

【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7年6月20日(2025.6.20)

【国際公開番号】WO2022/265993

【公表番号】特表2024-522192(P2024-522192A)

【公表日】令和6年6月11日(2024.6.11)

【年通号数】公開公報(特許)2024-107

【出願番号】特願2023-576007(P2023-576007)

【国際特許分類】

10

C 0 7 D 3 0 7 / 8 1 ( 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 P 3 5 / 0 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 D 4 0 5 / 1 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 4 4 3 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 3 4 3 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 4 5 2 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 4 0 3 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 5 0 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

20

C 0 7 D 4 0 9 / 1 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 3 8 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 4 1 5 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 D 4 0 5 / 1 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 4 9 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 D 4 0 7 / 1 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 D 4 1 3 / 1 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 1 7 / 1 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 4 2 7 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

30

A 6 1 K 3 1 / 3 8 1 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 4 1 ( 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 / 5 4 1 ( 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 8 7 / 0 4 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 5 1 9 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

C 0 7 D 4 9 8 / 1 0 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 4 1 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 4 1 7 8 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

40

C 0 7 D 4 7 1 / 0 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 0 3 / 1 2 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 4 9 8 5 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

A 6 1 K 3 1 / 4 4 3 6 ( 2 0 0 6 . 0 1 )

【 F I 】

C 0 7 D 3 0 7 / 8 1

A 6 1 P 4 3 / 0 0 1 1 1

A 6 1 P 3 5 / 0 0

A 6 1 P 3 5 / 0 2

50

C 0 7 D 4 0 5 / 1 2	C S P	
A 6 1 K 3 1 / 4 4 3		
A 6 1 K 3 1 / 3 4 3		
A 6 1 K 3 1 / 4 5 2 5		
A 6 1 K 3 1 / 4 0 3 5		
A 6 1 K 3 1 / 5 0 6		
C 0 7 D 4 0 9 / 1 2		
A 6 1 K 3 1 / 3 8 2		
A 6 1 K 3 1 / 4 1 5 5		
C 0 7 D 4 0 5 / 1 4		10
A 6 1 K 3 1 / 4 9 6		
C 0 7 D 4 0 7 / 1 2		
C 0 7 D 4 1 3 / 1 4		
A 6 1 K 3 1 / 5 3 7 7		
C 0 7 D 4 1 7 / 1 2		
A 6 1 K 3 1 / 4 2 7		
A 6 1 K 3 1 / 3 8 1		
A 6 1 K 3 1 / 4 1		
C 0 7 D 4 9 1 / 1 0 7		
A 6 1 K 3 1 / 5 4 1		20
C 0 7 D 4 1 7 / 1 4		
C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 1 4 2		
A 6 1 K 3 1 / 5 1 9		
C 0 7 D 4 9 8 / 1 0		
A 6 1 K 3 1 / 4 1 6		
A 6 1 K 3 1 / 4 1 7 8		
C 0 7 D 4 7 1 / 0 4 1 0 1		
C 0 7 D 4 0 9 / 1 4		
C 0 7 D 4 0 3 / 1 2		
C 0 7 D 4 8 7 / 0 4 1 4 0		30
A 6 1 K 3 1 / 4 9 8 5		
A 6 1 K 3 1 / 4 4 3 6		

【手続補正書】

【提出日】令和7年6月12日(2025.6.12)

【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】

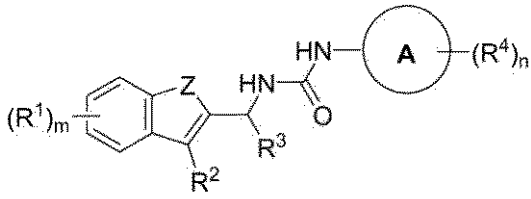
40

【特許請求の範囲】

【請求項1】

式(I)の化合物：

## 【化 1】



10

またはその医薬として許容される塩であって、式中、

Zが、Oまたは $\text{NR}^x$ であり、

$\text{R}^x$ が、水素、C1～C6アルキル、またはC3～C6シクロアルキルであり、

各 $\text{R}^1$ が独立して、ハロゲン、ヒドロキシル、シアノ、ヒドロキシルにより任意選択で置換されるC1～C6アルキル、及びC3～C6シクロアルキルから選択され、

mが、0、1、2、または3であり、

$\text{R}^2$ が、ハロゲン、ヒドロキシル、ヒドロキシルにより任意選択で置換されるC1～C6アルキル、C1～C6ハロアルキル、または1つもしくは2つのフルオロにより任意選択で置換されるC3～C6シクロアルキルであり、

$\text{R}^3$ が、C1～C6アルキル、C1～C6ハロアルキル、またはフルオロ及びC1～C6アルキルから独立して選択される1つもしくは2つの置換基により任意選択で置換されるC3～C6シクロアルキルであり、

20

環Aが、6～10員アリアル、C3～C8シクロアルキル、5～10員ヘテロアリアル、または4～10員ヘテロシクリルであり、

各 $\text{R}^4$ が独立して、

(i) ハロゲン、

(ii) 1つもしくは2つのヒドロキシルもしくは $-\text{NR}^A\text{R}^B$ により任意選択で置換されるC1～C6アルキル、

(iii) ヒドロキシル及びC3～C6シクロアルキルから独立して選択される1～2つの置換基により任意選択で置換されるC1～C6アルコキシ、

30

(iv) C1～C6ハロアルキル、

(v) ヒドロキシル、

(vi) シアノ、

(vii)  $-\text{CO}_2\text{H}$ 、

(viii)  $-\text{NR}^A\text{R}^B$ 、

(ix)  $=\text{NR}^A_2$ 、

(x)  $-\text{C}(=\text{O})\text{NR}^C\text{R}^D$ 、

(xi)  $-\text{SO}_2(\text{NR}^E\text{R}^F)$ 、

(xii)  $-\text{SO}_2(\text{C1～C6アルキル})$ 、

(xiii)  $-\text{S}(=\text{O})(=\text{NH})(\text{C1～C6アルキル})$ 、

40

(xiv)  $-\text{C}(=\text{O})(\text{C1～C6アルキル})$ 、

(xv)  $-\text{CO}_2(\text{C1～C6アルキル})$ 、

(xvi) C1～C6アルキルにより任意選択で置換される5～6員ヘテロアリアル、

(xvii) 1つまたは2つの独立して選択される $\text{R}^G$ により任意選択で置換される3～9員ヘテロシクリル、ならびに

(xviii) 1つまたは2つの独立して選択される $\text{R}^G$ により任意選択で置換される3～6員シクロアルキルからなる群から選択され、

nが、0、1、または2であり、

各 $\text{R}^A$ 、 $\text{R}^{A1}$ 、 $\text{R}^B$ 、 $\text{R}^{B1}$ 、 $\text{R}^C$ 、 $\text{R}^{C1}$ 、 $\text{R}^D$ 、 $\text{R}^{D1}$ 、 $\text{R}^E$ 、及び $\text{R}^F$ が独立して、

50

- ( i ) 水素、
- ( i i ) ヒドロキシル、
- ( i i i ) 4 ~ 6 員ヘテロシクリル、
- ( i v ) C 1 ~ C 6 ハロアルキル、
- ( v ) - C ( = O ) ( C 1 ~ C 6 アルキル )、
- ( v i ) - C ( = O ) O ( C 1 ~ C 6 アルキル )、
- ( v i i ) - S O <sub>2</sub> ( C 1 ~ C 6 アルキル )、
- ( v i i i ) ヒドロキシルにより任意選択で置換される 3 ~ 6 員シクロアルキル、また

は

( i x ) ヒドロキシル、 - C ( = O ) N R <sup>B 2</sup> R <sup>C 2</sup>、 5 ~ 6 員ヘテロアリール、 3 ~ 6 員シクロアルキル、 - S O <sub>2</sub> ( C 1 ~ C 6 アルキル )、 - C O <sub>2</sub> H、 及び - S O <sub>2</sub> ( N H <sub>2</sub> ) から独立して選択される 1 ~ 2 つの置換基により任意選択で置換される C 1 ~ C 6 アルキルであるか、あるいは

10

R <sup>C</sup> 及び R <sup>D</sup> が、それらに結合している窒素原子と一緒に、ヒドロキシル、ハロゲン、 - C ( = O ) N R <sup>B 1</sup> R <sup>C 1</sup>、 - S O <sub>2</sub> ( C 1 ~ C 6 アルキル )、 - C O <sub>2</sub> H、 ヒドロキシルにより任意選択で置換される C 1 ~ C 6 アルキル、 C 1 ~ C 6 アルコキシ、 及び C 1 ~ C 6 ハロアルコキシから独立して選択される 1 ~ 2 つの置換基により任意選択で置換される、 4 ~ 10 員ヘテロシクリルを形成し、

各 R <sup>A 2</sup>、 R <sup>B 2</sup>、 及び R <sup>C 2</sup> が独立して、水素または C 1 ~ C 6 アルキルであり、

各 R <sup>G</sup> が独立して、フルオロ、シアノ、ヒドロキシル、ヒドロキシルにより任意選択で置換される C 1 ~ C 6 アルキル、 C 1 ~ C 6 アルコキシ、 - N R <sup>A 1</sup> R <sup>B 1</sup>、 = N R <sup>A 2</sup>、 - C ( = O ) N R <sup>C 1</sup> R <sup>D 1</sup>、 - C O <sub>2</sub> ( C 1 ~ C 6 アルキル )、 C 1 ~ C 6 ハロアルキル、 C 3 ~ C 6 シクロアルキル、 C 1 ~ C 6 ハロアルコキシ、 - S O <sub>2</sub> ( C 1 ~ C 6 アルキル )、 及び - C O <sub>2</sub> H からなる群から選択され、

20

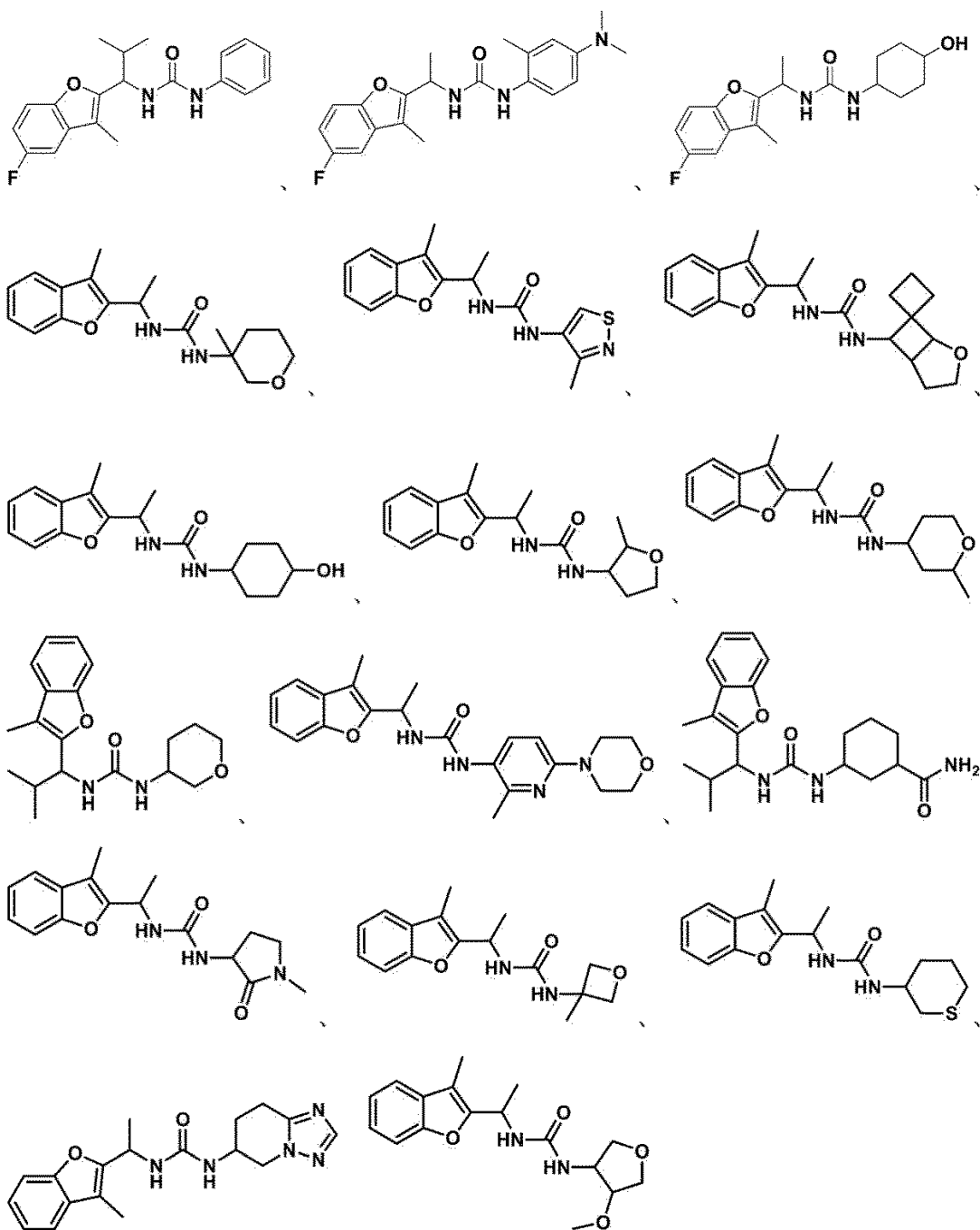
ここで、前記化合物が、

30

40

50

【化 2】



10

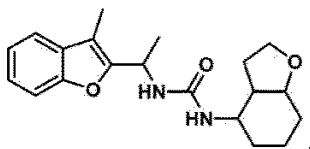
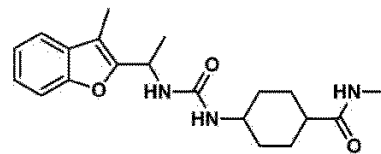
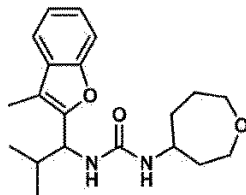
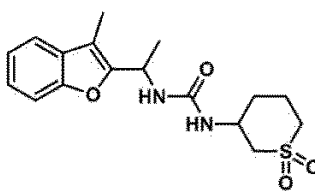
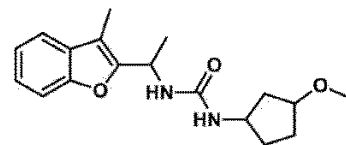
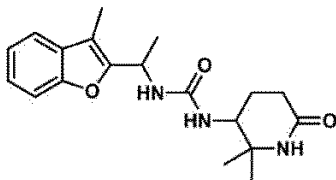
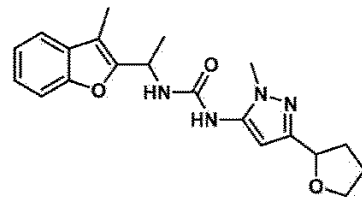
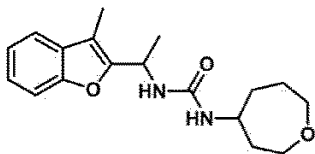
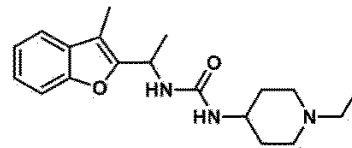
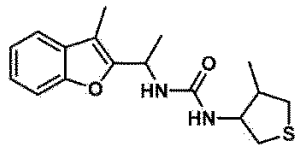
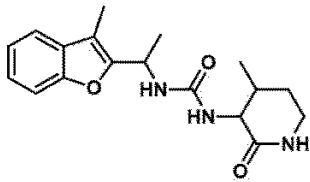
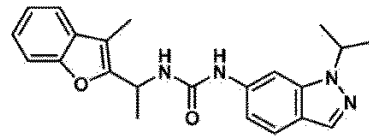
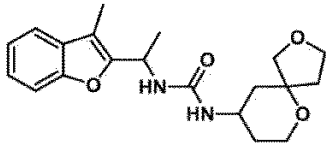
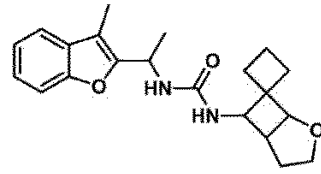
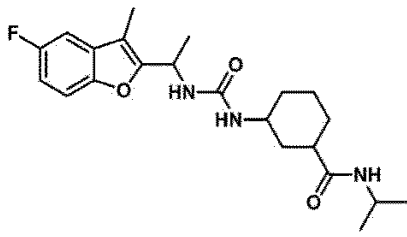
20

30

40

50





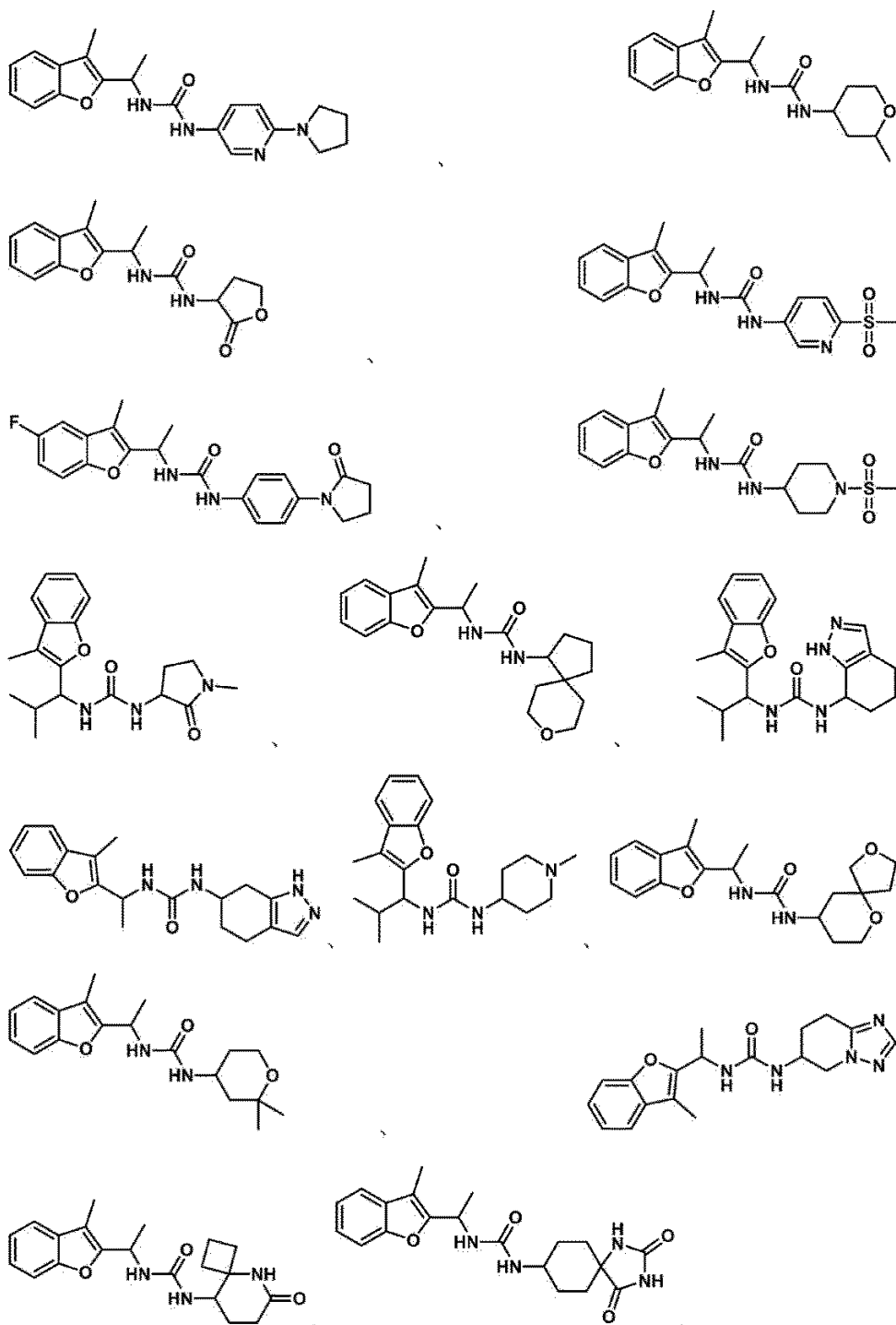
10

20

30

40

50



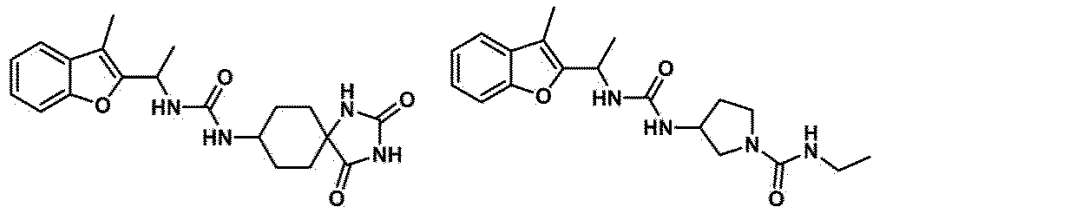
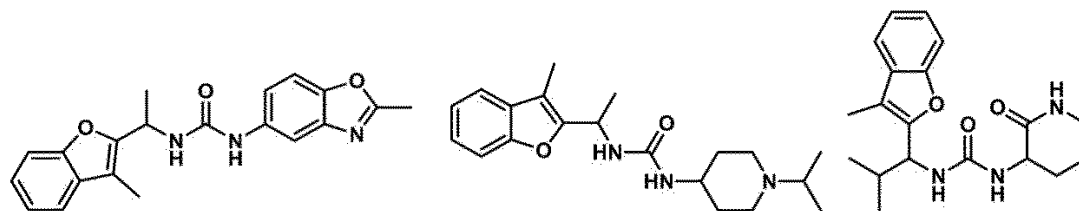
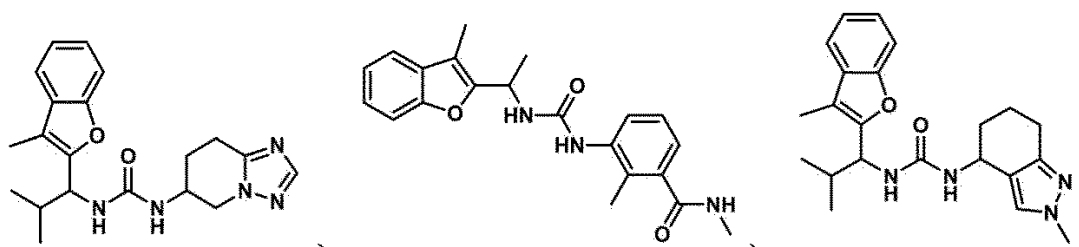
10

20

30

40

50



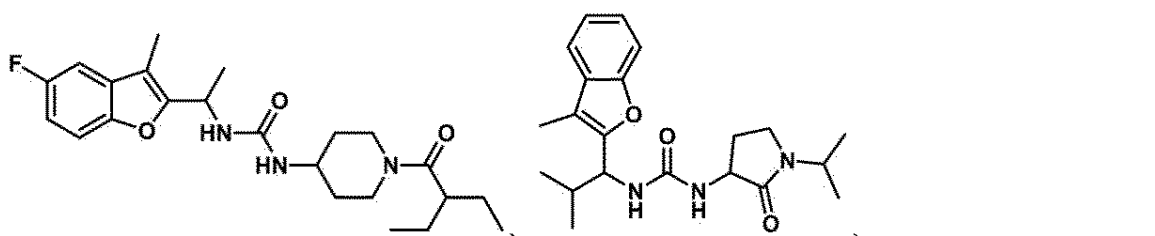
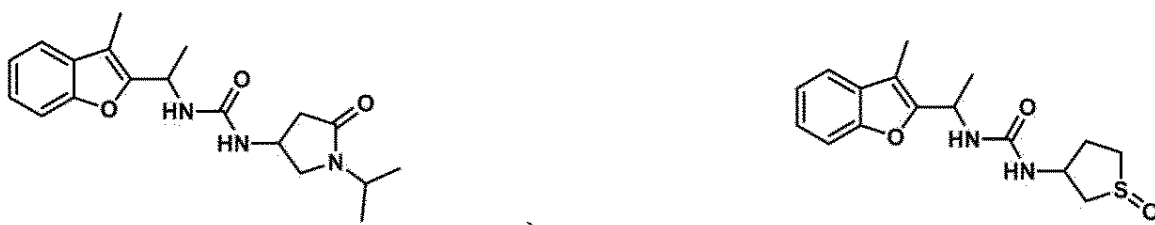
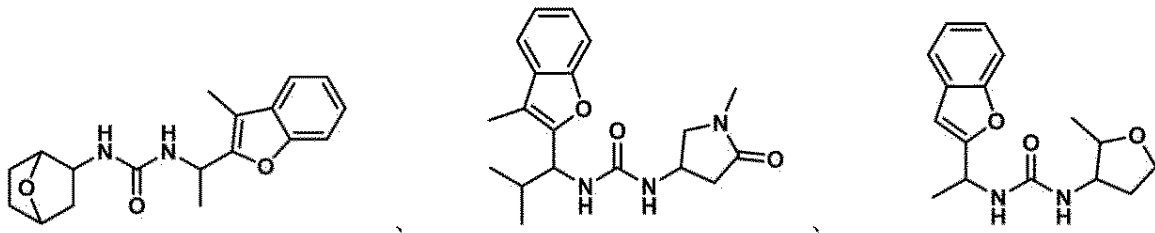
10

20

30

40

50



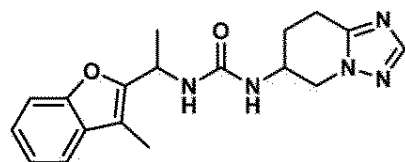
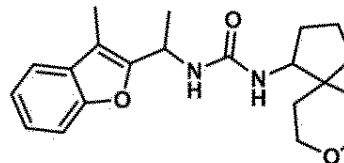
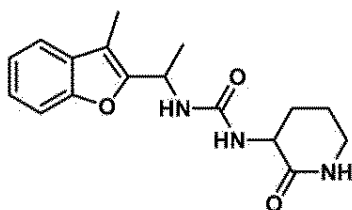
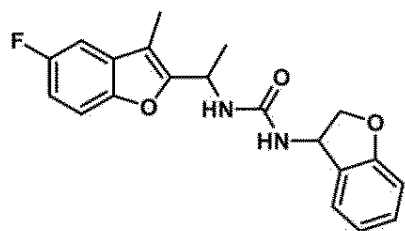
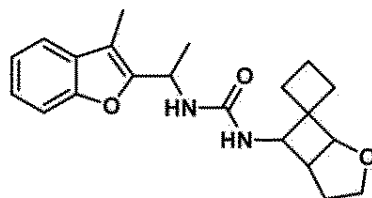
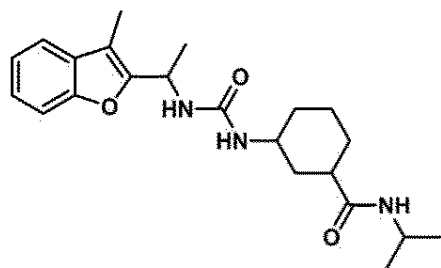
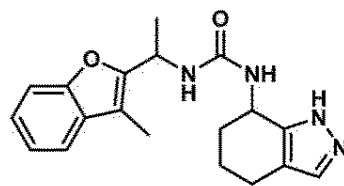
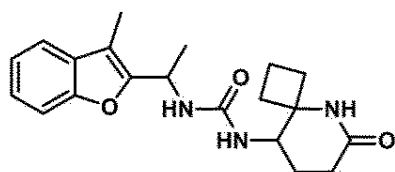
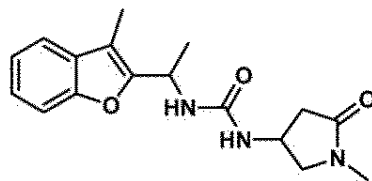
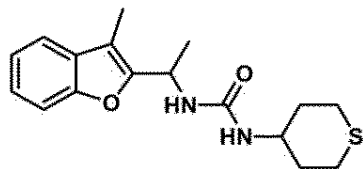
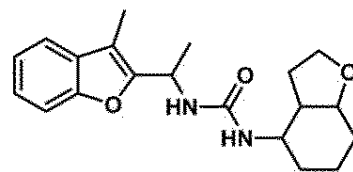
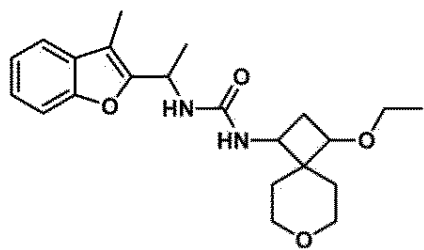
10

20

30

40

50



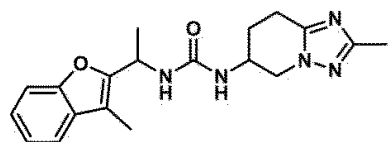
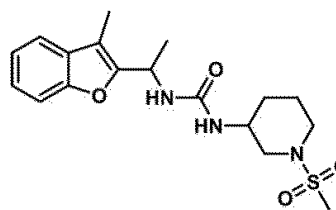
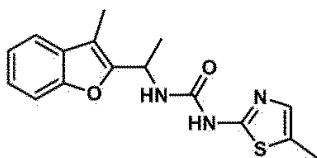
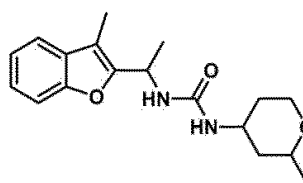
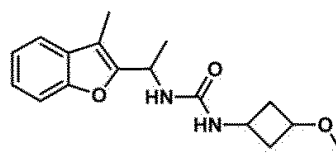
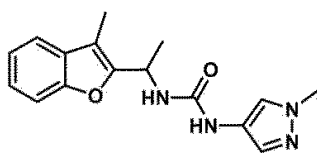
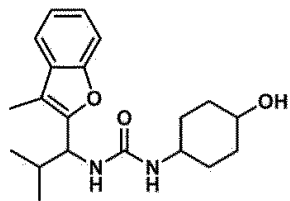
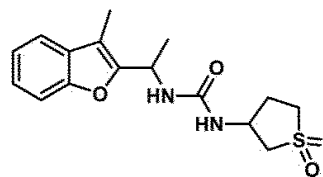
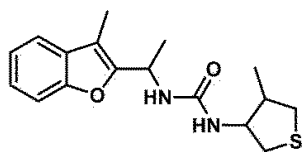
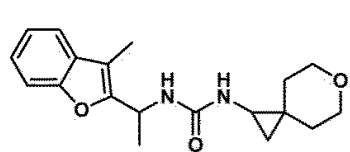
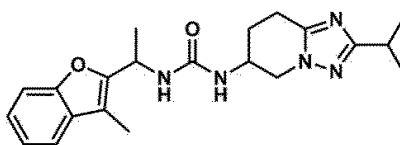
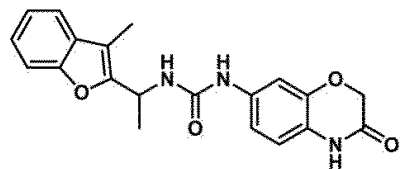
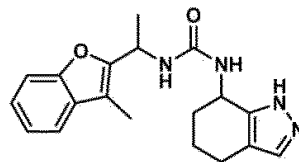
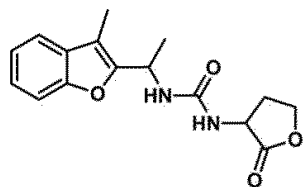
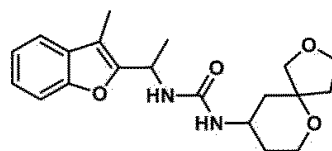
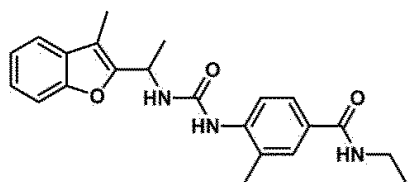
10

20

30

40

50



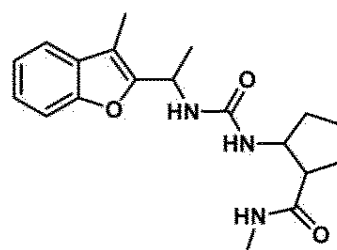
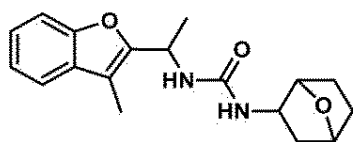
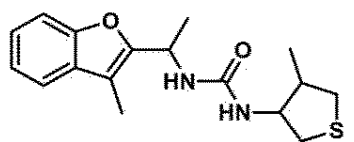
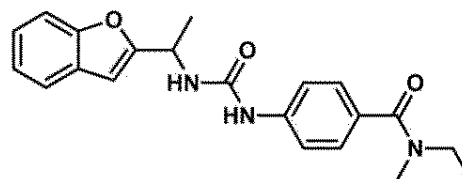
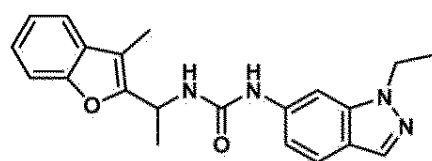
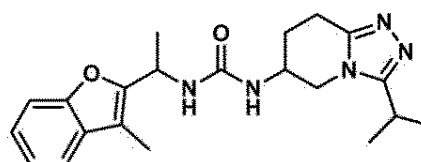
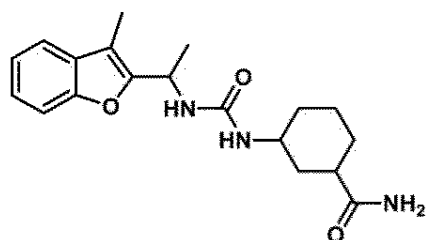
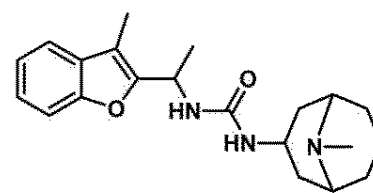
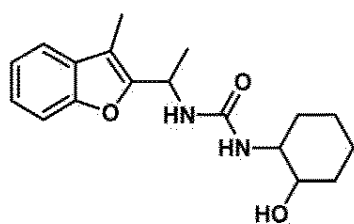
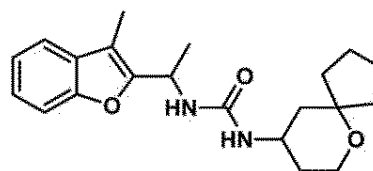
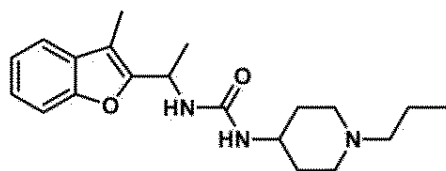
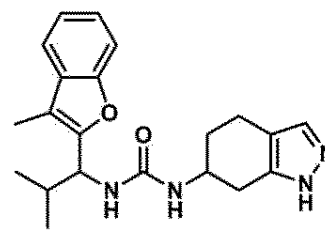
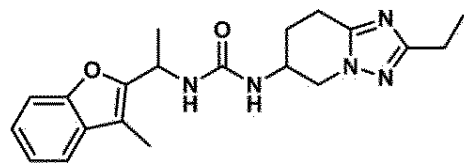
10

