

【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 07D 257/04 | (2006.01) |
| A 61P 35/00 | (2006.01) |
| C 07D 271/06 | (2006.01) |
| A 61K 31/4245 | (2006.01) |
| A 61K 31/4192 | (2006.01) |
| A 61K 31/41 | (2006.01) |
| C 07D 249/06 | (2006.01) |
| C 07D 233/60 | (2006.01) |
| C 07D 231/12 | (2006.01) |
| A 61K 31/415 | (2006.01) |
| A 61K 31/4164 | (2006.01) |
| A 61K 31/4196 | (2006.01) |
| C 07D 249/08 | (2006.01) |
| C 07D 403/04 | (2006.01) |
| C 07D 401/04 | (2006.01) |
| A 61K 31/454 | (2006.01) |
| A 61K 31/4439 | (2006.01) |
| C 07D 401/06 | (2006.01) |
| C 07D 401/14 | (2006.01) |
| C 07D 239/26 | (2006.01) |
| A 61K 31/505 | (2006.01) |
| A 61K 31/4402 | (2006.01) |
| A 61K 31/4409 | (2006.01) |
| C 07D 271/10 | (2006.01) |
| C 07D 213/38 | (2006.01) |
| C 07D 213/73 | (2006.01) |
| A 61K 31/44 | (2006.01) |
| A 61K 31/4406 | (2006.01) |
| C 07D 213/65 | (2006.01) |
| C 07D 213/61 | (2006.01) |
| C 07D 213/74 | (2006.01) |

【F I】

| | |
|---------------|---------|
| C 07D 257/04 | C S P E |
| A 61P 35/00 | |
| C 07D 271/06 | |
| A 61K 31/4245 | |
| A 61K 31/4192 | |
| A 61K 31/41 | |
| C 07D 249/06 | |
| C 07D 233/60 | 1 0 1 |
| C 07D 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

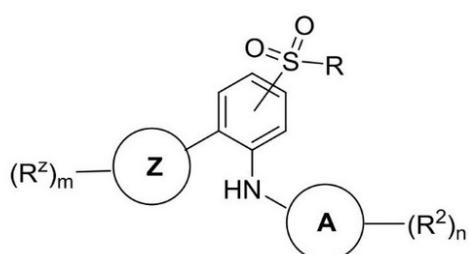
【補正の内容】

【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つて:

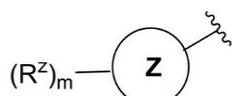
【化1】



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、置換または非置換のヘテロアリール、-L¹ - Y¹、あるいは、-L² - L³ - Y²であり；

mは0、1、2、3、4、あるいは5であり；

L¹は、置換または非置換のC₁ - C₆アルキレン、置換または非置換のC₂ - C₁₀シクロアルキレン、あるいは、置換または非置換のC₂ - C₁₀ヘテロシクロアルキレンであり；

Y¹は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り；

L²は、存在しないか、置換または非置換のC₁ - C₆アルキレン、置換または非置換のC₂ - C₁₀シクロアルキレン、あるいは置換または非置換のC₂ - C₁₀ヘテロシクロアルキレンであり；

L³は、-O-、-S-、-(S=O)-、-(SO₂)-、-NR³-、-(C=O)-、-(C=O)O-、-O(C=O)-、-(C=O)NR³-、-(C=O)NR³-O-、-O-NR³(C=O)-、-NR³(C=O)-、-NR³(C=O)NR³-、-O(C=O)NR³-、-NR³(C=O)O-、-NR³(SO₂)NR³-、-NR³(SO₂)NR³-、-(SO₂)NR³-(C=O)-、-(C=O)-NR³(SO₂)-、-(SO₂)NR³-(C=O)O-、-O(C=O)-NR³(SO₂)-、-NR³(SO₂)NR³-、-O(C=O)-NR³(SO₂)-NR³-、あるいは、-NR³(SO₂)NR³-(C=O)O-であり；

R³はそれぞれ独立して、Hあるいは置換または非置換のC₁ - C₆アルキルであり；

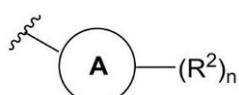
Y²は、H、置換または非置換のC₁ - C₆アルキル、置換または非置換のC₁ - C₆ハロアルキル、置換または非置換のC₁ - C₆ヘテロアルキル、置換または非置換のC₃ - C₁₀シクロアルキル、置換または非置換のC₂ - C₁₀ヘテロシクロアルキル、置換または非置換のアリール、あるいは置換または非置換のヘテロアリールであり；

あるいは、同じN原子上のR³とY²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NHR¹またはR¹であり；

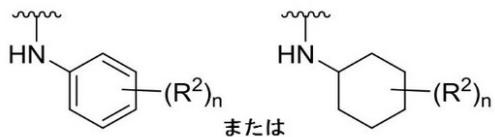
R¹は、置換または非置換のC₁ - C₆アルキル、置換または非置換のC₁ - C₆ハロアルキル、置換または非置換のC₁ - C₆ヘテロアルキル、置換または非置換のC₃ - C₁₀シクロアルキル、置換または非置換のC₂ - C₁₀ヘテロシクロアルキル、置換または非置換のアラルキル、置換または非置換のアリール、あるいは置換または非置換のヘテロアリールであり；

【化3】



は、

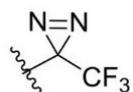
【化4】



であり；

R^2 はそれぞれ独立して、H、ハロゲン、-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、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；

