

【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 3 年 9 月 30 日 (2021.9.30)

【公表番号】特表 2020-533280 (P2020-533280A)

【公表日】令和 2 年 11 月 19 日 (2020.11.19)

【年通号数】公開・登録公報 2020-047

【出願番号】特願 2020-510091 (P2020-510091)

【国際特許分類】

C 0 7 D 257/04 (2006.01)

A 6 1 P 35/00 (2006.01)

C 0 7 D 271/06 (2006.01)

A 6 1 K 31/4245 (2006.01)

A 6 1 K 31/4192 (2006.01)

A 6 1 K 31/41 (2006.01)

C 0 7 D 249/06 (2006.01)

C 0 7 D 233/60 (2006.01)

C 0 7 D 231/12 (2006.01)

A 6 1 K 31/415 (2006.01)

A 6 1 K 31/4164 (2006.01)

A 6 1 K 31/4196 (2006.01)

C 0 7 D 249/08 (2006.01)

C 0 7 D 403/04 (2006.01)

C 0 7 D 401/04 (2006.01)

A 6 1 K 31/454 (2006.01)

A 6 1 K 31/4439 (2006.01)

C 0 7 D 401/06 (2006.01)

C 0 7 D 401/14 (2006.01)

C 0 7 D 239/26 (2006.01)

A 6 1 K 31/505 (2006.01)

A 6 1 K 31/4402 (2006.01)

A 6 1 K 31/4409 (2006.01)

C 0 7 D 271/10 (2006.01)

C 0 7 D 213/38 (2006.01)

C 0 7 D 213/73 (2006.01)

A 6 1 K 31/44 (2006.01)

A 6 1 K 31/4406 (2006.01)

C 0 7 D 213/65 (2006.01)

C 0 7 D 213/61 (2006.01)

C 0 7 D 213/74 (2006.01)

【 F I 】

C 0 7 D 257/04 C S P E

A 6 1 P 35/00

C 0 7 D 271/06

A 6 1 K 31/4245

A 6 1 K 31/4192

A 6 1 K 31/41

C 0 7 D 249/06

C 0 7 D 233/60 1 0 1

C 0 7 D 231/12 A

A 6 1 K 31/415
 A 6 1 K 31/4164
 A 6 1 K 31/4196
 C 0 7 D 249/08 5 2 6
 C 0 7 D 403/04
 C 0 7 D 401/04
 A 6 1 K 31/454
 A 6 1 K 31/4439
 C 0 7 D 401/06
 C 0 7 D 401/14
 C 0 7 D 239/26
 A 6 1 K 31/505
 A 6 1 K 31/4402
 A 6 1 K 31/4409
 C 0 7 D 271/10
 C 0 7 D 213/38
 C 0 7 D 213/73
 A 6 1 K 31/44
 A 6 1 K 31/4406
 C 0 7 D 213/65
 C 0 7 D 213/61
 C 0 7 D 213/74

【手続補正書】

【提出日】令和3年8月18日(2021.8.18)

【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

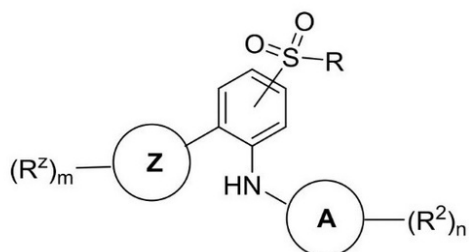
【補正の内容】

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩であって：

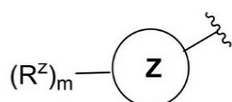
【化1】



式(I)

式中、

【化2】



は、置換または非置換のピロリル、置換または非置換のイミダゾリル、置換または非置換のピラゾリル、置換または非置換のオキサゾリル、置換または非置換のイソキサゾリル、置換または非置換のチアゾリル、置換または非置換のイソチアゾリル、置換または非置換のトリアゾリル、置換または非置換のテトラゾリル、置換または非置換のオキサジアゾリル、あるいは置換または非置換のチアジアゾリルであり；

R^2 はそれぞれ独立して、H、ハロゲン、 $-CN$ 、置換または非置換の $C_1 - C_6$ アルキル、置換または非置換の $C_1 - C_6$ ハロアルキル、置換または非置換の $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、置換または非置換の $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、置換または非置換の $C_2 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキル、置換または非置換のアラルキル、置換または非置換のアリール、置換または非置換のヘテロアリール、 $-L^1 - Y^1$ 、あるいは、 $-L^2 - L^3 - Y^2$ であり；

m は 0、1、2、3、4、あるいは 5 であり；

L^1 は、置換または非置換の $C_1 - C_6$ アルキレン、置換または非置換の $C_2 - C_{10}$ シクロアルキレン、あるいは、置換または非置換の $C_2 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキレンであり；

Y^1 は置換または非置換の $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、置換または非置換の $C_2 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキル、置換または非置換のアリール、あるいは置換または非置換のヘテロアリールであり；

L^2 は、存在しないか、置換または非置換の $C_1 - C_6$ アルキレン、置換または非置換の $C_2 - C_{10}$ シクロアルキレン、あるいは置換または非置換の $C_2 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキレンであり；

L^3 は、 $-O-$ 、 $-S-$ 、 $-(S=O)-$ 、 $-(SO_2)-$ 、 $-NR^3-$ 、 $-(C=O)-$ 、 $-(C=O)O-$ 、 $-O(C=O)-$ 、 $-(C=O)NR^3-$ 、 $-(C=O)NR^3-O-$ 、 $-O-NR^3(C=O)-$ 、 $-NR^3(C=O)-$ 、 $-NR^3(C=O)NR^3-$ 、 $-O(C=O)NR^3-$ 、 $-NR^3(C=O)O-$ 、 $-NR^3(SO_2)NR^3-$ 、 $-NR^3(SO_2)-$ 、 $-(SO_2)NR^3-$ 、 $-(SO_2)NR^3-(C=O)-$ 、 $-(C=O)-NR^3(SO_2)-$ 、 $-(SO_2)NR^3-(C=O)O-$ 、 $-O(C=O)-NR^3(SO_2)-$ 、 $-NR^3(SO_2)NR^3-(C=O)-$ 、 $-(C=O)-NR^3(SO_2)NR^3-$ 、 $-O(C=O)-NR^3(SO_2)-NR^3-$ 、あるいは、 $-NR^3(SO_2)NR^3-(C=O)O-$ であり；

R^3 はそれぞれ独立して、Hあるいは置換または非置換の $C_1 - C_6$ アルキルであり；

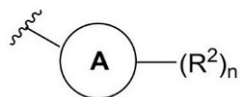
Y^2 は、H、置換または非置換の $C_1 - C_6$ アルキル、置換または非置換の $C_1 - C_6$ ハロアルキル、置換または非置換の $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、置換または非置換の $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、置換または非置換の $C_2 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキル、置換または非置換のアリール、あるいは置換または非置換のヘテロアリールであり；

あるいは、同じN原子上の R^3 と Y^2 は、それらが結合するN原子と一体となって、置換または非置換のN含有複素環を形成し；

R は NHR^1 または R^1 であり；

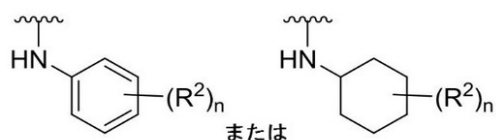
R^1 は、置換または非置換の $C_1 - C_6$ アルキル、置換または非置換の $C_1 - C_6$ ハロアルキル、置換または非置換の $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、置換または非置換の $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、置換または非置換の $C_2 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキル、置換または非置換のアラルキル、置換または非置換のアリール、あるいは置換または非置換のヘテロアリールであり；

