

【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】

C 07 D 401/04(2006.01)

A 61 K 45/00(2006.01)

A 61 P 43/00(2006.01)

A 61 P 35/00(2006.01)

A 61 K 31/454(2006.01)

A 61 K 31/5377(2006.01)

C 07 D 401/14(2006.01)

C 07 D 409/14(2006.01)

C 07 D 417/14(2006.01)

C 07 D 413/14(2006.01)

C 07 D 491/107(2006.01)

A 61 K 31/497(2006.01)

C 07 D 407/14(2006.01)

10

20

30

40

50

【F I】

C 07 D 401/04 C S P

A 61 K 45/00

A 61 P 43/00 1 2 1

A 61 P 43/00 1 1 1

A 61 P 35/00

A 61 K 31/454

A 61 K 31/5377

C 07 D 401/14

C 07 D 409/14

C 07 D 417/14

C 07 D 413/14

C 07 D 491/107

A 61 K 31/497

C 07 D 407/14

【手続補正書】

【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

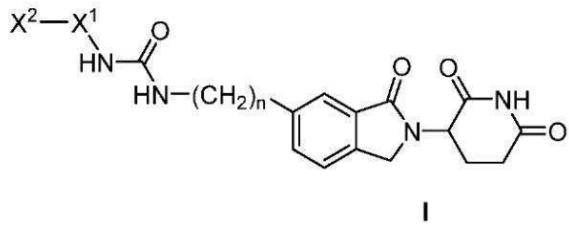
【補正の内容】

【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

【化137】



であって、式中、

10

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、 C_{HF_2} 、 $-O-C_{HF_2}$ 、 $-O-(CH_2)_2-O-Me$ 、 $O-CF_3$ 、 $C_{1 \sim 6}$ 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、

20

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 ~ 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、 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、

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。

【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、 C_{HF_2} 、 $-O-C_{HF_2}$ 、 $-O-(CH_2)_2-O-Me$ 、 $O-CF_3$ 、 $C_{1 \sim 6}$ 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、

40

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 ~ 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、 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。

50

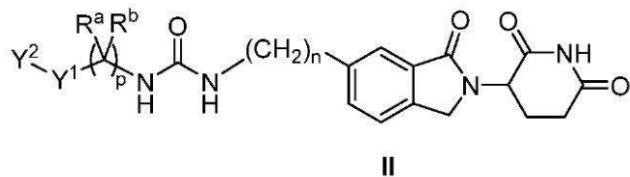
【請求項3】

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。

【請求項4】

式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の塩もしくは立体異性体

【化138】



10

20

30

40

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、

Y¹は水素、C₆アリール、5～10員のヘテロアリールC₃～6シクロアルキルであり、Y¹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C₁～4アルキル、直鎖状もしくは分枝鎖状C₁～6ヘテロアルキル、CF₃、CHF₂、-O-CHF₂、-O-(CH₂)₂-OMe、OCF₃、-CN、-N(H)C(O)-C₁～6アルキル、-OC(O)-C₁～6アルキル、-OC(O)-C₁～4ヘテロアルキル、-C(O)O-C₁～6アルキル、-COOH、-CHO、-C₁～6アルキルC(O)OH、-C₁～6アルキルC(O)O-C₁～6アルキル、NH₂またはC₁～6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、Y¹は水素ではないことを条件とし、

Y²は水素、C₆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、C₁～4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-C₁～4アルキル-(4～8員のヘテロシクロアルキル)、-OC(O)-C₁～4アルキル-4～8員ヘテロシクロアルキルまたはC₆アリールオキシであり、Y²は無置換であるか、あるいは直鎖状もしくは分枝鎖状C₁～6アルキル、NH₂、NMe₂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、

R^a、R^bはそれぞれ、水素および直鎖状または分枝鎖状C₁～4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。

【請求項5】

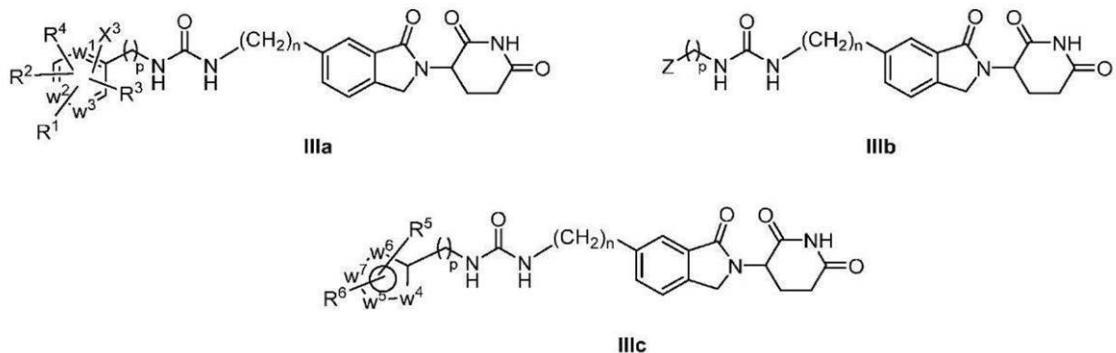
nが1である、請求項4に記載の化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは立体異性体。

【請求項6】

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

50

【化 1 3 9】



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、

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、C₆ アリール、好ましくはフェニル、CF₃、CHF₂、-O-CHF₂-O-(CH₂)₂-OMe、OCF₃、-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、NH₂、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、