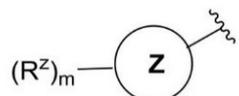
n は0、1、2、3、4、あるいは5であり；および、

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、

化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

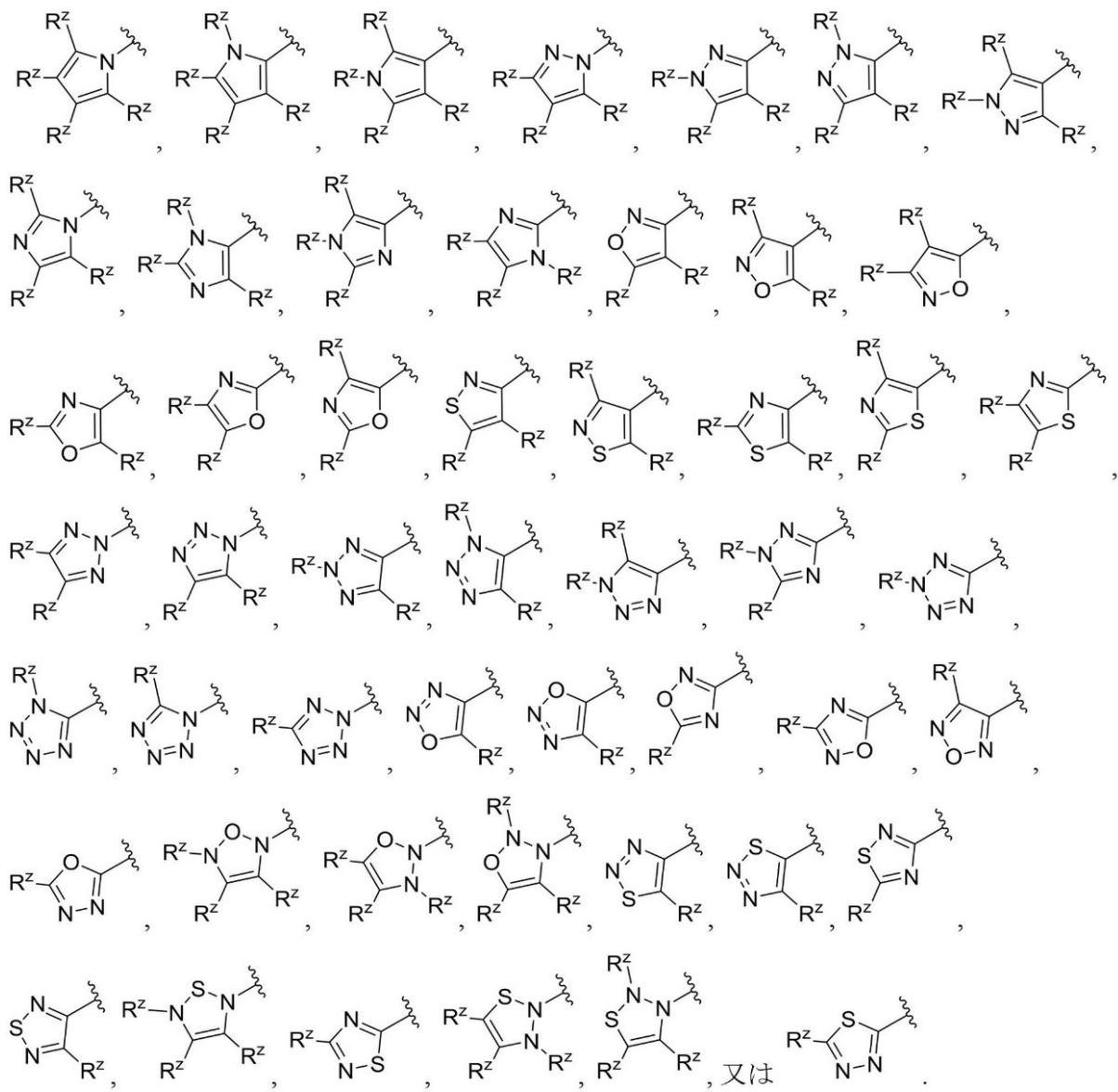
【請求項2】

【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】

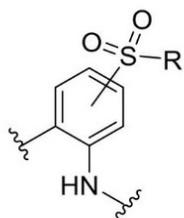
R^{\pm} はそれぞれ独立して、H、ハロゲン、置換または非置換の $C_1 - C_6$ アルキル、置換または非置換の $C_1 - C_6$ ハロアルキル、置換または非置換の $C_3 - C_{10}$ シクロアルキル、置換または非置換の $C_2 - C_{10}$ ヘテロシクロアルキル、置換または非置換のアリール、あるいは置換または非置換のヘテロアリールである、請求項 1 または 2 に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

【請求項4】

R² 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。

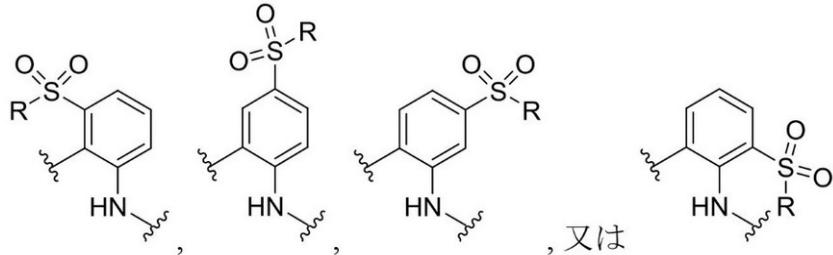
【請求項5】

【化8】



は、

【化9】

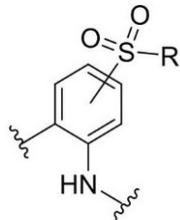


, 又は

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。

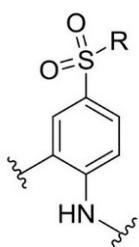
【請求項6】

【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NHR¹であり；および、

R¹は、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1-6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。

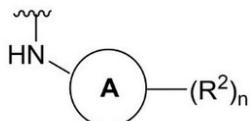
【請求項8】

R¹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。

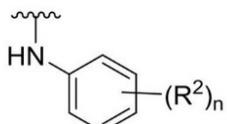
【請求項9】

【化12】



は、

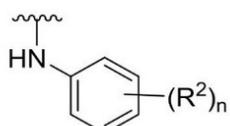
【化13】



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。

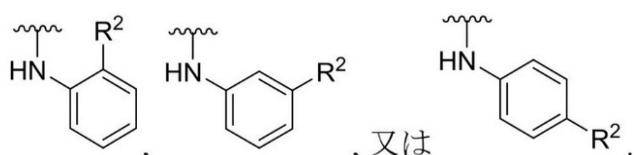
【請求項10】

【化14】



は、

【化15】



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。

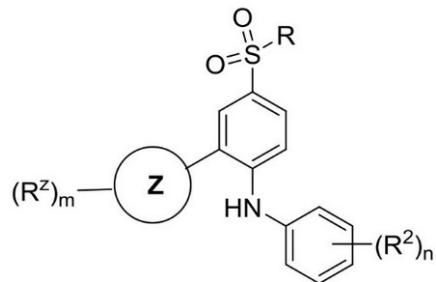
【請求項11】

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16】

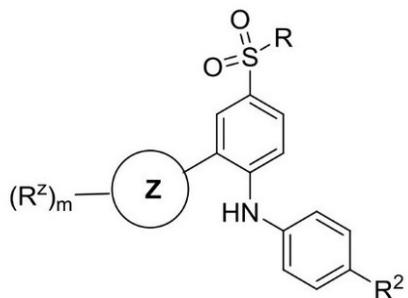


式(Id).