20

30

40

50



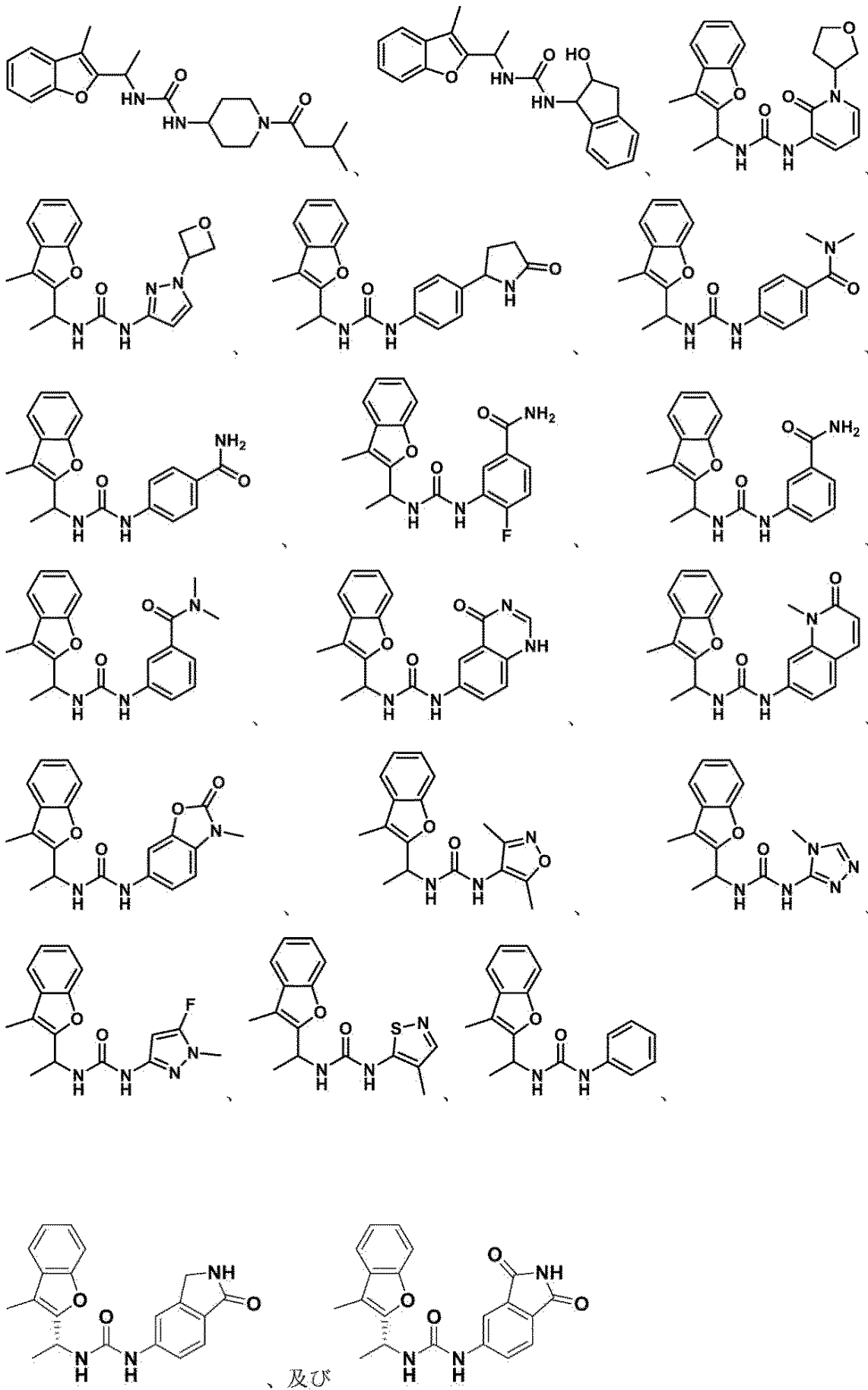
10

20

30

40

50



10

20

30

40

50

、及び

からなる群から選択される化合物ではない、前記化合物、または前記その医薬として許容される塩。

【請求項 2】

m が 2 である、請求項 1 に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩。

【請求項 3】

各 R<sup>1</sup> が、フルオロ及びクロロから選択される、請求項 1 に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩。

【請求項 4】

各 R<sup>1</sup> が、フルオロである、請求項 1 に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩。

10

【請求項 5】

R<sup>2</sup> が、C 1 ~ C 6 アルキルである、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩。

【請求項 6】

R<sup>2</sup> が、メチルである、請求項 5 に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩。

【請求項 7】

R<sup>3</sup> が、C 1 ~ C 6 ハロアルキルである、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩。

【請求項 8】

R<sup>3</sup> が、トリフルオロメチルである、請求項 7 に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩。

20

【請求項 9】

環 A が、ピリミジニル、ピリジル、チアゾリル、チオフェニル、またはピラゾリルである、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩。

【請求項 10】

環 A が、ピリミジニルである、請求項 9 に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩。

【請求項 11】

n が 1 であり、R<sup>4</sup> が、-NR<sup>A</sup>R<sup>B</sup> である、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩。

30

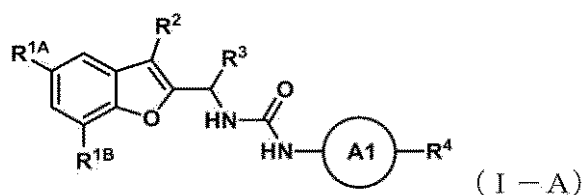
【請求項 12】

Z が、O である、請求項 1 ~ 4 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩。

【請求項 13】

式 (I - A) の化合物：

【化 3】



40

またはその医薬として許容される塩であり、式中、

環 A 1 が、ピリミジニル、ピリジル、またはピラゾリルであり、

R<sup>1A</sup> が、ハロゲンであり、

R<sup>1B</sup> が、ハロゲンであるか、または不在であり、

50

$R^2$  が、 $C1 \sim C6$  アルキルまたは  $C1 \sim C6$  ハロアルキルであり、

$R^3$  が、 $C1 \sim C6$  アルキル、 $C1 \sim C6$  ハロアルキル、またはフルオロ及び  $C1 \sim C6$  アルキルから独立して選択される1つもしくは2つの置換基により任意選択で置換される  $C3 \sim C6$  シクロアルキルであり、

$R^4$  が独立して、 $-NR^A R^B$  により任意選択で置換される  $C1 \sim C6$  アルキル、 $C1 \sim C6$  アルコキシ、 $C1 \sim C6$  ハロアルキル、ヒドロキシル、シアノ、 $-CO_2H$ 、 $-NR^A R^B$ 、 $-C(=O)NR^C R^D$ 、 $-SO_2(NR^E R^F)$ 、 $-SO_2(C1 \sim C6$  アルキル)、 $-S(=O)(=NH)(C1 \sim C6$  アルキル)、 $-C(=O)(C1 \sim C6$  アルキル)、 $-CO_2(C1 \sim C6$  アルキル)、 $C1 \sim C6$  アルキルにより任意選択で置換される5~6員ヘテロアリアル、1つまたは2つの独立して選択される  $R^G$  により任意選択で置換される3~6員ヘテロシクリル、及び1つまたは2つの独立して選択される  $R^G$  により任意選択で置換される3~6員シクロアルキルからなる群から選択され、

ここで、 $R^4$  が、尿素部分のN原子に対してパラ位である環A1の位置に結合しており、

各  $R^A$ 、 $R^{A1}$ 、 $R^B$ 、 $R^{B1}$ 、 $R^C$ 、 $R^{C1}$ 、 $R^D$ 、 $R^{D1}$ 、 $R^E$ 、及び  $R^F$  が独立して、水素、4~6員ヘテロシクリル、 $C1 \sim C6$  ハロアルキル、ヒドロキシルにより任意選択で置換される3~6員シクロアルキル、またはヒドロキシル、3~6員シクロアルキル、 $-SO_2(C1 \sim C6$  アルキル)、及び  $-SO_2(NH_2)$  から独立して選択される1~2つの置換基により任意選択で置換される  $C1 \sim C6$  アルキルであるか、あるいは  $R^C$  及び  $R^D$  が、それらに結合している窒素原子と一緒に、4~6員ヘテロシクリルを形成し、

各  $R^G$  が独立して、フルオロ、シアノ、ヒドロキシル、 $C1 \sim C6$  アルキル、 $C1 \sim C6$  アルコキシ、 $-NR^{A1} R^{B1}$ 、 $-C(=O)NR^{C1} R^{D1}$ 、 $-CO_2(C1 \sim C6$  アルキル)、 $C1 \sim C6$  ハロアルキル、 $C3 \sim C6$  シクロアルキル、及び  $-CO_2H$  からなる群から選択される、前記化合物、または前記その医薬として許容される塩。

【請求項14】

$R^{1A}$  及び  $R^{1B}$  が各々、フルオロである、請求項13に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩。

【請求項15】

$R^2$  が  $C1 \sim C6$  アルキルである、請求項13または14に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩。

【請求項16】

$R^2$  がメチルである、請求項15に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩。

【請求項17】

$R^3$  が  $C1 \sim C6$  ハロアルキルである、請求項13または14に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩。

【請求項18】

$R^3$  がトリフルオロメチルである、請求項17に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩。

【請求項19】

環A1が5-ピリミジニル、3-ピリジル、または4-ピラゾリルである、請求項13または14に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩。

【請求項20】

環A1が5-ピリミジニルである、請求項19に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩。

【請求項21】

$R^4$  が  $-NR^A R^B$  である、請求項13または14に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩。

【請求項22】

10

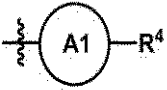
20

30

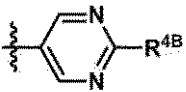
40

50

式：  
【化 4】



が  
【化 5】



であり、式中、 $R^{4B}$ が、 $-NR^A R^B$ 、及び1つの窒素環員を含むと共に1~2つの独立して選択される $R^{G1}$ により任意選択で置換される4~6員ヘテロシクリルから選択され、ここで、 $R^{G1}$ が、フルオロ、ヒドロキシル、及びC1~C6アルキルから選択される、請求項13または14に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩。

【請求項23】

下記表に記載の化合物からなる群から選択される化合物、またはその医薬として許容される塩。

10

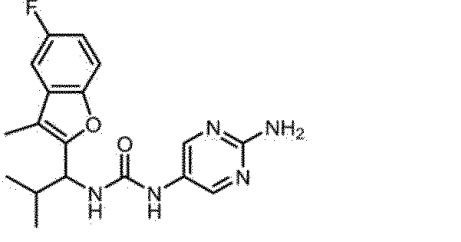
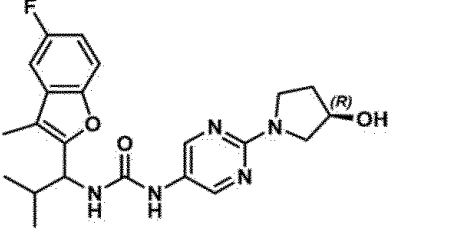
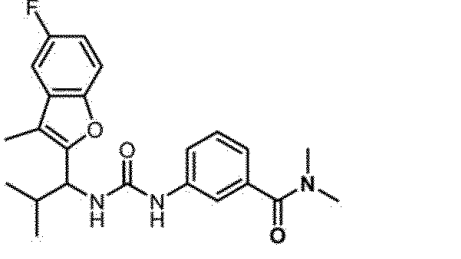
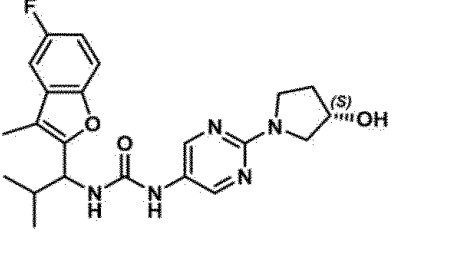
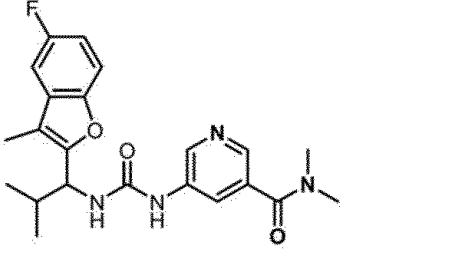
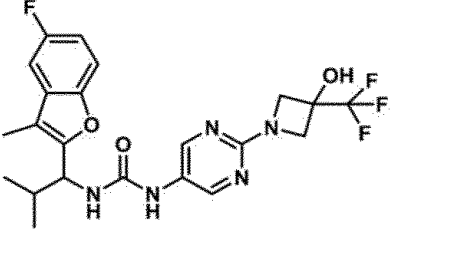
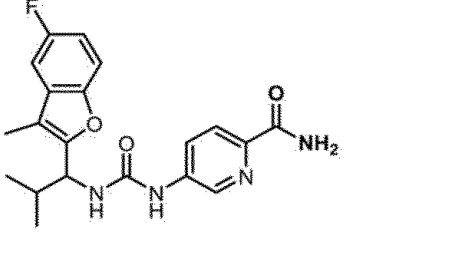
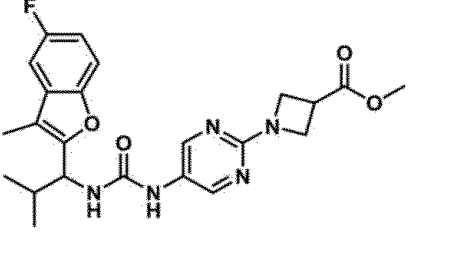
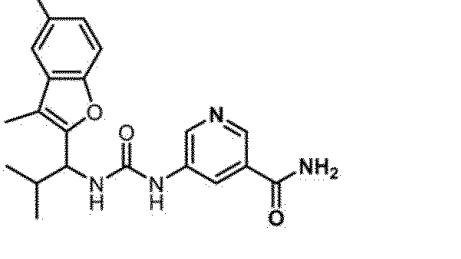
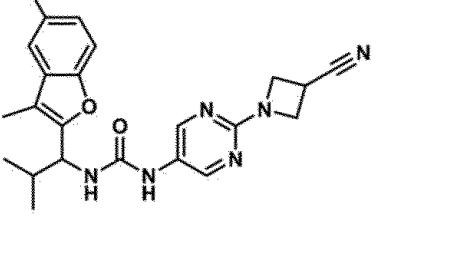
20

30

40

50

【表 1 - 1】

構造	構造
	
	
	
	
	

10

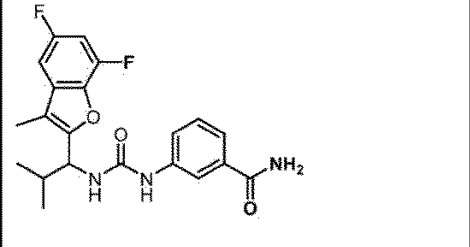
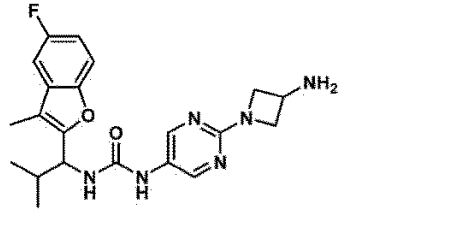
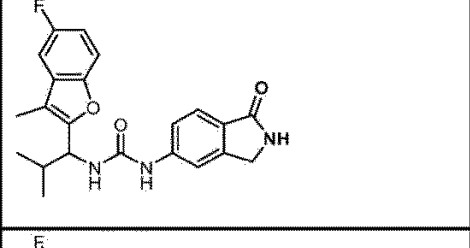
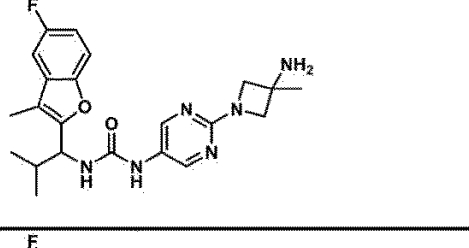
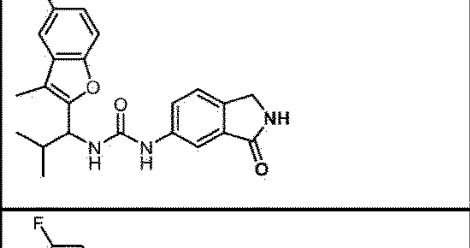
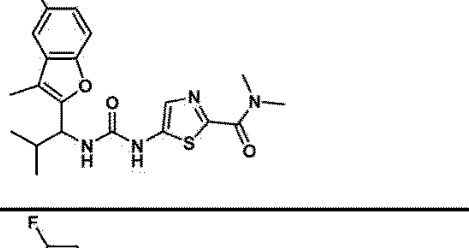
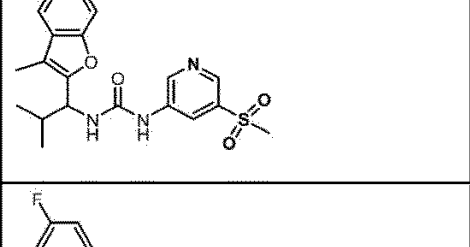
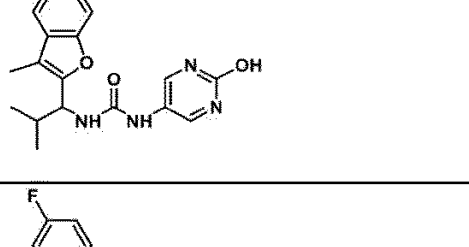
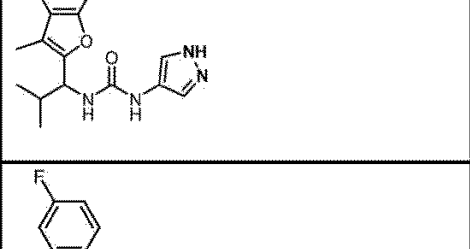
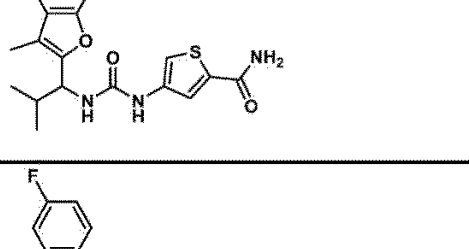
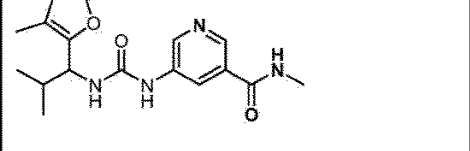
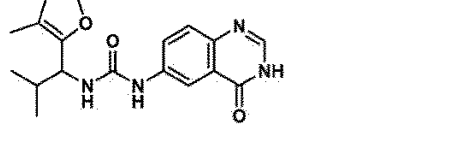
20

30

40

50

【表 1 - 2】

10

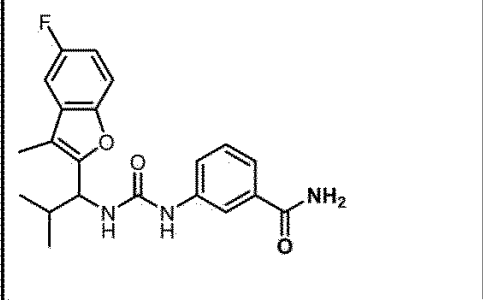
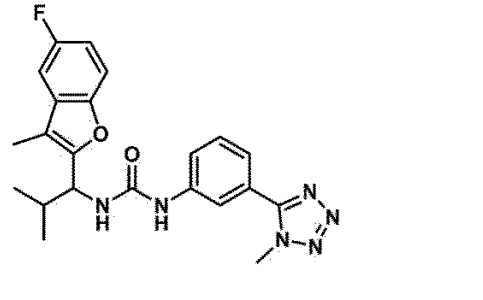
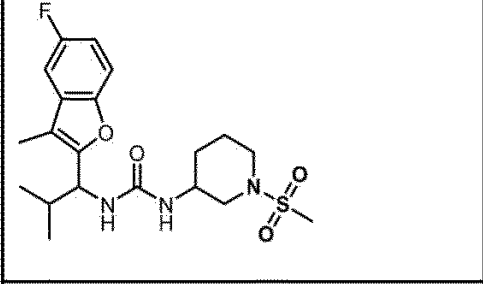
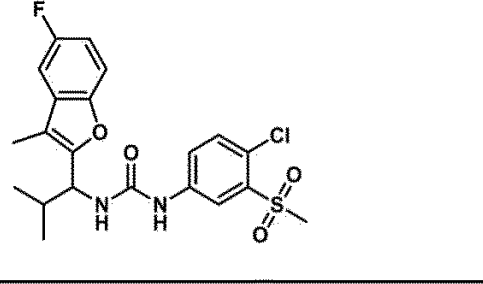
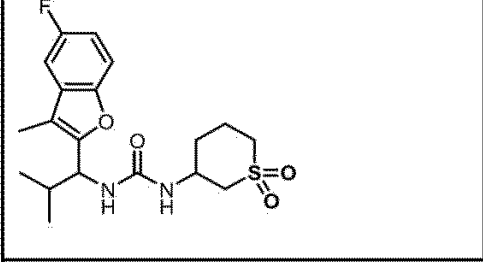
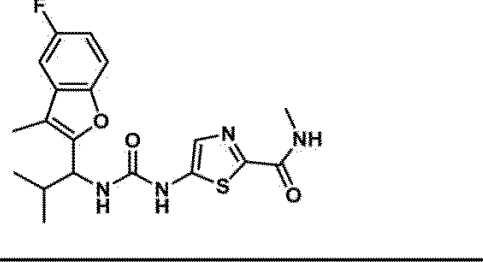
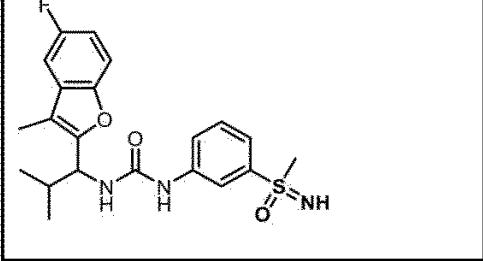
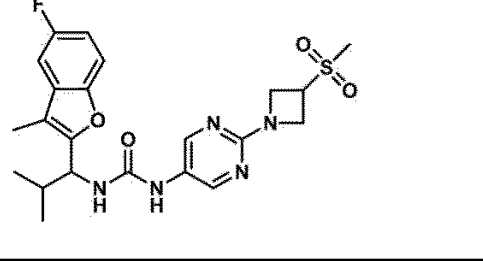
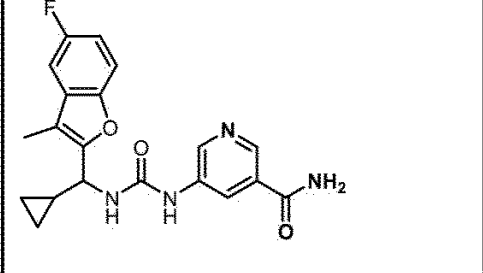
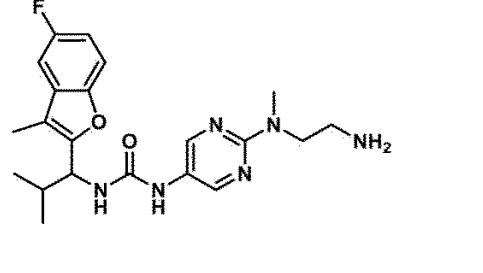
20

30

40

50

【表 1 - 3】

10

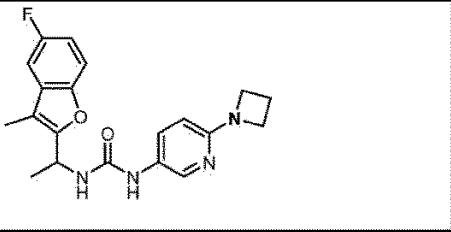
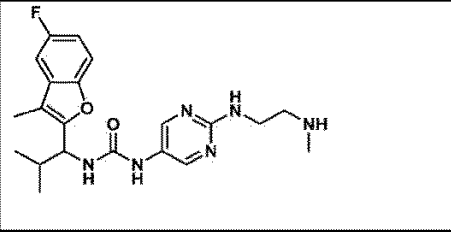
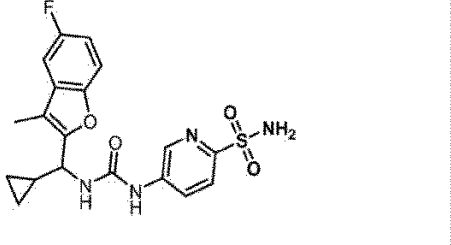
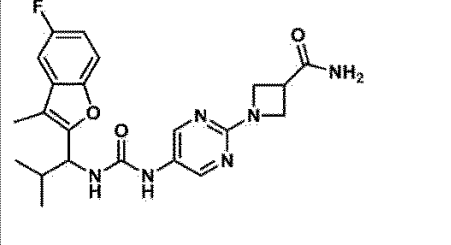
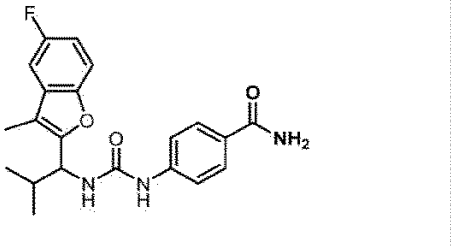
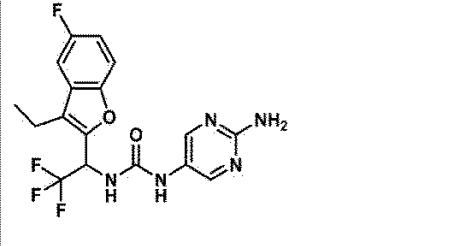
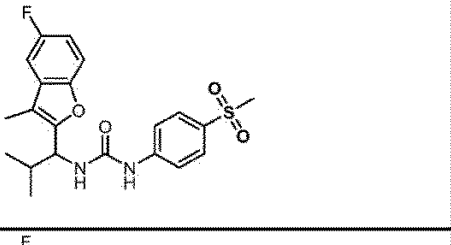
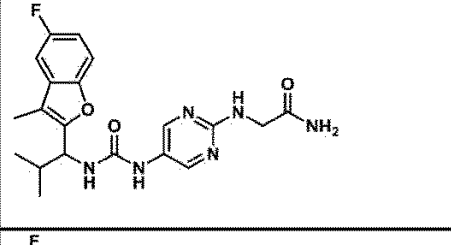
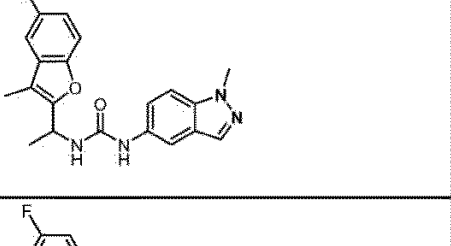
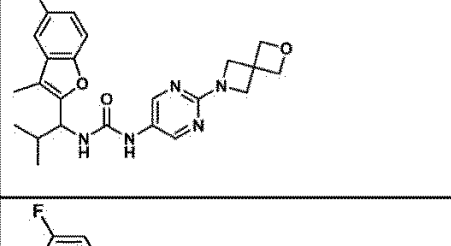
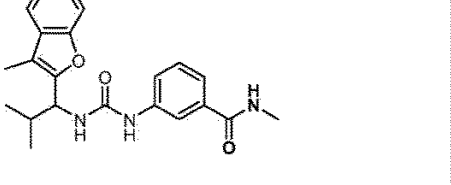
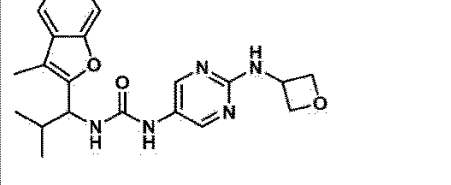
20

30

40

50

【表 1 - 4】

10

20

30

40

50

【表 1 - 5】


10

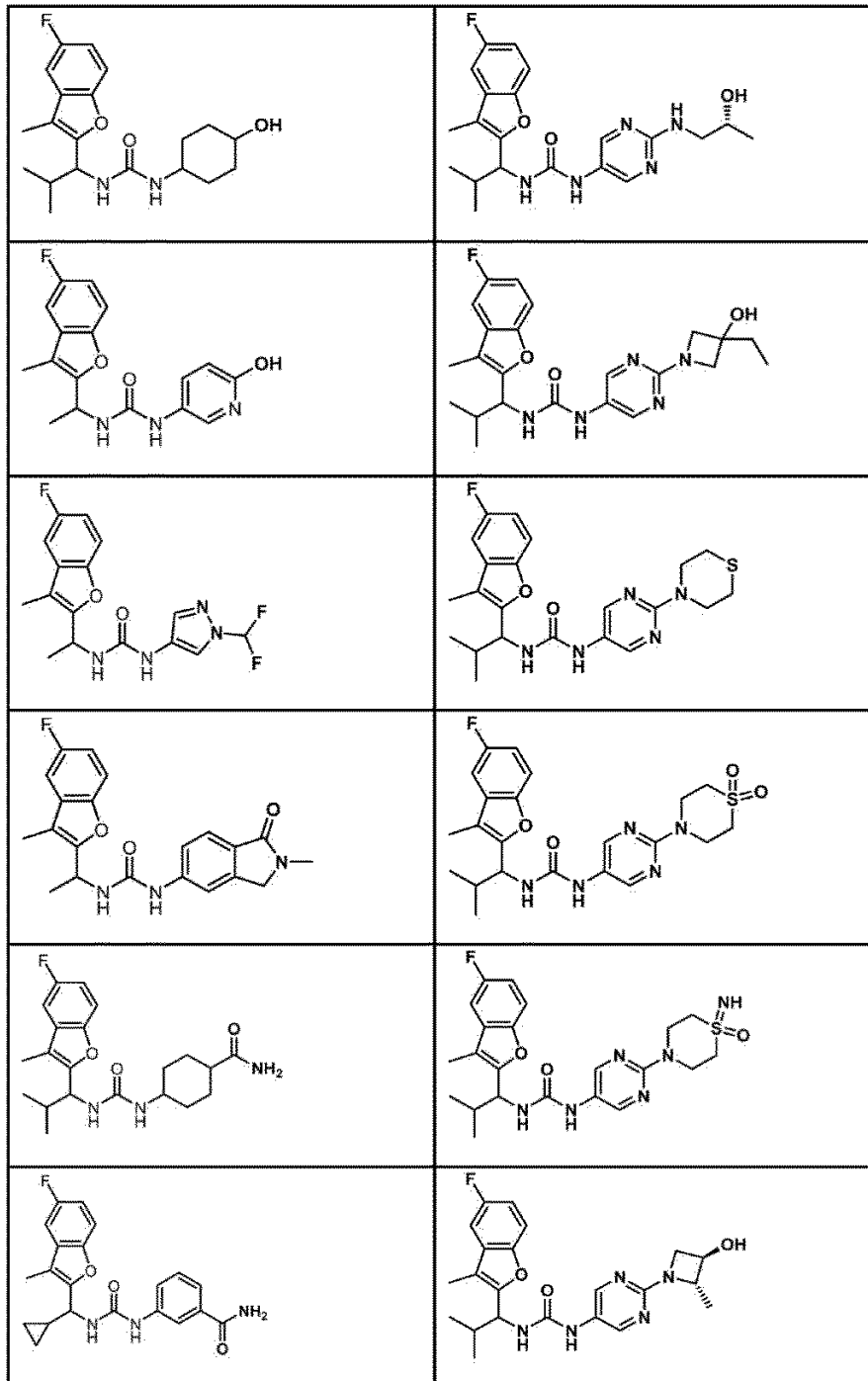
20

30

40

50

【表 1 - 6】



10

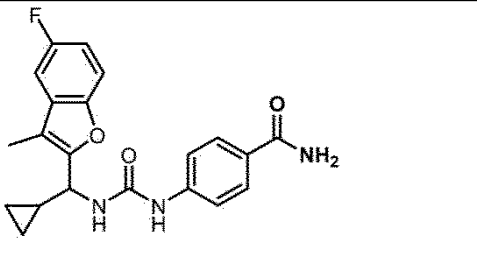
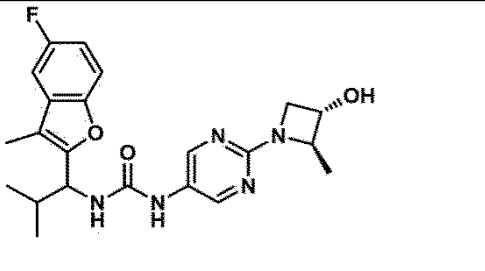
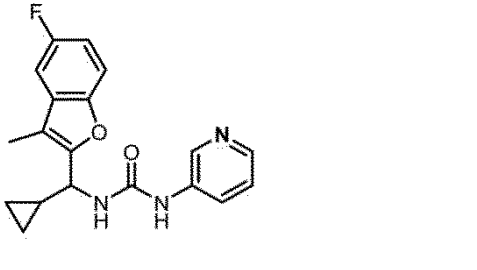
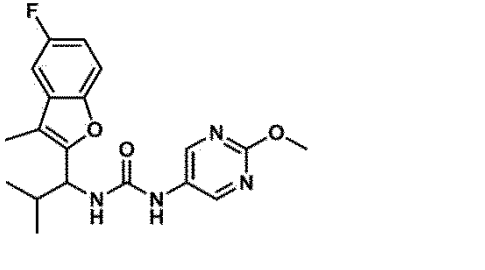
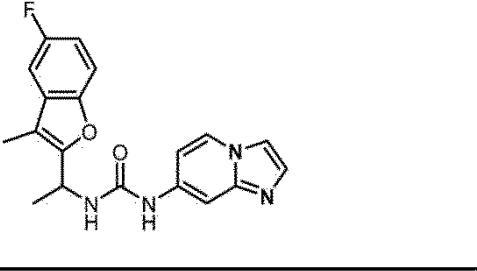
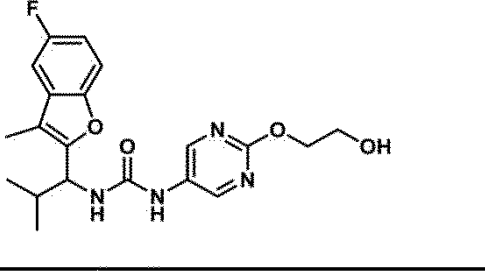
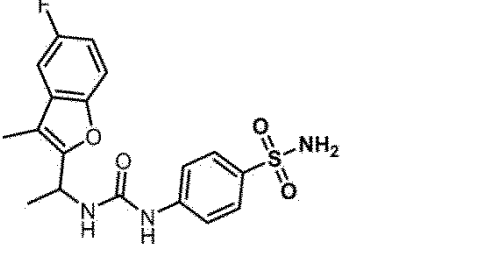
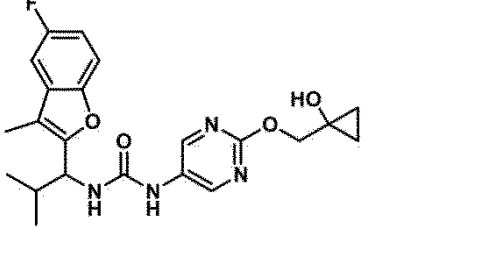
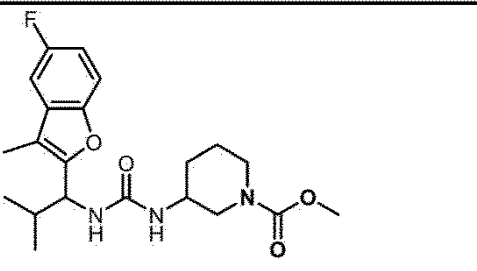
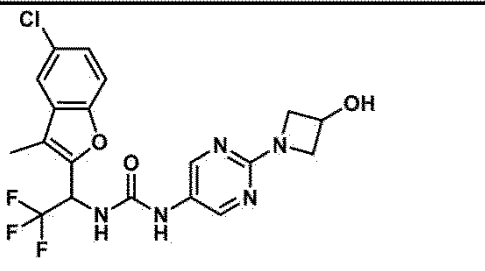
20