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、CF₃、CHF₂、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-(4~8 員のヘテロシクロアルキル)、-C_{1~4} 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_{1~4} 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_{1~6} アルキル、NH₂、NMe₂ 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、

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こ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。

10

20

30

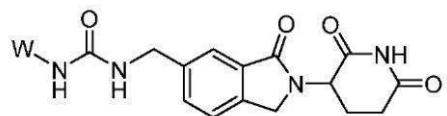
40

50

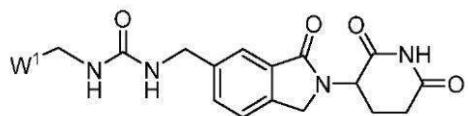
【請求項 9】

式 I V、V、VIおよびVII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】

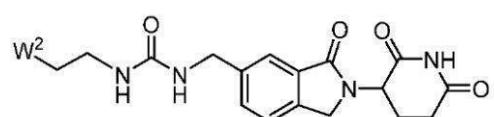


IV

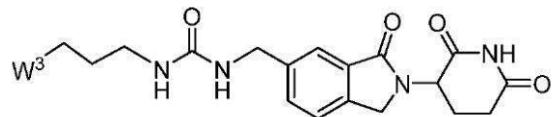


V

10



VI



VII

であって、式中、

W、W¹、W²、W³は

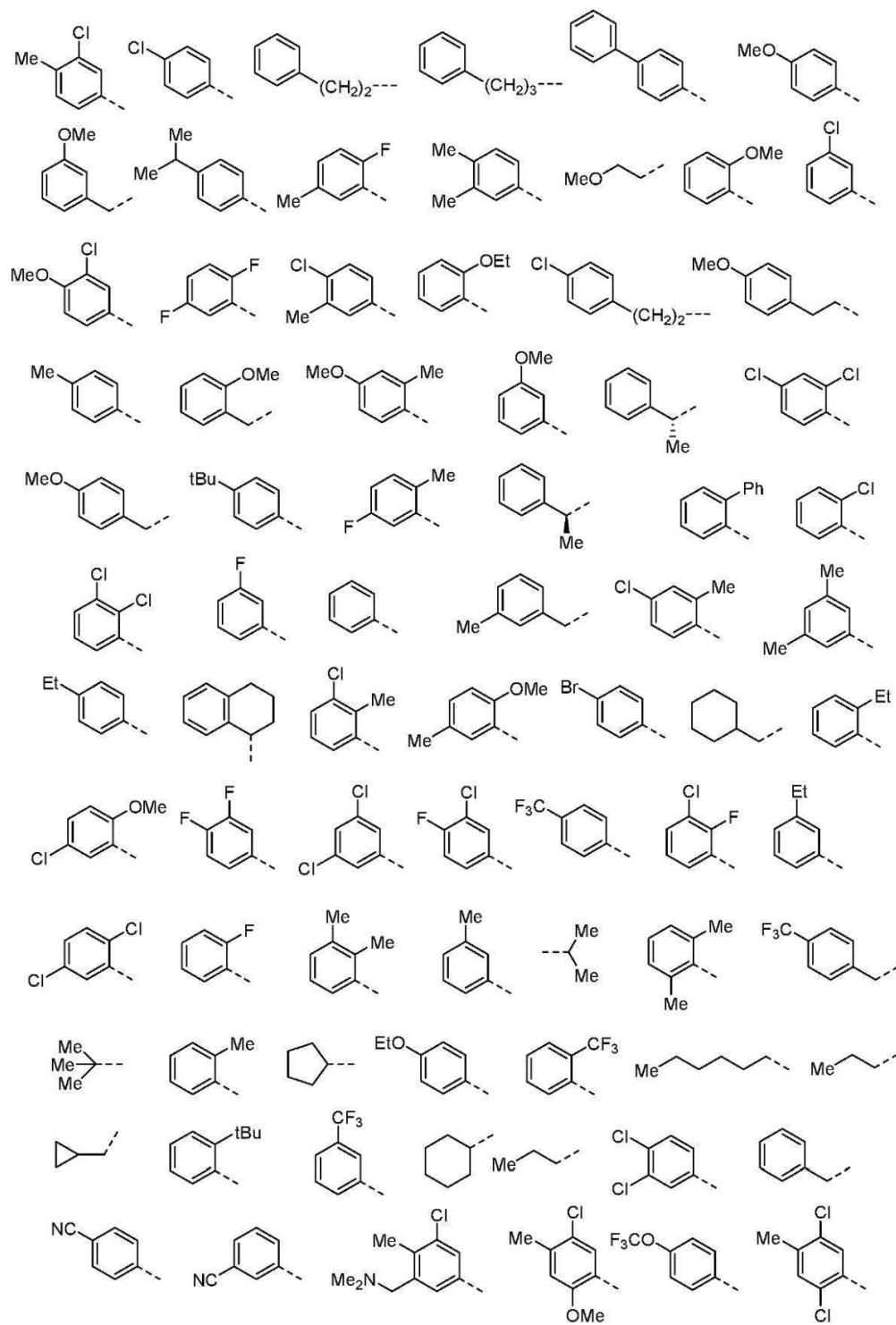
20

30

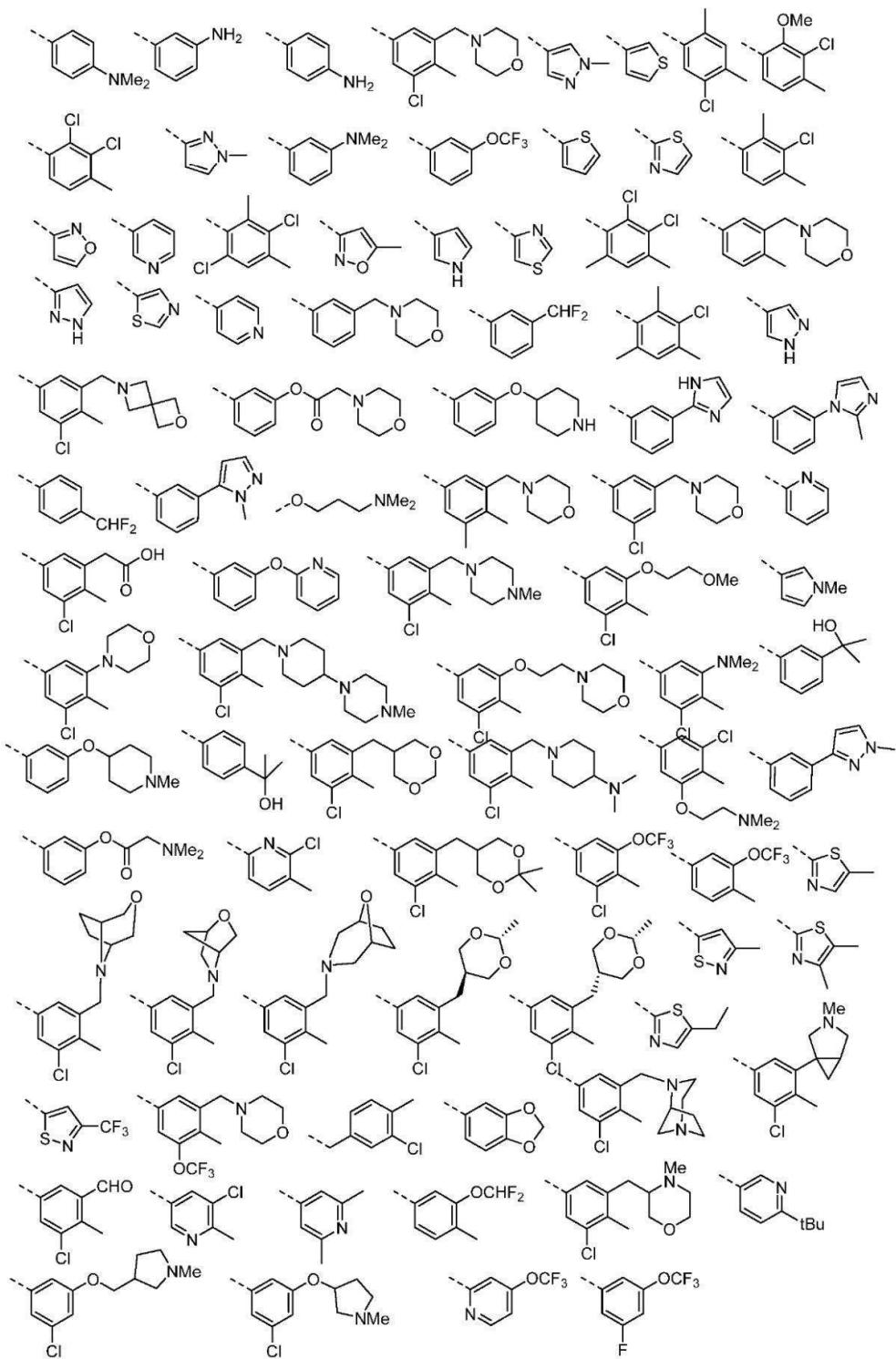
40

50

【化 1 4 1】



【化 1 4 2】



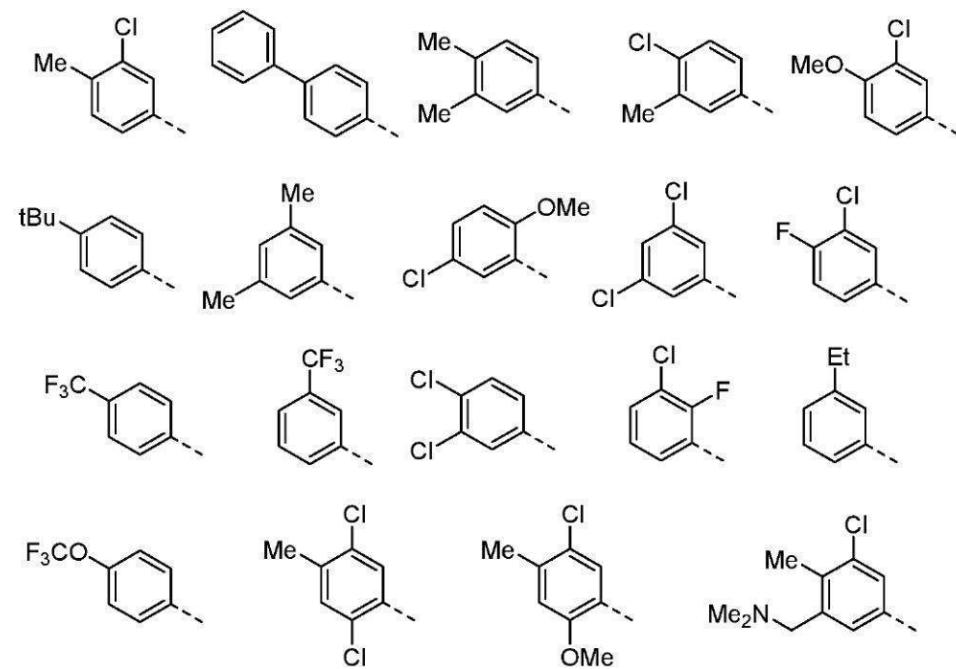
から独立して選択される、

化合物、または薬学的に許容されるそれらの塩もしくは立体異性体。

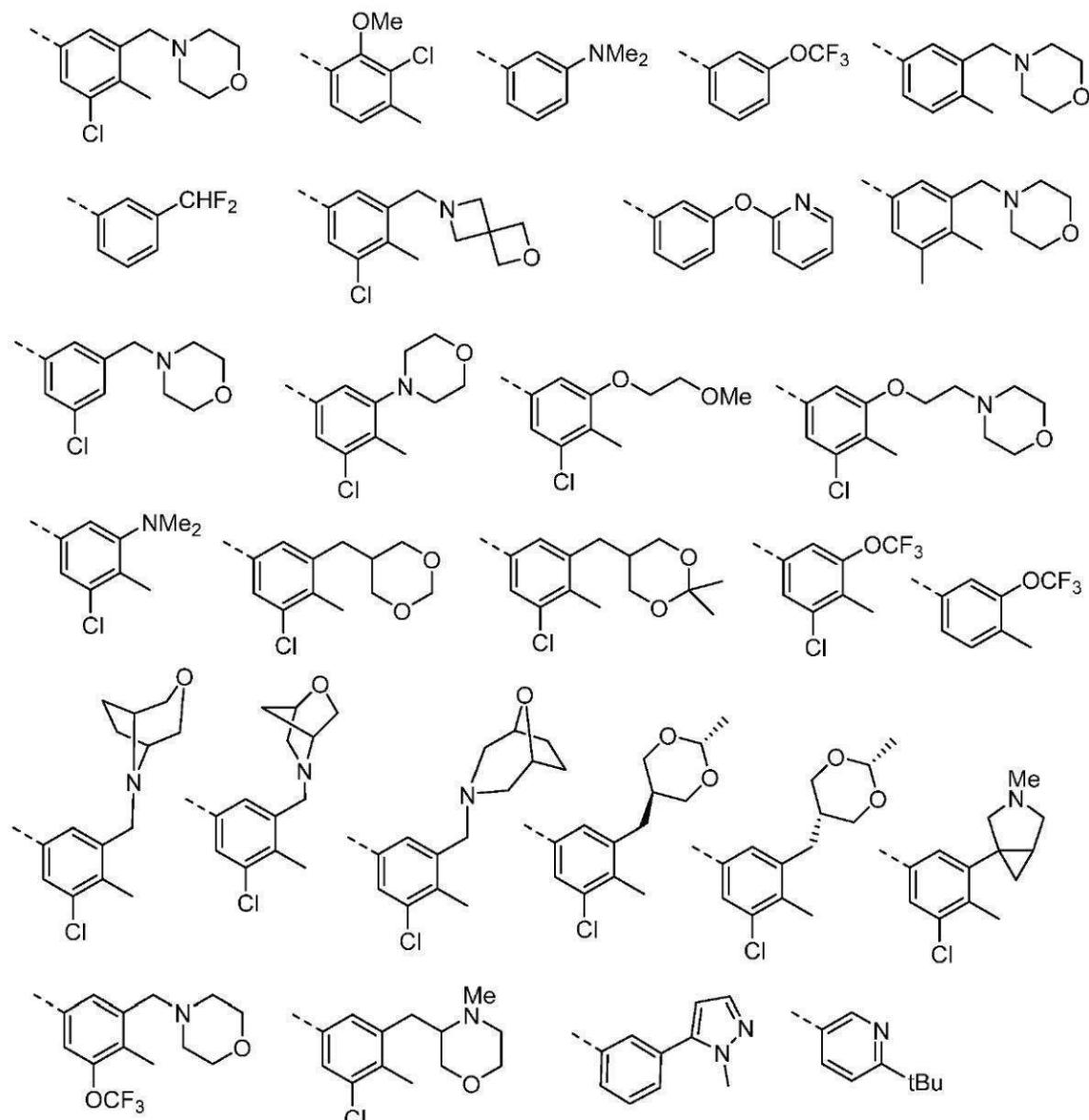
【請求項 10】

W が、

【化 1 4 3】



【化 1 4 4】



である、請求項 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。

【請求項 1 1】

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を含む、組成物。

【請求項 1 2】

薬学的に許容される担体をさらに含む、請求項 1 1 に記載の組成物。

【請求項 1 3】

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

【請求項 1 4】

治療に使用するための、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 1 1 ~ 1 3 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 1 5】

G S P T 1 に関する疾患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 1 1 ~ 1 3 のいずれか一項に記載の組成物。

【請求項 1 6】

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。

【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】 0 0 2 5

【補正方法】変更

【補正の内容】

[0 0 2 5]

第6の様式では、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。

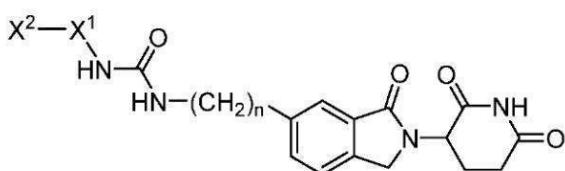
一部の実施形態では、本方法は、セレブロンに結合する、本明細書に記載されている実施形態のいずれかによる化合物、または薬学的に許容されるその塩もしくは立体異性体を含む。