【化 3】



は、

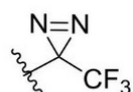
【化 4】



であり；

R^2 はそれぞれ独立して、H、ハロゲン、 $-N_3$ 、 $-CN$ 、 $-OR^4$ 、 $-SR^4$ 、 $-(SO_2)R^4$ 、 $-N(R^4)_2$ 、 $-CO_2R^4$ 、置換または非置換の $C_1 - C_6$ アルキル、置換または非置換の $C_1 - C_6$ ハロアルキル、置換または非置換の $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、置換または非置換の $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、置換または非置換の $C_2 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキル、置換または非置換のアラルキル、置換または非置換のアリール、置換または非置換のヘテロアリール、あるいは、

【化 5】



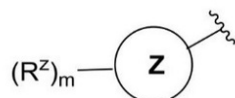
であり；

n は 0、1、2、3、4、あるいは 5 であり；および、

R^4 はそれぞれ独立して、H、置換または非置換の $C_1 - C_6$ アルキル、置換または非置換の $C_1 - C_6$ ハロアルキル、置換または非置換の $C_1 - C_6$ ヘテロアルキル、置換または非置換の $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、置換または非置換の $C_2 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキル、置換または非置換のアラルキル、置換または非置換のアリール、あるいは置換または非置換のヘテロアリールである、
化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

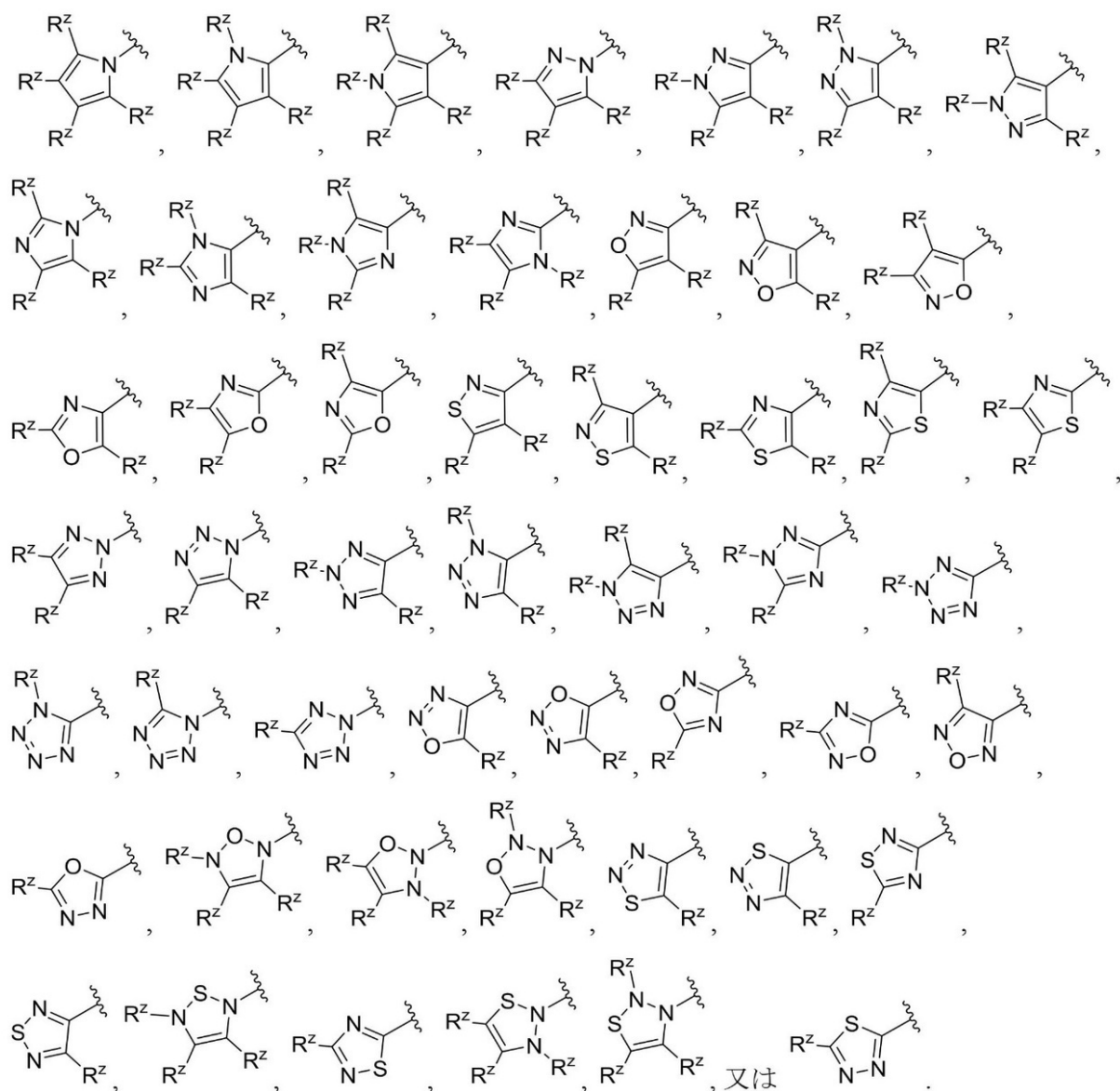
【請求項 2】

【化 6】



は、

【化 7】



である、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 3】

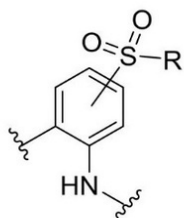
R^Z はそれぞれ独立して、H、ハロゲン、置換または非置換の C₁ - C₆ アルキル、置換または非置換の C₁ - C₆ ハロアルキル、置換または非置換の C₃ - C₁₀ シクロアルキル、置換または非置換の C₂ - C₁₀ ヘテロシクロアルキル、置換または非置換のアリール、あるいは置換または非置換のヘテロアリールである、請求項 1 または 2 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 4】

R^Z はそれぞれ独立して、H、-F、-Cl、-Br、-I、メチル、エチル、n-プロピル、イソ-プロピル、n-ブチル、イソ-ブチル、tert-ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、あるいはフェニルである、請求項 3 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

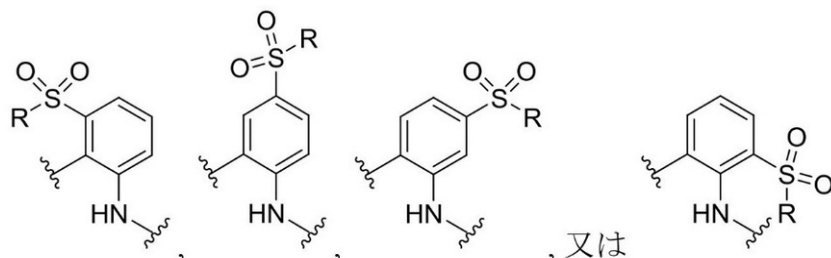
【請求項 5】

【化 8】



は、

【化 9】

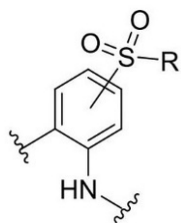


である、請求項 1 - 4 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩

。

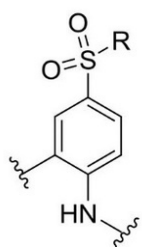
【請求項 6】

【化 10】



は、

【化 11】



である、請求項 5 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 7】

R は NHR^1 であり；および、

R^1 は、置換または非置換の $\text{C}_1 - \text{C}_6$ アルキル、置換または非置換の $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ハロアルキル、置換または非置換の $\text{C}_1 - \text{C}_6$ ヘテロアルキル、置換または非置換の $\text{C}_3 - \text{C}_{10}$ シクロアルキル、置換または非置換の $\text{C}_2 - \text{C}_{10}$ ヘテロシクロアルキル、置換または非置換のアラルキル、置換または非置換のアリール、あるいは置換または非置換のヘテロアリールである、請求項 1 - 6 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