30

40

50

【表 1 - 7】

10

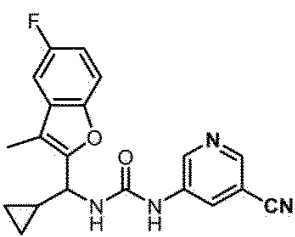
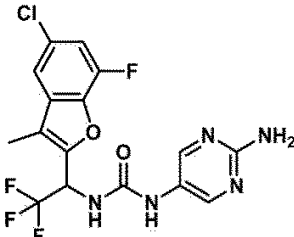
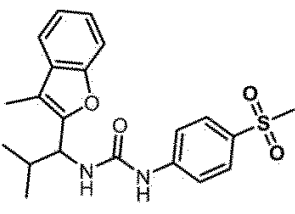
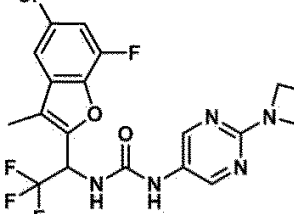
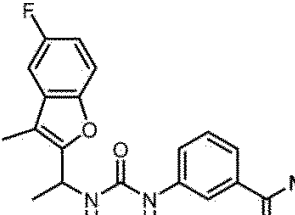
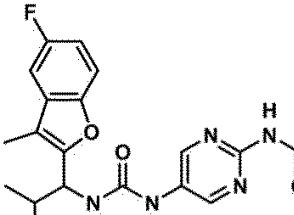
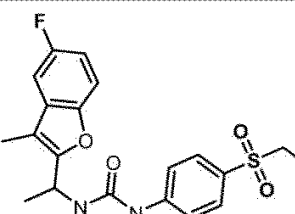
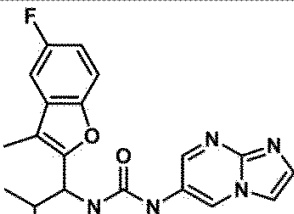
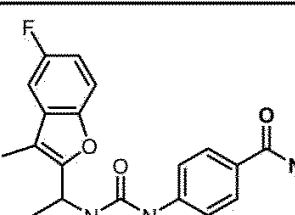
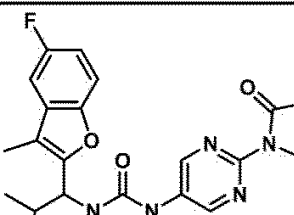
20

30

40

50

【表 1 - 8】

10

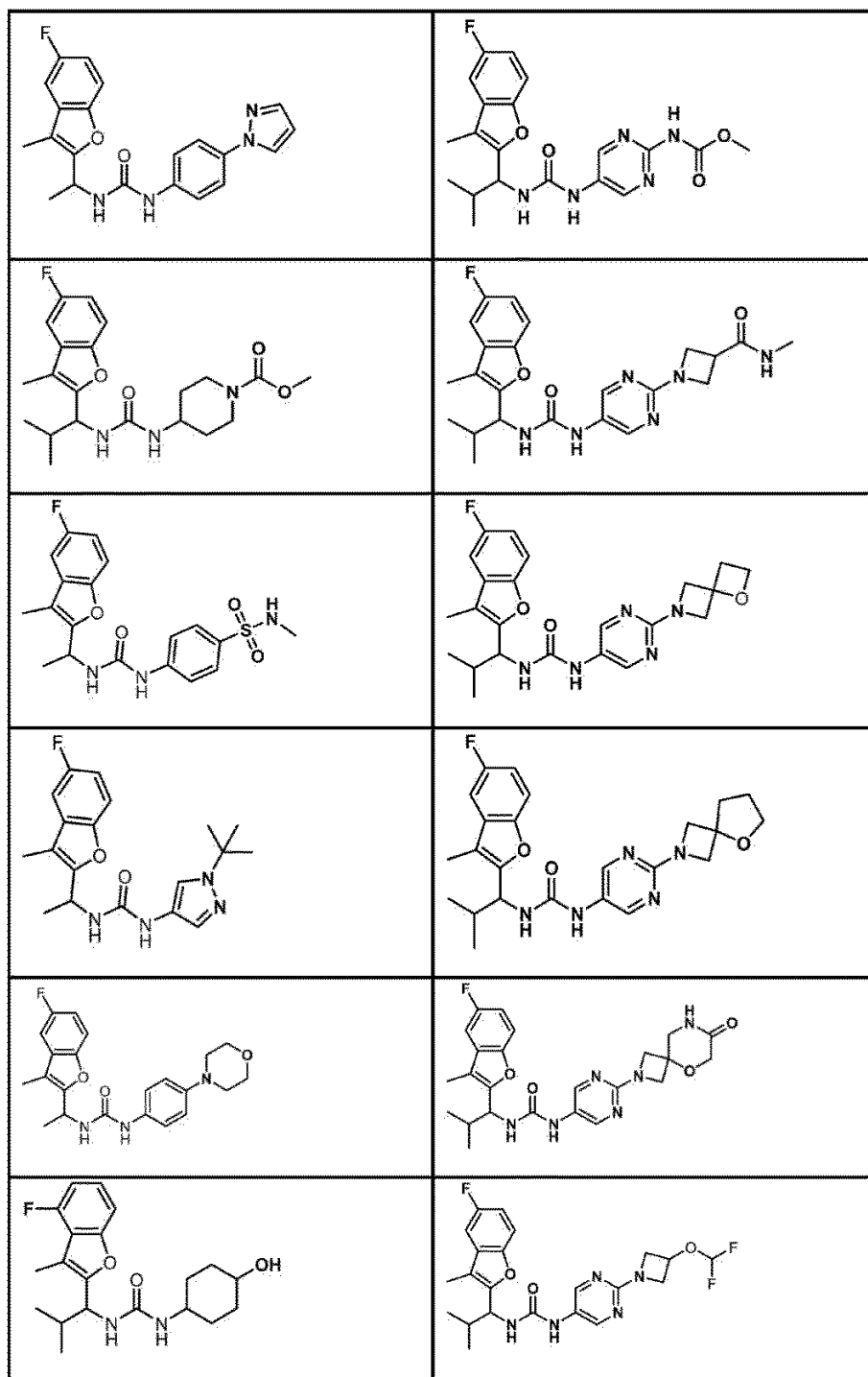
20

30

40

50

【表 1 - 9】



10

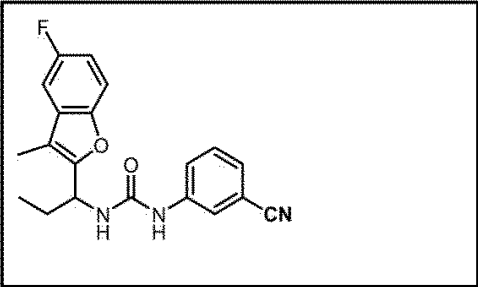
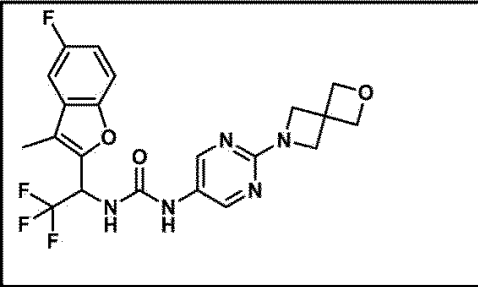
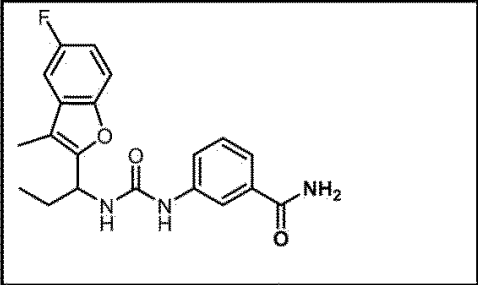
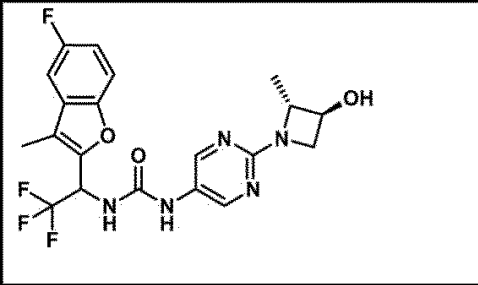
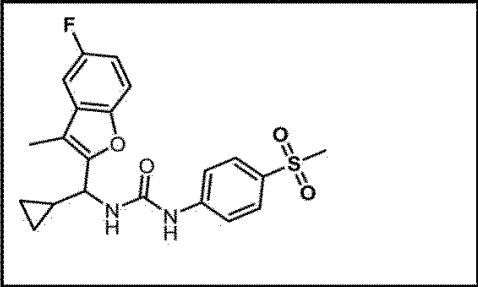
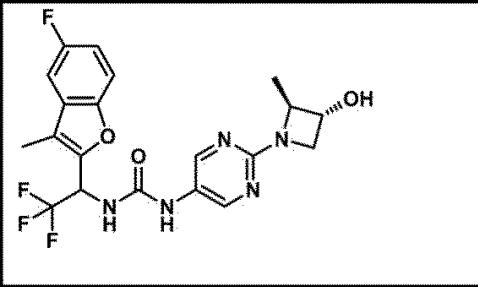
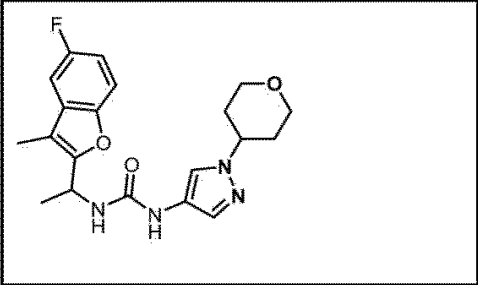
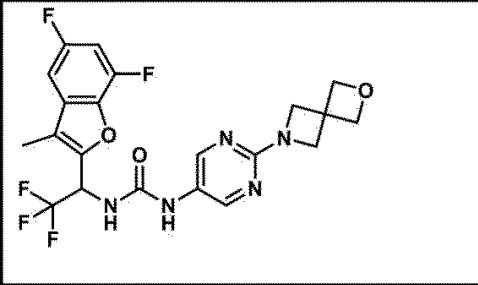
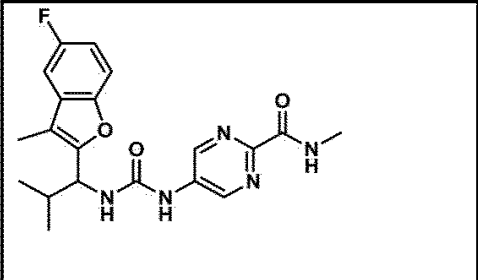
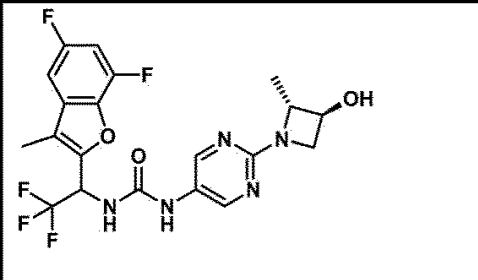
20

30

40

50

【表 1 - 10】

10

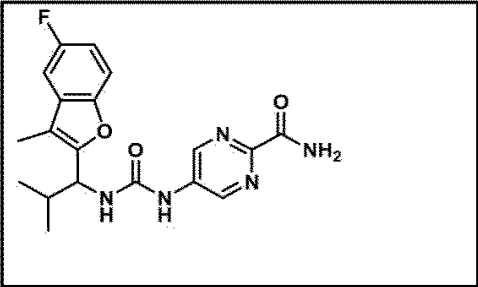
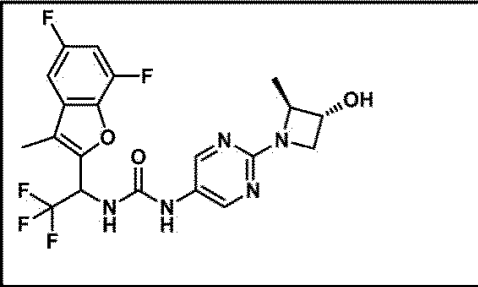
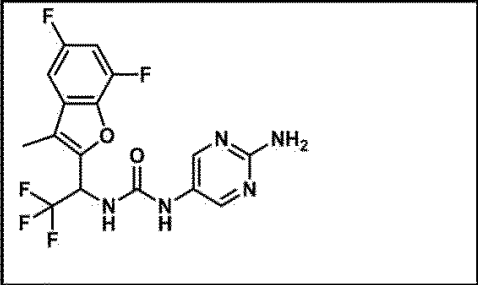
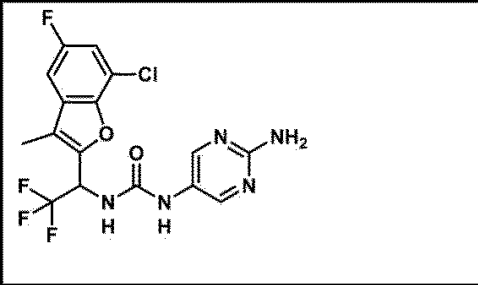
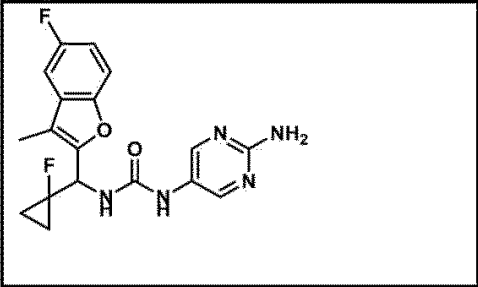
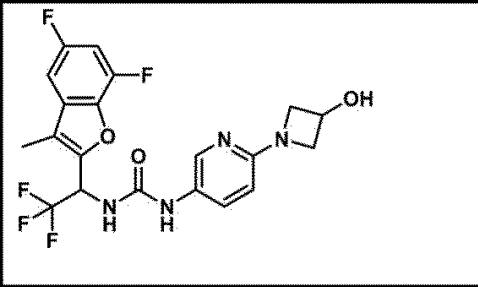
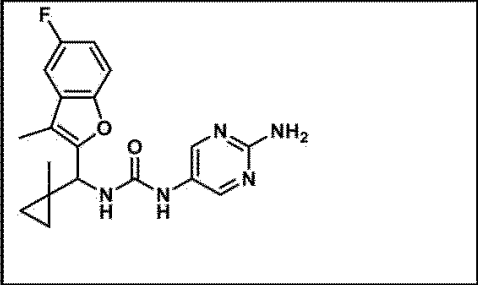
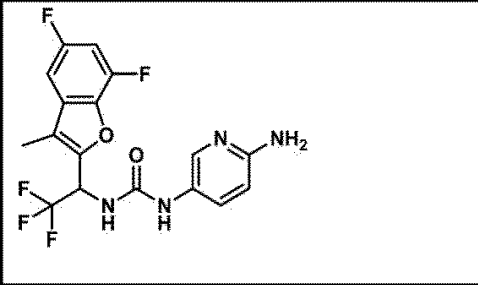
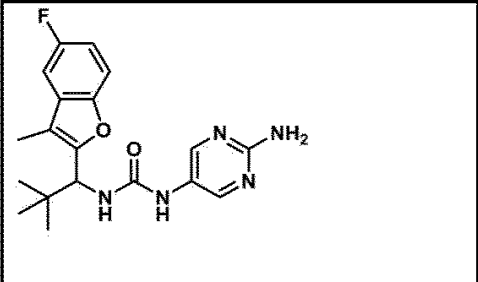
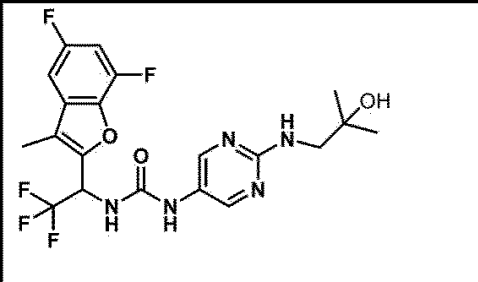
20

30

40

50

【表 1 - 1 1】

10

20

30

40

50

【表 1 - 1 2】


10

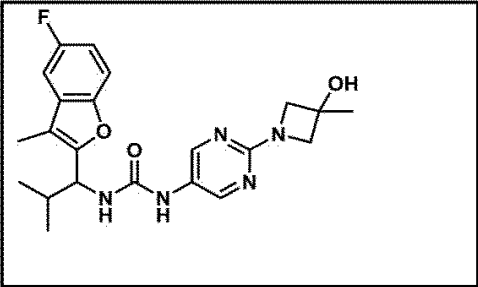
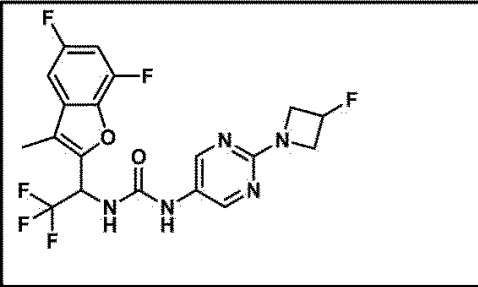
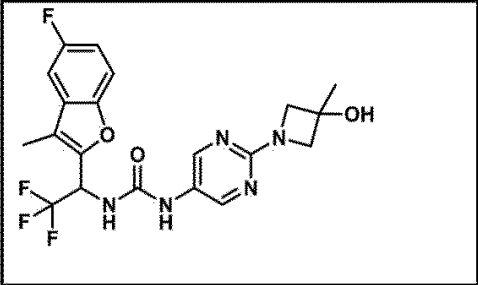
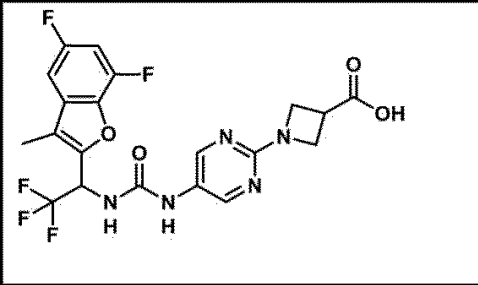
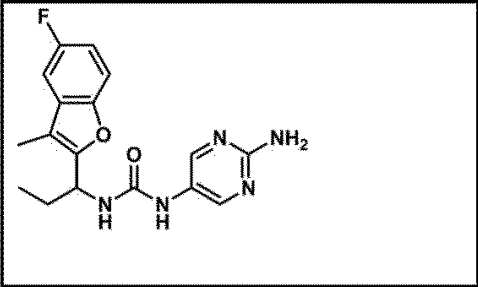
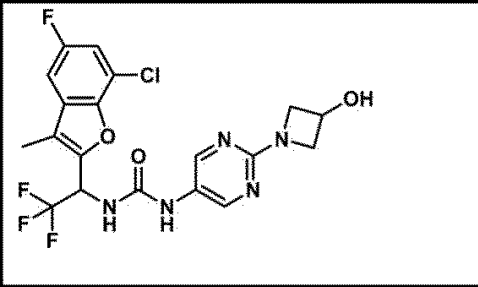
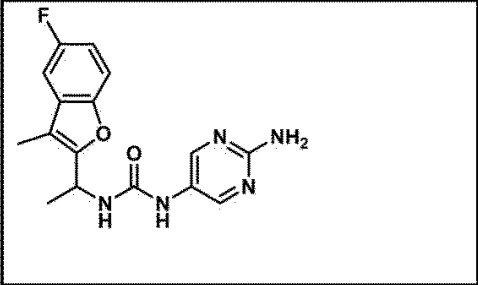
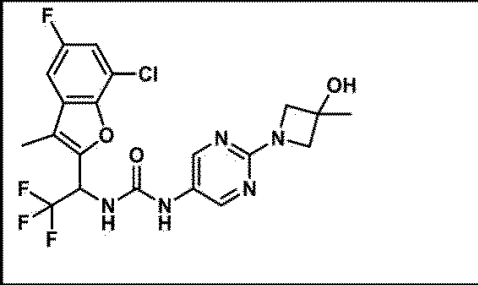
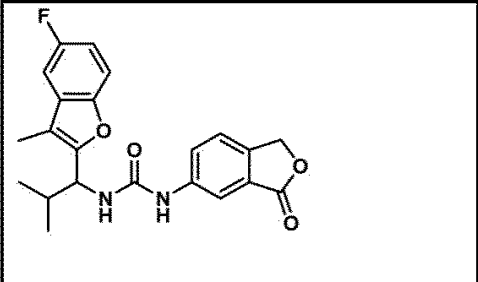
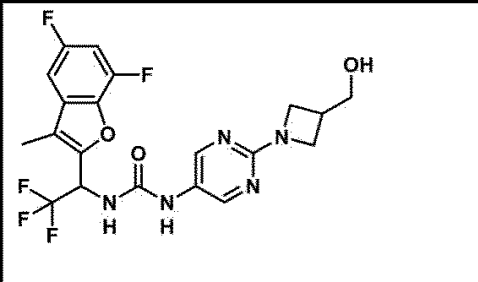
20

30

40

50

【表 1 - 13】

10

20

30

40

50

【表 1 - 1 4】


10

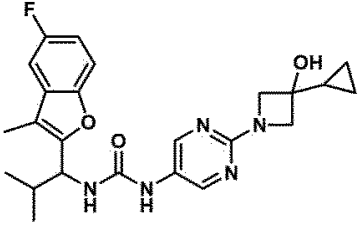
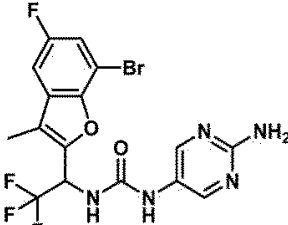
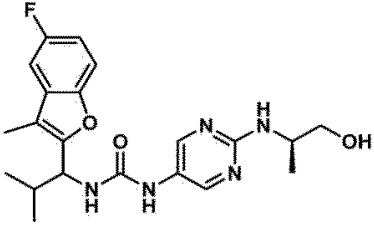
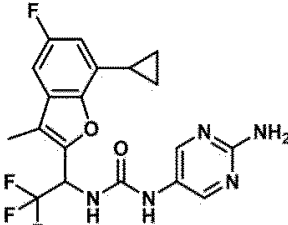
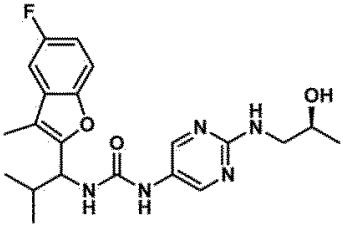
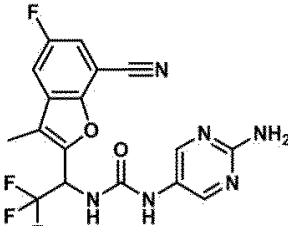
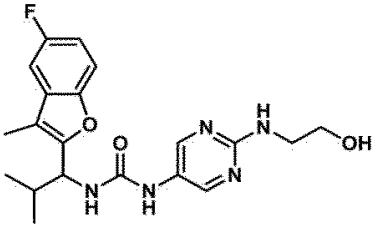
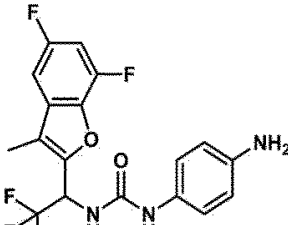
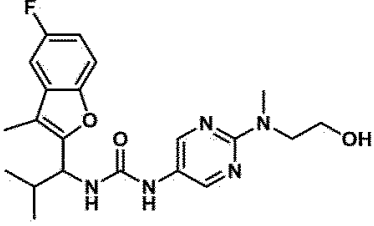
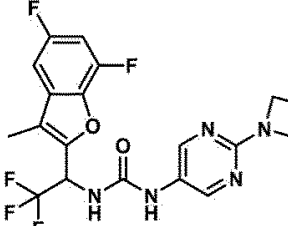
20

30

40

50

【表 1 - 15】

10

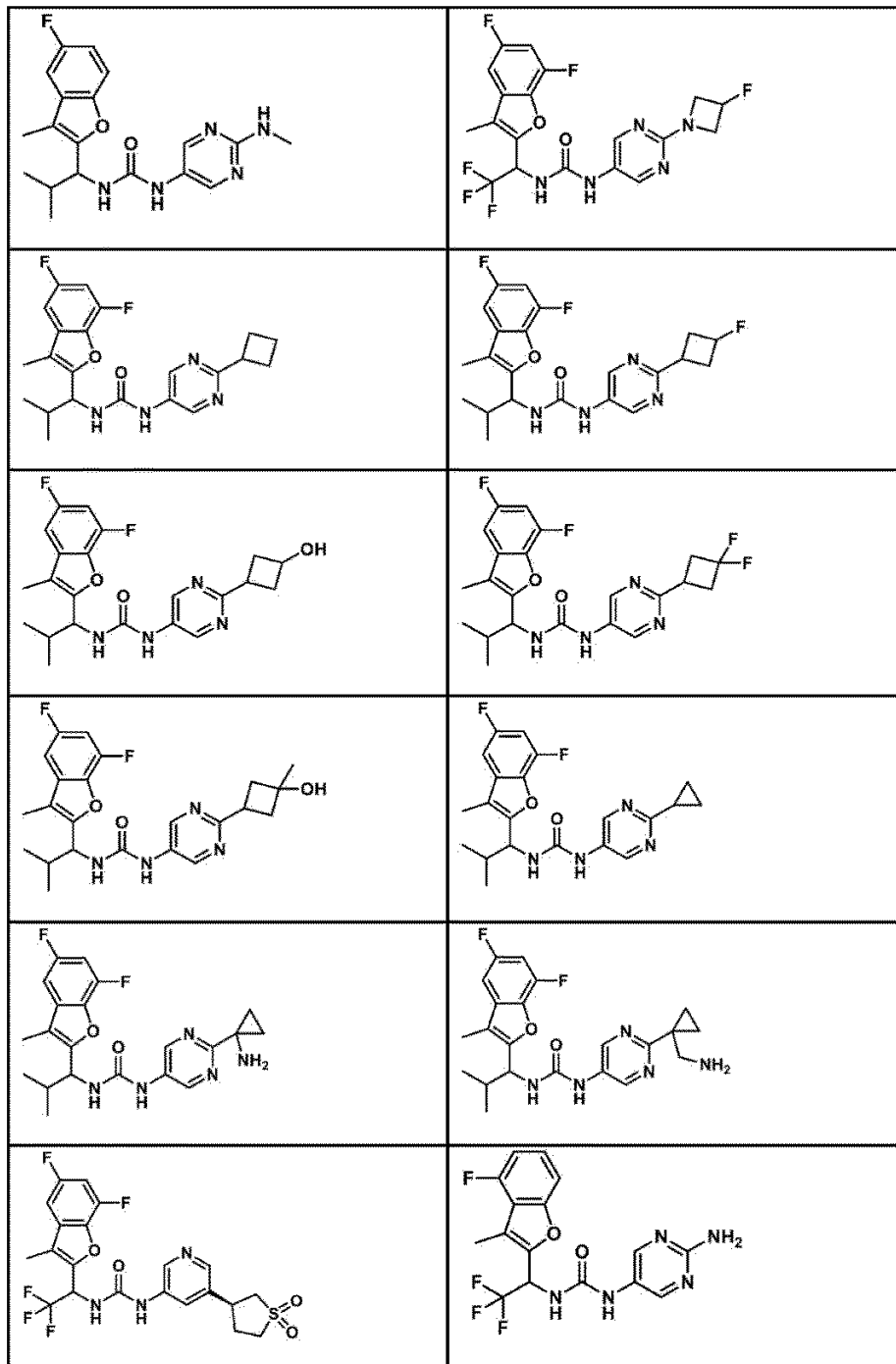
20

30

40

50

【表 1 - 16】



10

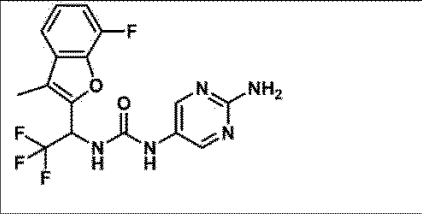
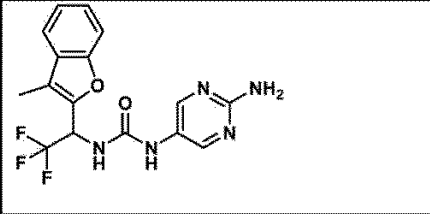
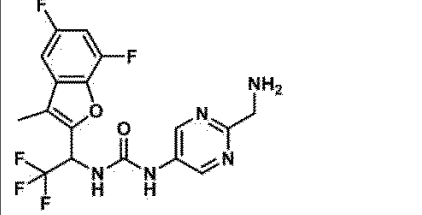
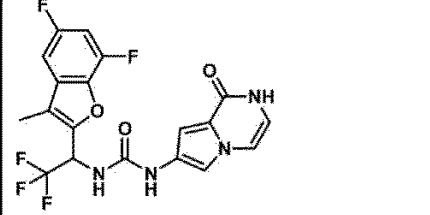
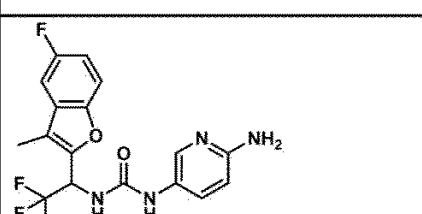
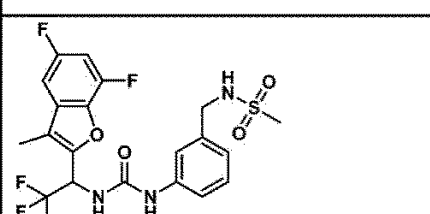
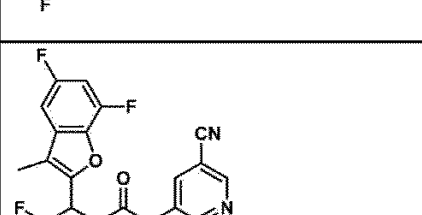
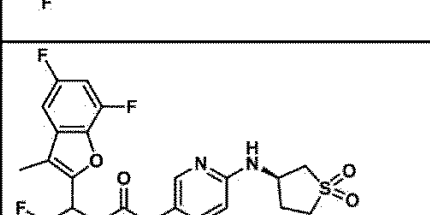
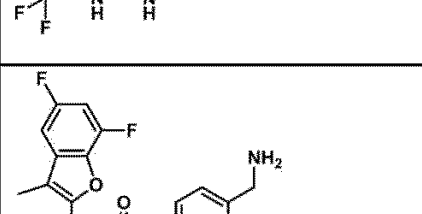
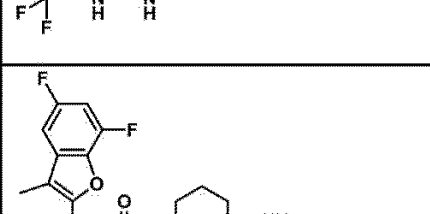
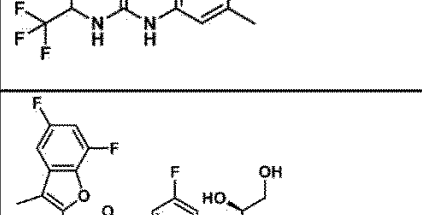
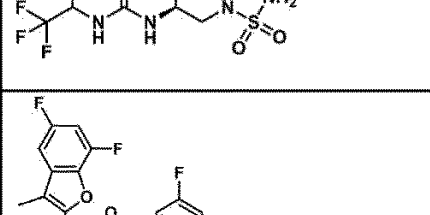
20