【請求項13】

化合物が式(Ie)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17】



式(Ie).

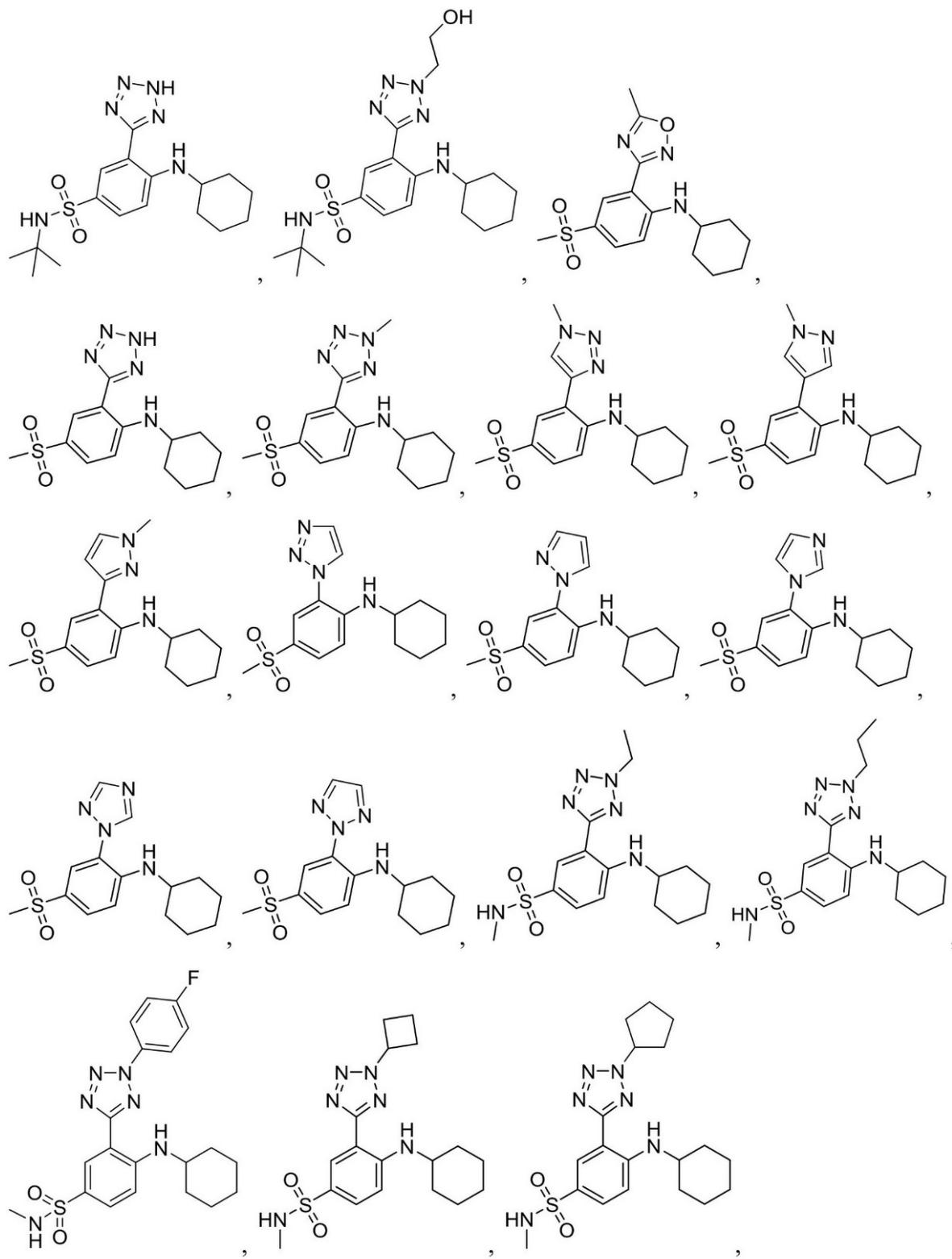