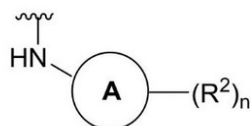
【請求項 8】

R^1 は、メチル、エチル、*n*-プロピル、イソ-プロピル、*n*-ブチル、イソ-ブチル、

tert - ブチル、シクロプロピル、シクロブチル、シクロペンチル、シクロヘキシル、あるいはフェニルである、請求項 7 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

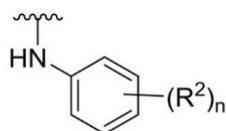
【請求項 9】

【化 1 2】



は、

【化 1 3】

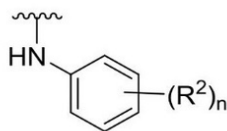


である、請求項 1 - 8 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩

。

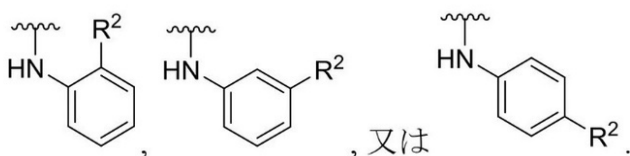
【請求項 10】

【化 1 4】



は、

【化 1 5】



である、請求項 9 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

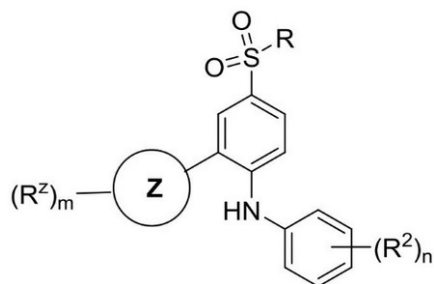
【請求項 11】

R² はそれぞれ独立して、H、ハロゲン、-N₃、-CN、-OR⁴、-SR⁴、-(SO₂)R⁴、-N(R⁴)₂、-CO₂R⁴、置換または非置換のC₁-C₆アルキル、置換または非置換のC₁-C₆ハロアルキル、置換または非置換のC₁-C₆ヘテロアルキル、置換または非置換のC₃-C₁₀シクロアルキル、置換または非置換のC₂-C₁₀ヘテロシクロアルキル、置換または非置換のアラルキル、置換または非置換のアリール、あるいは、置換または非置換のヘテロアリールである、請求項 1 - 10 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項 12】

化合物が式 (I d) の構造、あるいはその薬学的に許容可能な塩を有する、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【化 1 6】

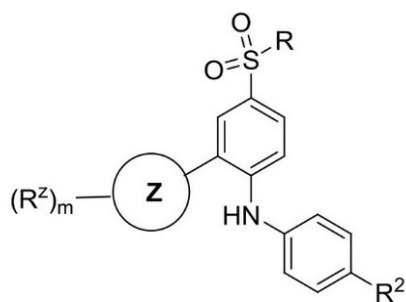


式 (Id).

【請求項 1 3】

化合物が式 (I e) の構造、あるいはその薬学的に許容可能な塩を有する、請求項 1 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【化 1 7】



式 (Ie).

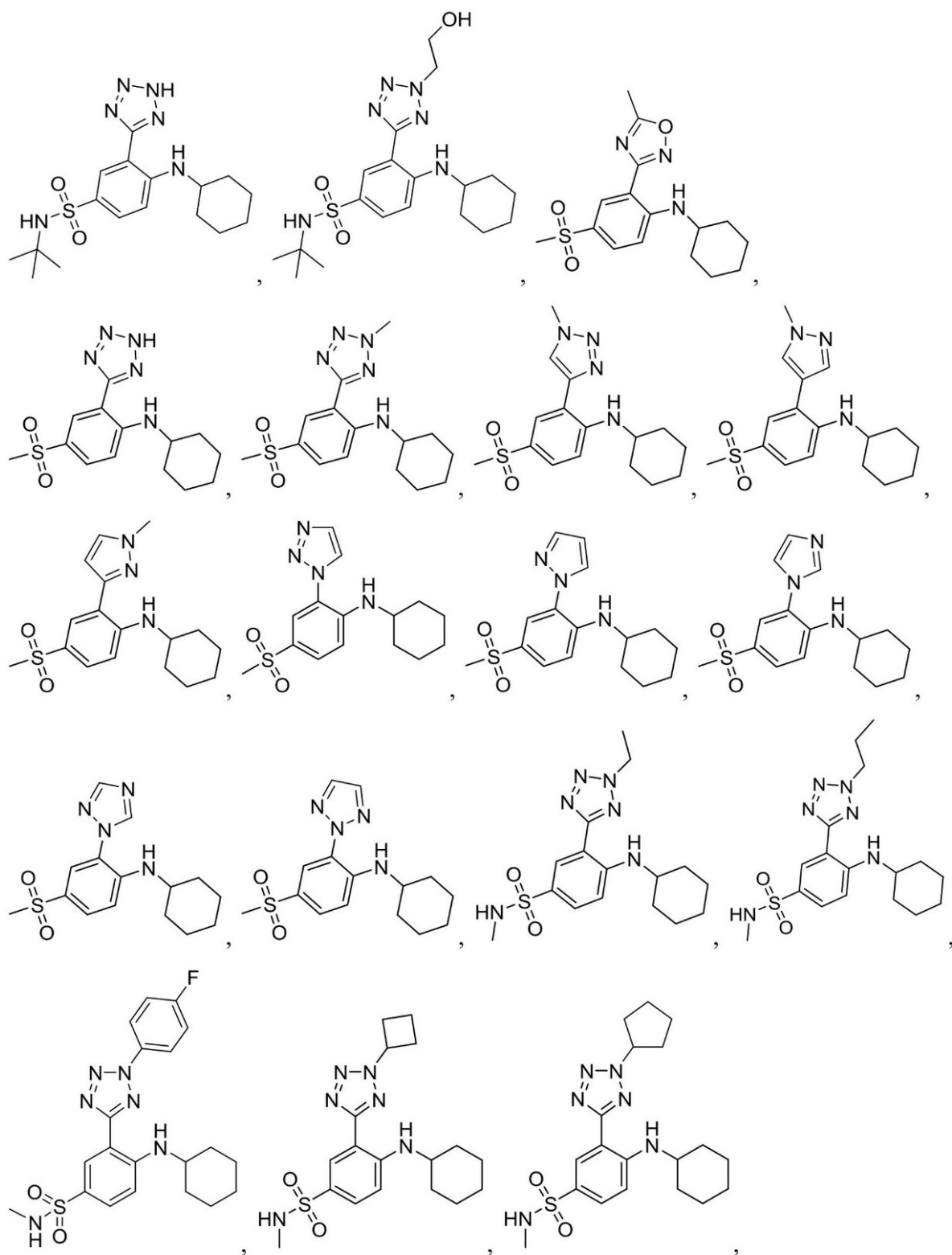
【請求項 1 4】

R^2 は $-\text{CF}_3$ である、請求項 1 2 または 1 3 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