30

40

50

【表 1 - 17】

10

20

30

40

50

【表 1 - 18】


10

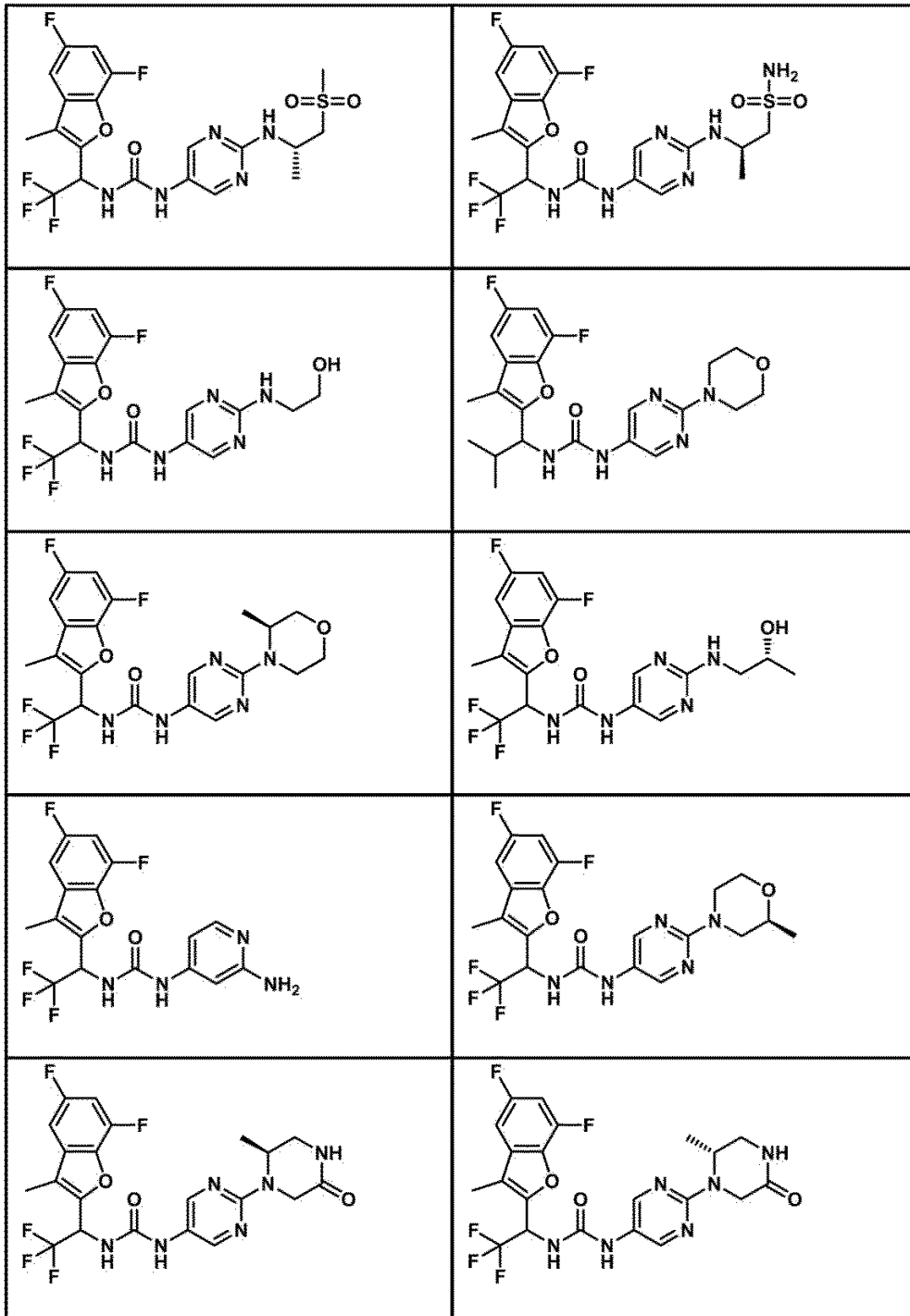
20

30

40

50

【表 1 - 19】



10

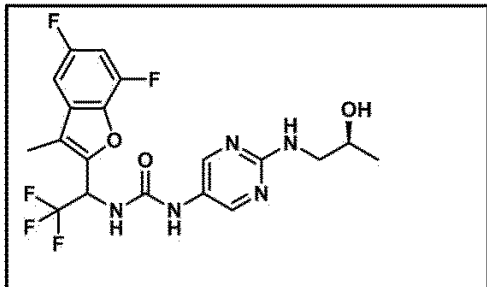
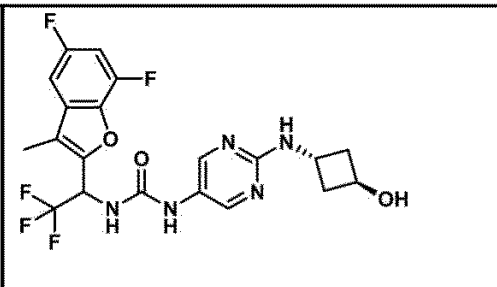
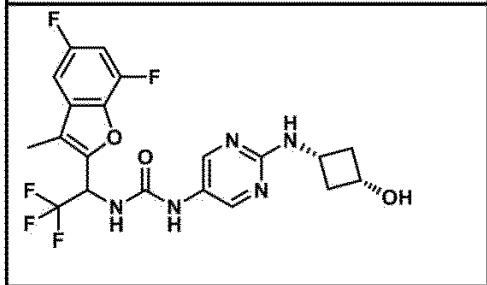
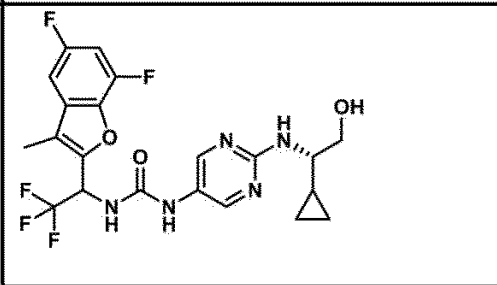
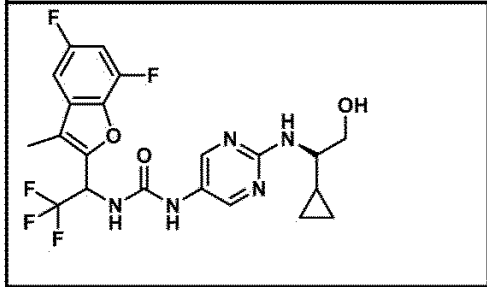
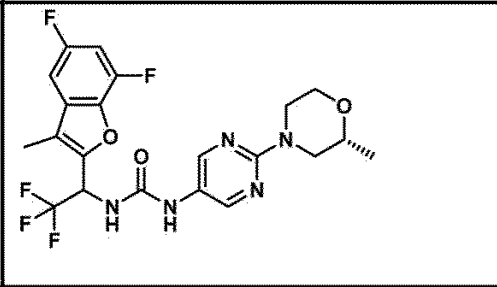
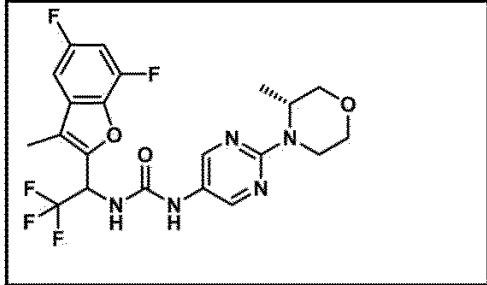
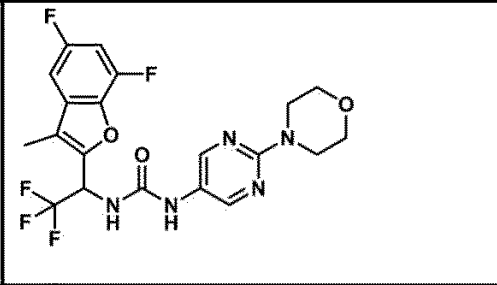
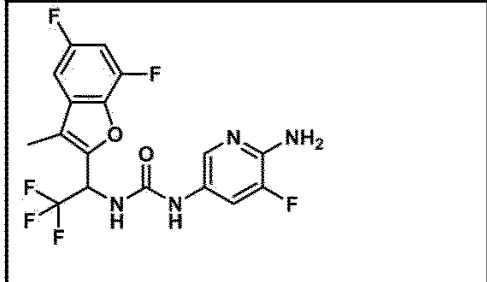
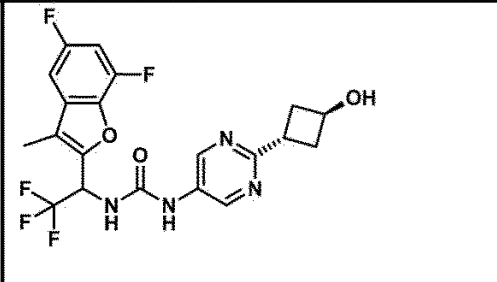
20

30

40

50

【表 1 - 20】

10

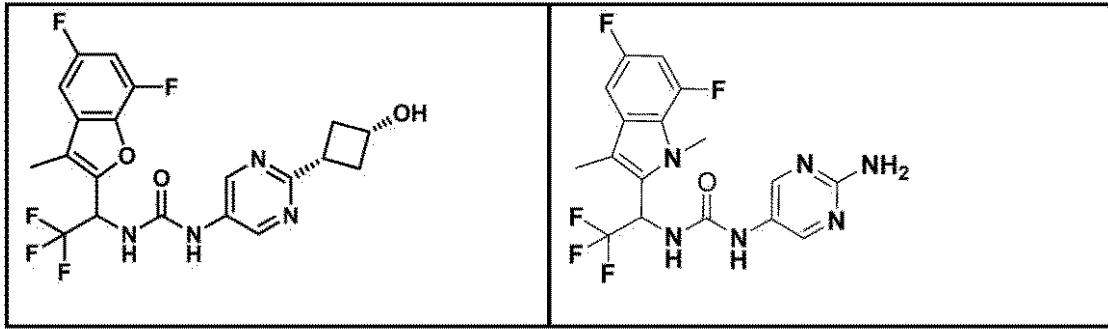
20

30

40

50

【表 1 - 2 1】



10

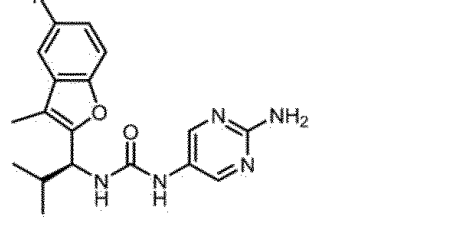
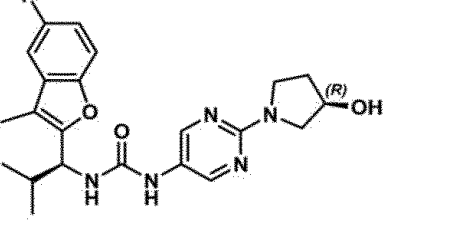
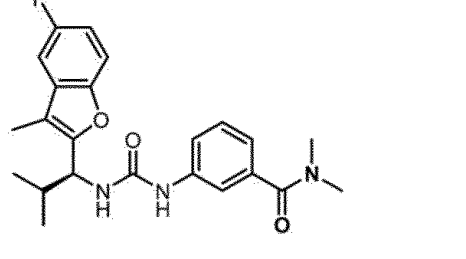
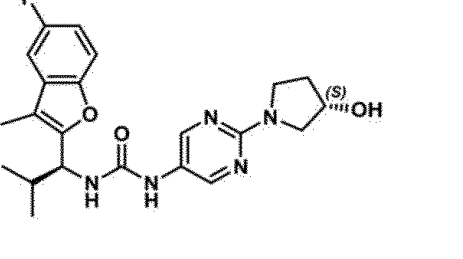
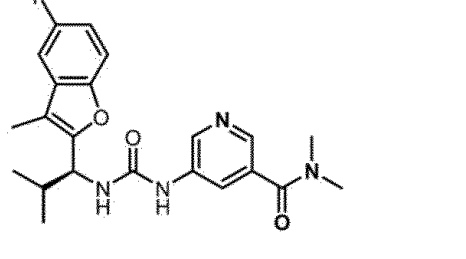
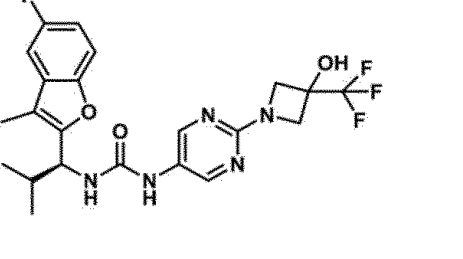
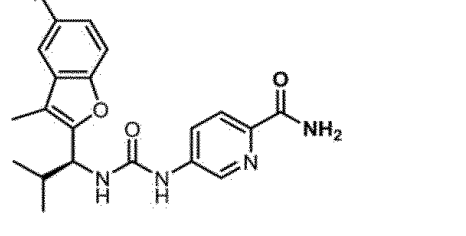
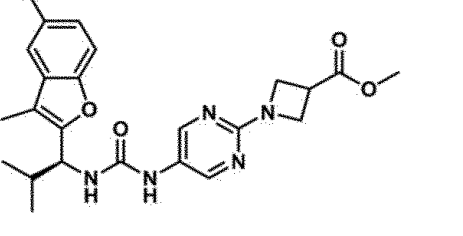
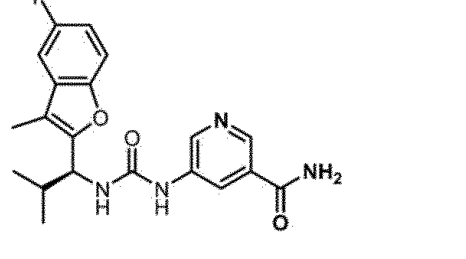
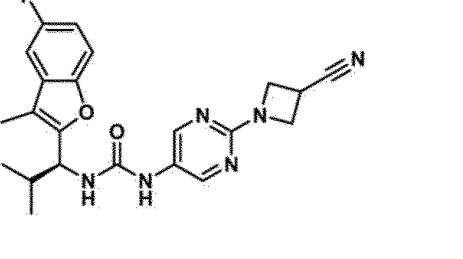
20

30

40

50

【表 2 - 1】

構造	構造
	
	
	
	
	

10

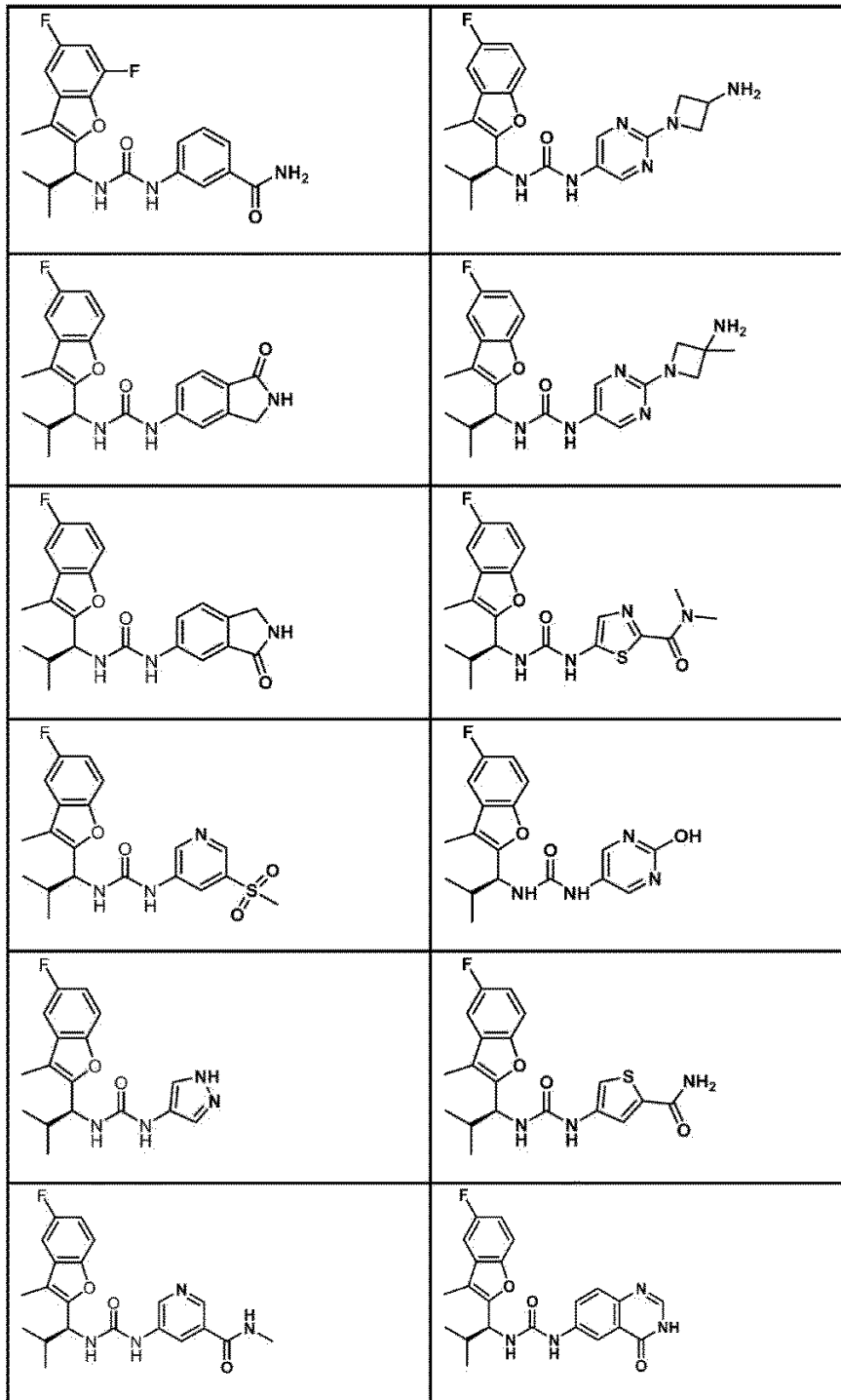
20

30

40

50

【表 2 - 2】



10

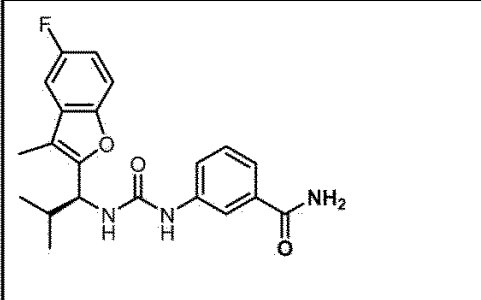
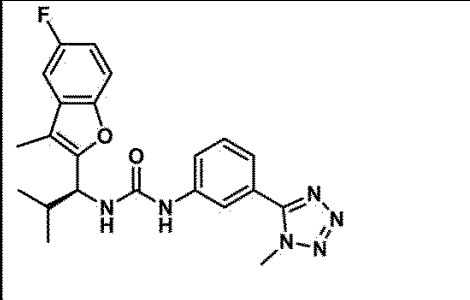
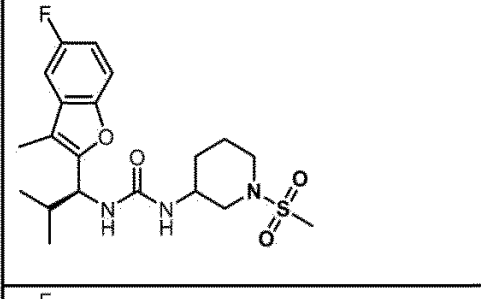
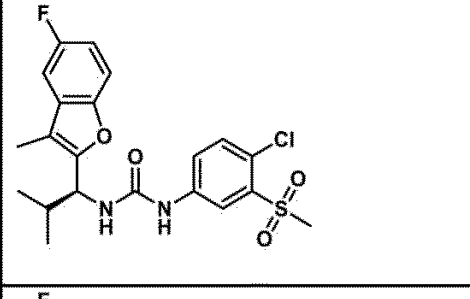
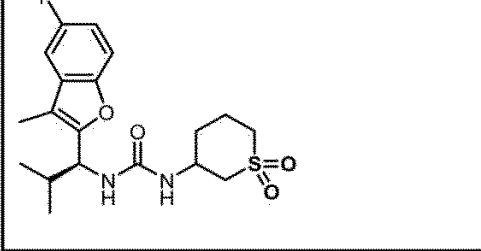
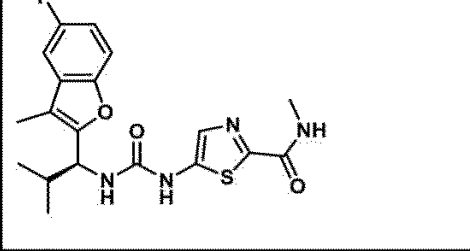
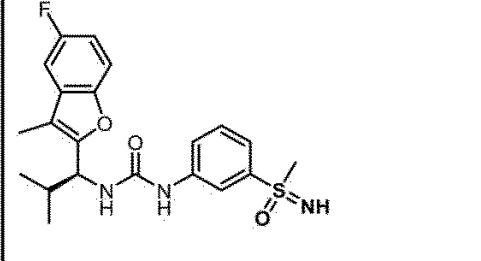
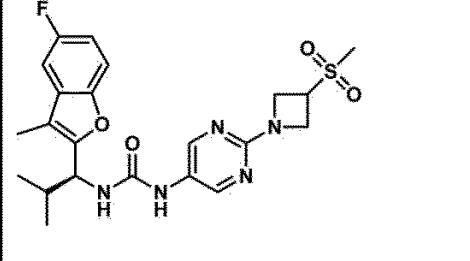
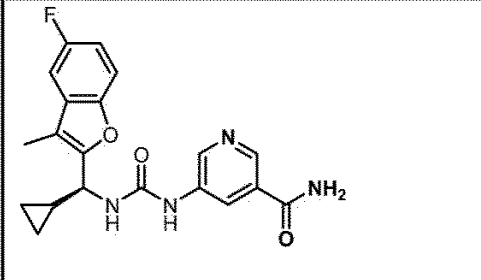
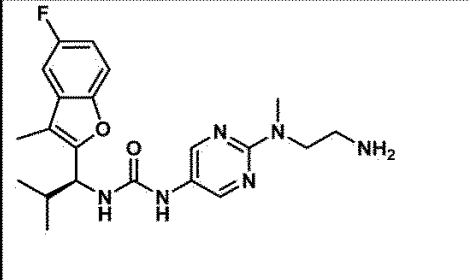
20

30

40

50

【表 2 - 3】

10

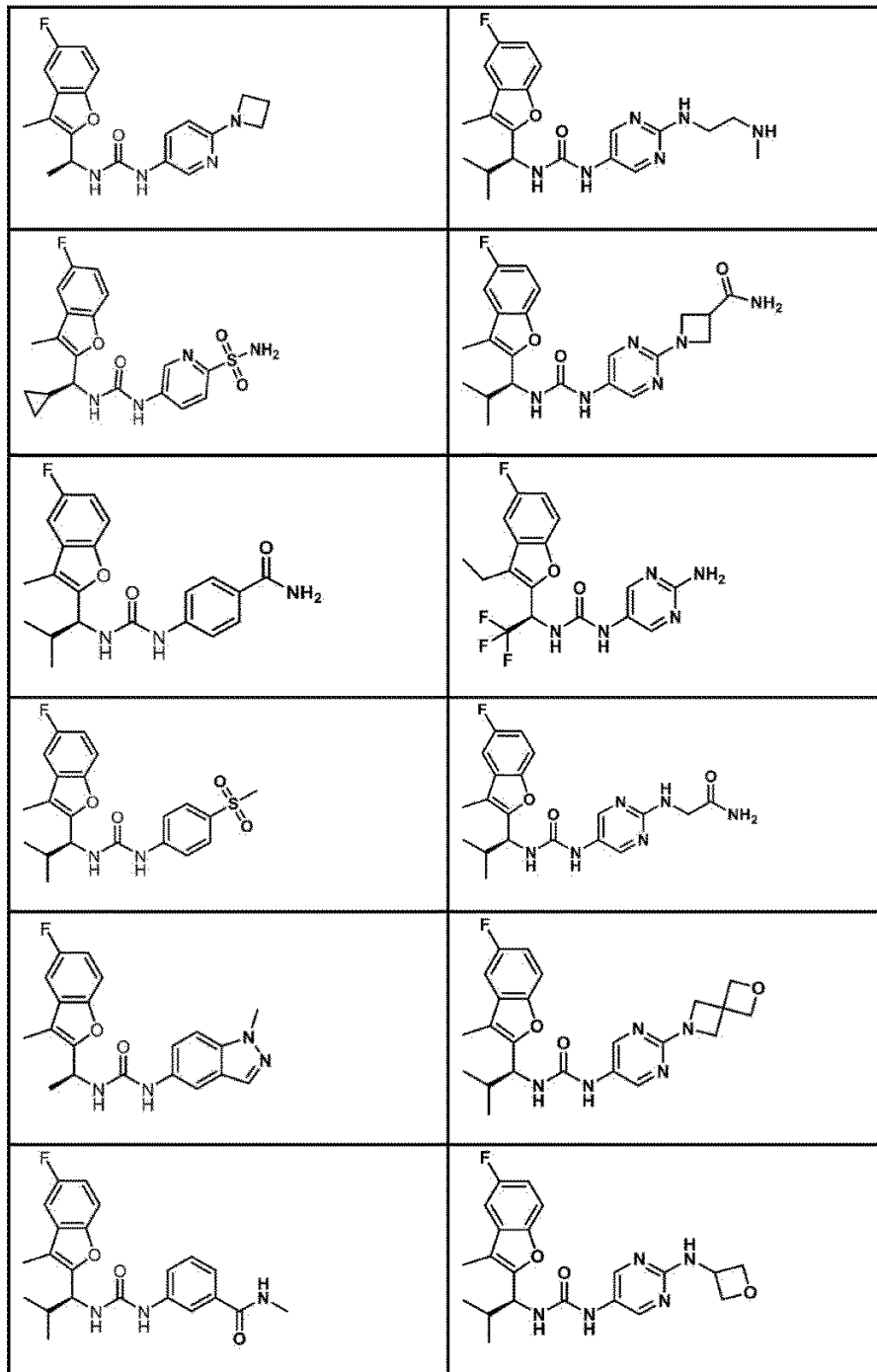
20

30

40

50

【表 2 - 4】



10

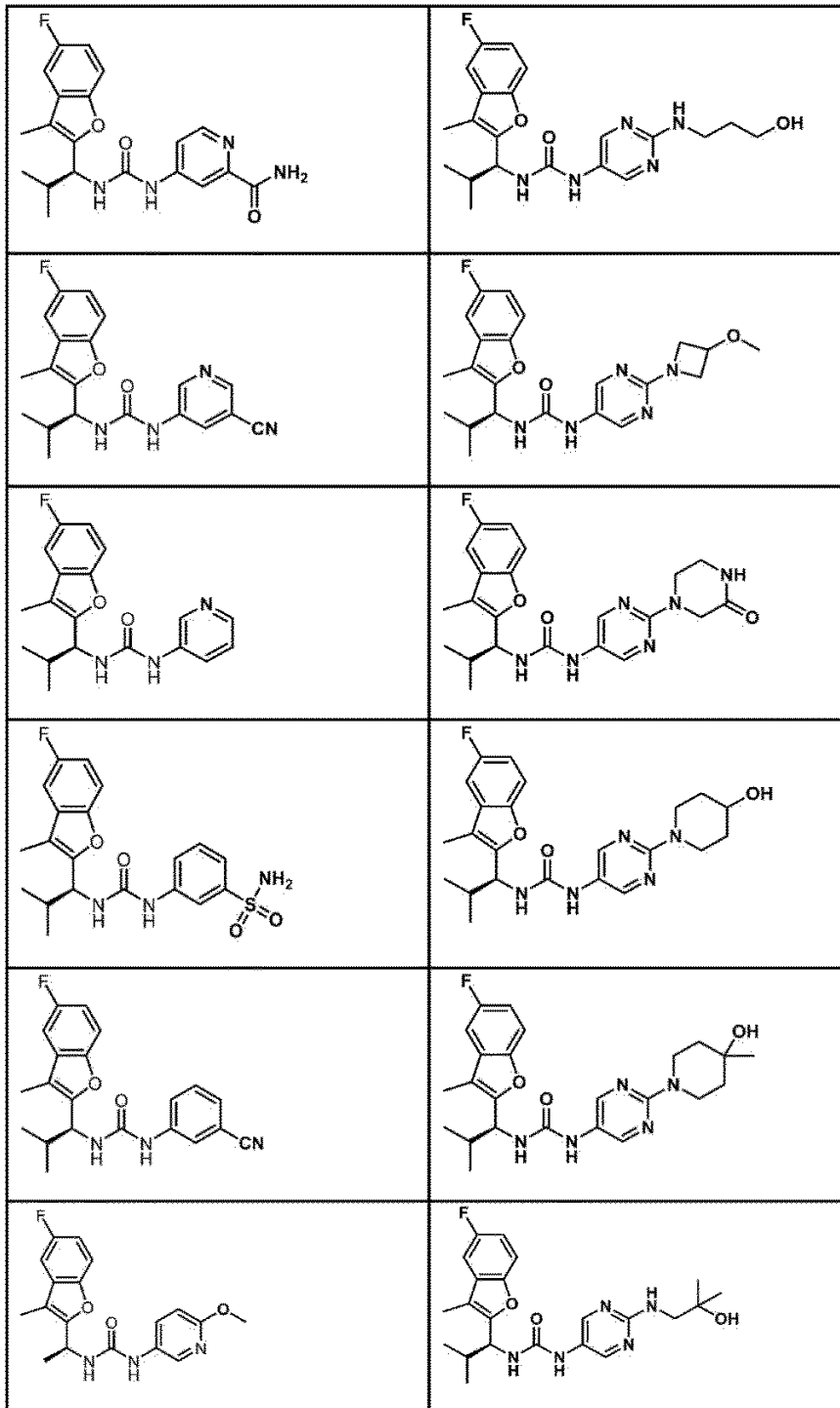
20

30

40

50

【表 2 - 5】



10

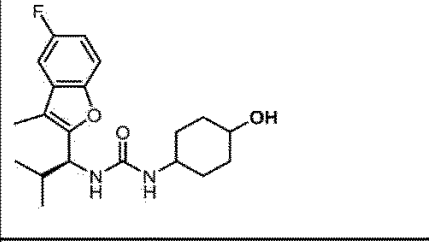
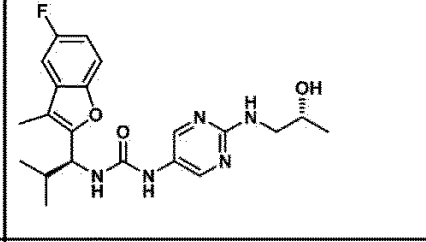
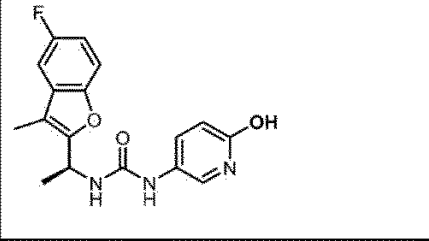
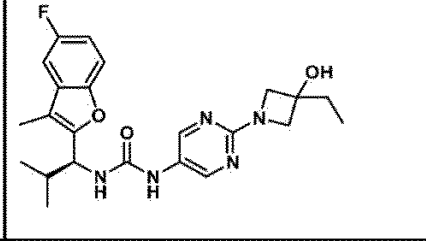
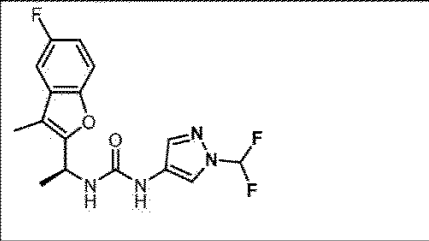
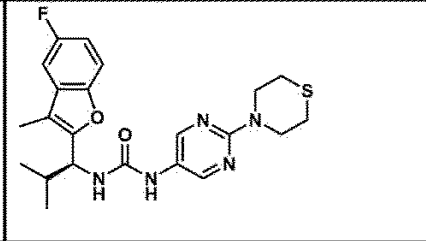
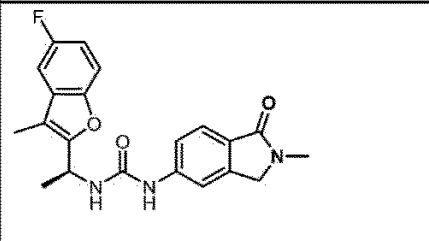
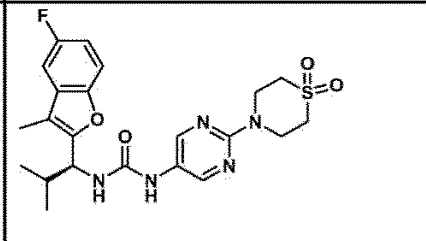
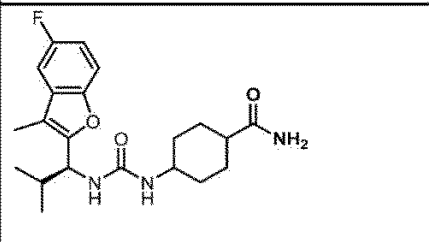
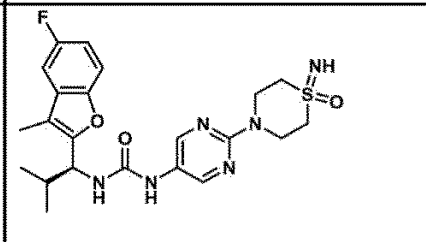
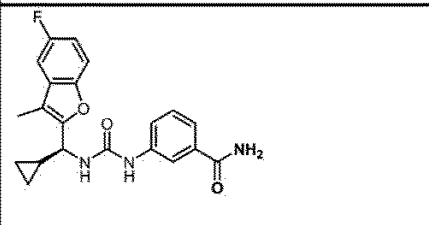
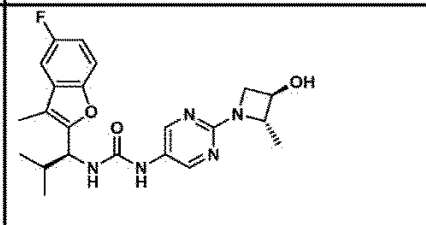
20