【請求項14】

R²は-CF₃である、請求項12または13に記載の化合物、またはその薬学的に許容可能な塩。

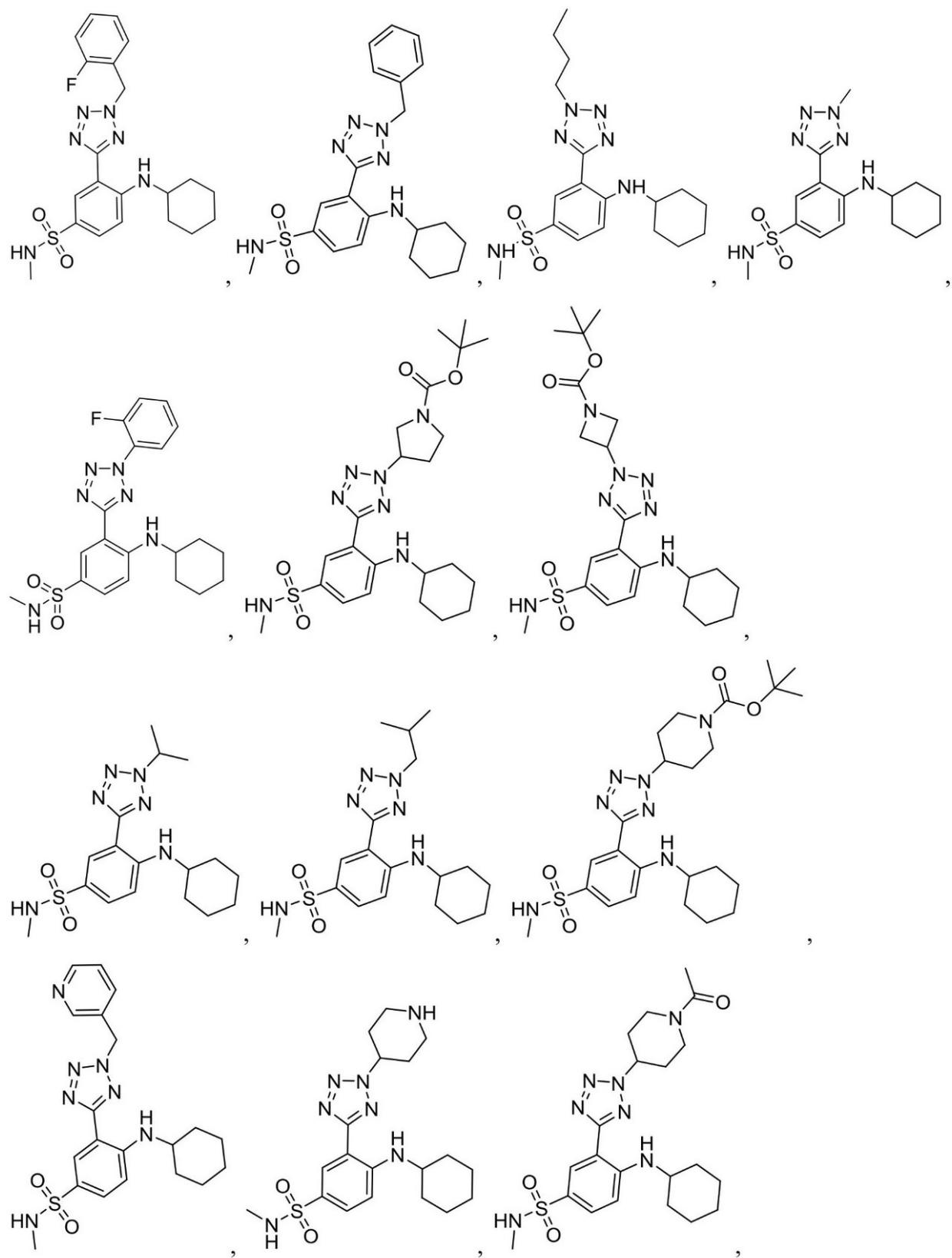
【請求項15】

以下の構造のうち1つを有する、請求項1-14