 、 $CHF_2$ 、ハロゲン、好ましくはF、Cl、Br、より好ましくはFまたはClから独立して選択され、

$X^3$ は存在しない、水素または4～8員のヘテロシクロアルキル、 $C_{1\sim4}$ アルキル4～8員ヘテロシクロアルキル、 $-O-$ (4～8員のヘテロシクロアルキル)、 $-C_{1\sim4}$ アルコキシ-(4～8員のヘテロシクロアルキル)、5～10員のヘテロアリール、 $-O-$ (5～10員のヘテロアリール)、 $-OC(O)-C_{1\sim4}$ アルキル-4～8員ヘテロシクロアルキルであり、 $X^3$ は無置換であるか、あるいは直鎖状もしくは分枝鎖状 $C_{1\sim6}$ アルキル、 $NH_2$ 、 $NMe_2$ または5～6員のヘテロシクロアルキルのうちの1つまたは複数により置換されており、

10

Zは、直鎖状もしくは分枝鎖状 $C_{1\sim6}$ アルキル、または $C_{3\sim6}$ シクロアルキルまたは $C_{1\sim4}$ アルコキシであり、Zは無置換であるか、または $C_{1\sim4}$ アルキルにより置換されている、

化合物、または薬学的に許容されるそれらの塩もしくは立体異性体。

(項目7)

nが1である、項目6に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは立体異性体。

(項目8)

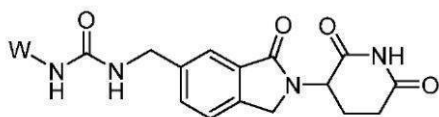
pが0または1である、項目6もしくは7に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは立体異性体。

20

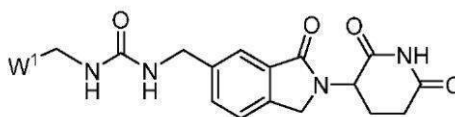
(項目9)