30

40

50

【表 2 - 6】

10

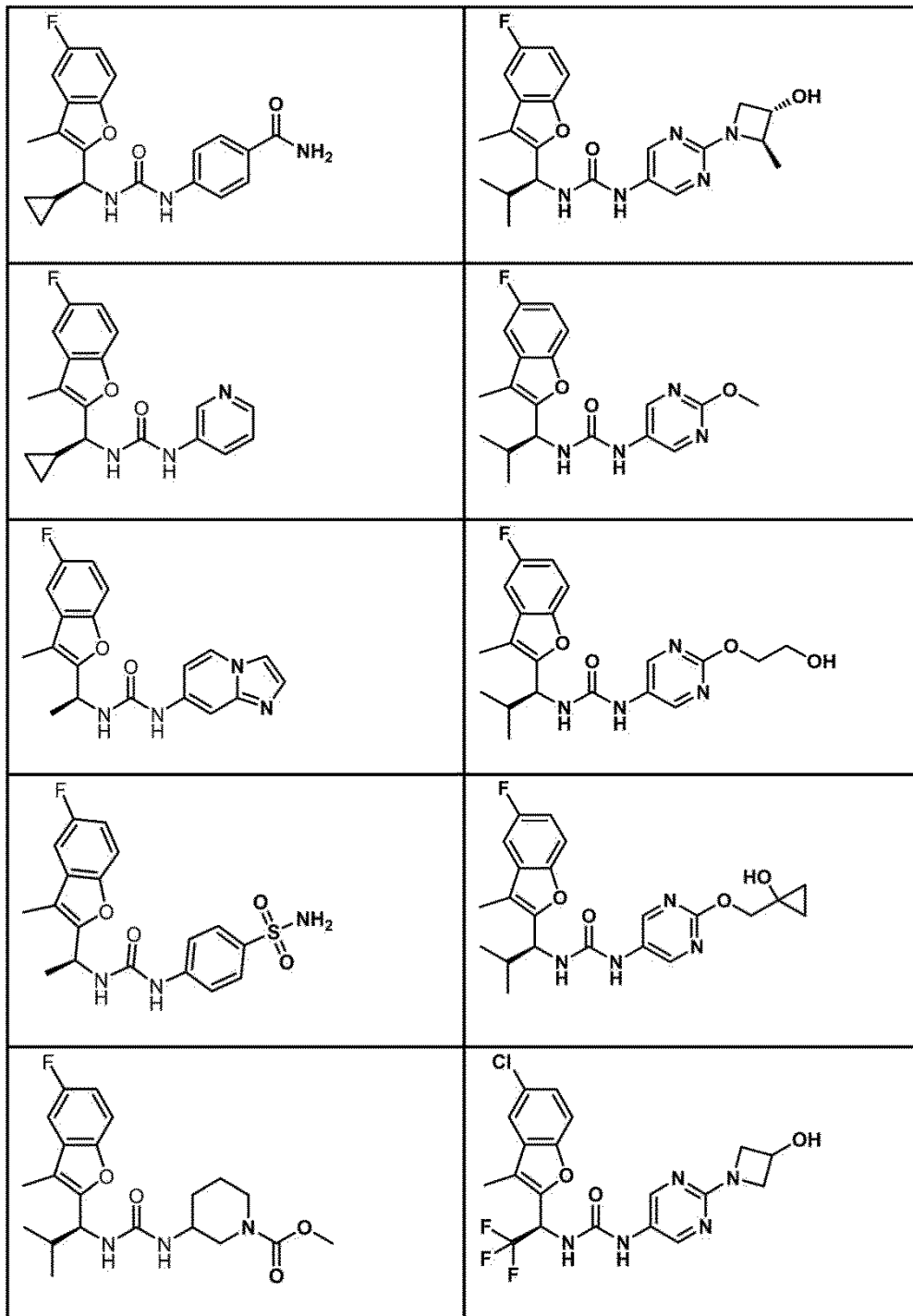
20

30

40

50

【表 2 - 7】



10

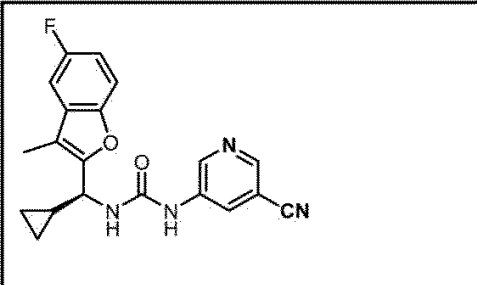
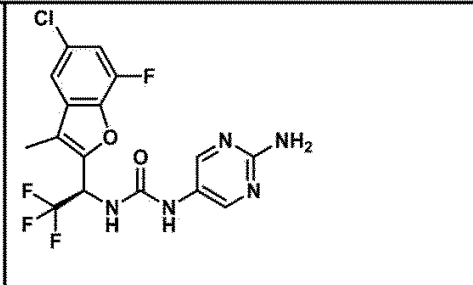
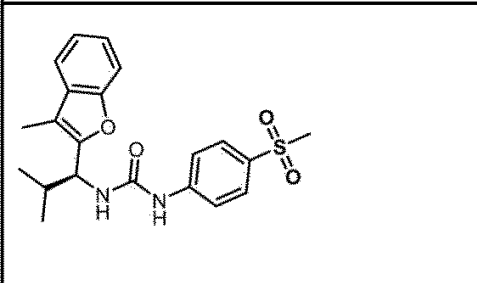
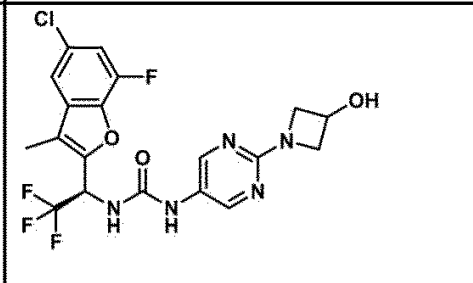
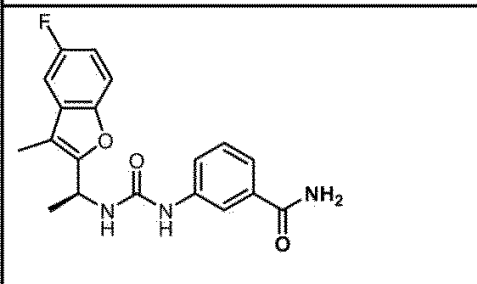
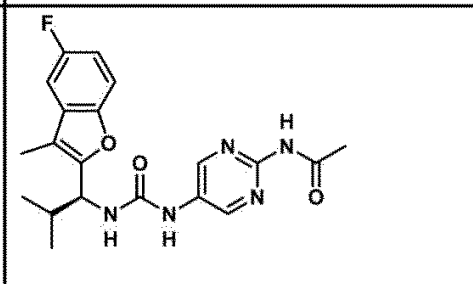
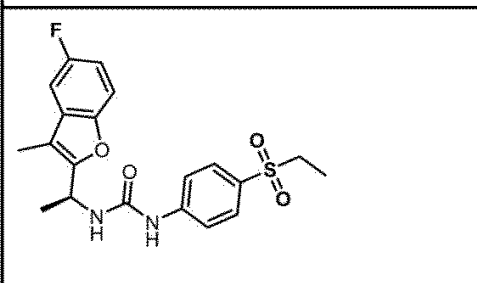
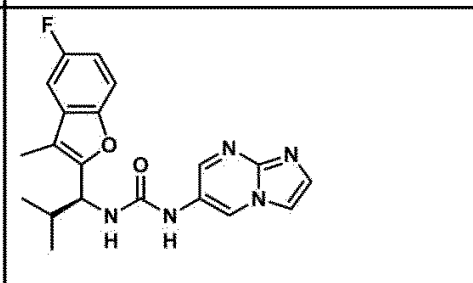
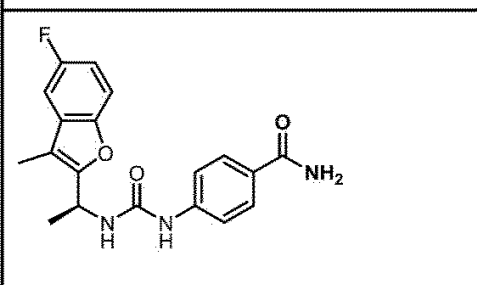
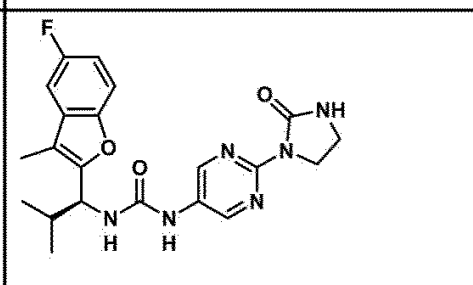
20

30

40

50

【表 2 - 8】

10

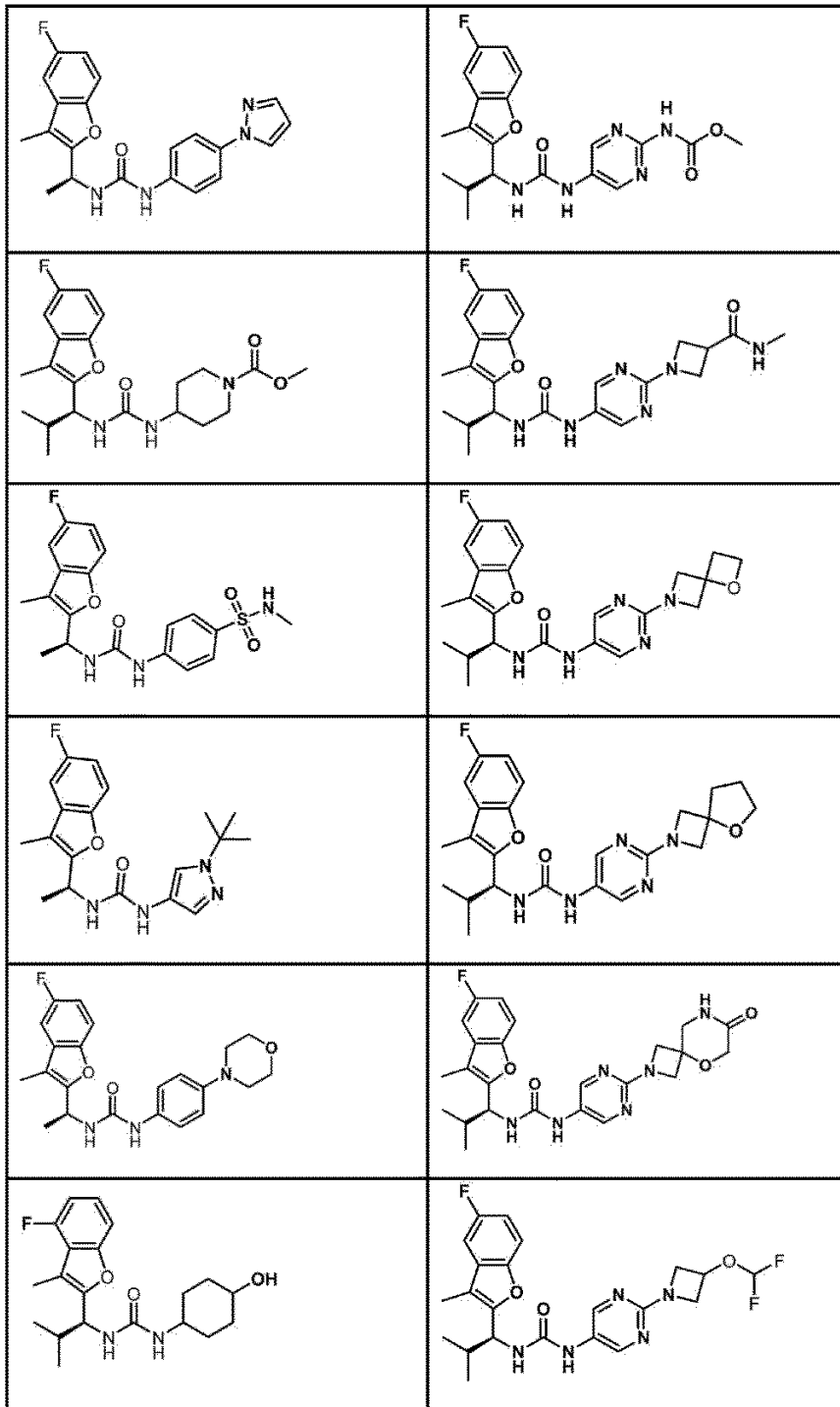
20

30

40

50

【表 2 - 9】



10

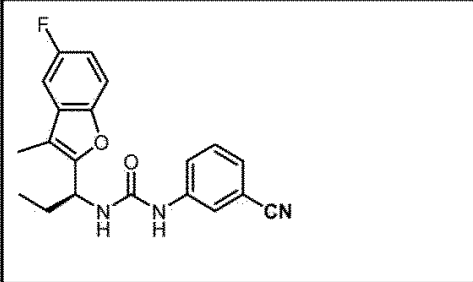
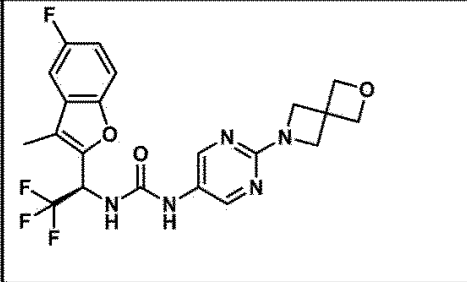
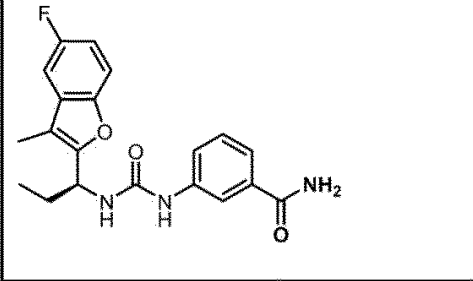
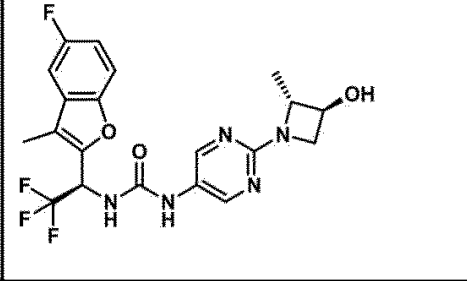
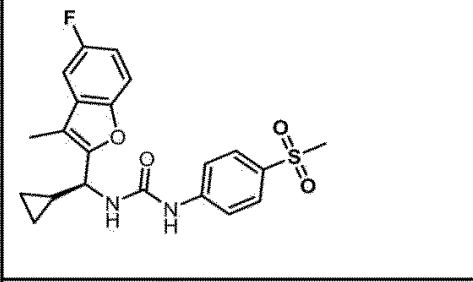
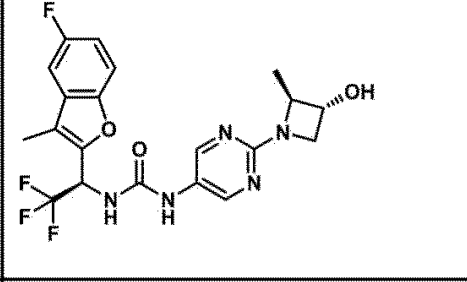
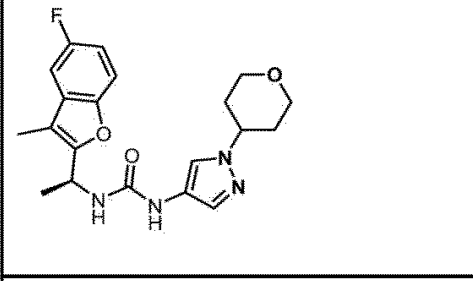
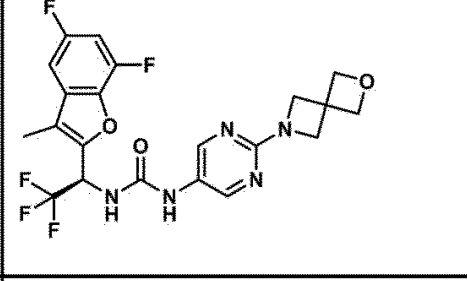
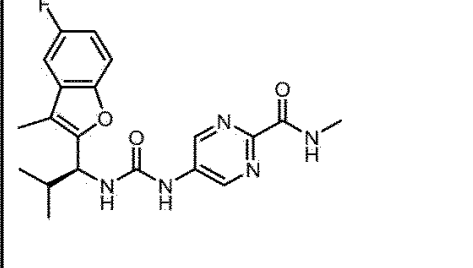
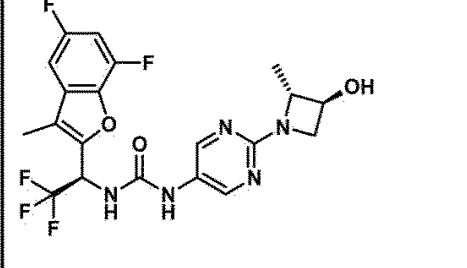
20

30

40

50

【表 2 - 10】

10

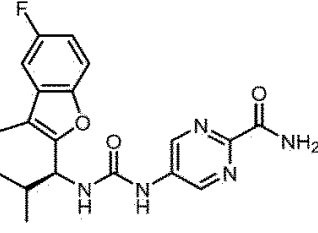
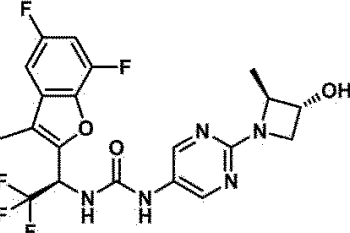
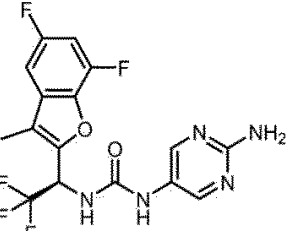
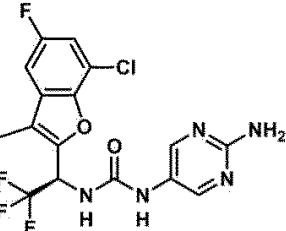
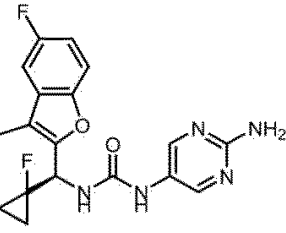
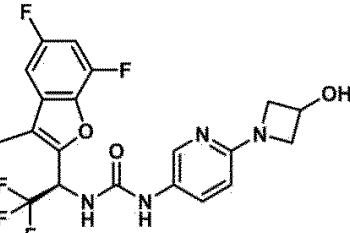
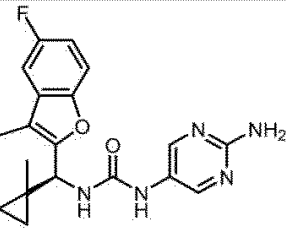
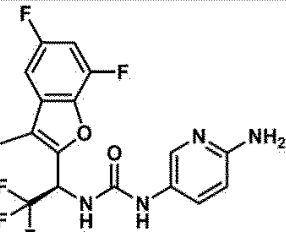
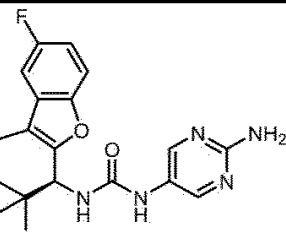
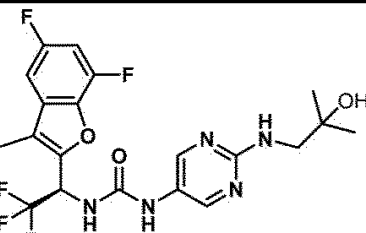
20

30

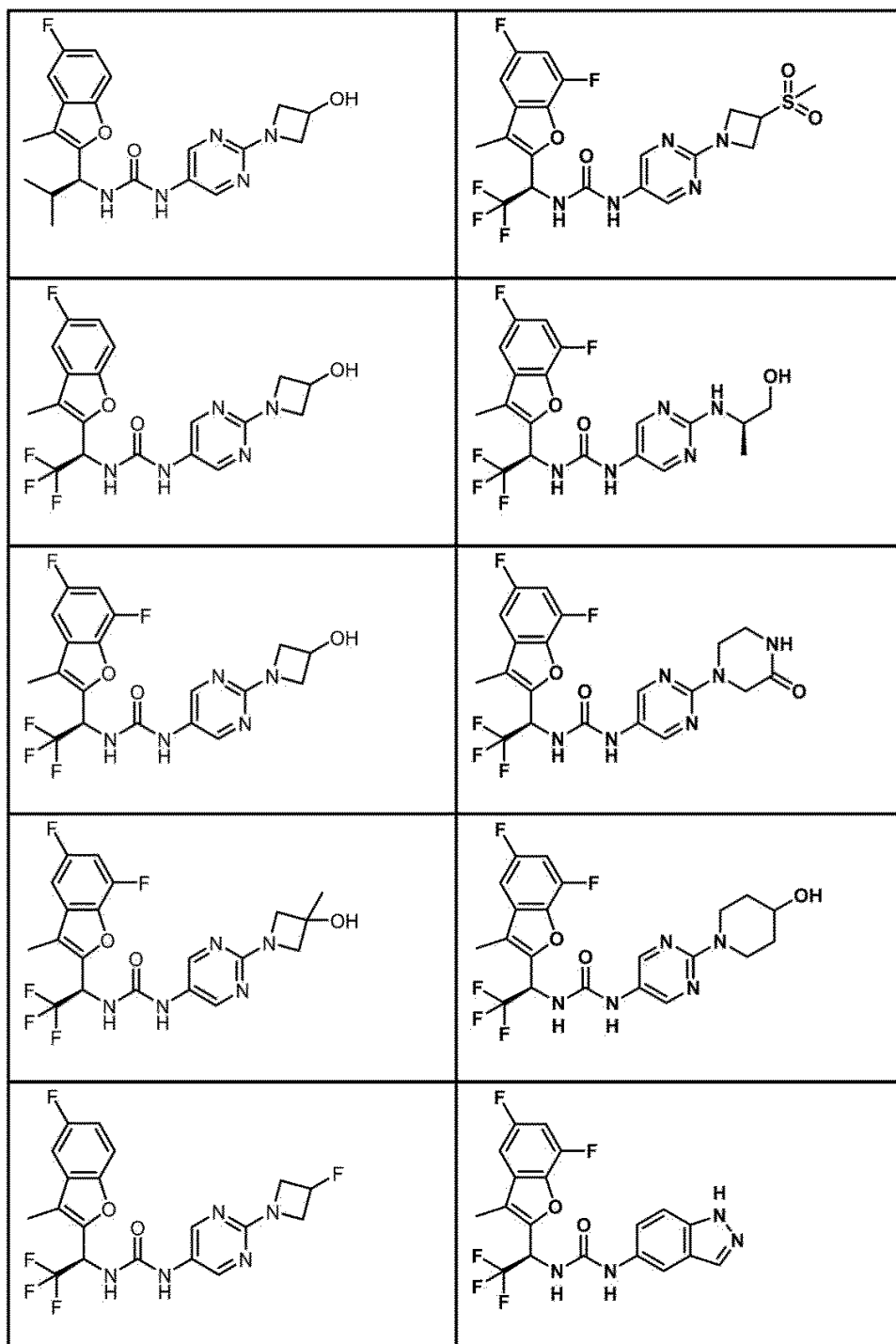
40

50

【表 2 - 1 1】

		10
		20
		30
		40
		50

【表 2 - 1 2】



10

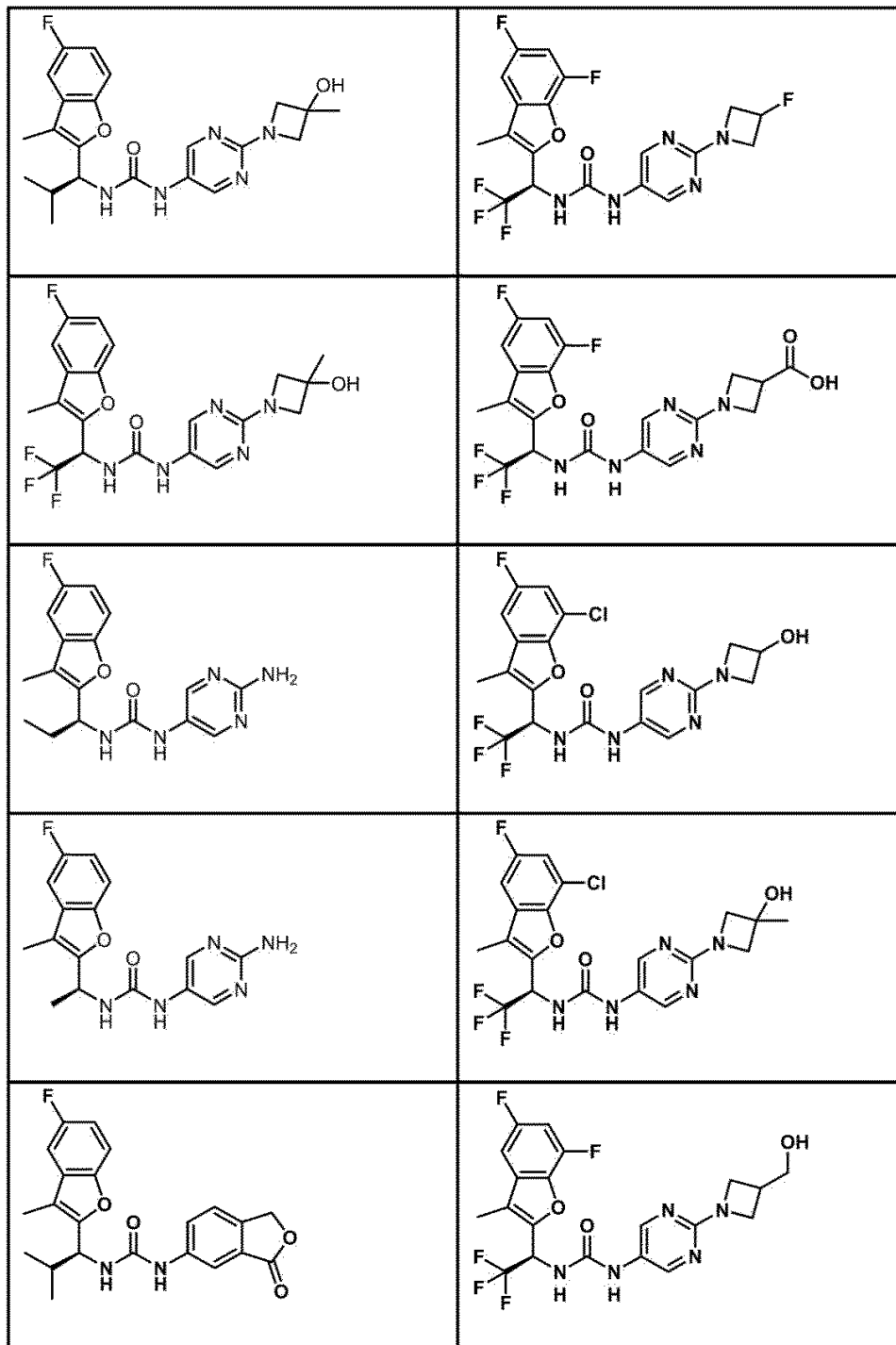
20

30

40

50

【表 2 - 1 3】



10

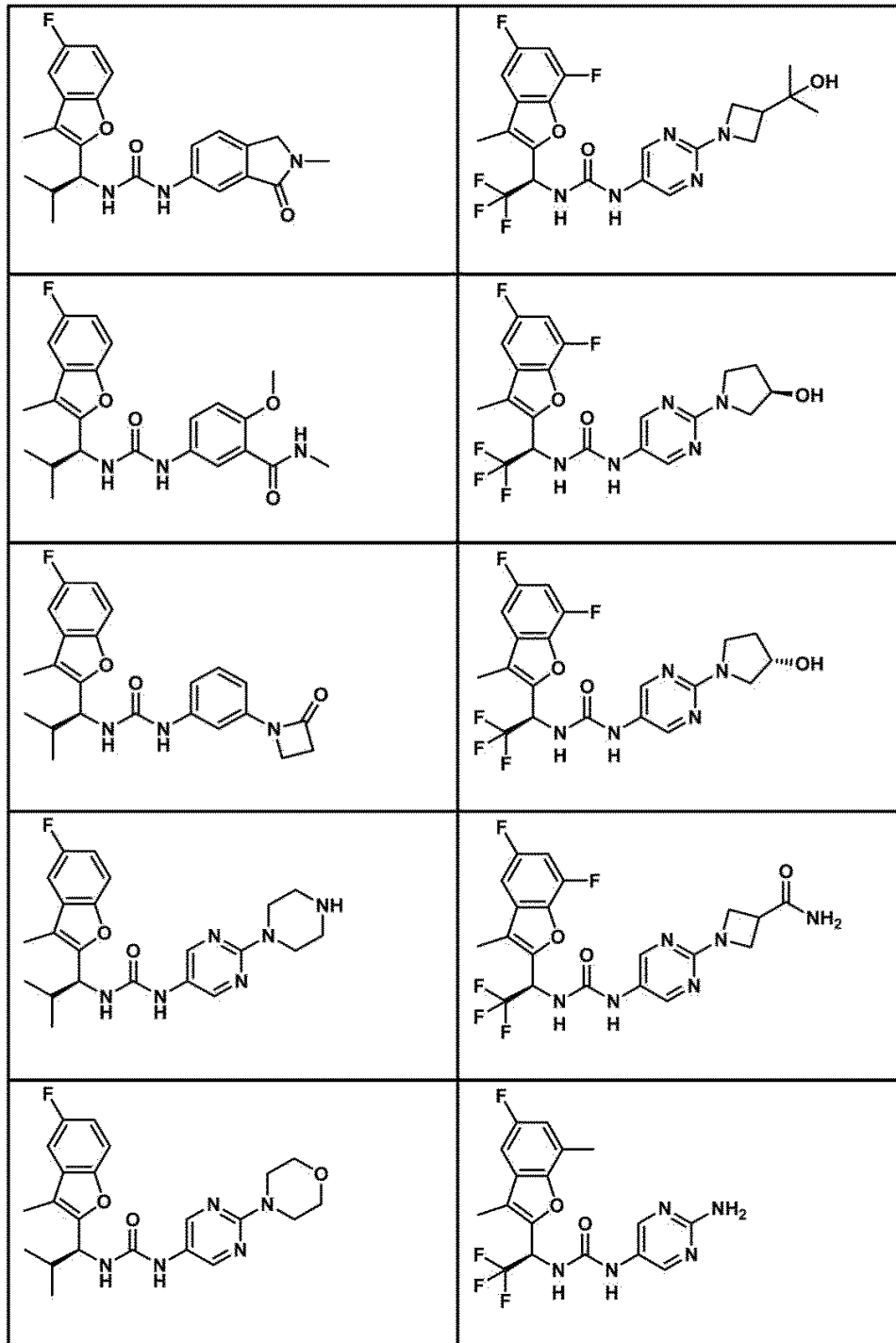
20

30

40

50

【表 2 - 1 4】



10

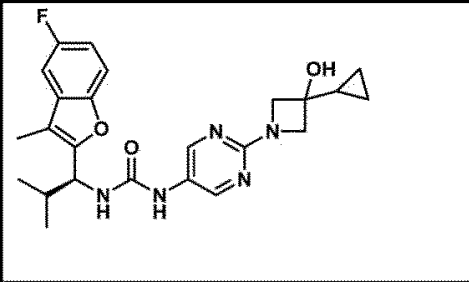
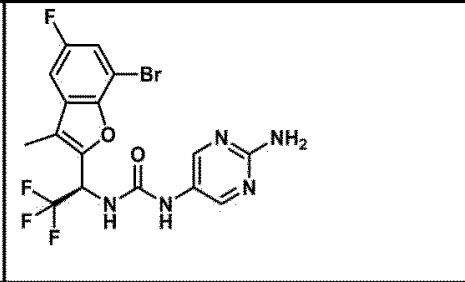
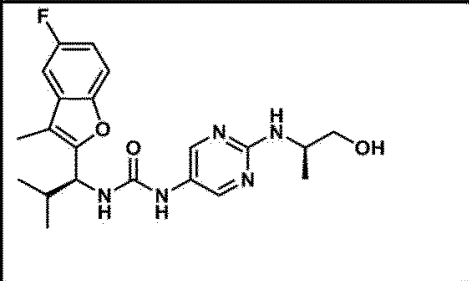
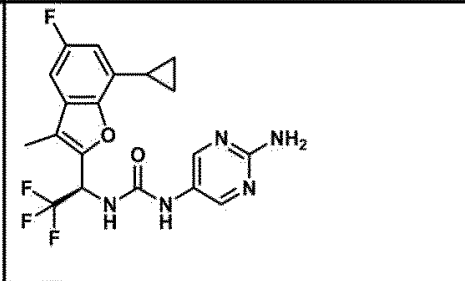
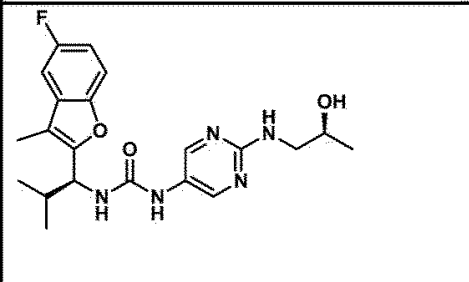
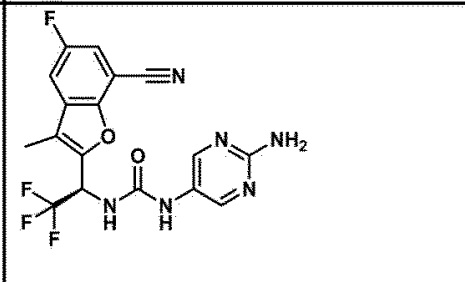
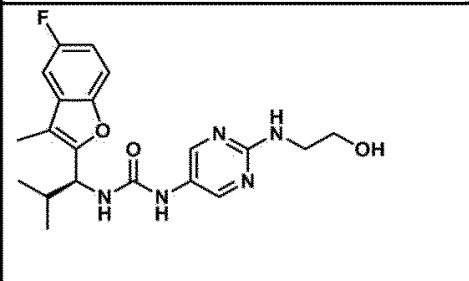
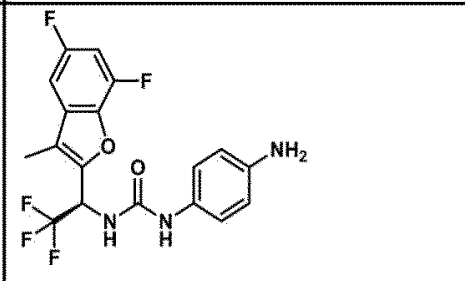
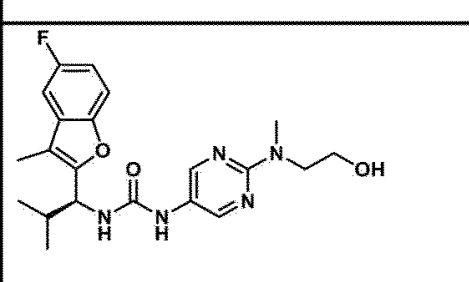
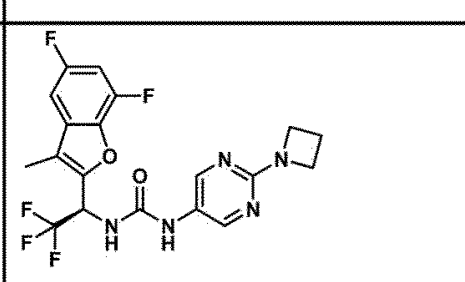
20