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 1 3 7】



であつて、式由

X¹は直鎖状または分枝鎖状C₁~6アルキル、C₃~6シクロアルキル、-C₁~6アルキルC₃~6シクロアルキル、C₆~10アリール、5~10員のヘテロアリール、C₁~

～6 アルキル C₆～10 アリール、C₁～6 アルキル 5～10 員ヘテロアリールであり、X₁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 C₁～6 アルキル、直

鎖状もしくは分枝鎖状 C₁ ~ 6 ヘテロアルキル、C₁F₃、C₁H₂F₂、-O-C₁H₂F₂-、-O-(C₁H₂)₂-OMe、OC₁F₃、C₁ ~ 6 アルキルアミノ、-CN、-N(H)C(=O)、-S-C(=O)-カルボキル、-C(=O)S-C(=O)-カルボキル、-C(=O)S-C(=O)-S-C(=O)-

(O) - C_{1~6}アルキル、-OC(O)-C_{1~6}アルキル、-OC(O)-C_{1~4}ヨルキルアミノ、-C(O)O-C_{1~6}アルキル、-COOH、-CHO、-C_{1~6}アリキル-S(=O)CH₃、-S(=O)CH₂-アリキル-S(=O)CH₃、-S(=O)CH₂-アリキル-NH₂、-S(=O)CH₂-アリキル-NH-アリキル-S(=O)CH₃

ルキル C (0) OH、-C_{1~6}アルキル C (0) O-C_{1~6}アルキル、NH₂、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。

× 2は参考 Caco-1のアリール比 5~1.0量のヒトロアリール Caco-6 5~1.0量

のヘテロアリール)、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-(4~8員のヘテロシクロアルキル)、-O-C_{1~4}アルキル-(4~8員のヘテロシクロアルキル)、-OC(O)-C_{1~4}アルキル-4~8員ヘテロシクロアルキルまたはC₆アリールオキシであり、X²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、NH₂、NMe₂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)

X¹が、直鎖状または分枝鎖状C_{1~4}アルキル、C_{3~6}シクロアルキル、-C_{1~4}アルキルC_{3~6}シクロアルキル、C₆アリール、5~10員のヘテロアリール、C_{1~6}アルキルC₆アリール、C_{1~6}アルキル5~10員ヘテロアリールであり、X¹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_{1~4}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、CF₃、CHF₂、-O-CHF₂、-O-(CH₂)₂-OMe、OCF₃、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、NH₂、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、X²が、水素、C₆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_{1~4}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_{1~4}アルキル-(4~8員のヘテロシクロアルキル)、-OC(O)-C_{1~4}アルキル-4~8員ヘテロシクロアルキルまたはC₆アリールオキシであり、X²が無置換であるか、あるいは直鎖状もしくは分枝鎖状C_{1~6}アルキル、NH₂、NMe₂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。

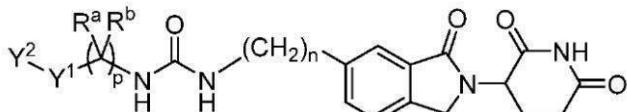
(項目3)

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

40

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、

Y¹は水素、C₆アリール、5~10員のヘテロアリールC_{3~6}シクロアルキルであり、Y¹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_{1~4}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、CF₃、CHF₂、-O-CHF₂、-O-(CH₂)₂-OMe、OCF₃、-CN、-N(H)C(O)-C_{1~6}アルキル、-OC(O)-C_{1~4}アルキル、-OC(O)-C_{1~6}アルキル、-O-C(O)-

50

) - C_{1~4}ヘテロアルキル、- 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、
 NH₂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
 ただし、pが0である場合、Y¹は水素ではないことを条件とし、

Y²は水素、C₆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_{1~4}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_{1~4}アルキル - (4~8員のヘテロシクロアルキル)、- OC(O) - C_{1~4}アルキル - 4~8員ヘテロ
 シクロアルキルまたはC₆アリールオキシであり、Y²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、NH₂、NMe₂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、

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_{1~4}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

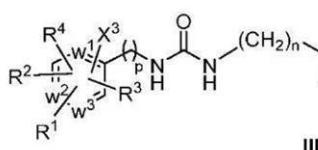
10

20

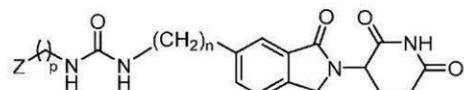
30

40

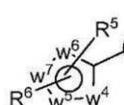
50



IIIa



IIIb



IIIc

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、

w¹、w²またはw³のうちの1つは、CおよびNから選択され、w¹、w²またはw³
 のうちの他の2つはCであり、

w⁴、w⁵、w⁶、w⁷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、w⁴、w⁵、w⁶およびw⁷のうちの2つまたは3つは、Cであ
 り、

R¹、R²、R³、R⁴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、C₆アリール、好ましくはフェニル、CF₃、CHF₂、- O -
 CHF₂ - O - (CH₂)₂ - OMe、OCF₃、- 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、NH₂、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R¹、R²、R³、R⁴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、

R₅、R₆はそれぞれ、水素、直鎖状もしくは分枝鎖状C₁～4アルキル、C₂F₃、C₂H₂、ハロゲン、好ましくはF、C₁、Br、より好ましくはFまたはC₁から独立して選択され、