式IV、V、VIおよびVIIの前記項目のいずれかに記載の化合物、または薬学的に許容されるそれらの塩もしくは立体異性体

【化140】

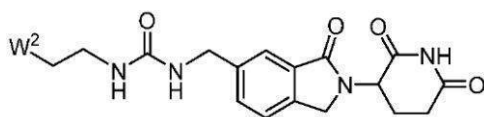


IV

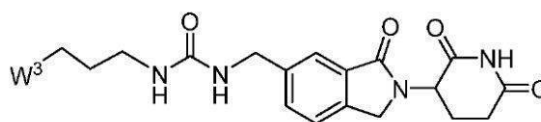


V

30



VI



VII

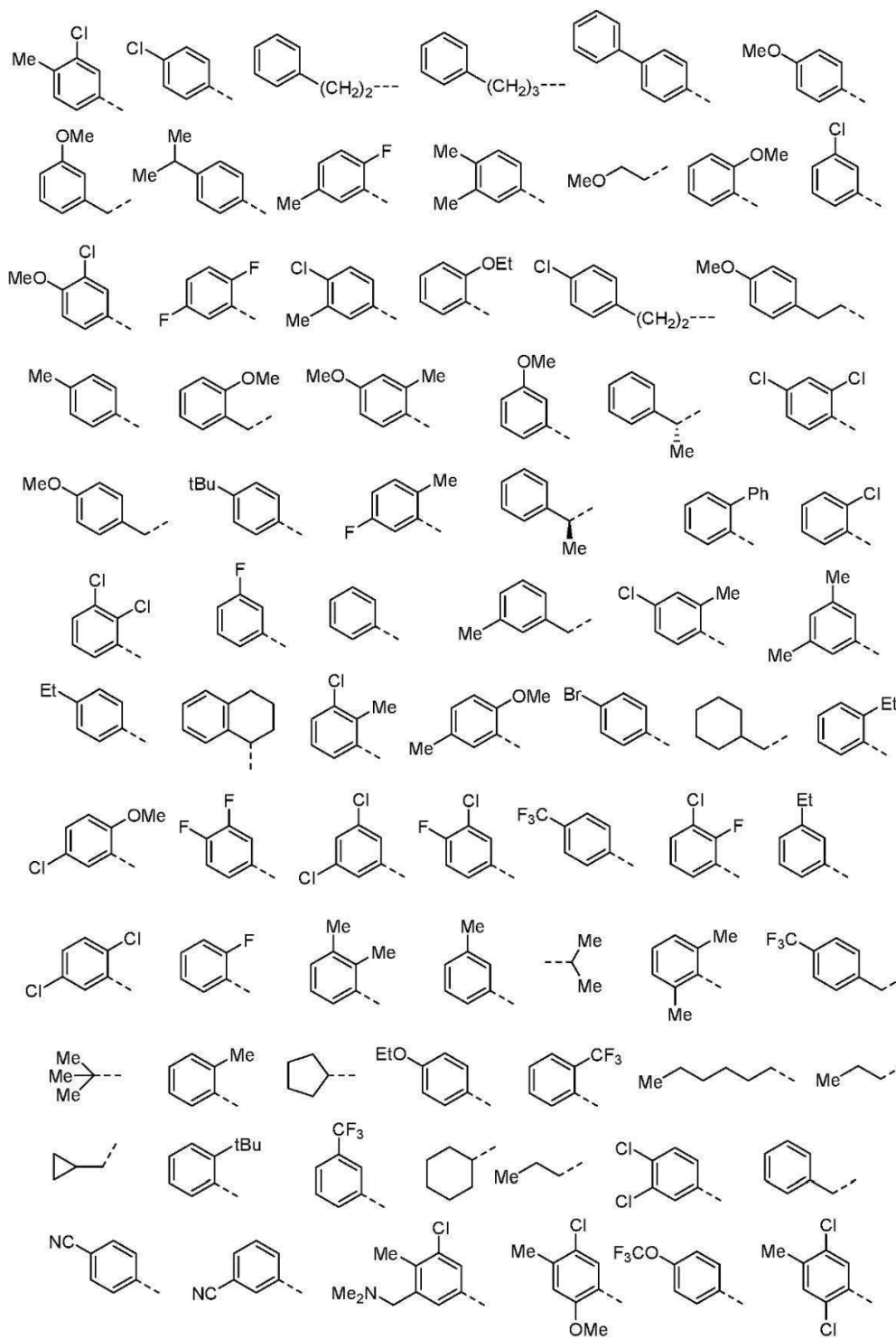
であって、式中、

40

$W$ 、 $W^1$ 、 $W^2$ 、 $W^3$ は

50

【化 1 4 1】



10

20

30

40

50

## 10



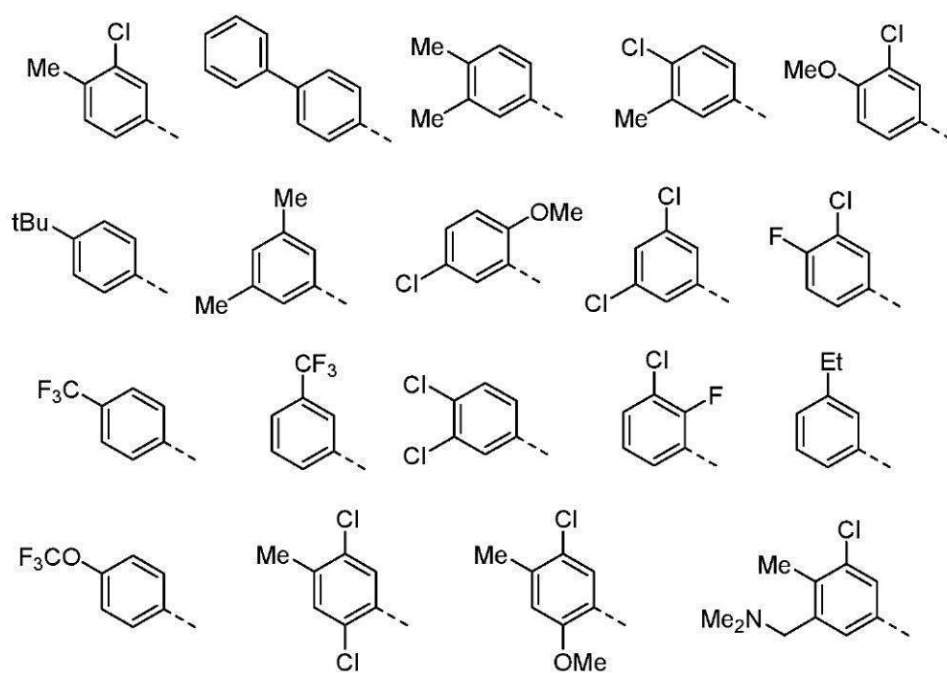
30

40

W が、

W が、

【化 1 4 3】



10

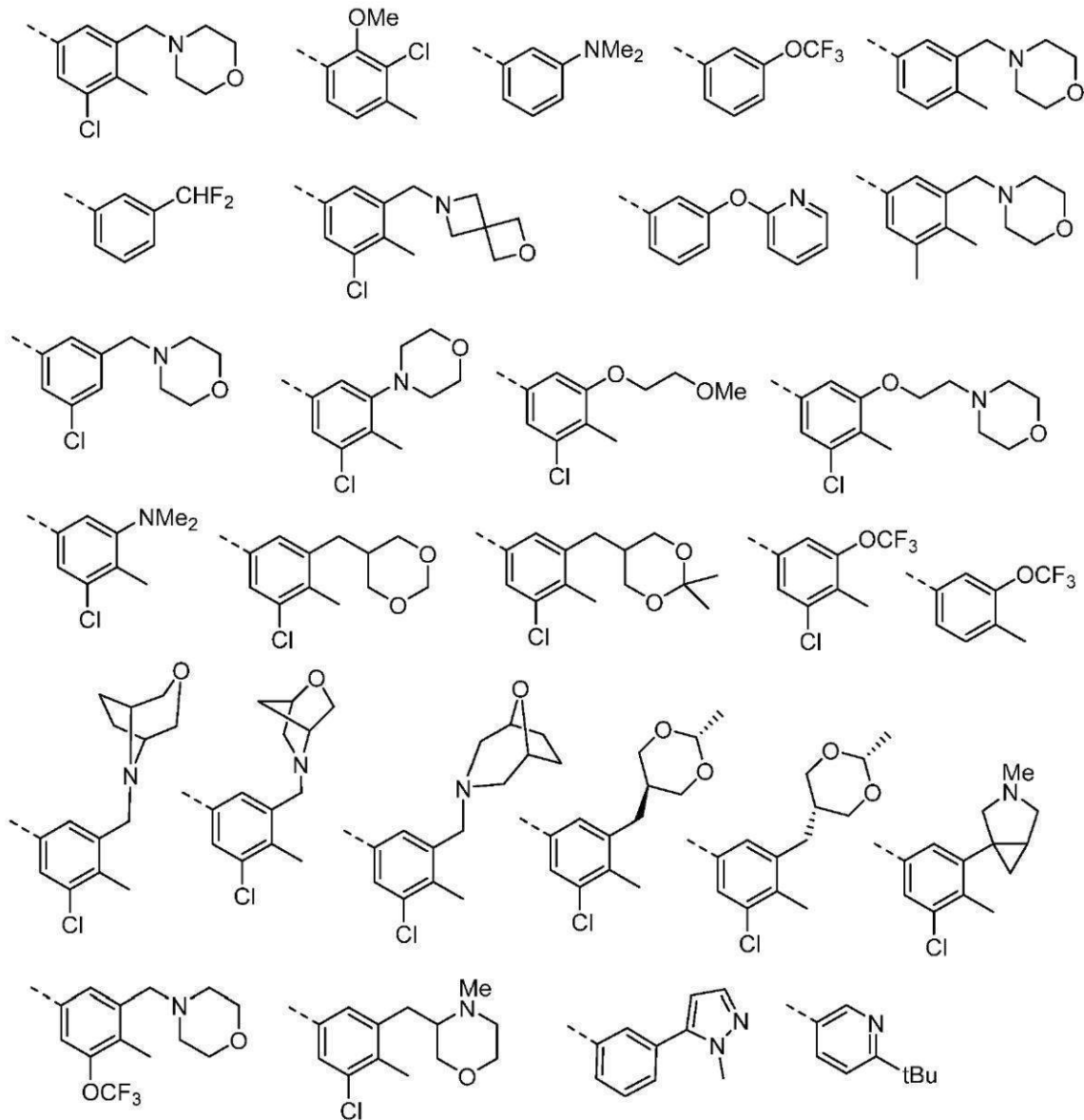
20

30

40

50

## 【化 1 4 4】



10

20

30

である、項目 9 に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは立体異性体。

(項目 1 1)

項目 1 ~ 1 0 のいずれか一項に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは立体異性体を含む、組成物。

(項目 1 2)

薬学的に許容される担体をさらに含む、項目 1 1 に記載の組成物。

40