30

40

50

【表 2 - 15】

10

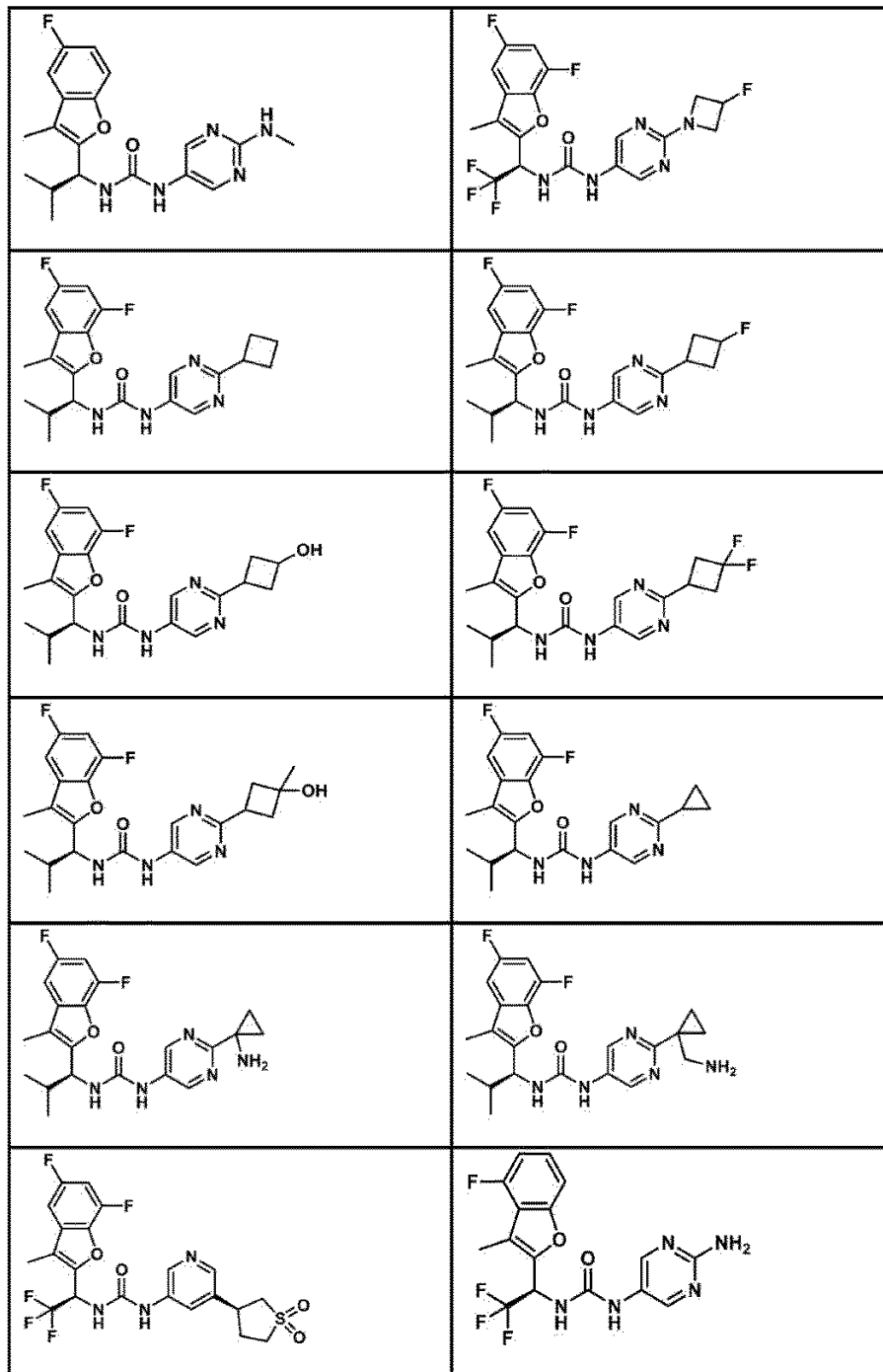
20

30

40

50

【表 2 - 16】



10

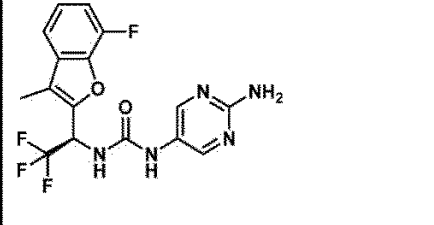
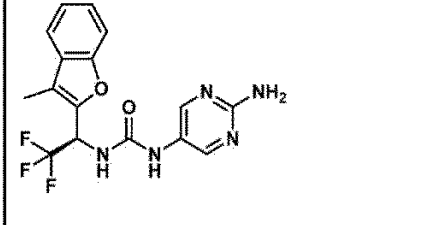
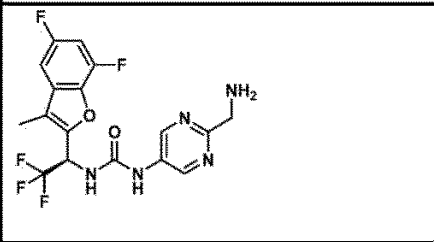
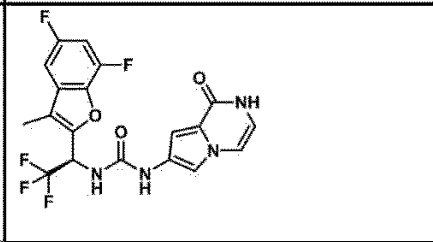
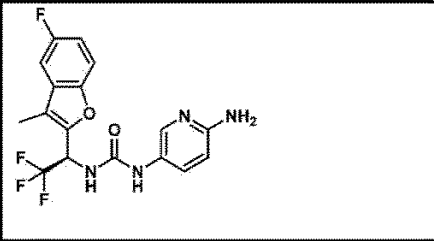
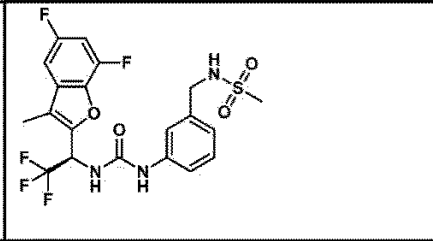
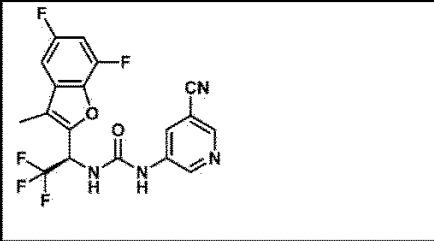
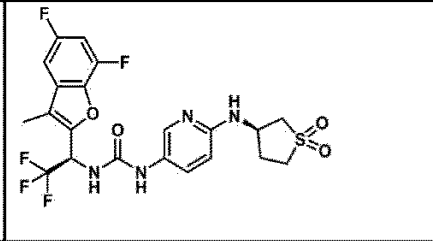
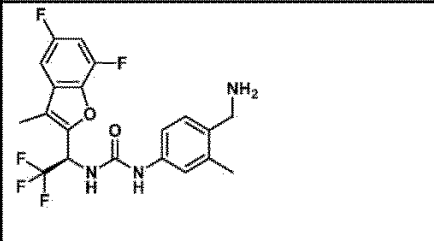
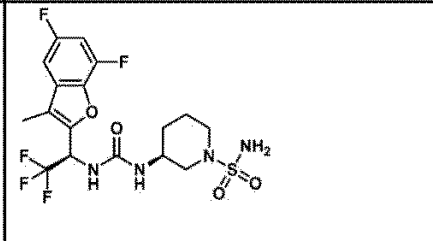
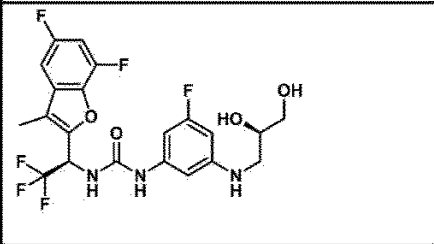
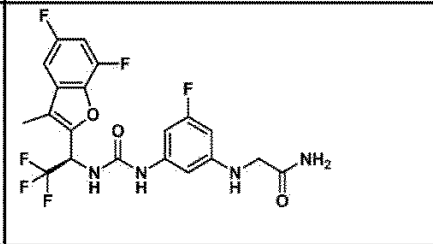
20

30

40

50

【表 2 - 17】

10

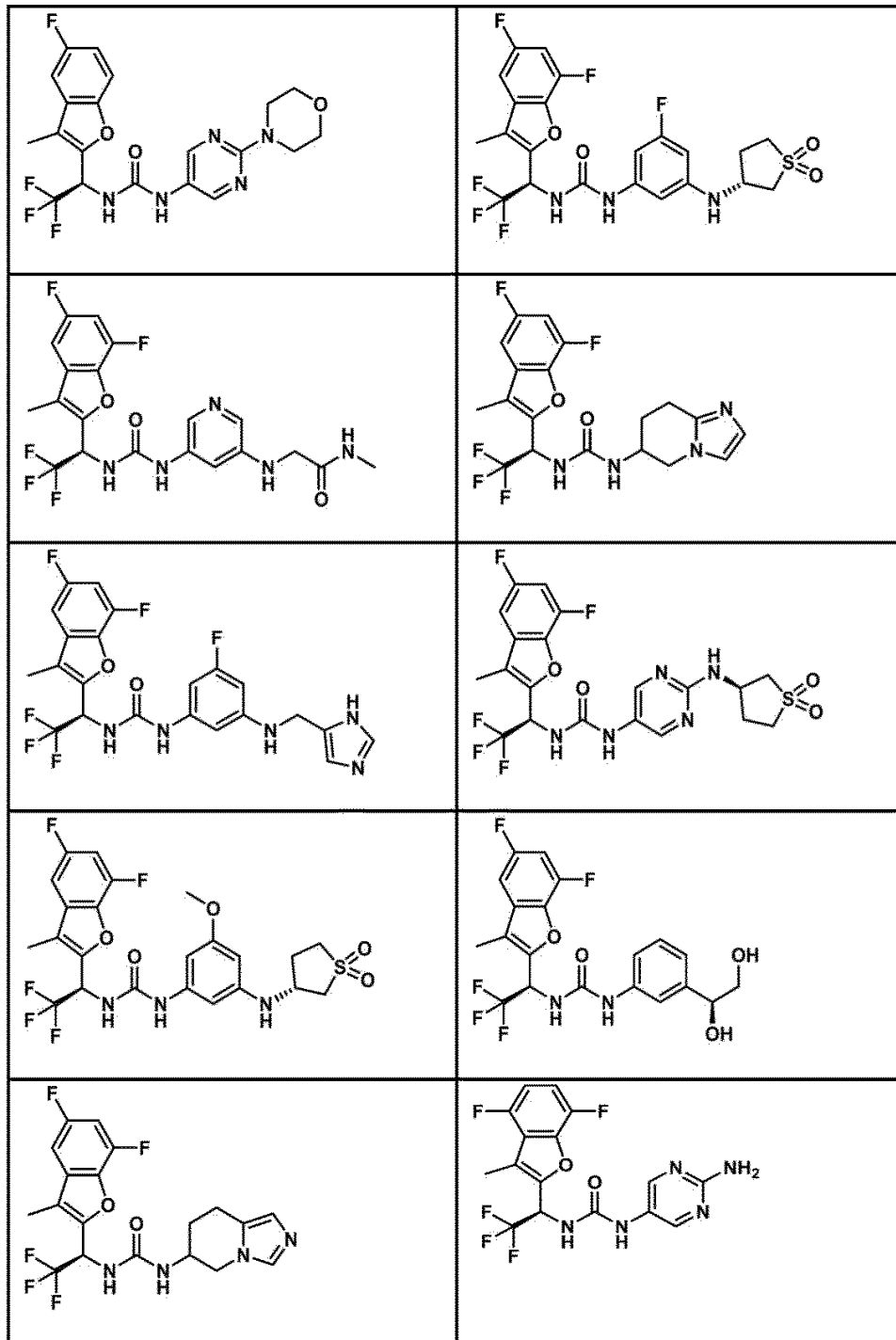
20

30

40

50

【表 2 - 18】



10

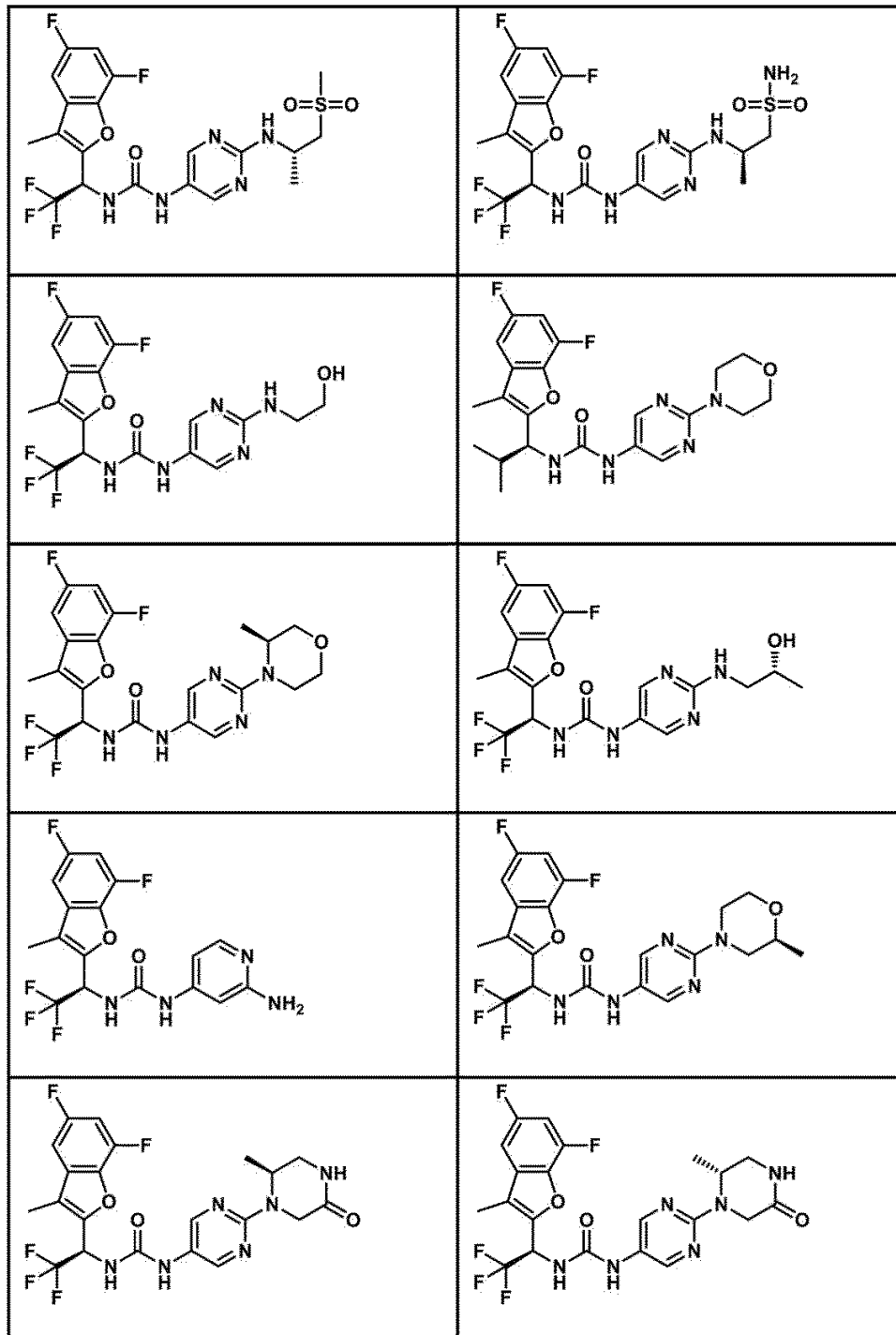
20

30

40

50

【表 2 - 19】



10

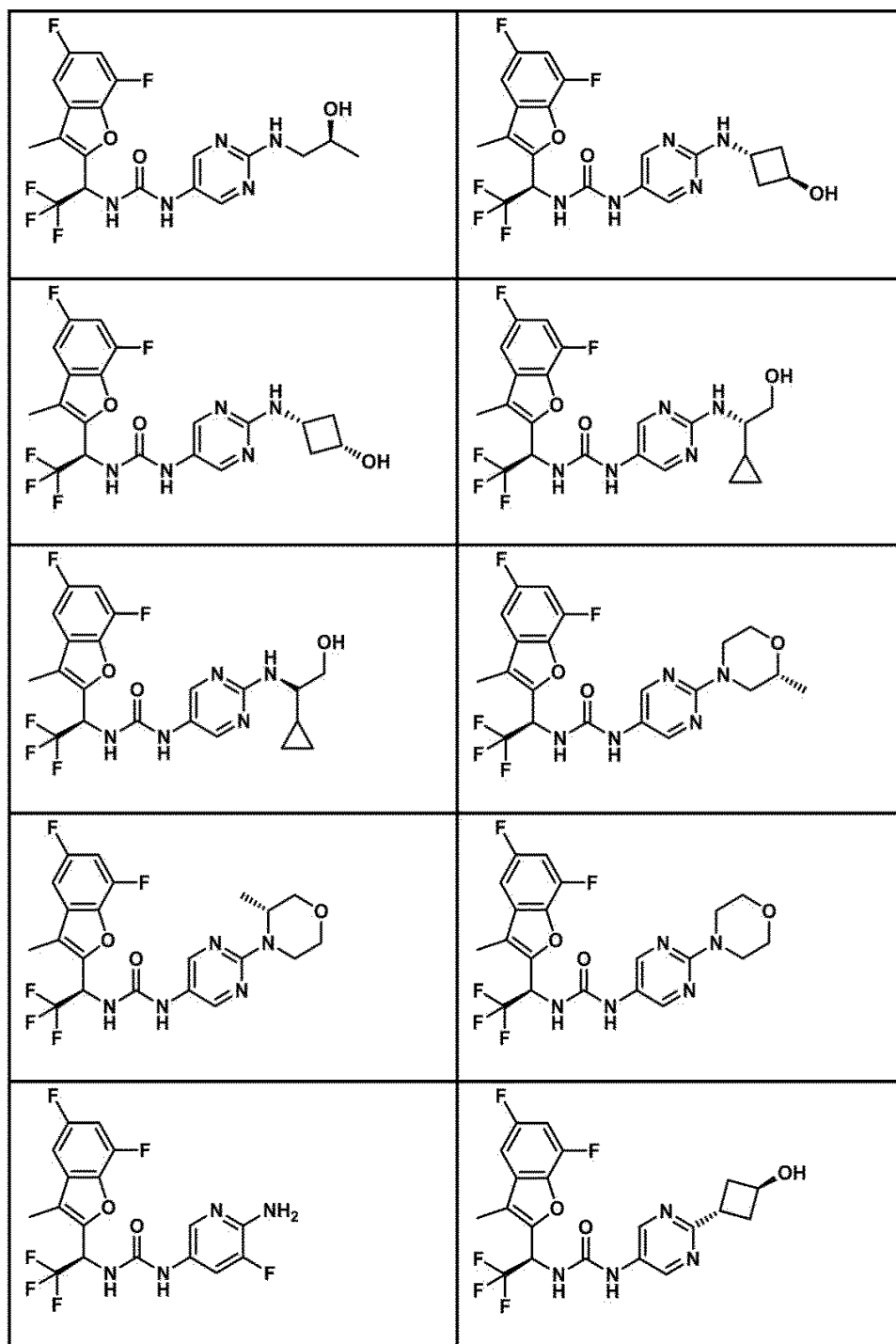
20

30

40

50

【表 2 - 20】



10

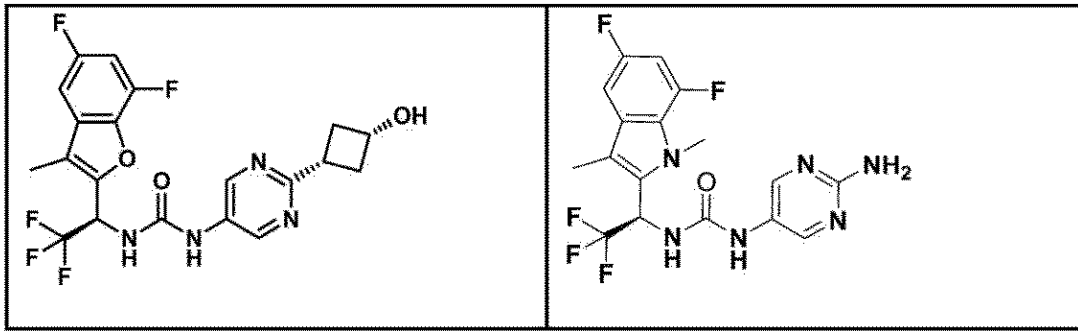
20

30

40

50

【表 2 - 2 1】



10

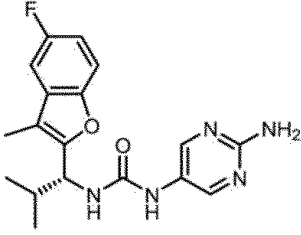
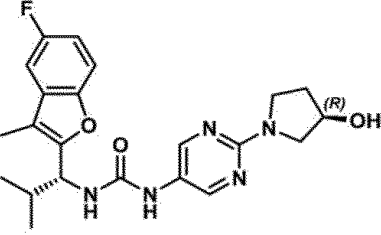
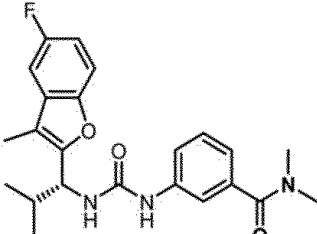
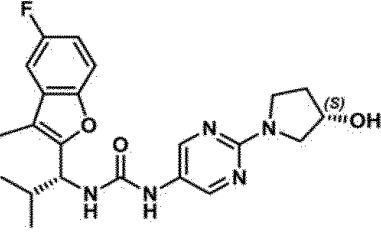
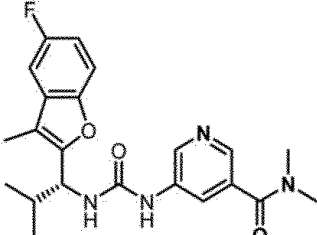
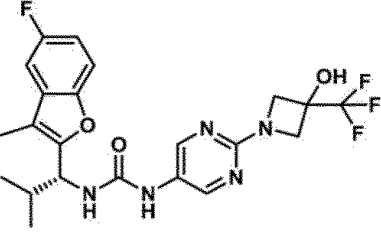
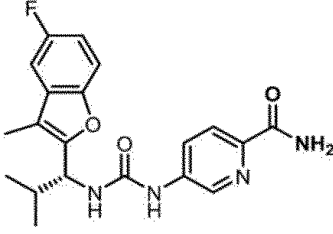
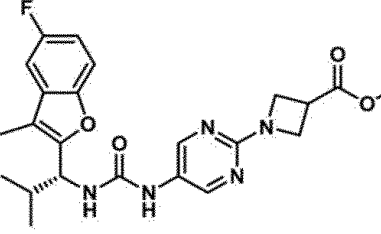
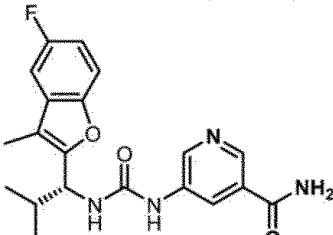
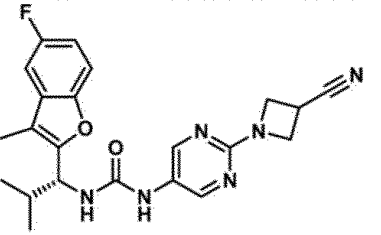
20

30

40

50

【表 3 - 1】

構造	構造
	
	
	
	
	

10

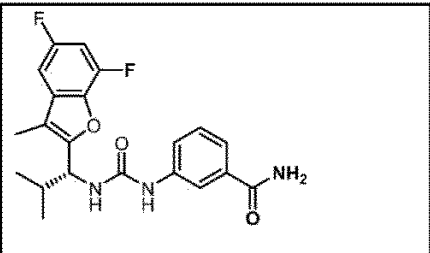
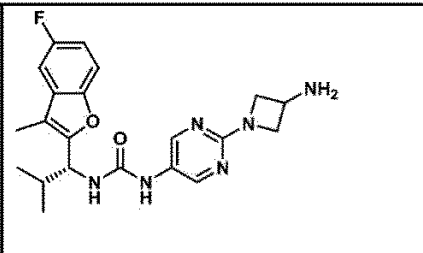
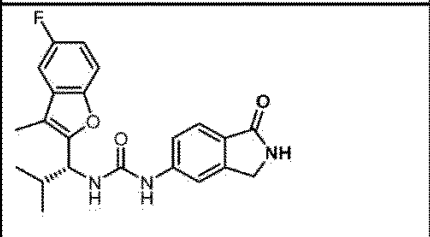
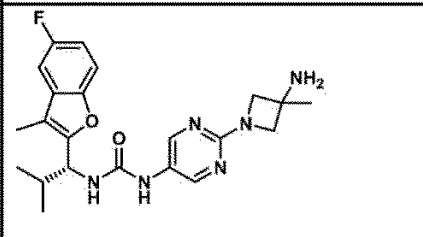
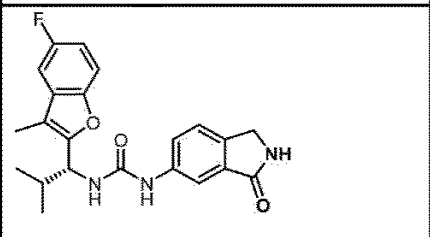
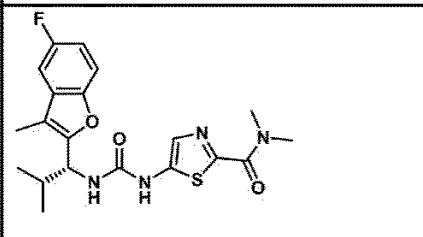
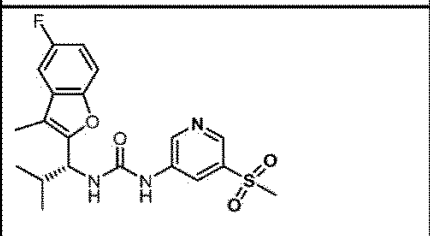
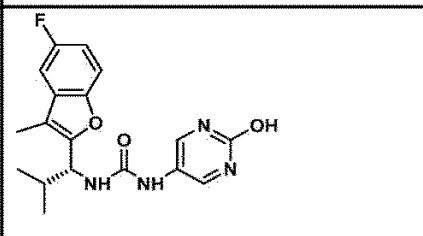
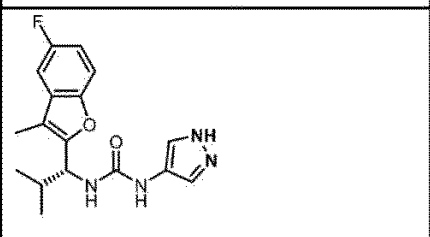
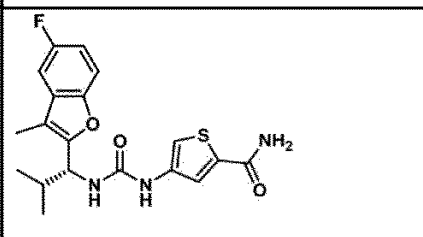
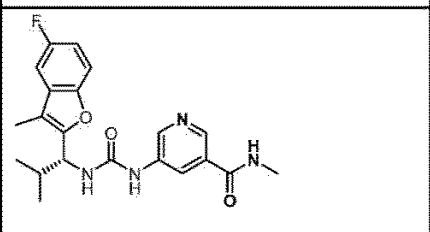
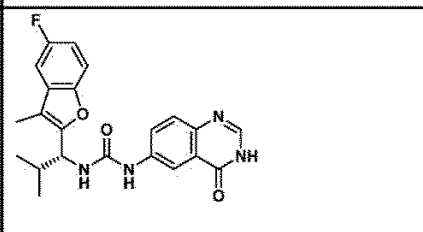
20