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。

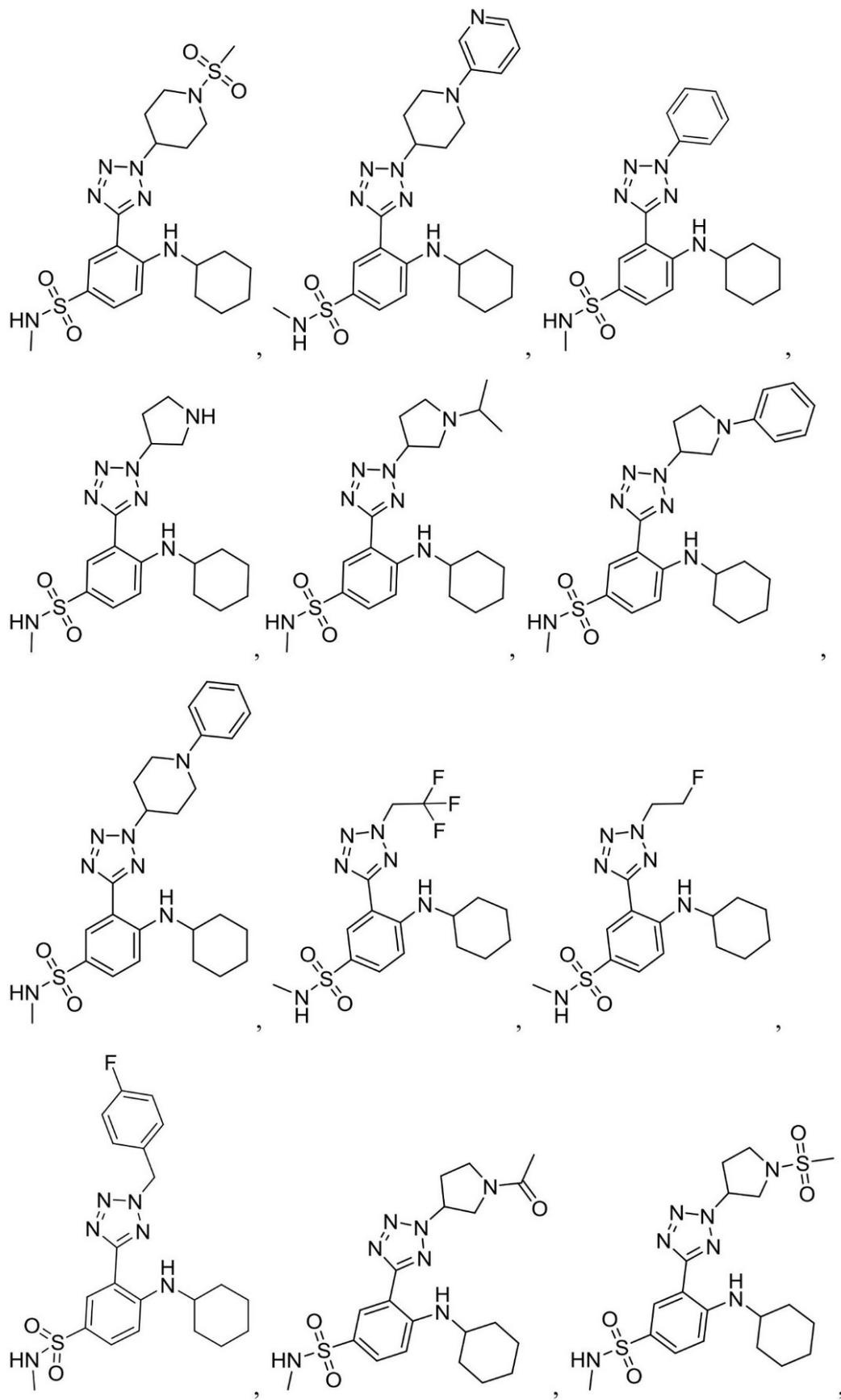
【化 1 8 】



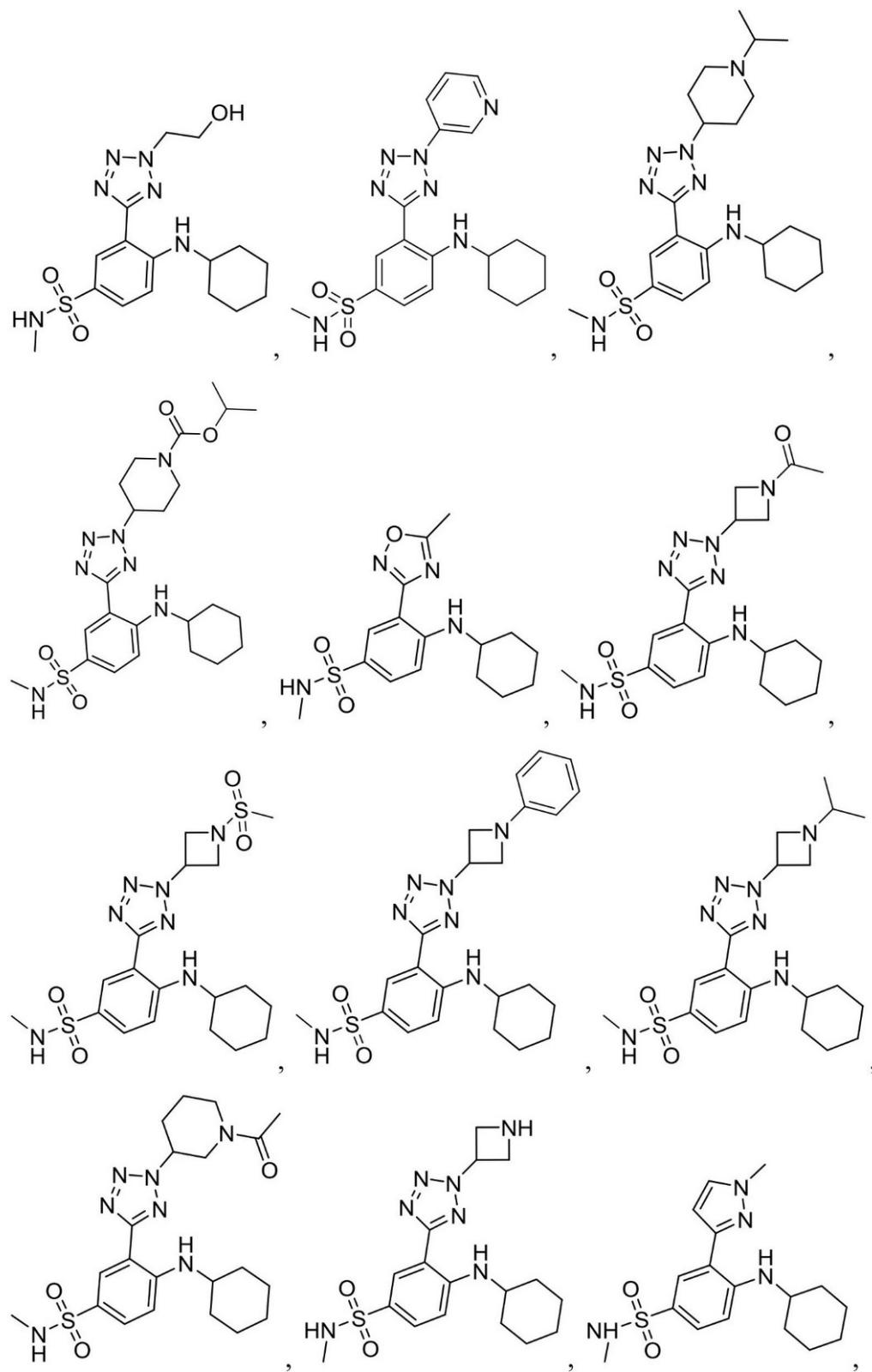