(項目 1 3)

第 2 の治療活性剤をさらに含む、項目 1 1 または 1 2 に記載の組成物。

(項目 1 4)

治療に使用するための、項目 1 ~ 1 0 に記載の化合物または項目 1 1 ~ 1 3 のいずれか一項に記載の組成物。

(項目 1 5)

G S P T 1 に関連する疾患の処置に使用するための、項目 1 ~ 1 0 に記載の化合物または項目 1 1 ~ 1 3 のいずれか一項に記載の組成物。

(項目 1 6)

がん、特に乳がんの処置に使用するための、項目 1 ~ 1 0 に記載の化合物または項目 1

50

1 ～ 1 3 のいずれか一項に記載の組成物。

(項目 1 7 )

対象に治療有効量の前記組成物を投与するステップを含む、セレブロンに結合させるための、項目 1 ～ 1 0 に記載の化合物または項目 1 1 もしくは 1 2 に記載の組成物の使用。

(項目 1 8 )

がん、特に乳がんを処置するための、項目 1 7 に記載の使用。

(項目 1 9 )

対象においてがんを処置する方法であって、対象に、治療有効量の項目 1 ～ 1 0 に記載の化合物または項目 1 1 もしくは 1 2 のいずれか一項に記載の組成物を投与するステップを含む、方法。

10

(項目 2 0 )

項目 1 ～ 1 0 のいずれか一項に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは立体異性体が前記セレブロンに結合する、項目 1 9 に記載の方法。

20

30

40

50