30

40

50

【表 3 - 2】

10

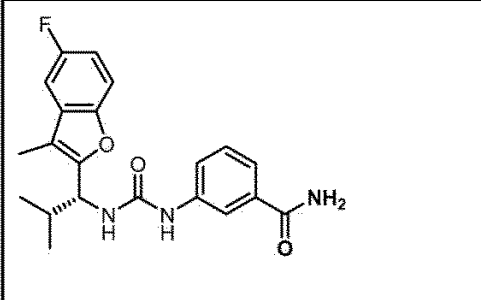
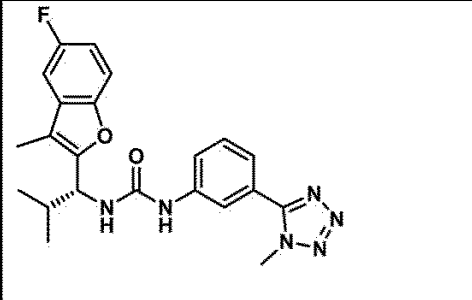
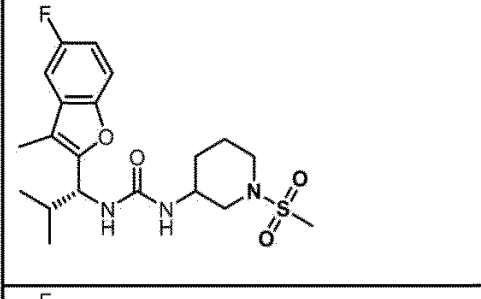
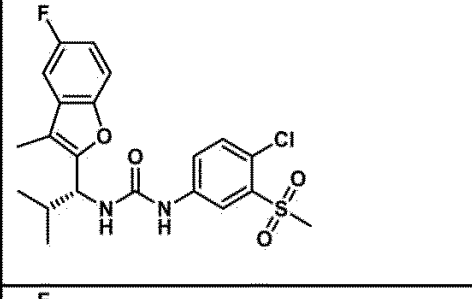
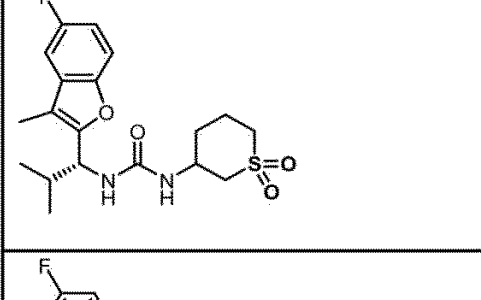
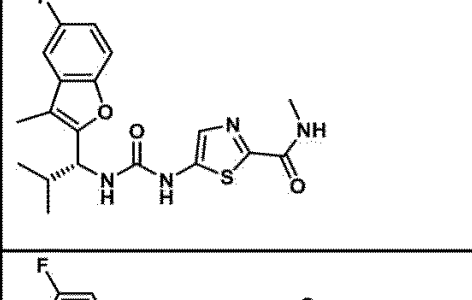
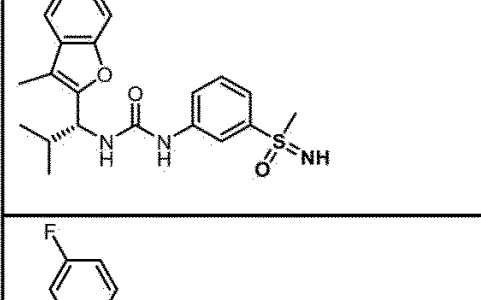
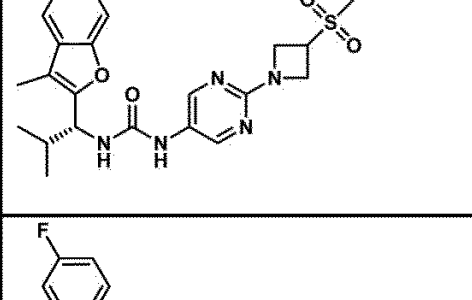
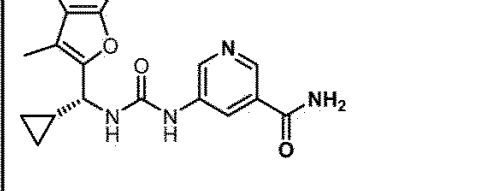
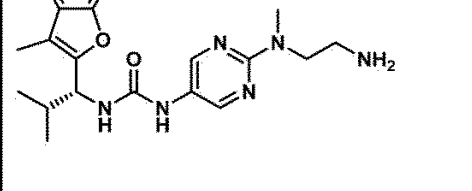
20

30

40

50

【表 3 - 3】

10

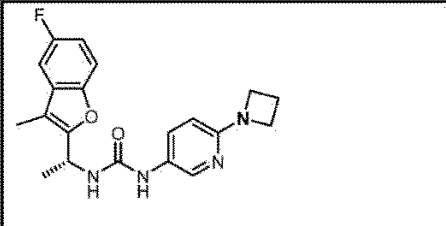
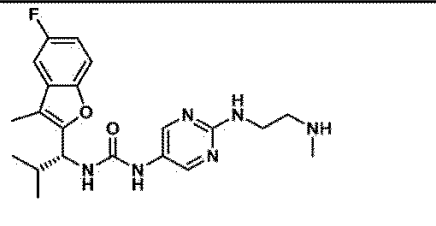
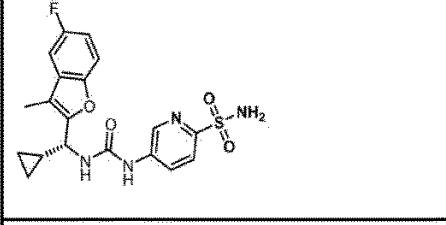
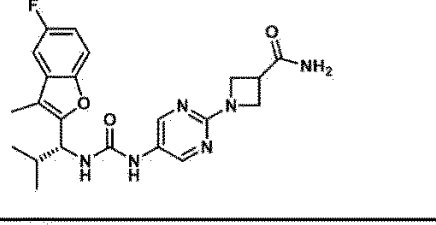
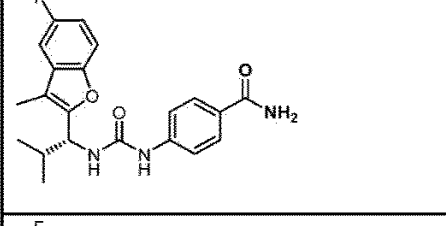
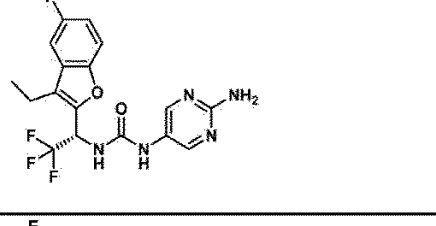
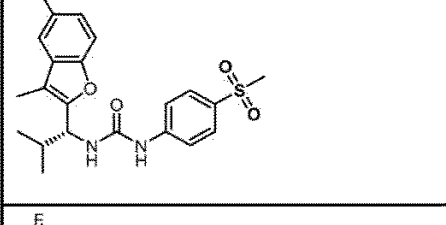
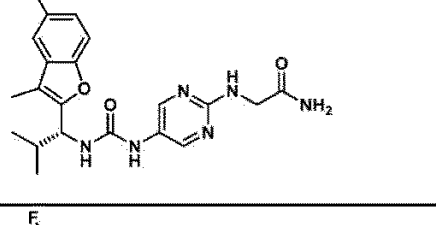
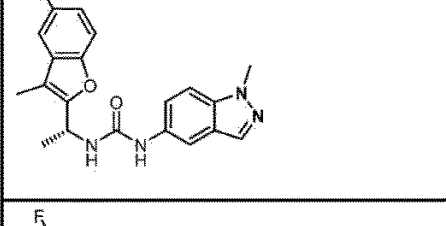
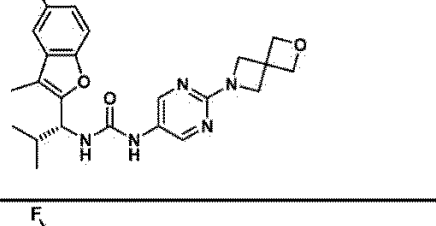
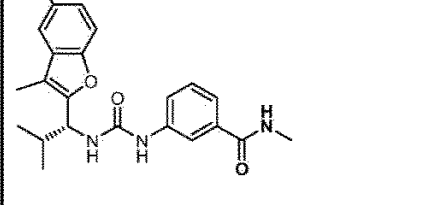
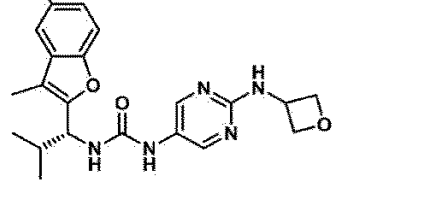
20

30

40

50

【表 3 - 4】

10

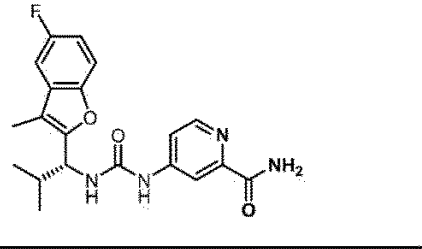
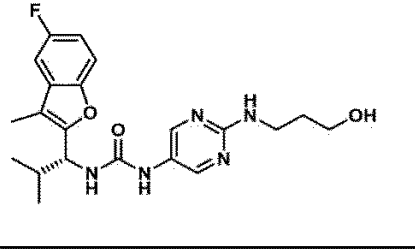
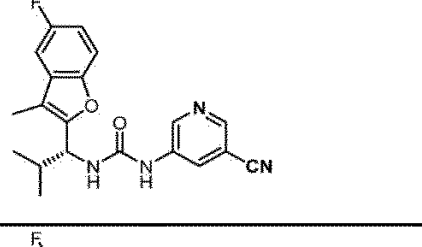
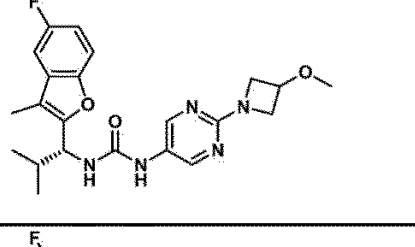
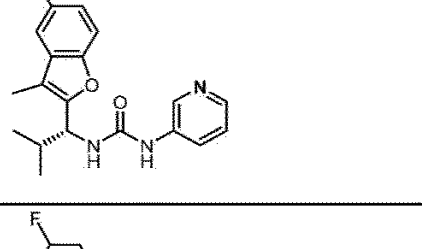
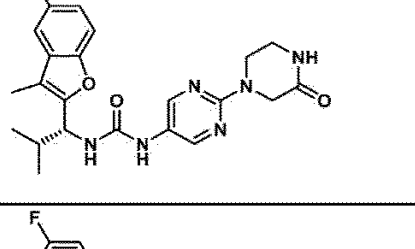
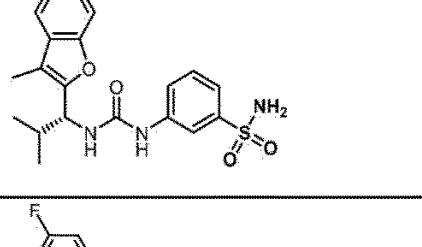
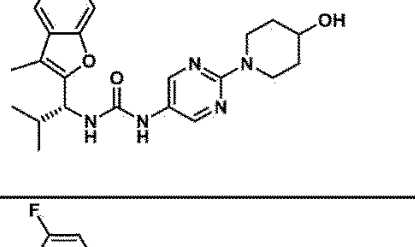
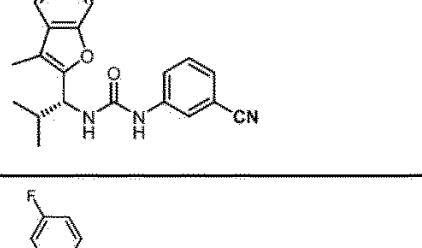
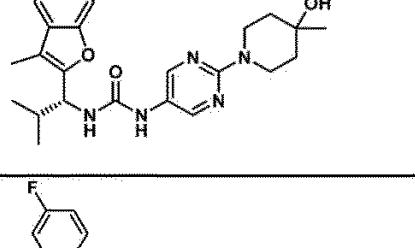
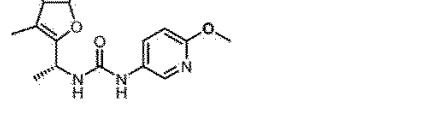
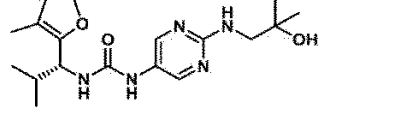
20

30

40

50

【表 3 - 5】

10

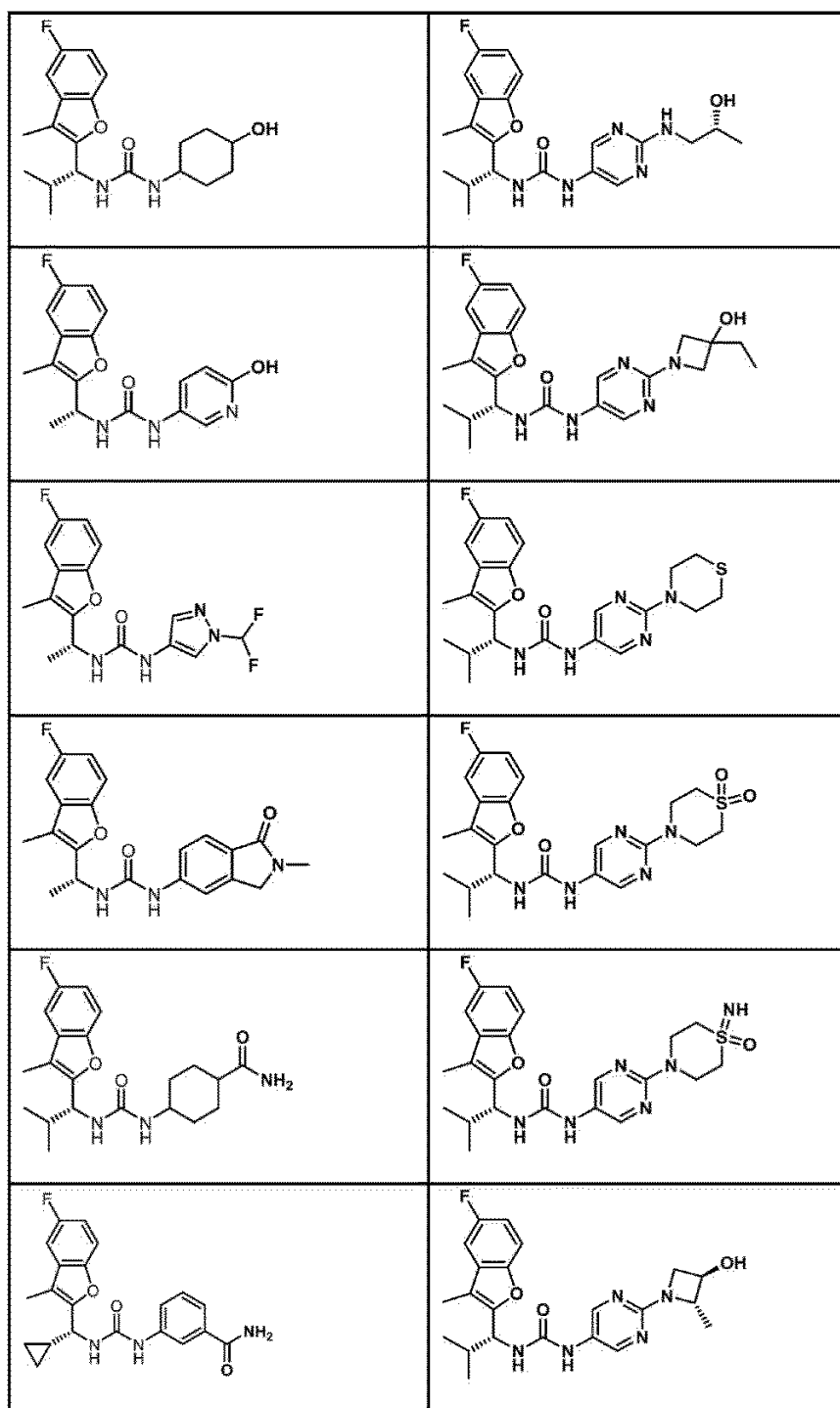
20

30

40

50

【表 3 - 6】



10

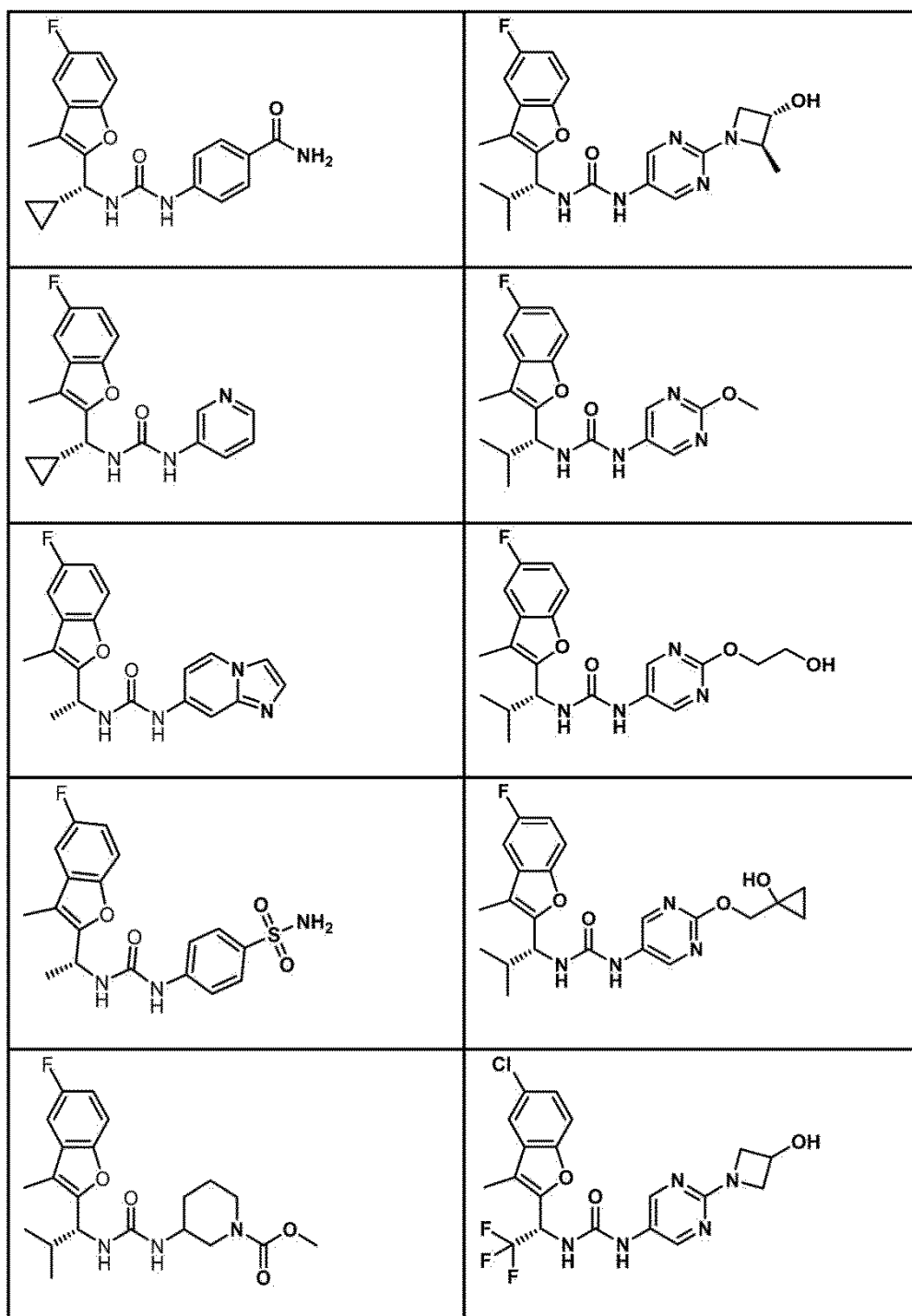
20

30

40

50

【表 3 - 7】



10

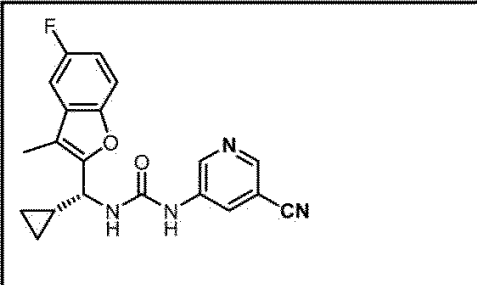
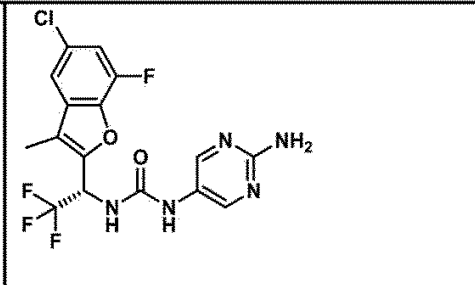
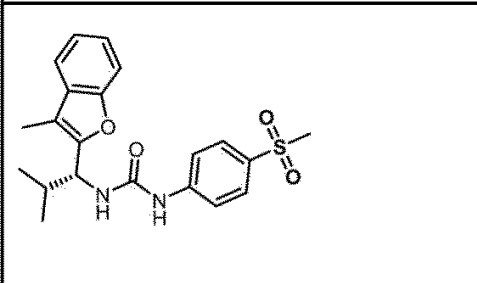
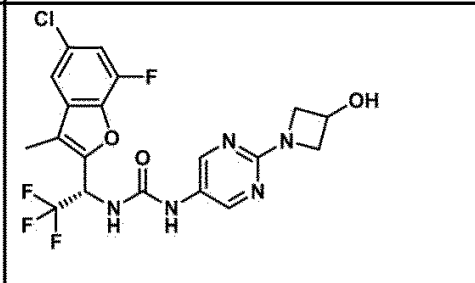
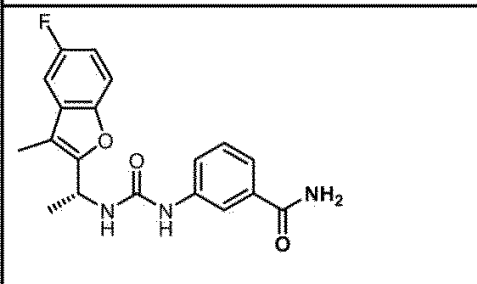
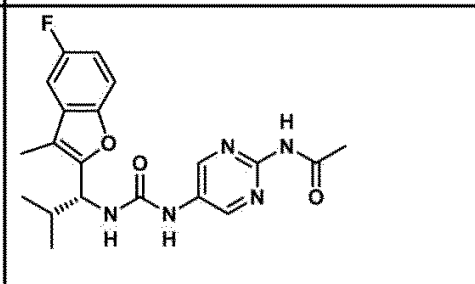
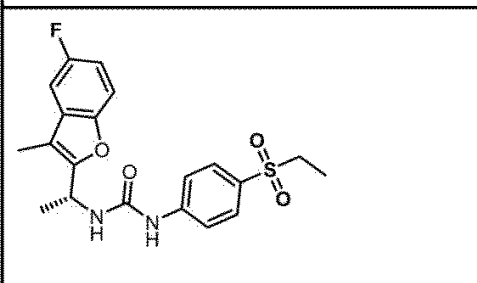
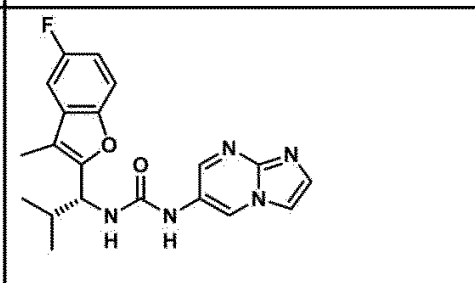
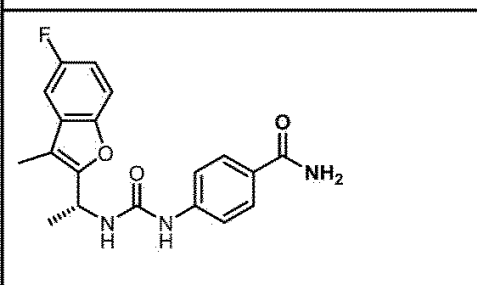
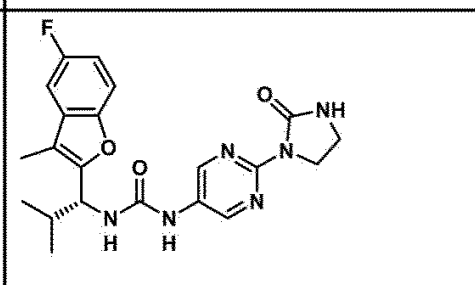
20

30

40

50

【表 3 - 8】

10

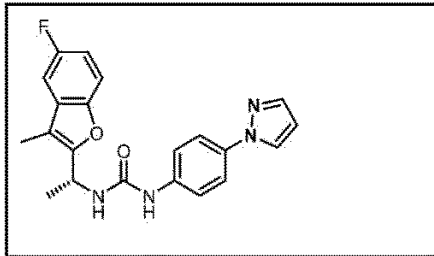
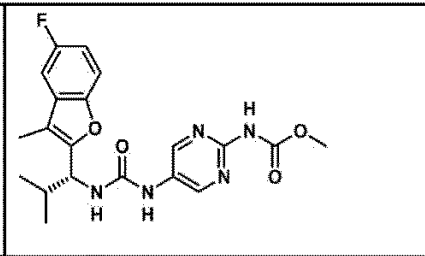
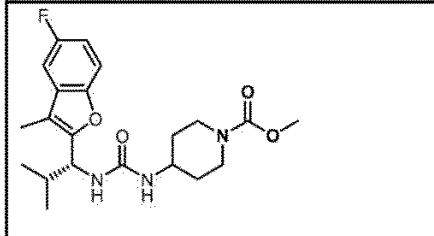
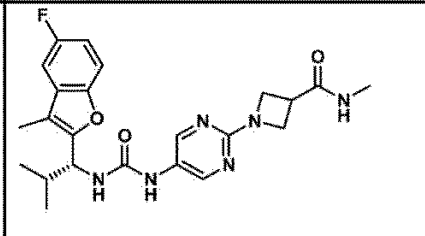
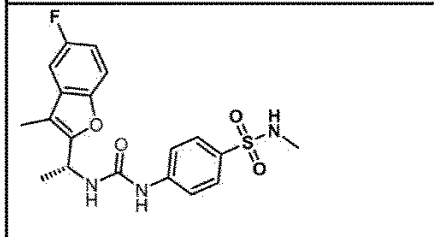
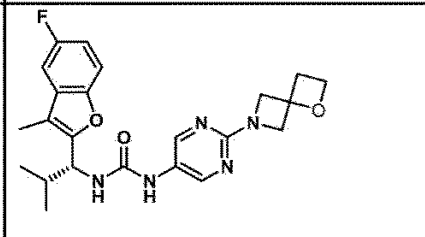
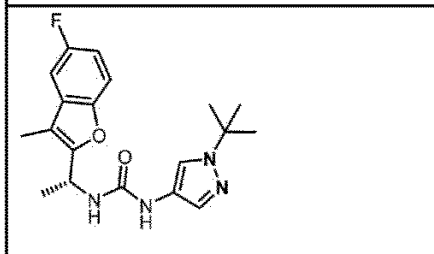
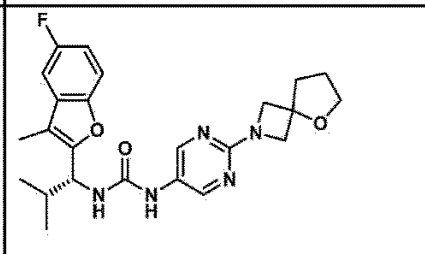
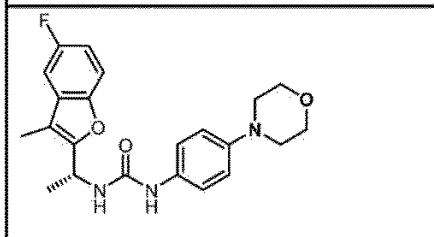
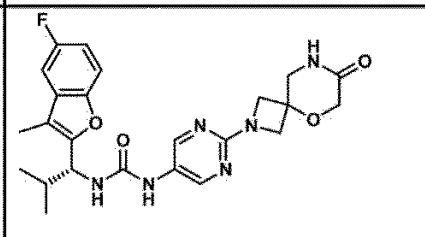
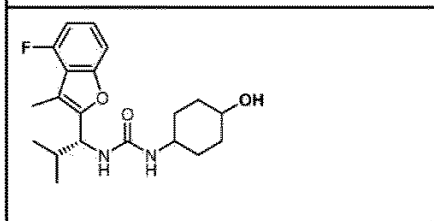
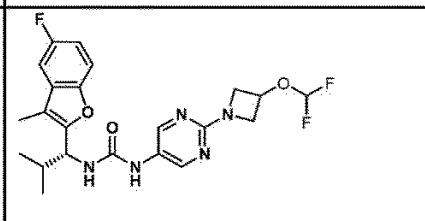
20

30

40

50

【表 3 - 9】

10

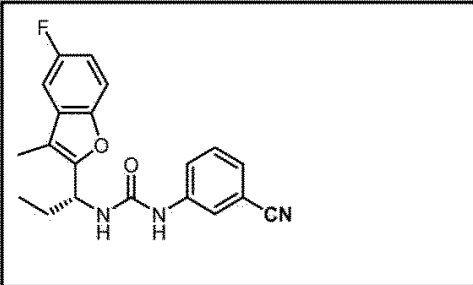
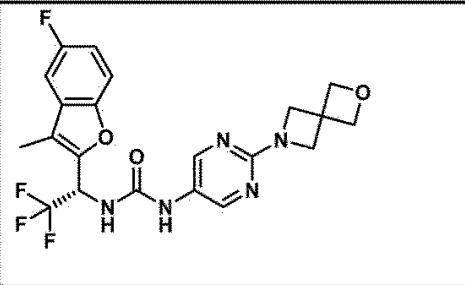
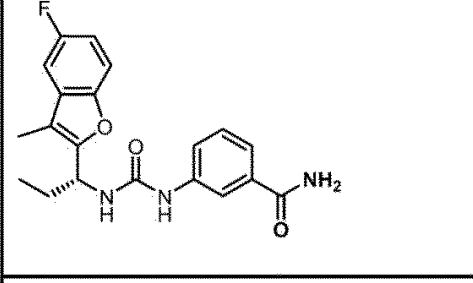
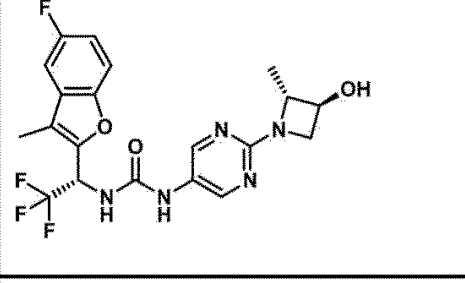
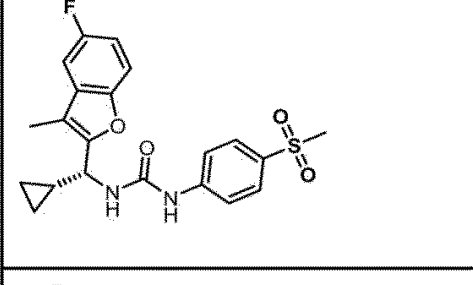
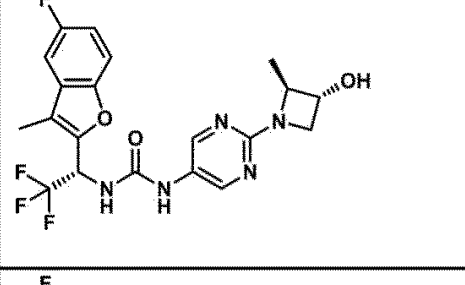
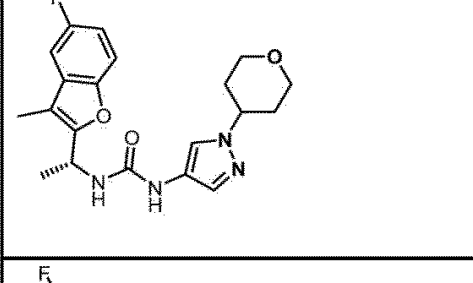
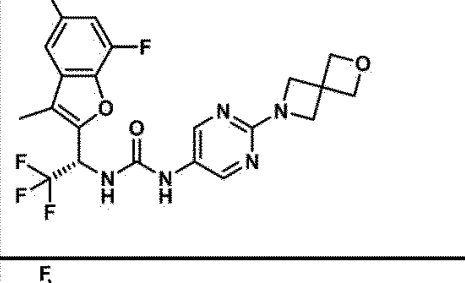
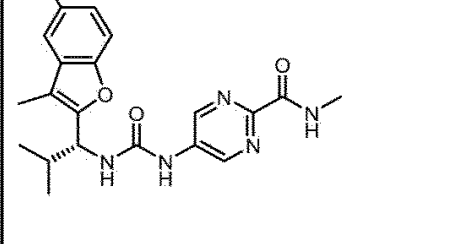
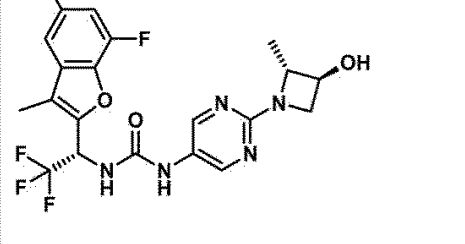
20