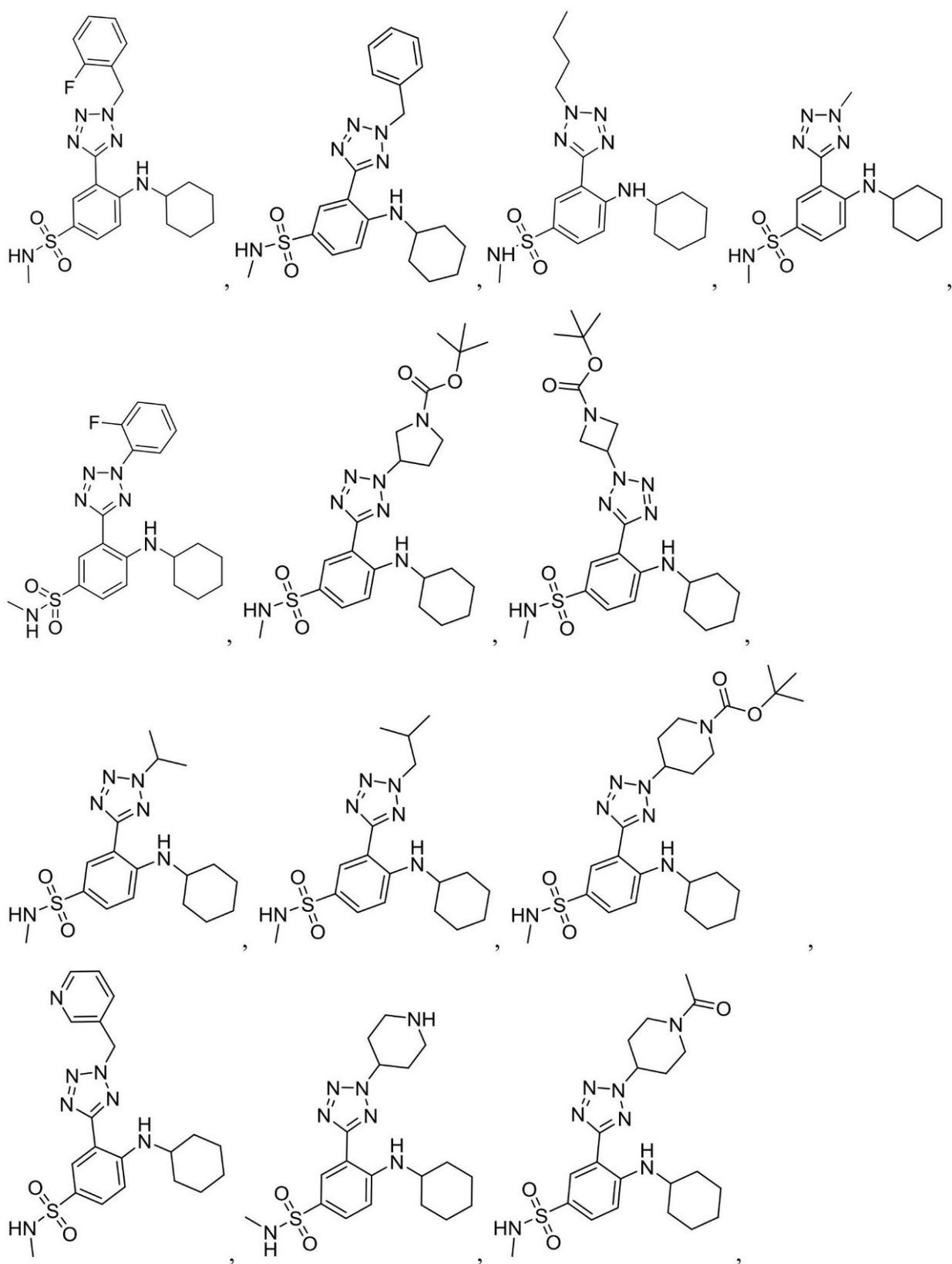
【請求項 1 5】

以下の構造のうち 1 つを有する、請求項 1 - 1 4 のいずれか 1 つに記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