【化 19】



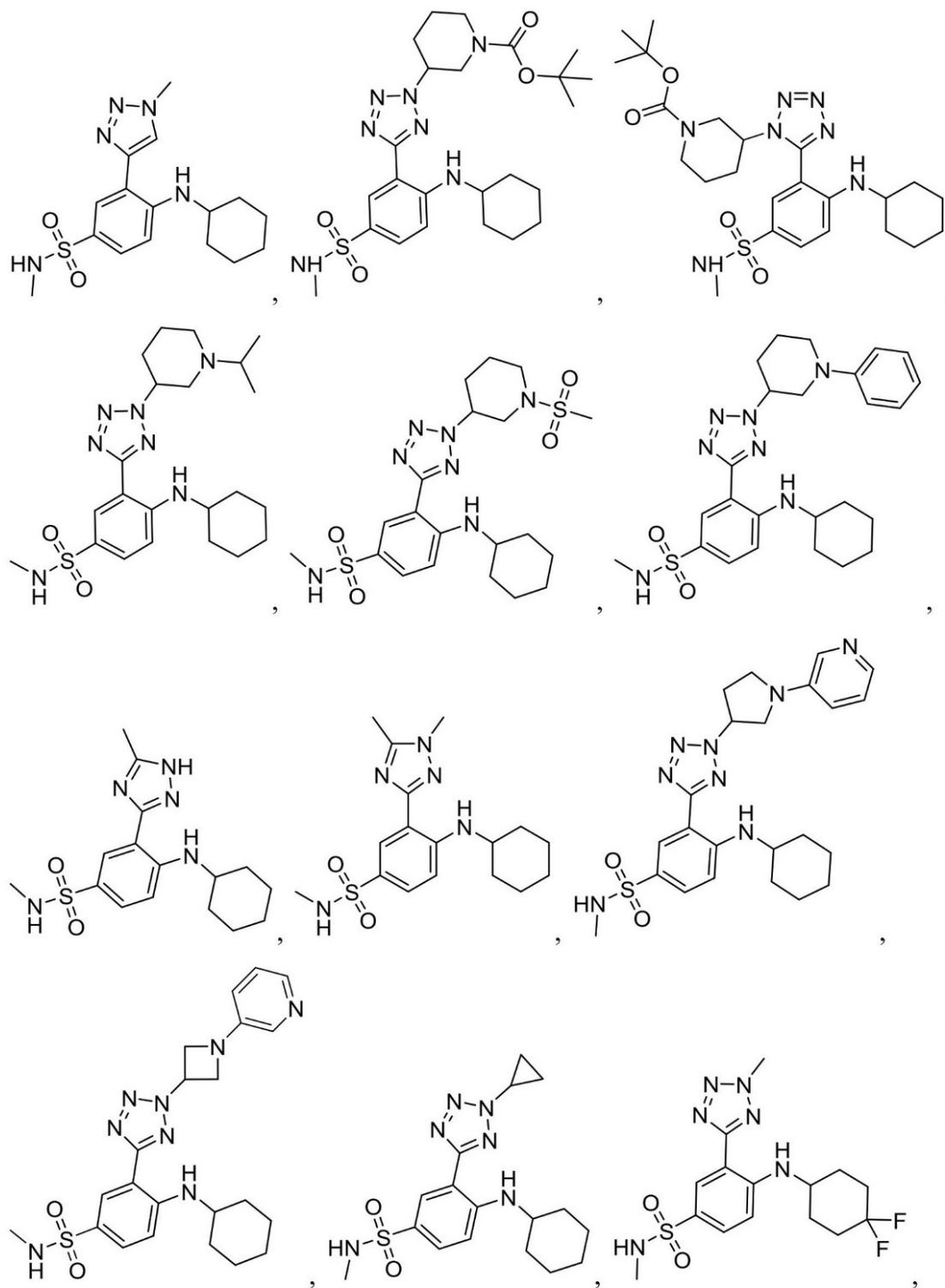
【化 2 0】



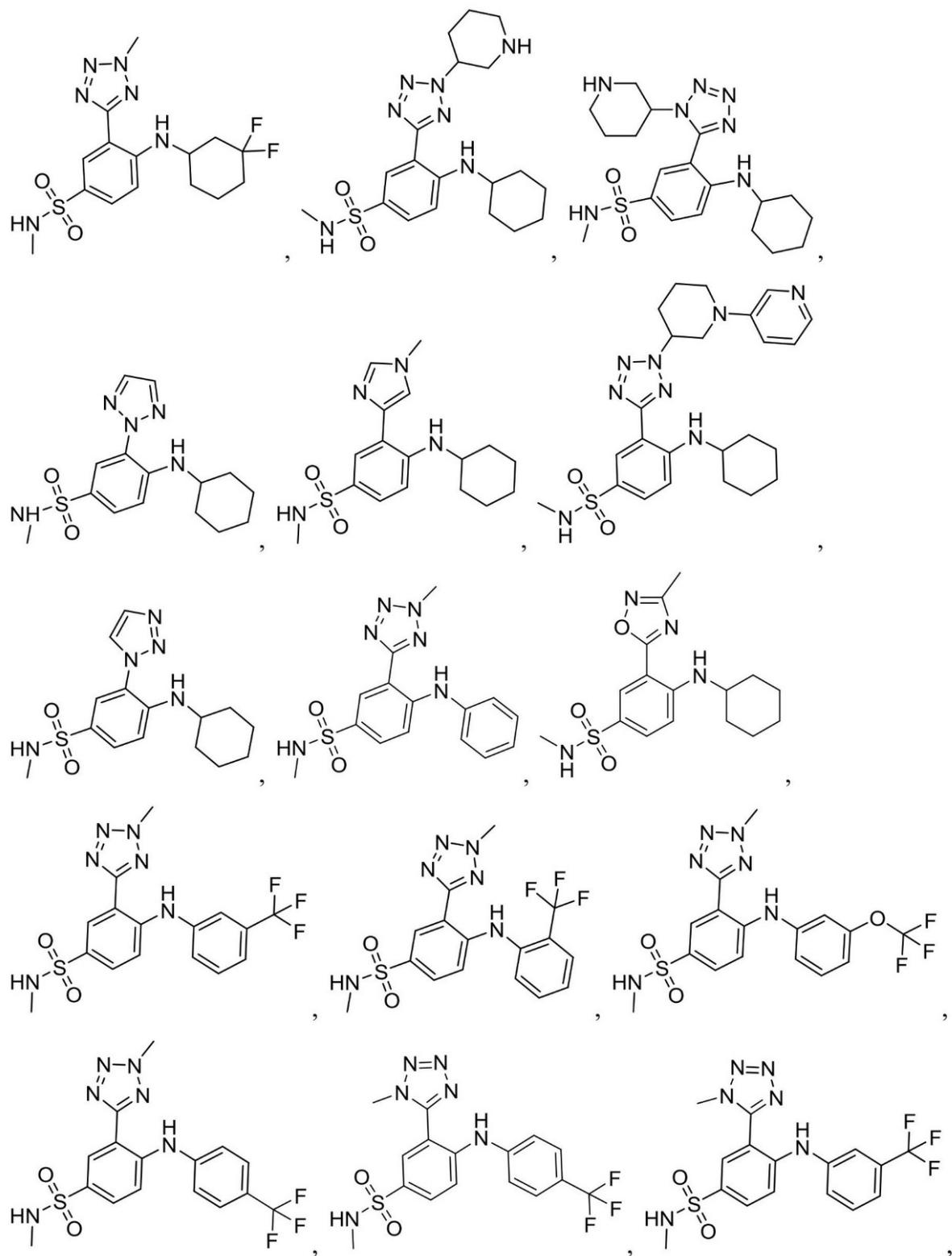
【化 2 1】