X₃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、C₁～4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)、-C₁～4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)-C₁～4アルキル-4～8員ヘテロシクロアルキルであり、X₃は無置換であるか、あるいは直鎖状もしくは分枝鎖状C₁～6アルキル、NH₂、NMe₂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C₁～6アルキル、またはC₃～6シクロアルキルまたはC₁～4アルコキシであり、Zは無置換であるか、またはC₁～4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。

(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。

20

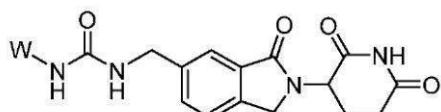
(項目8)

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。

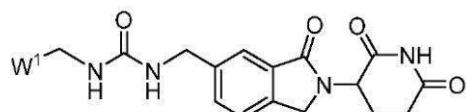
(項目9)

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】

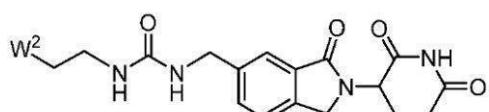


IV

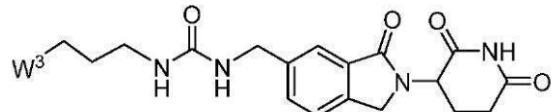


V

30



VI



VII

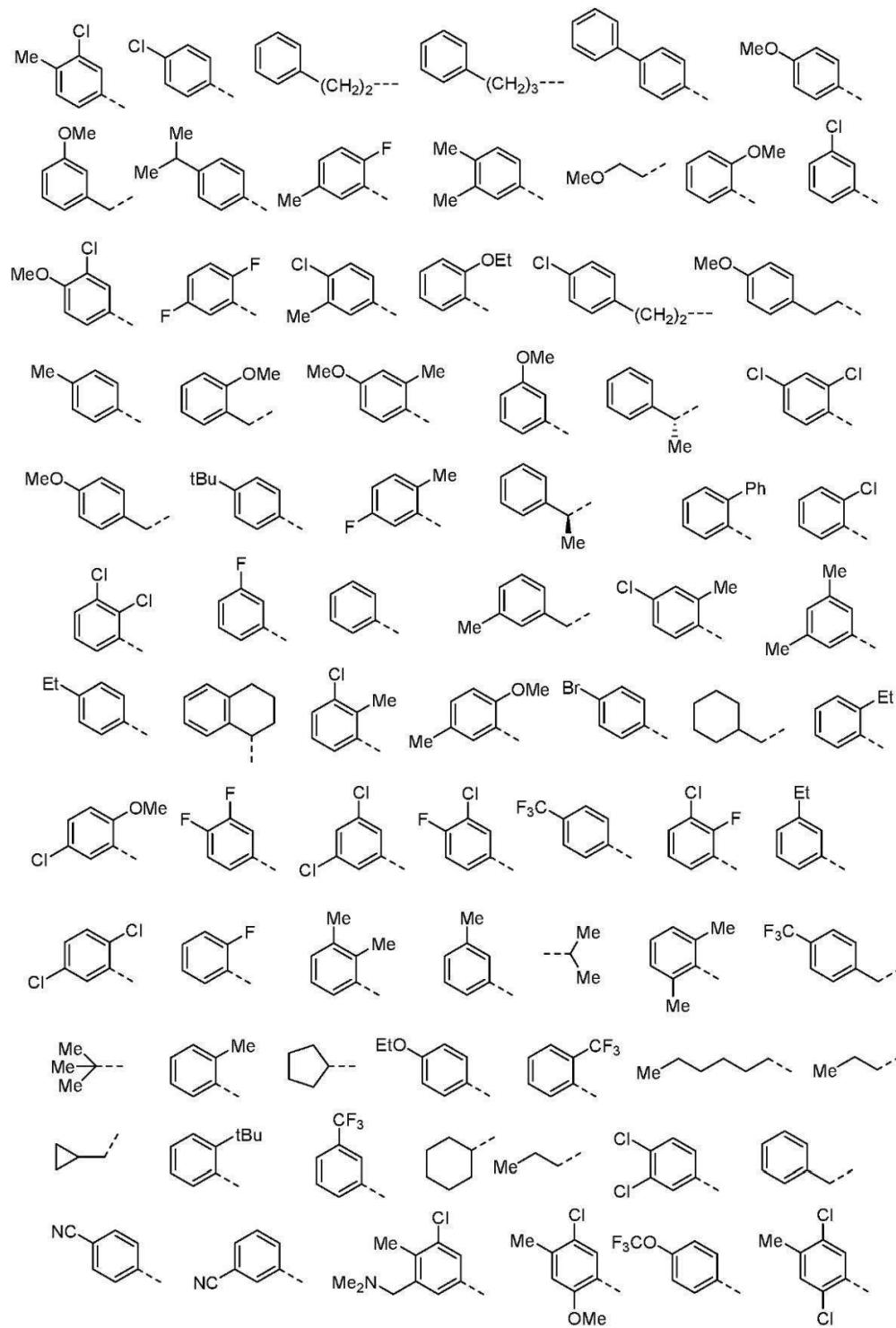
40

であって、式中、

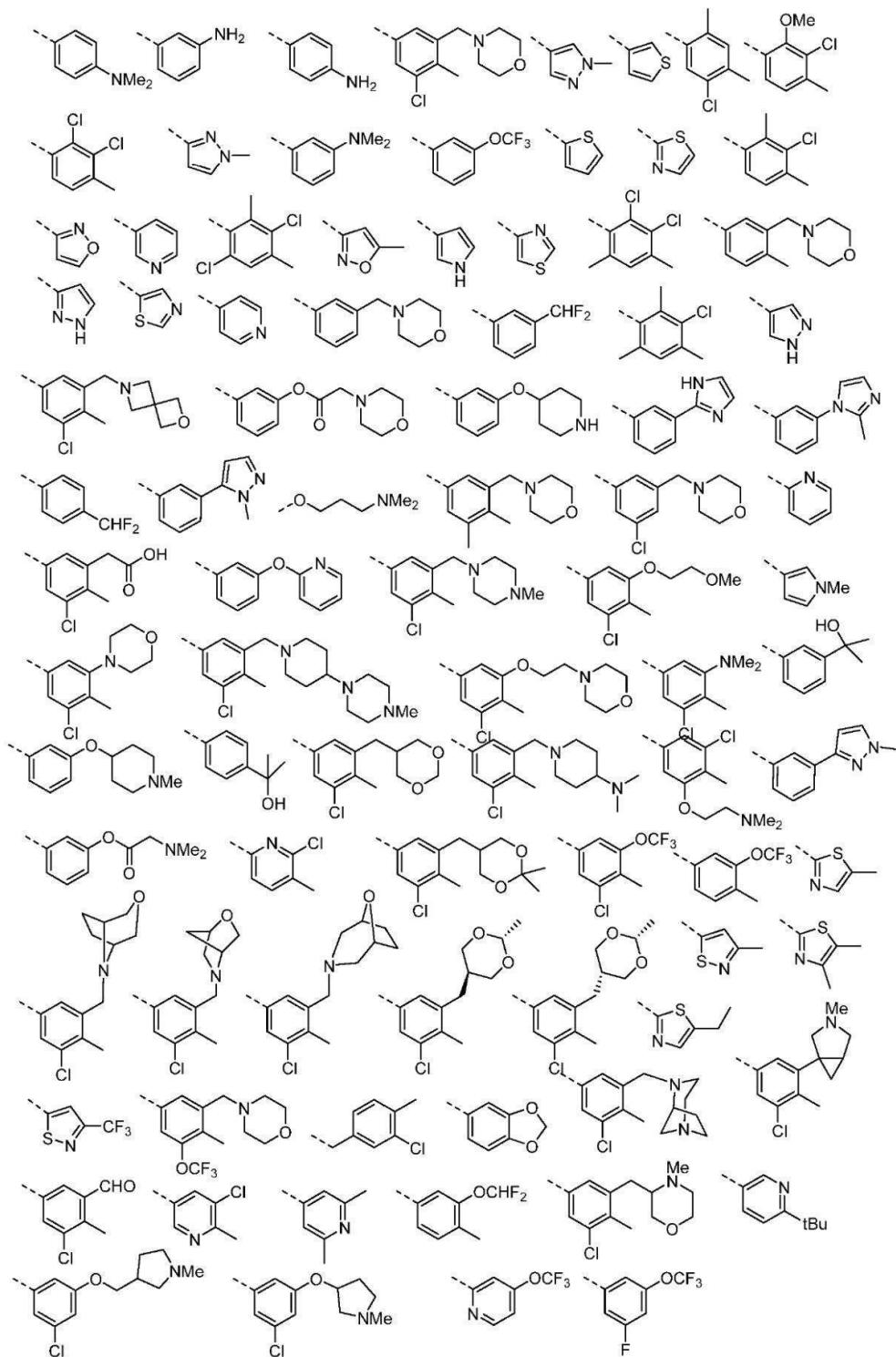
W、W¹、W²、W³は

50

【化 1 4 1】



【化 1 4 2】



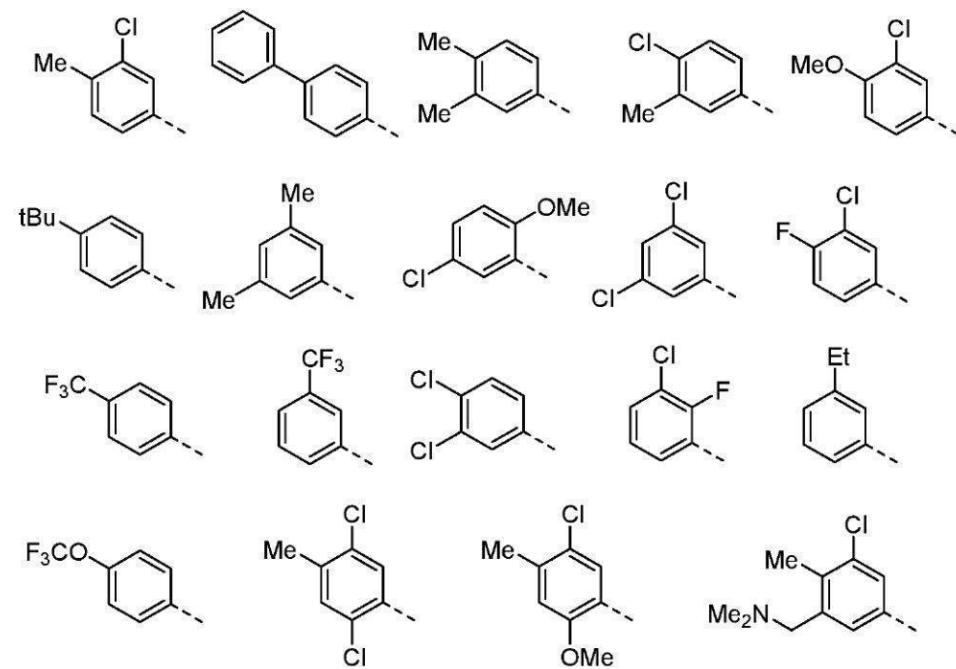
から独立して選択される、

化合物、または薬学的に許容されるそれらの塩もしくは立体異性体。

(項目 10)