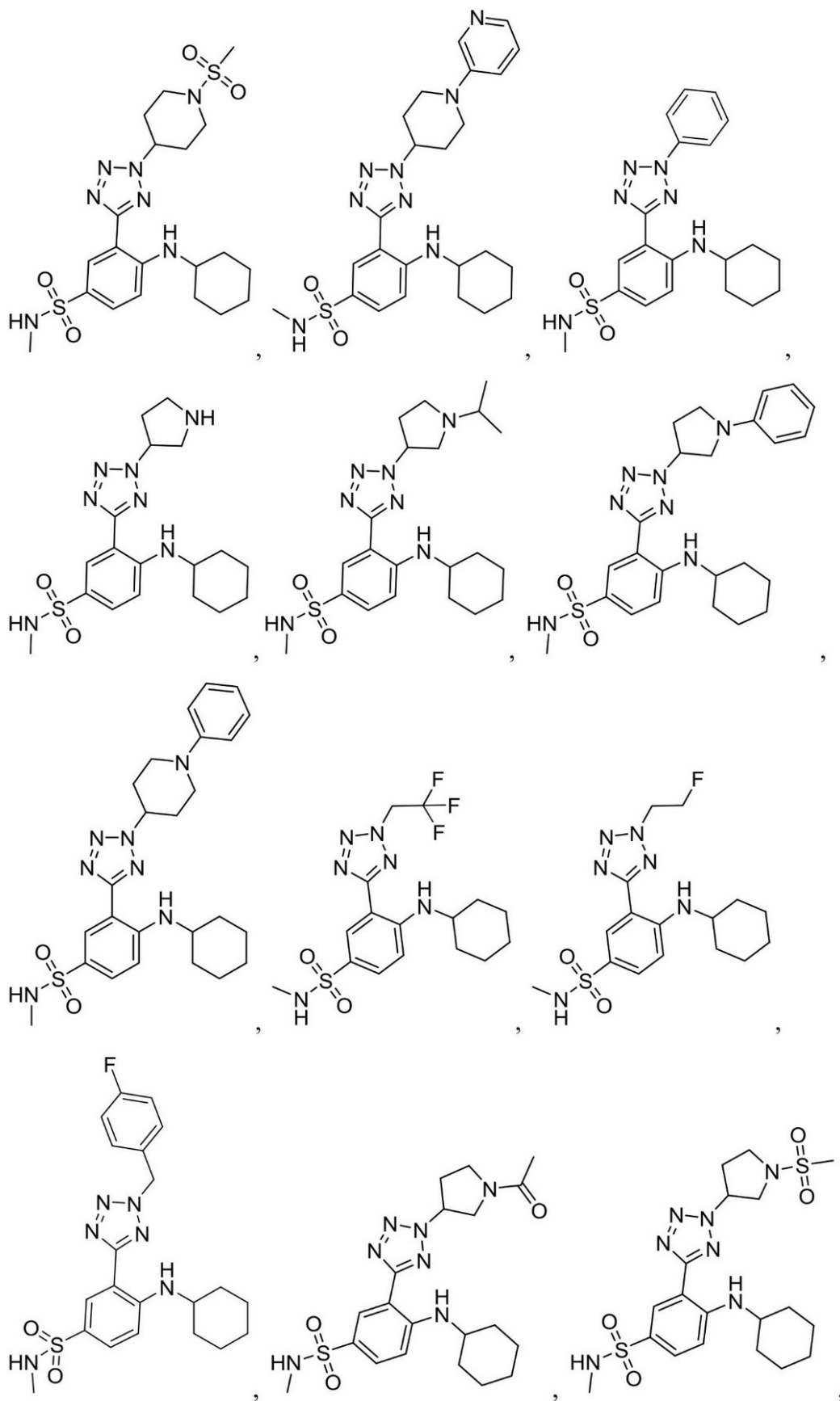
【化 1 8】



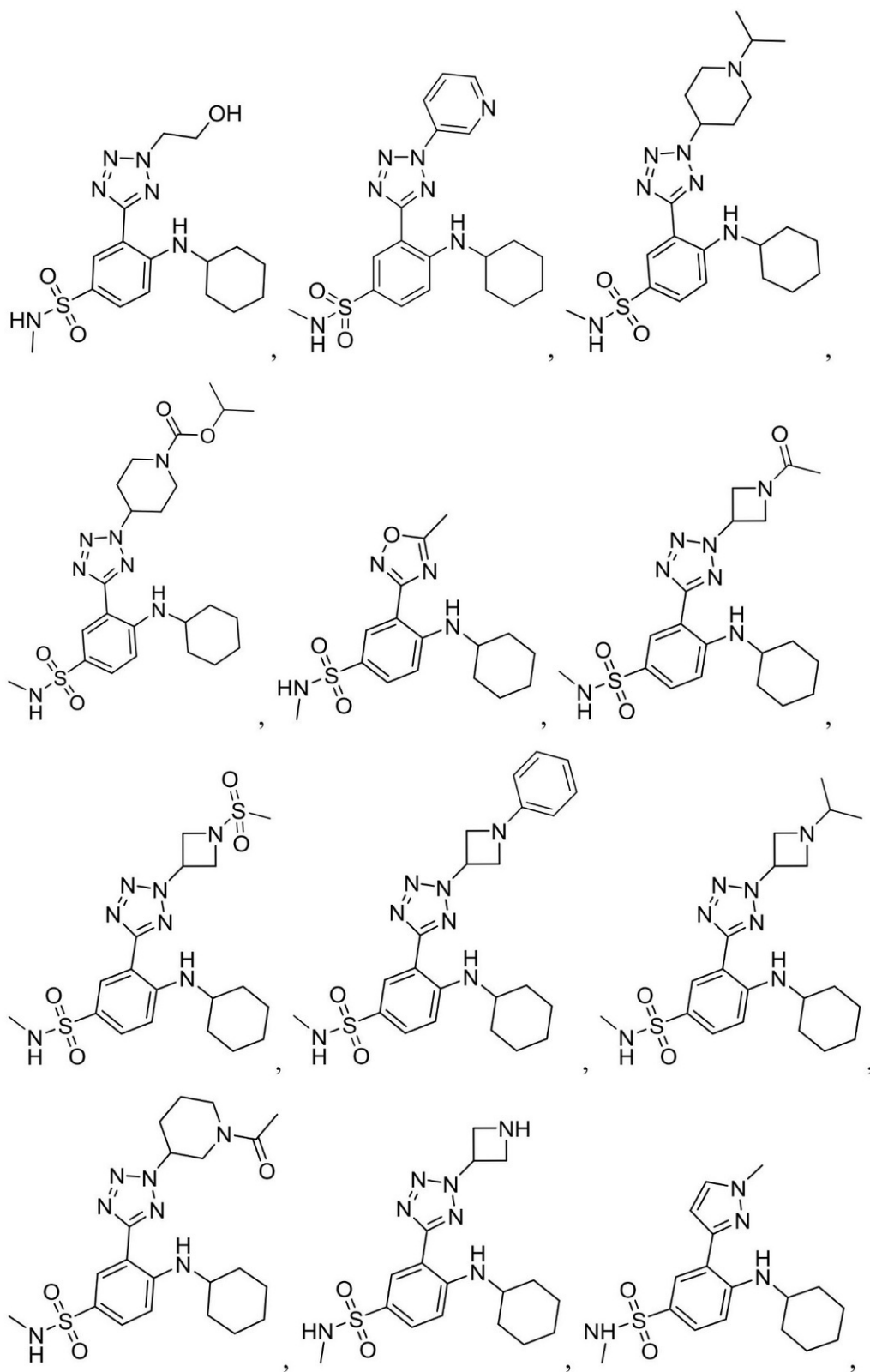
【化 19】



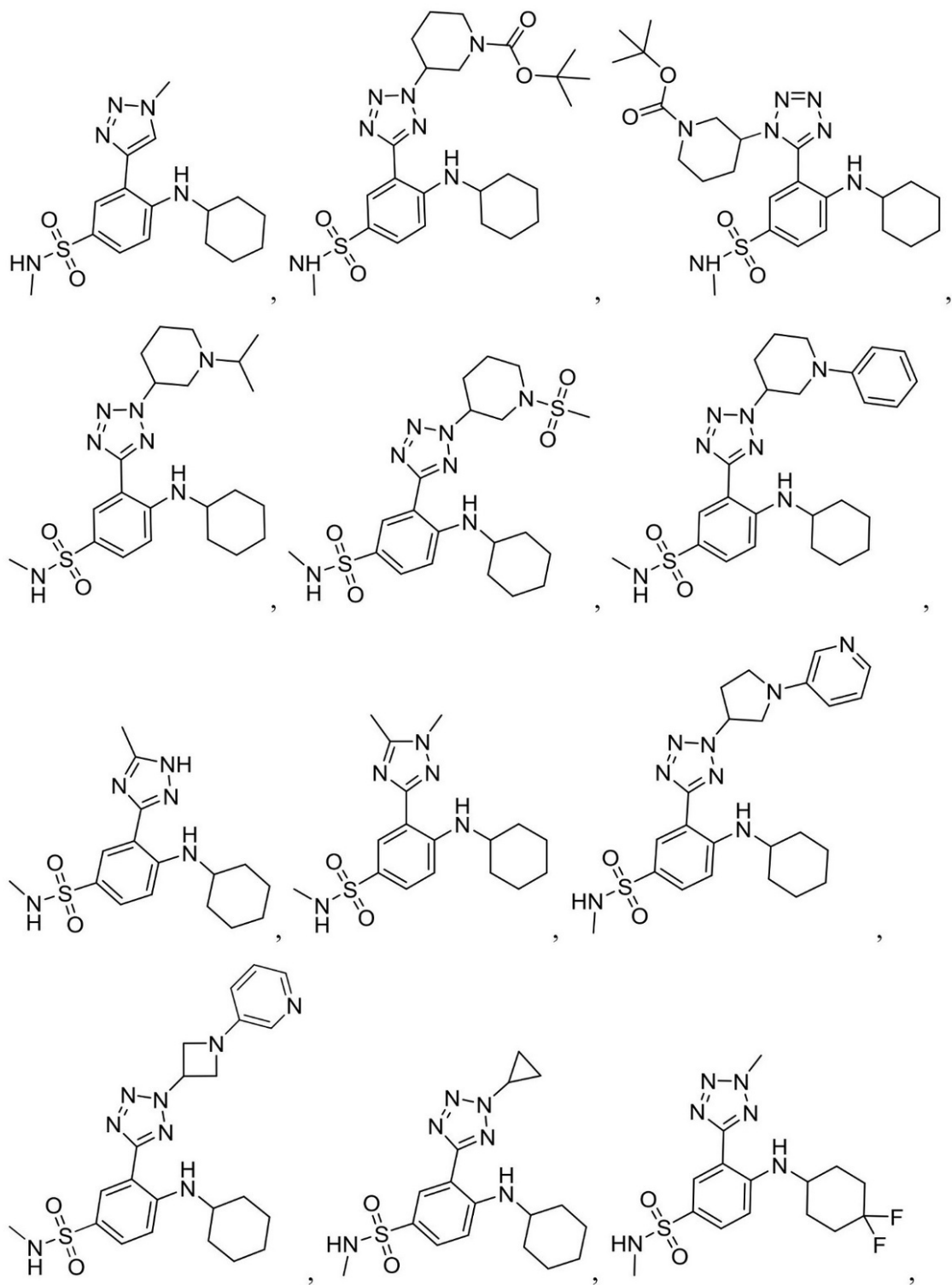
【化 20】



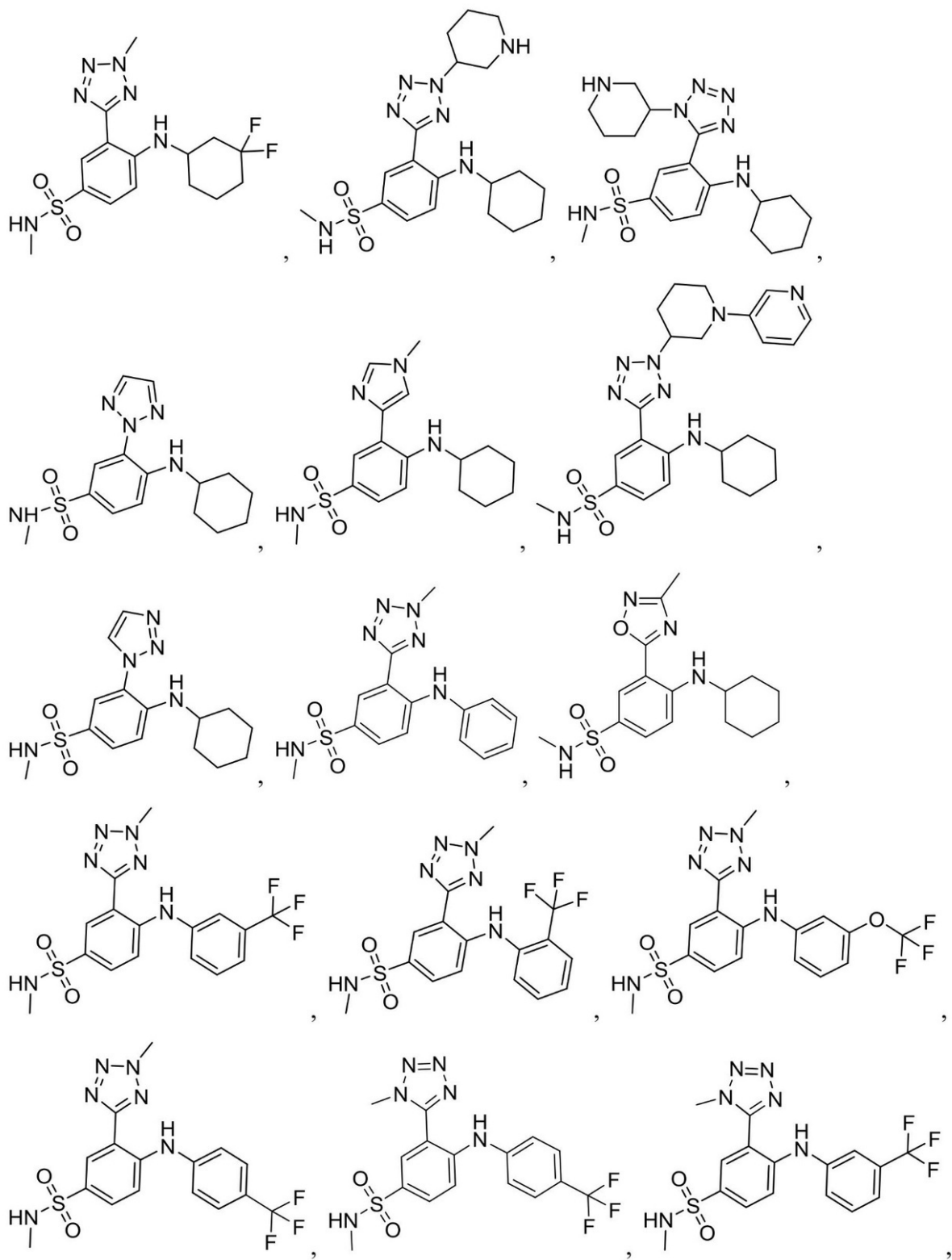
【化 2 1】



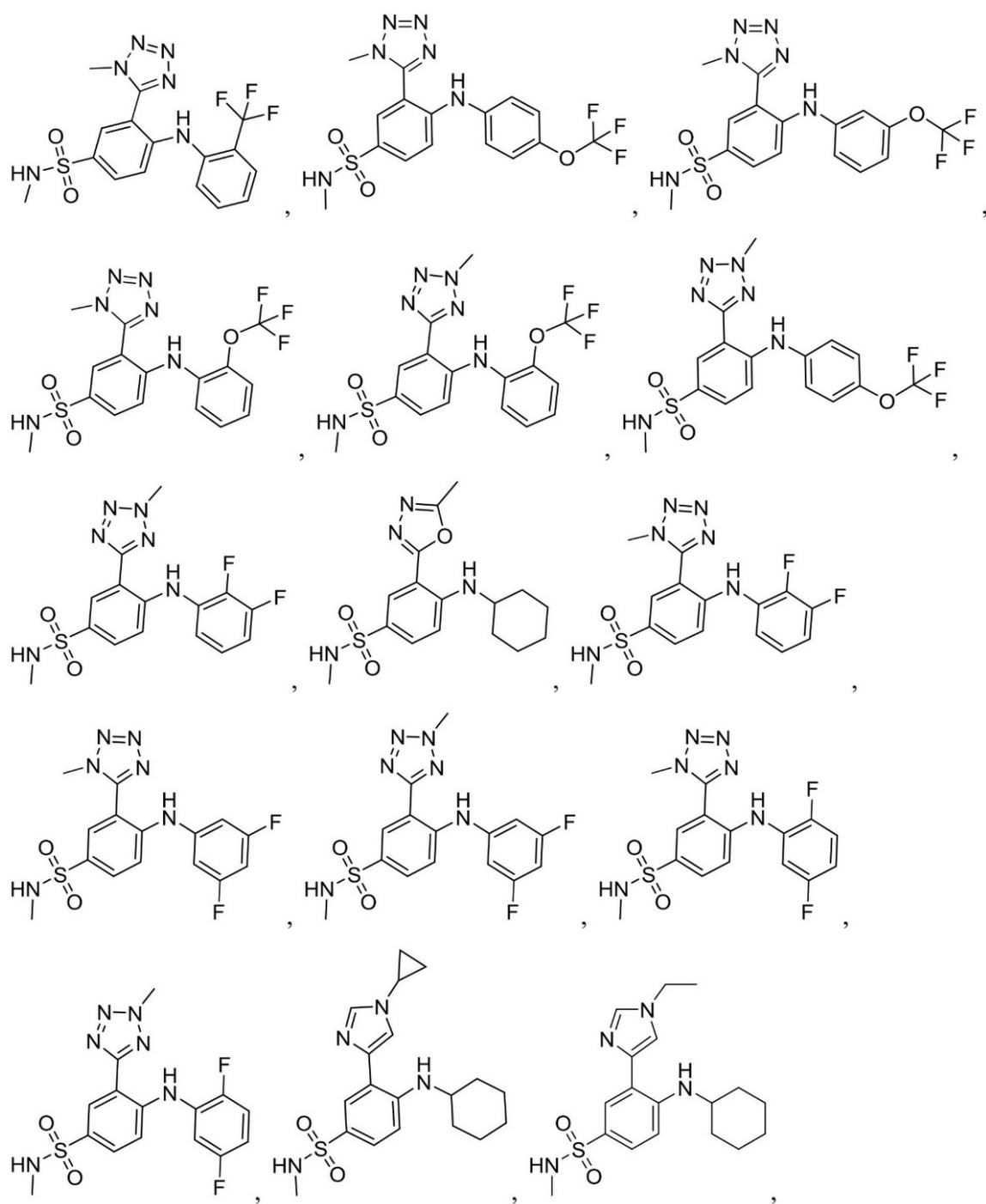
【化 2 2】



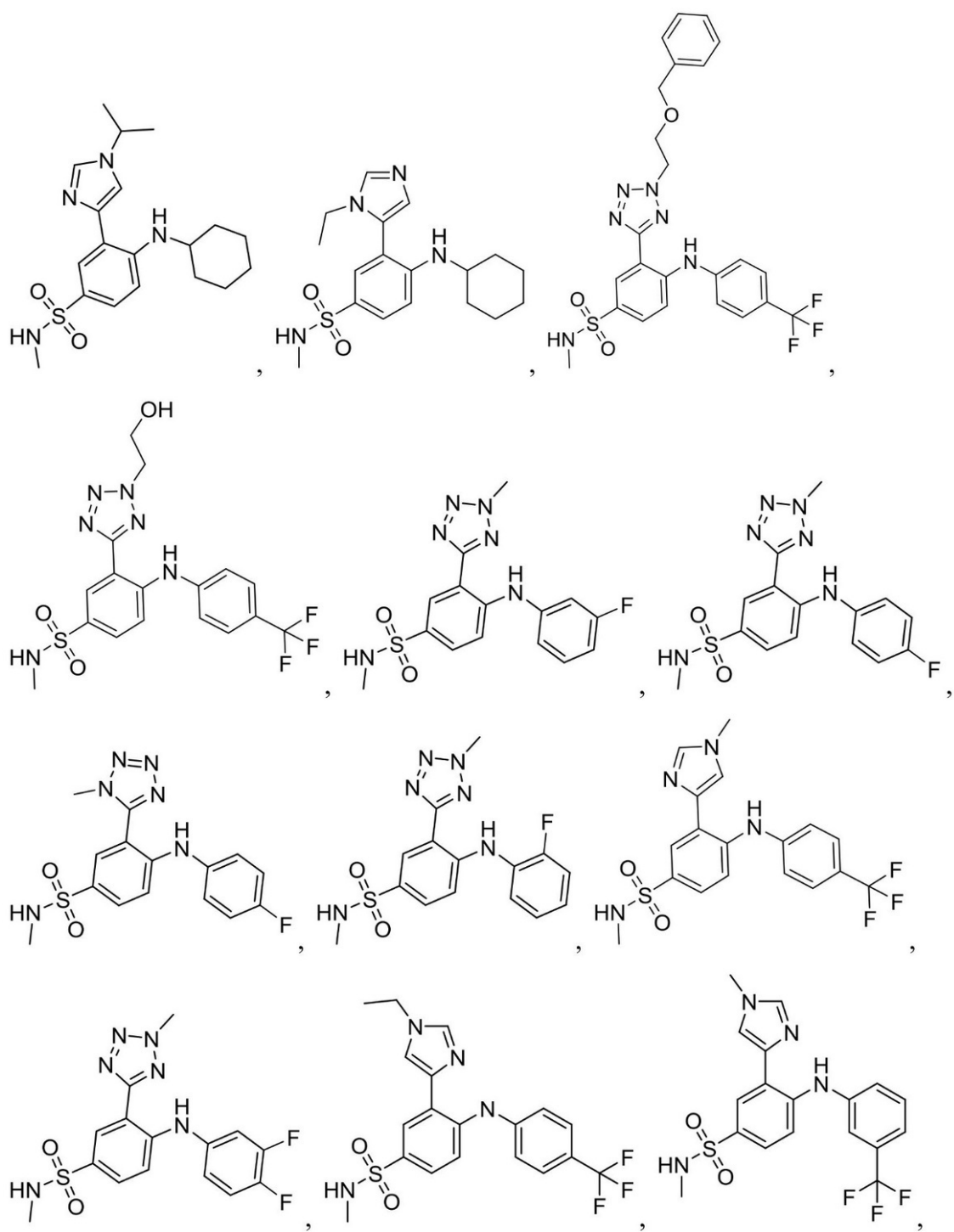
【化 2 3】



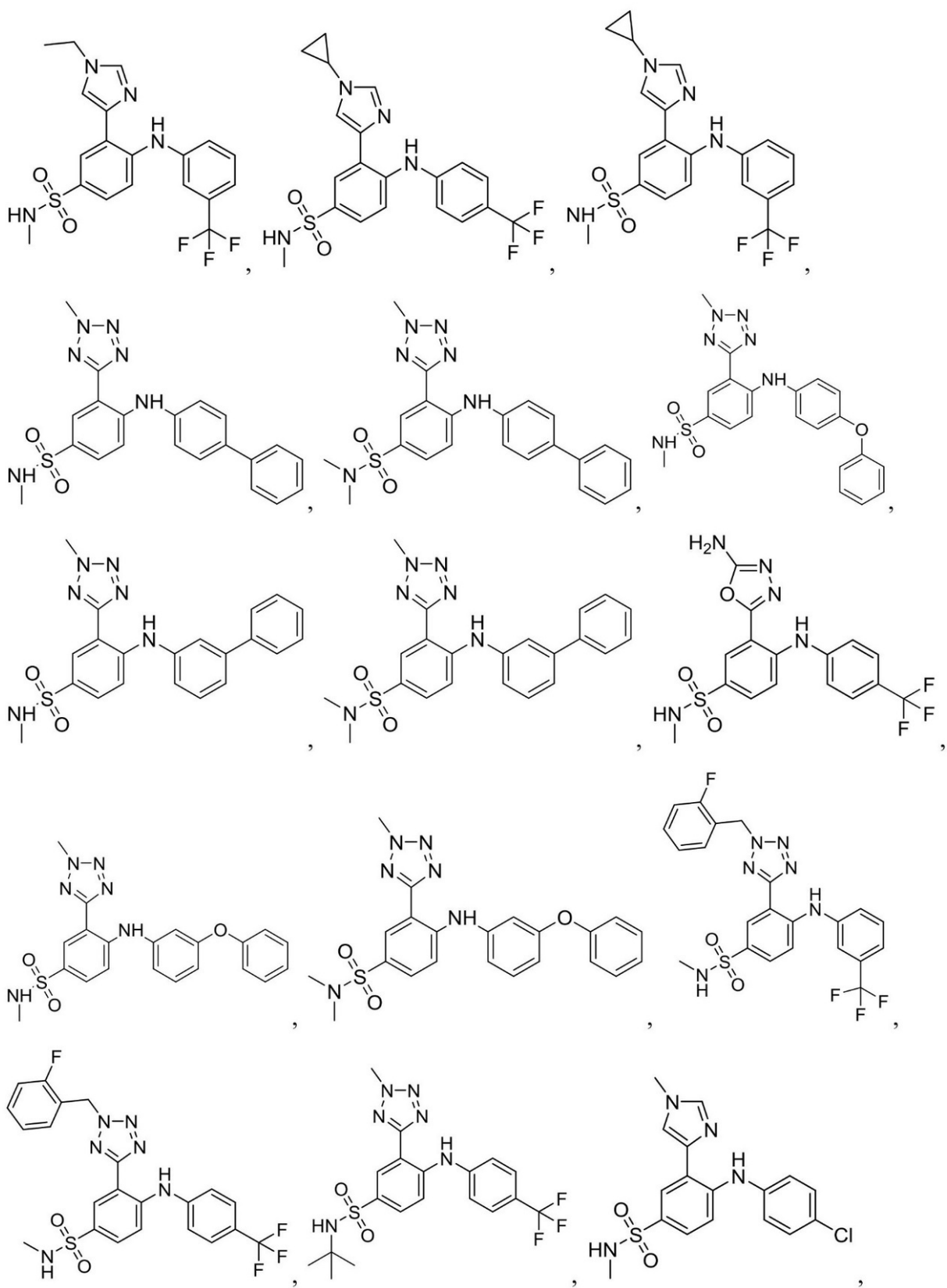
【化 2 4】



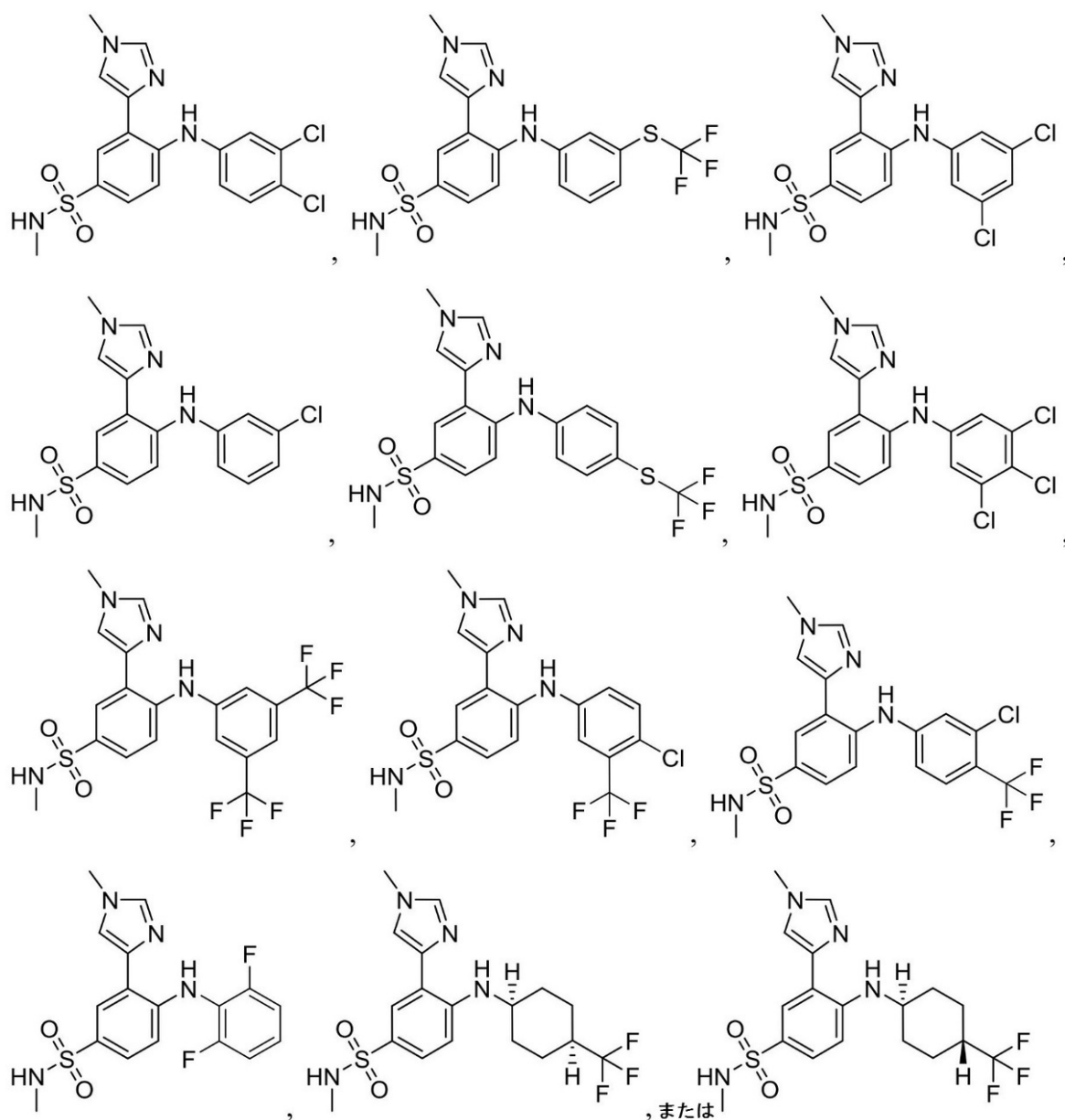
【化 2 5】