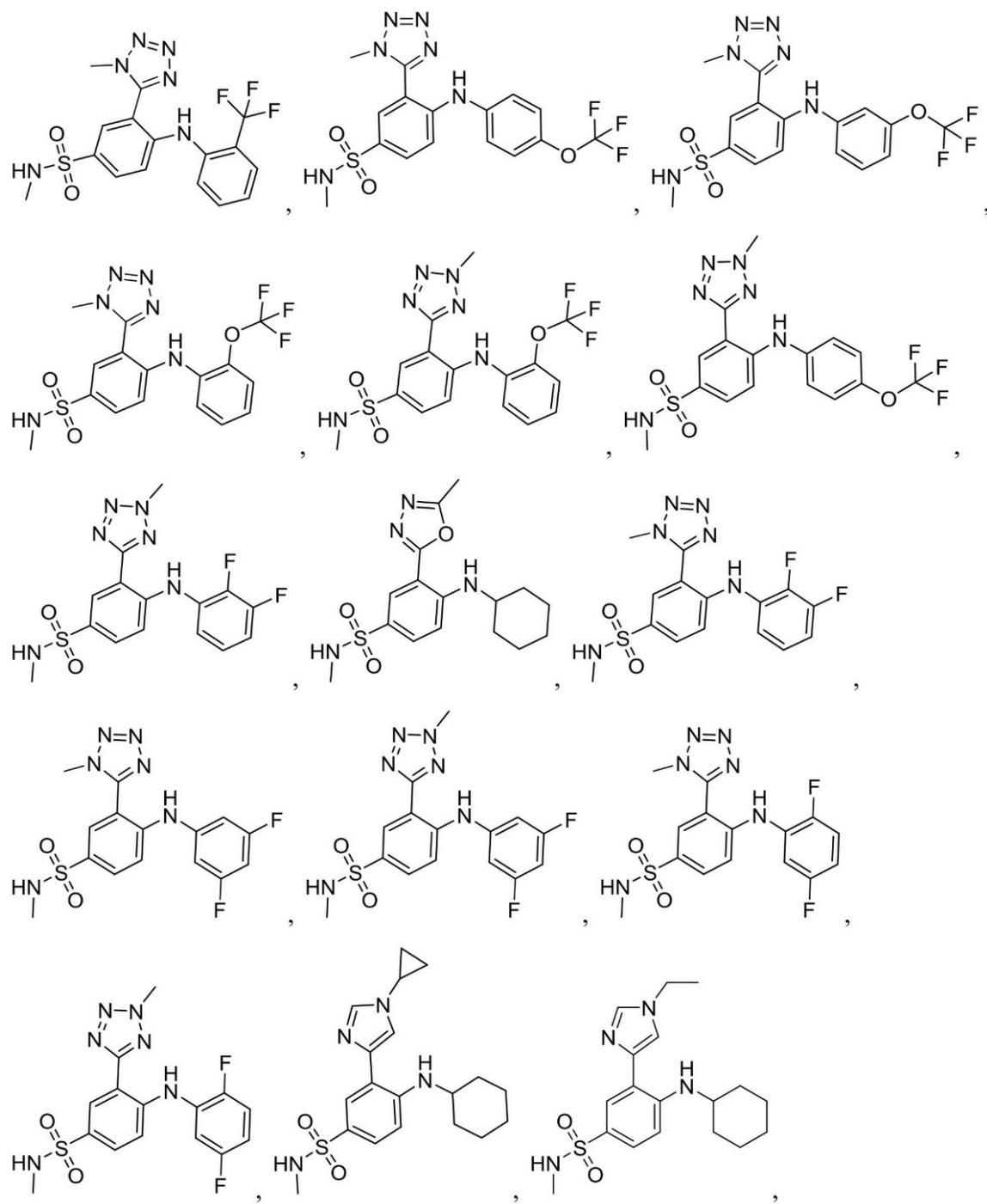
【化 2 2】



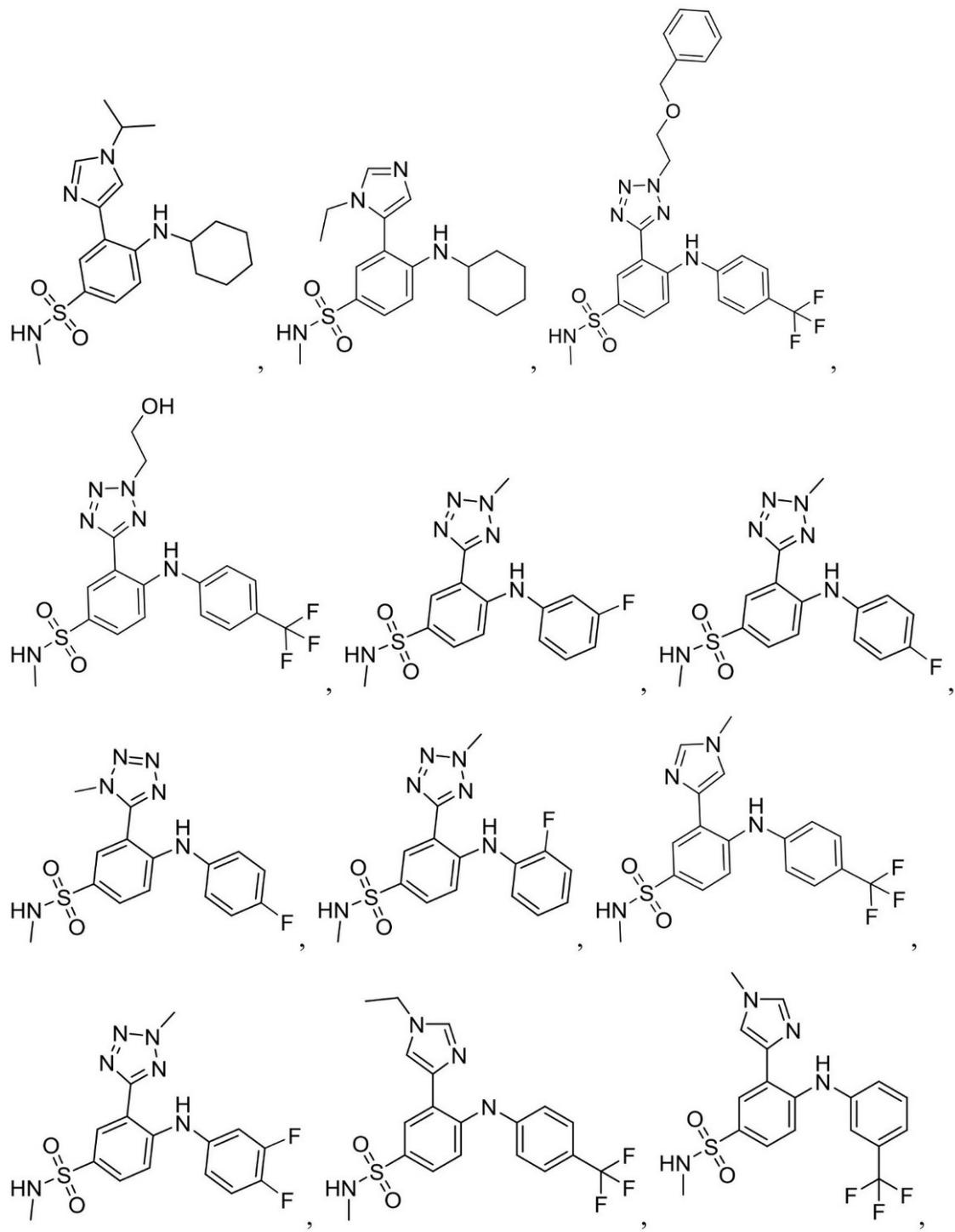
【化 2 3】



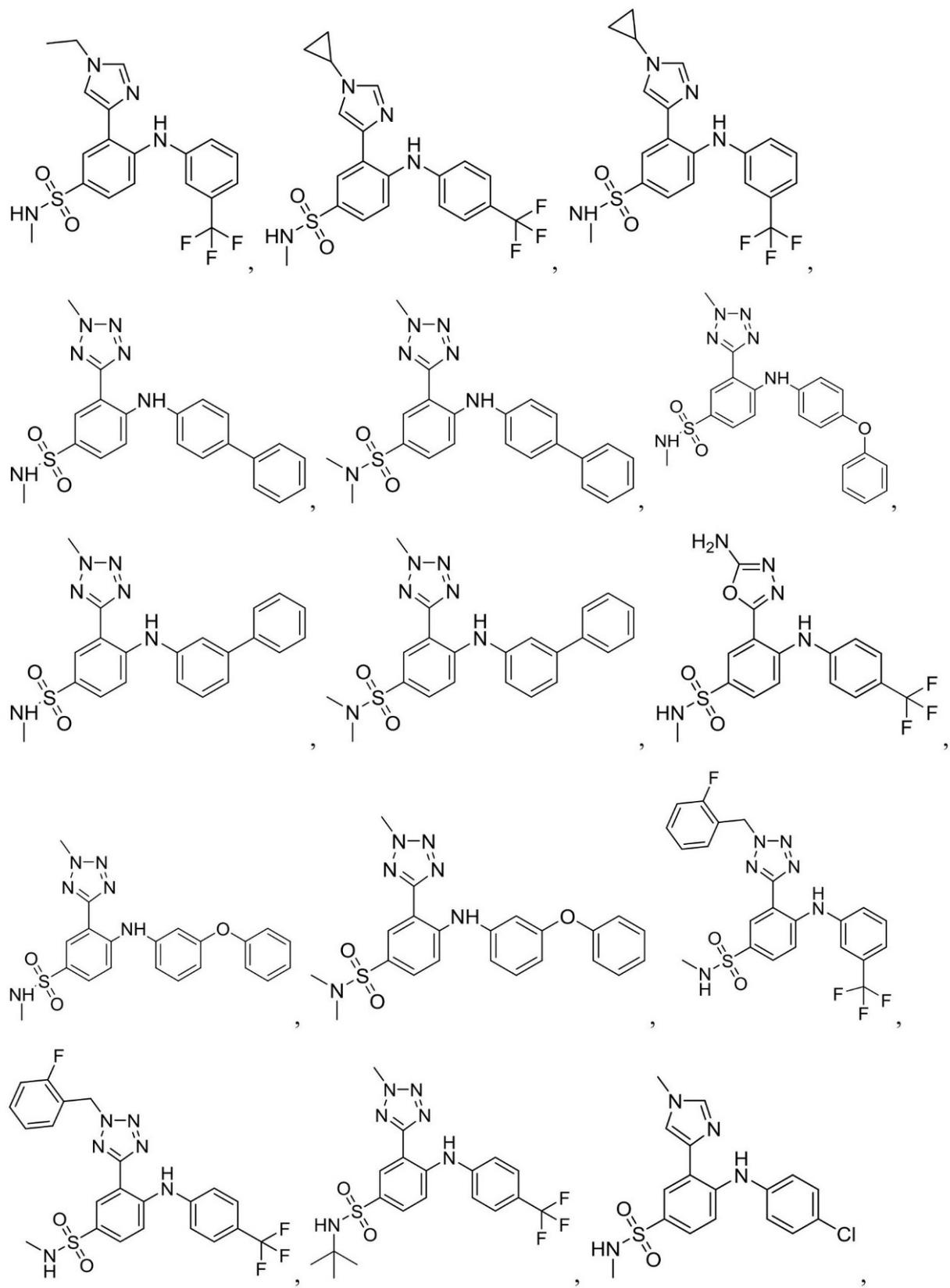