W が、

【化 1 4 3】



10

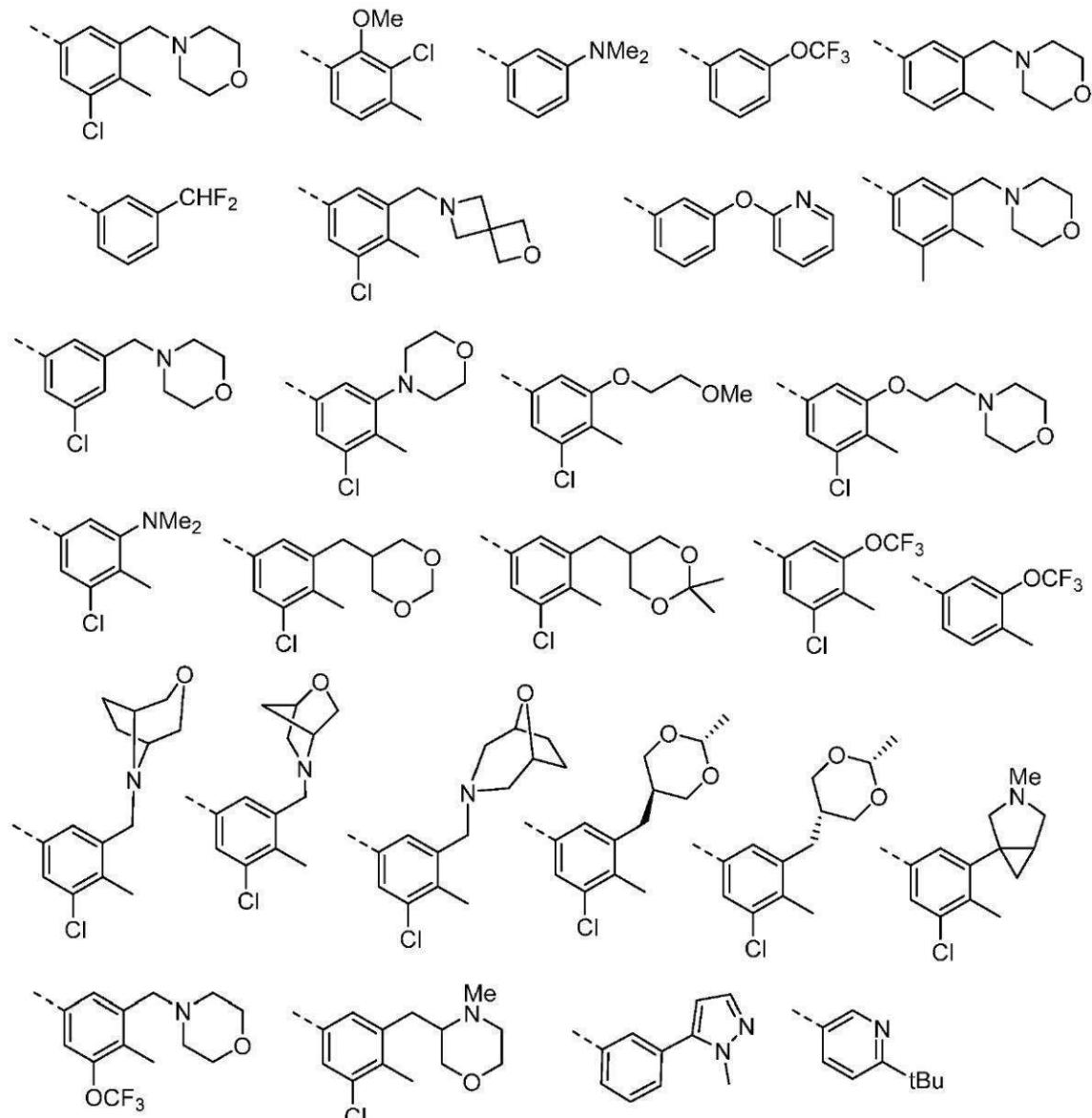
20

30

40

50

【化144】



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11)

項目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を含む、組成物。

(項目12)

薬学的に許容される担体をさらに含む、項目11に記載の組成物。

(項目13)

第2の治療活性剤をさらに含む、項目11または12に記載の組成物。

(項目14)

治療に使用するための、項目1～10に記載の化合物または項目11～13のいずれか一項に記載の組成物。

(項目15)

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1～10に記載の化合物または項目11～13のいずれか一項に記載の組成物。

(項目16)

がん、特に乳がんの処置に使用するための、項目1～10に記載の化合物または項目1

40

50

1～13のいずれか一項に記載の組成物。

(項目17)

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1～10に記載の化合物または項目11もしくは12に記載の組成物の使用。

(項目18)

がん、特に乳がんを処置するための、項目17に記載の使用。

(項目19)

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1～10に記載の化合物または項目11もしくは12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。

(項目20)

項目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、項目19に記載の方法。

10

20

30

40

50