【化 2 6】



【化 2 7】



【請求項 1 6】

薬学的に許容可能な賦形剤、および請求項 1 - 1 5 のいずれか 1 つに記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩を含む医薬組成物。

【請求項 1 7】

被験体の癌を処置するための薬剤の製造における、請求項 1 - 1 5 のいずれか 1 つに記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩の使用。

【請求項 1 8】

前記癌は、中皮腫、肝細胞癌、髄膜腫、悪性末梢神経鞘腫、肺癌、前立腺癌、膵臓癌、腺扁平上皮癌、甲状腺癌、胃癌、食道癌、卵巣癌、黒色腫、および乳癌から選択される、請求項 1 7 に記載の使用。

【請求項 1 9】

被験体の H i p p o 経路に包含されるまたは該経路に関連するタンパク質の 1 つ以上を阻害するための薬剤の製造における、請求項 1 - 1 5 のいずれか 1 つに記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩の使用。

【請求項 2 0】

被験体の P D Z 結合モチーフを有する転写コアクチベーター / Y e s 関連タンパク質転写

コアクチベーター（T A Z / Y A P）を阻害するための薬剤の製造における、請求項 1 - 1 5 のいずれか 1 つに記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩の使用。

【請求項 2 1】

被験体の癌を処置する方法に使用するための、請求項 1 - 1 5 のいずれか 1 つに記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩を含む、医薬組成物。

【請求項 2 2】

前記癌は、中皮腫、肝細胞癌、髄膜腫、悪性末梢神経鞘腫、肺癌、前立腺癌、膵臓癌、腺扁平上皮癌、甲状腺癌、胃癌、食道癌、卵巣癌、黒色腫、および乳癌から選択される、請求項 2 1 に記載の医薬組成物。

【請求項 2 3】

被験体の H i p p o 経路に包含されるまたは該経路に関連するタンパク質の 1 つ以上を阻害する方法に使用するための、請求項 1 - 1 5 のいずれか 1 つに記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩を含む、医薬組成物。

【請求項 2 4】

被験体の P D Z 結合モチーフを有する転写コアクチベーター / Y e s 関連タンパク質転写コアクチベーター（T A Z / Y A P）を阻害する方法に使用するための、請求項 1 - 1 5 のいずれか 1 つに記載の化合物またはその薬学的に許容可能な塩を含む、医薬組成物。