【化 2 4】



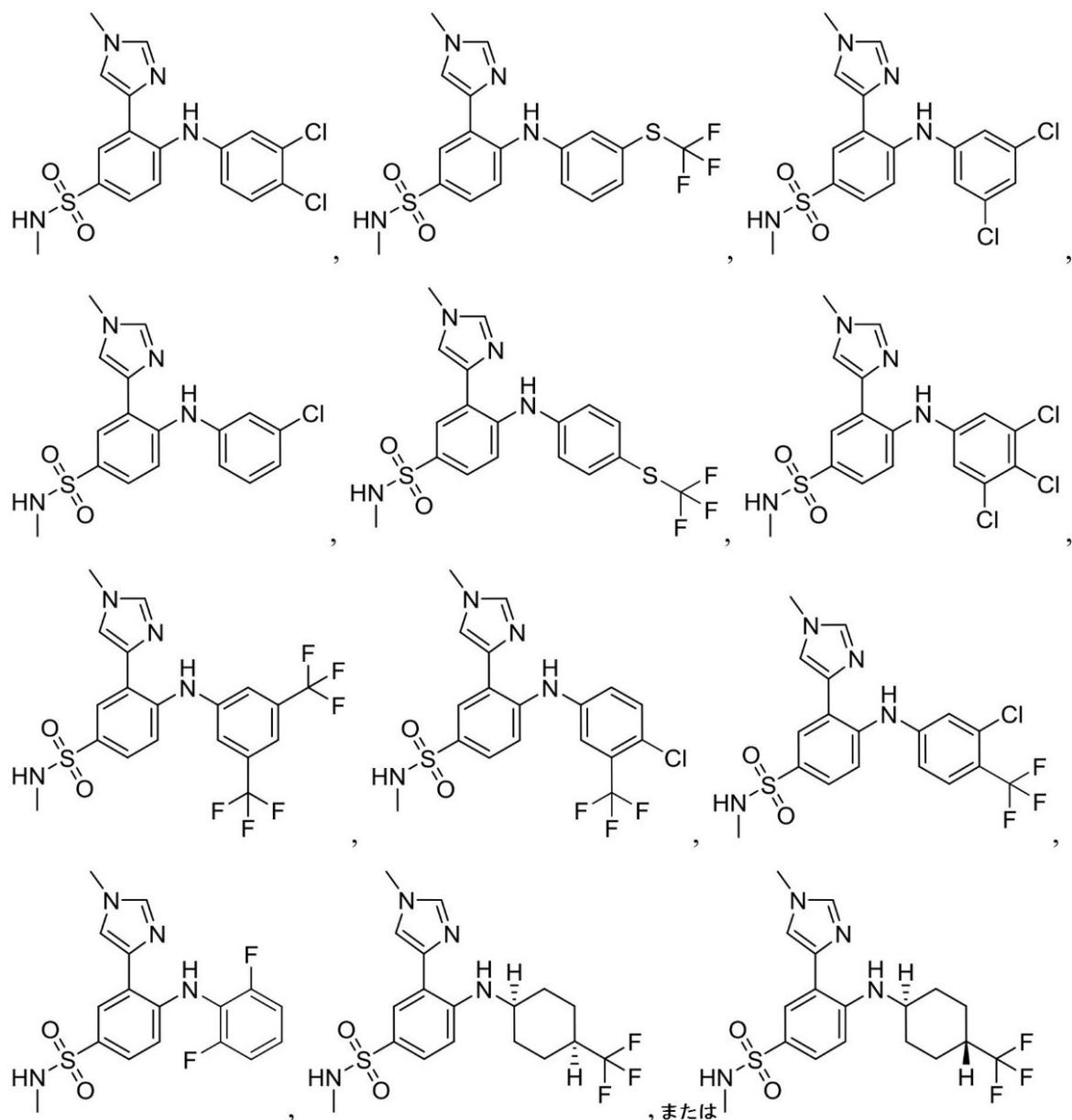
【化 2 5 】



【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。