30

40

50

【表 3 - 10】

10

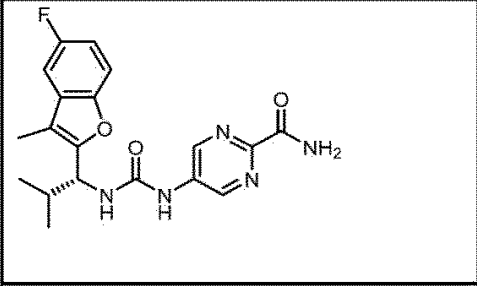
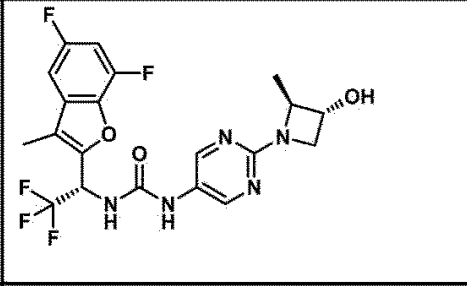
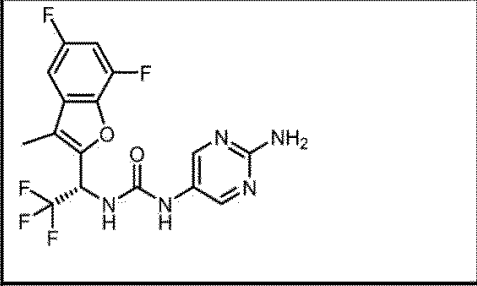
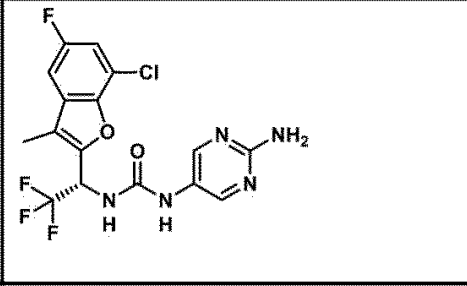
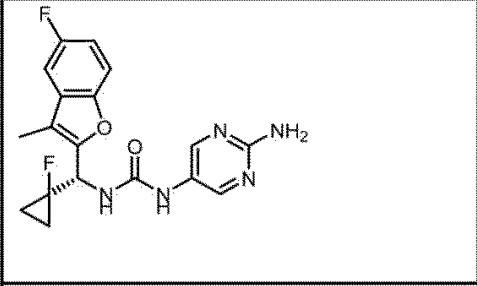
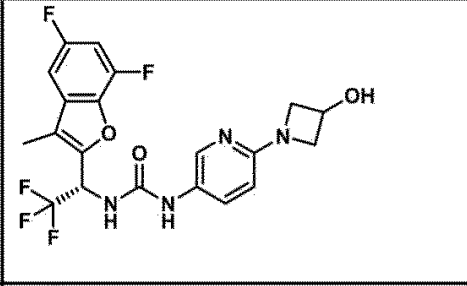
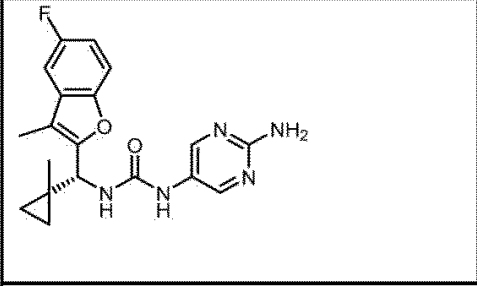
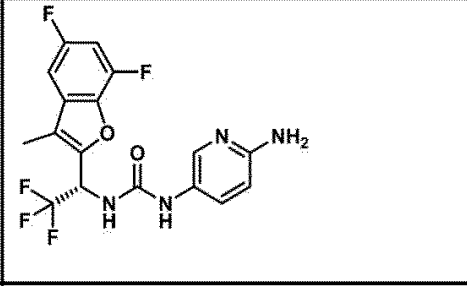
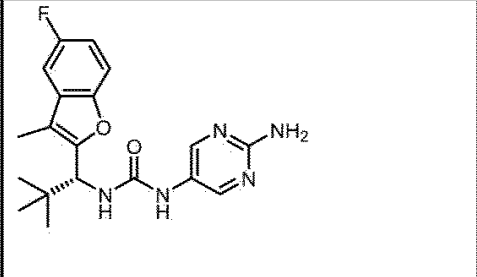
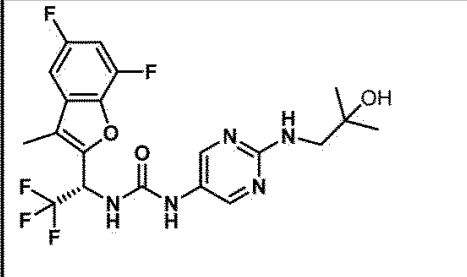
20

30

40

50

【表 3 - 1 1】

10

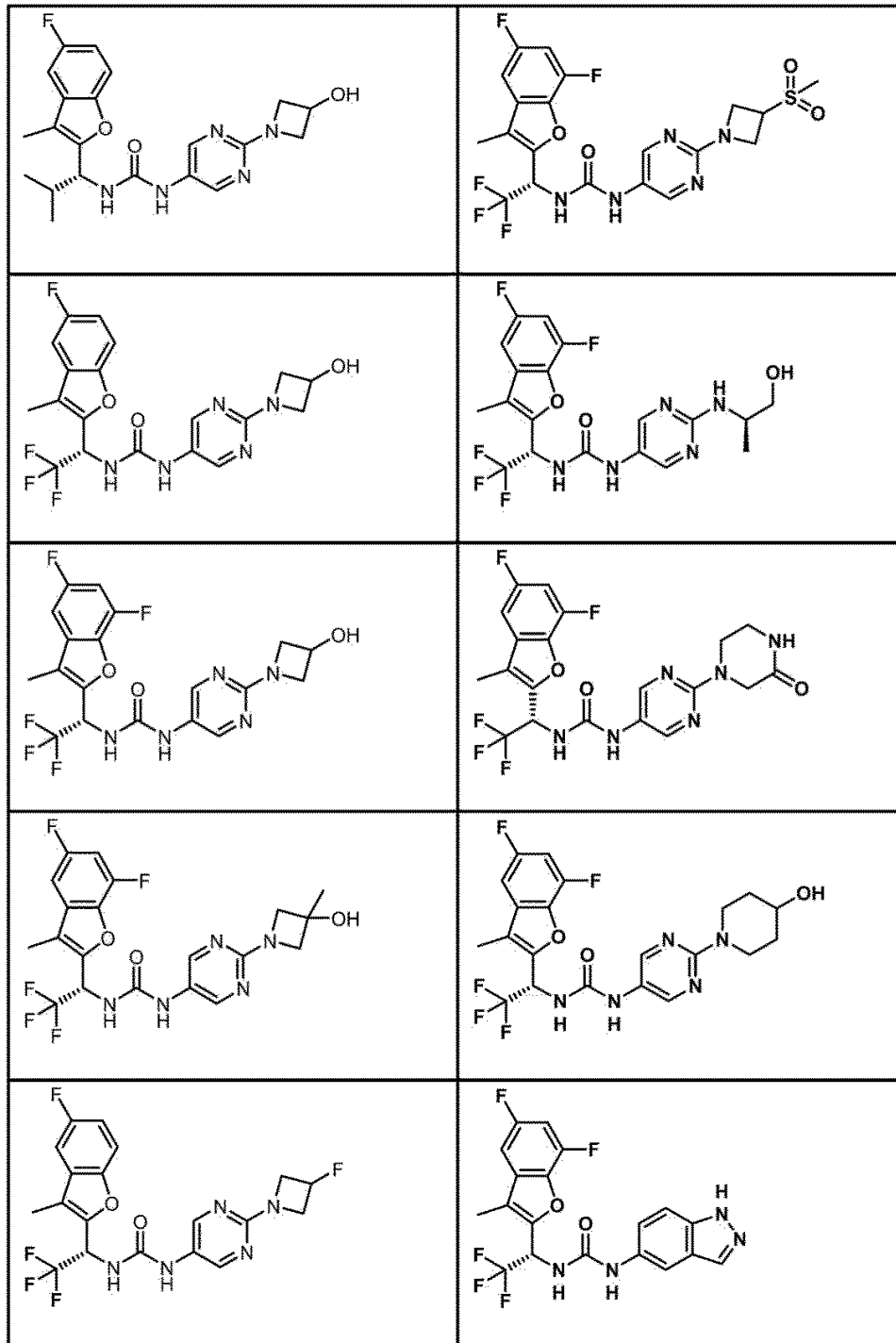
20

30

40

50

【表 3 - 1 2】



10

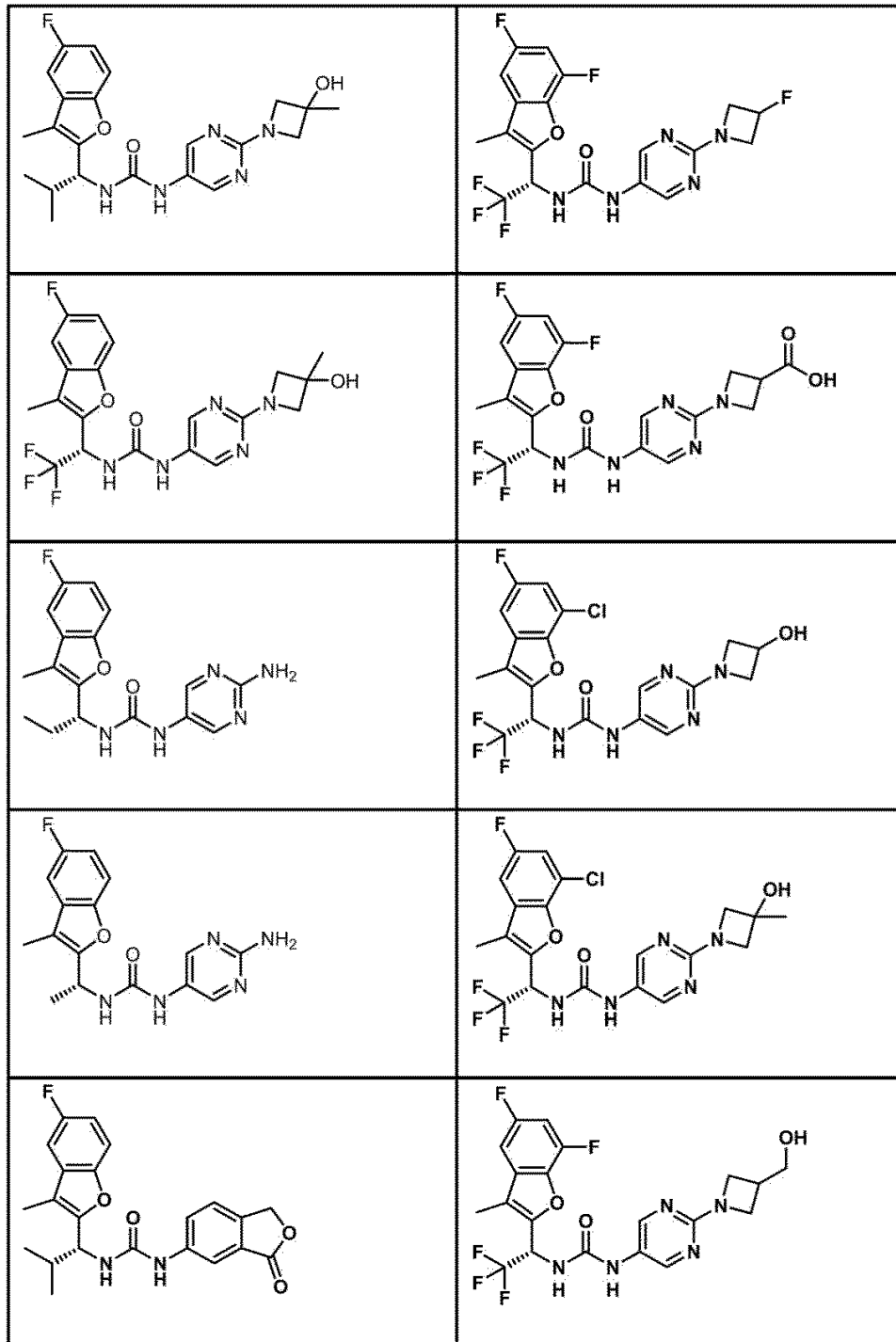
20

30

40

50

【表 3 - 1 3】



10

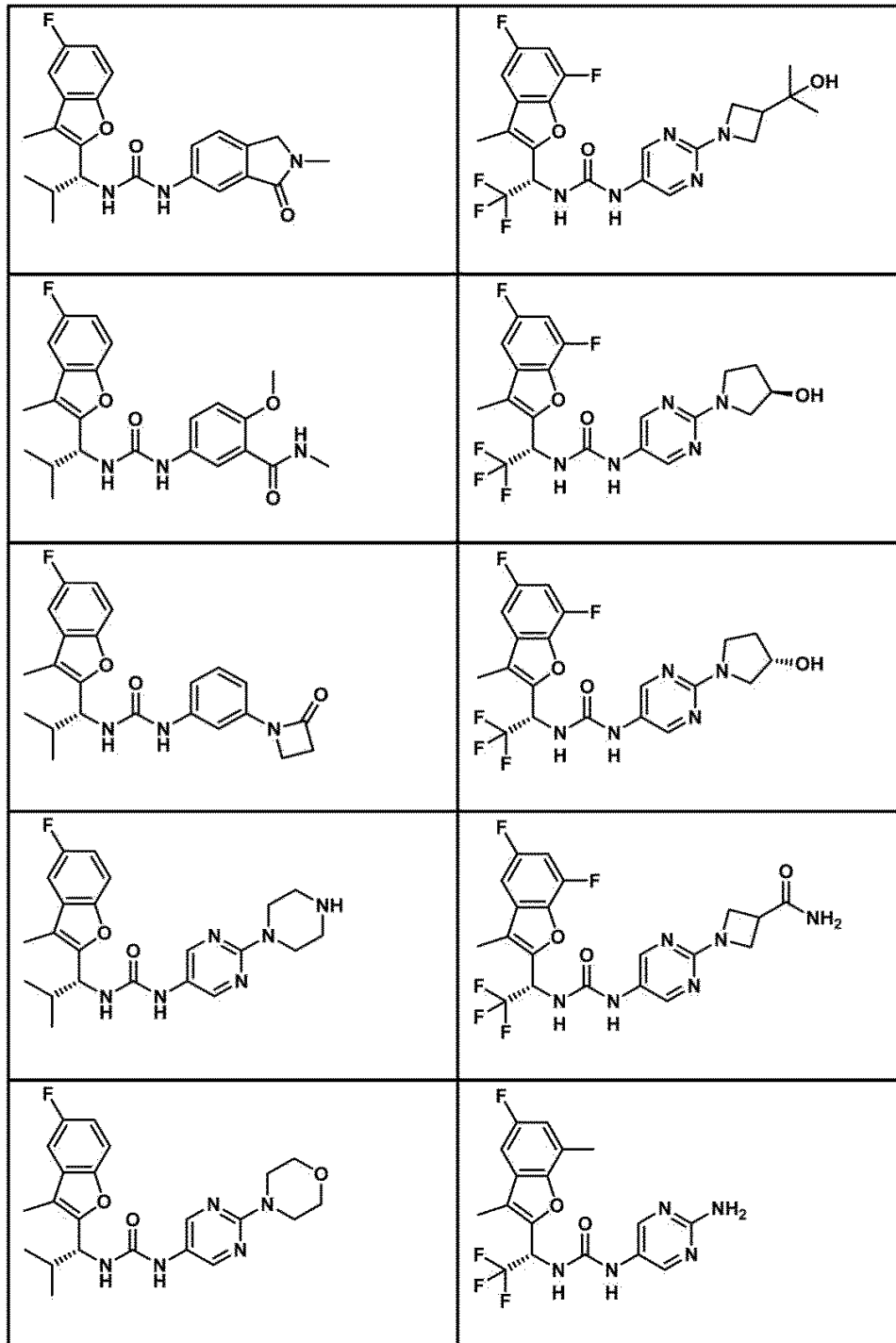
20

30

40

50

【表 3 - 1 4】



10

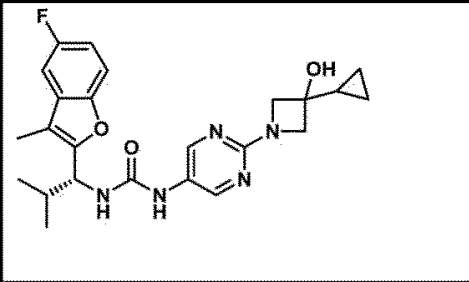
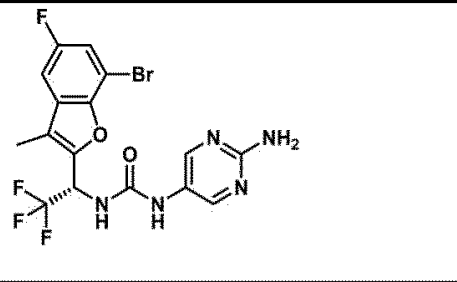
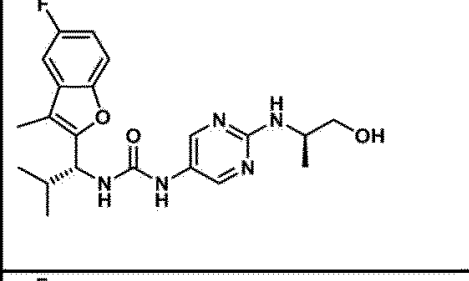
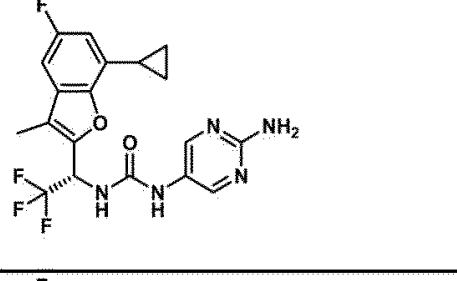
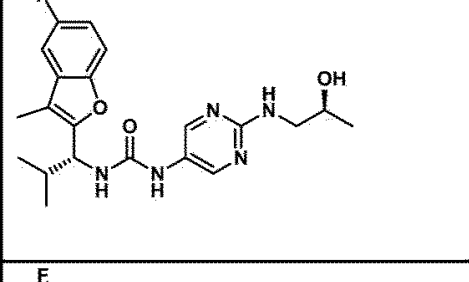
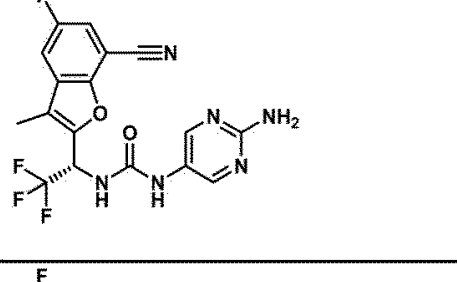
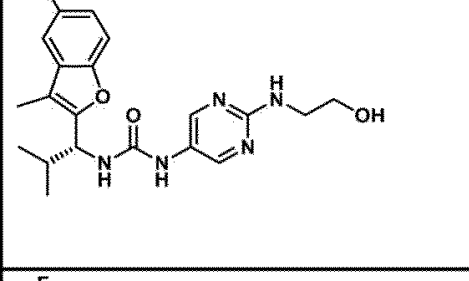
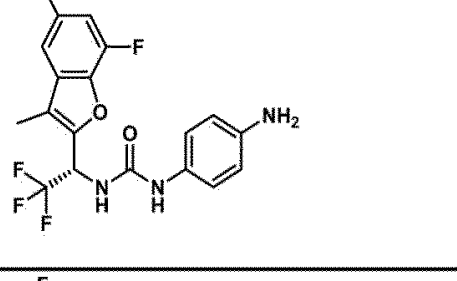
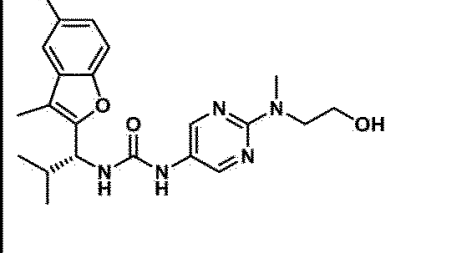
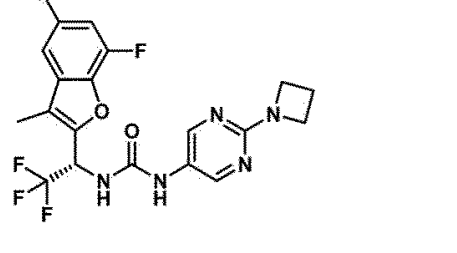
20

30

40

50

【表 3 - 15】

10

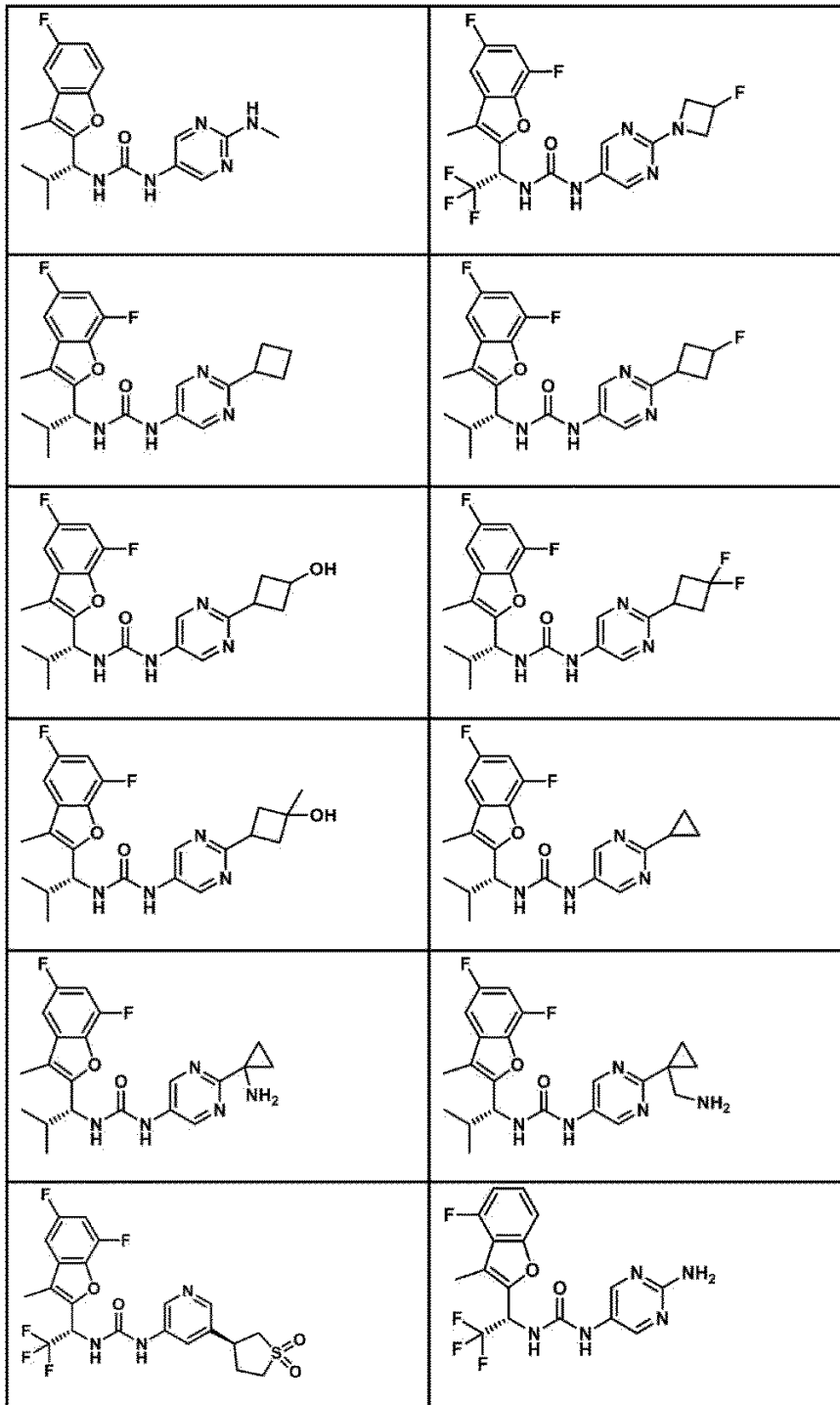
20

30

40

50

【表 3 - 1 6】



10

20

30

40

50

【表 3 - 17】


10

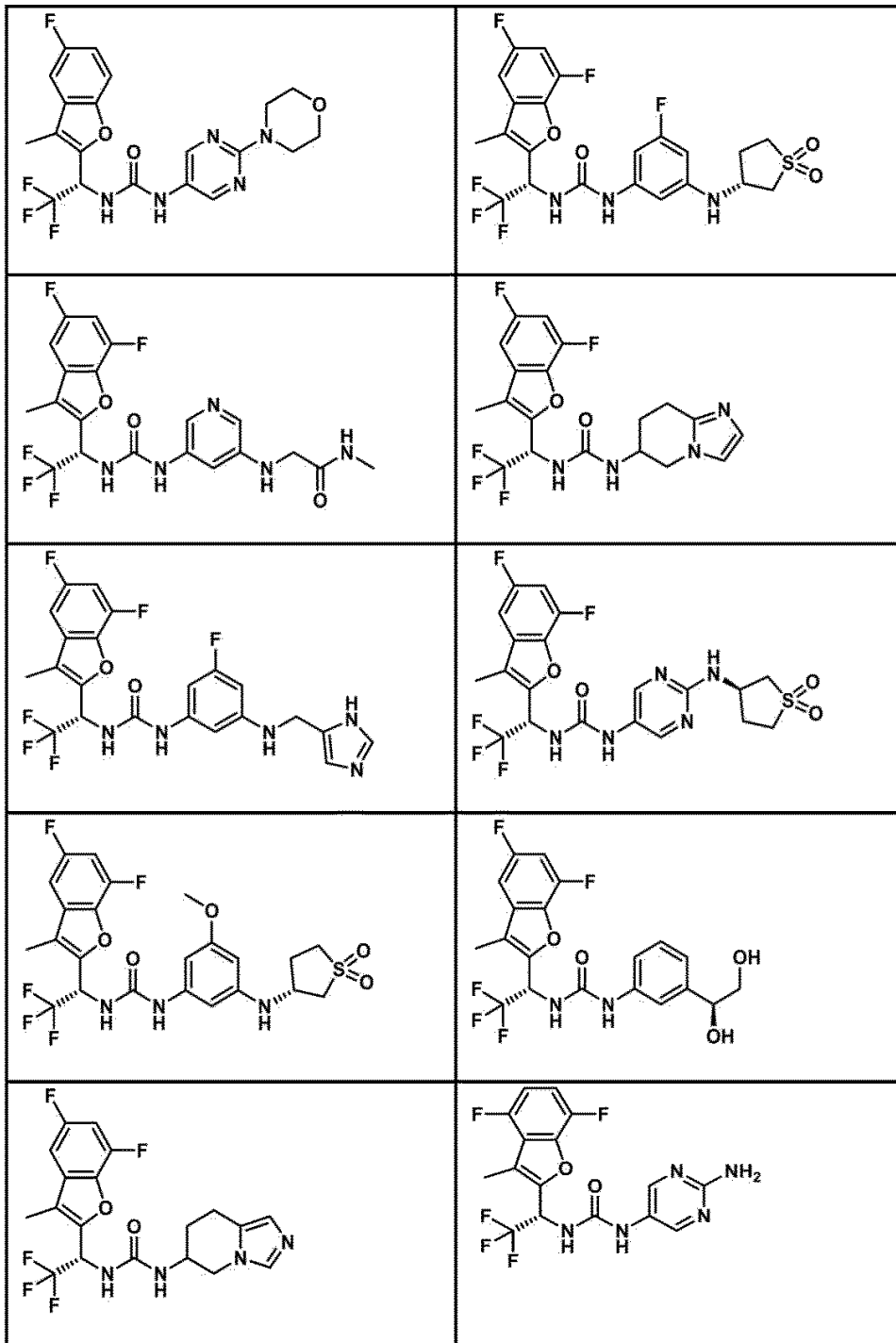
20

30

40

50

【表 3 - 18】



10

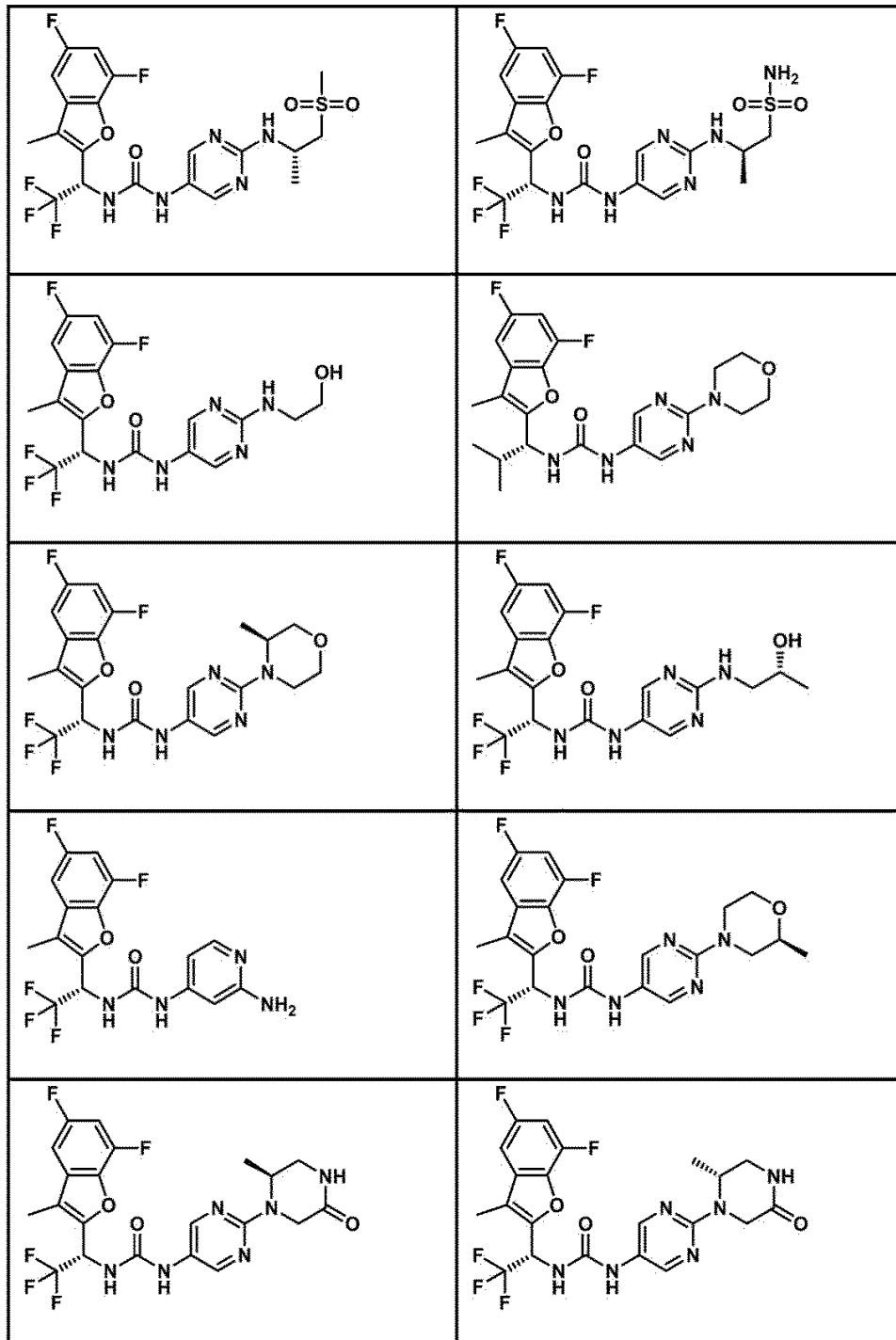
20

30

40

50

【表 3 - 19】



10

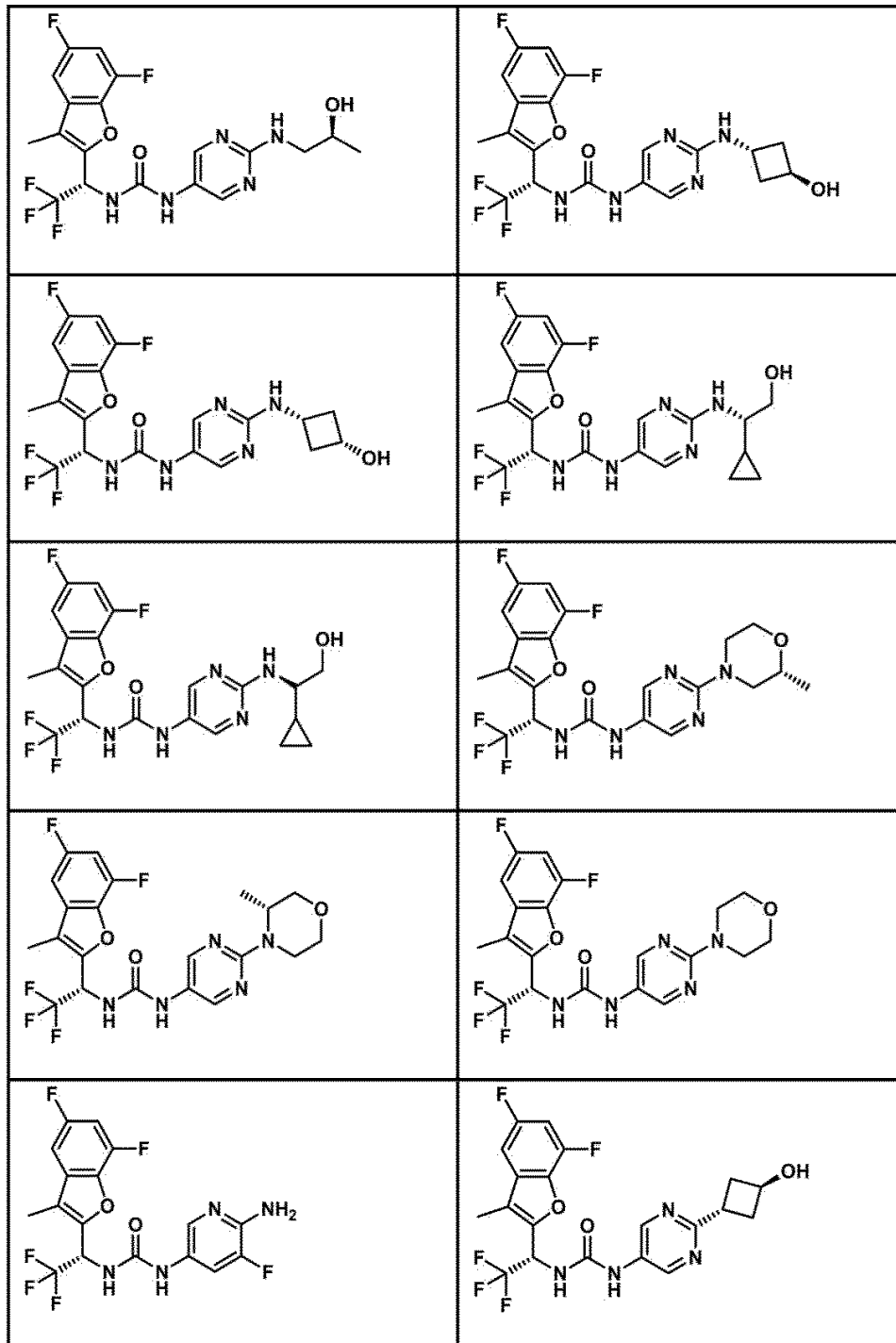
20

30

40

50

【表 3 - 20】



10

20

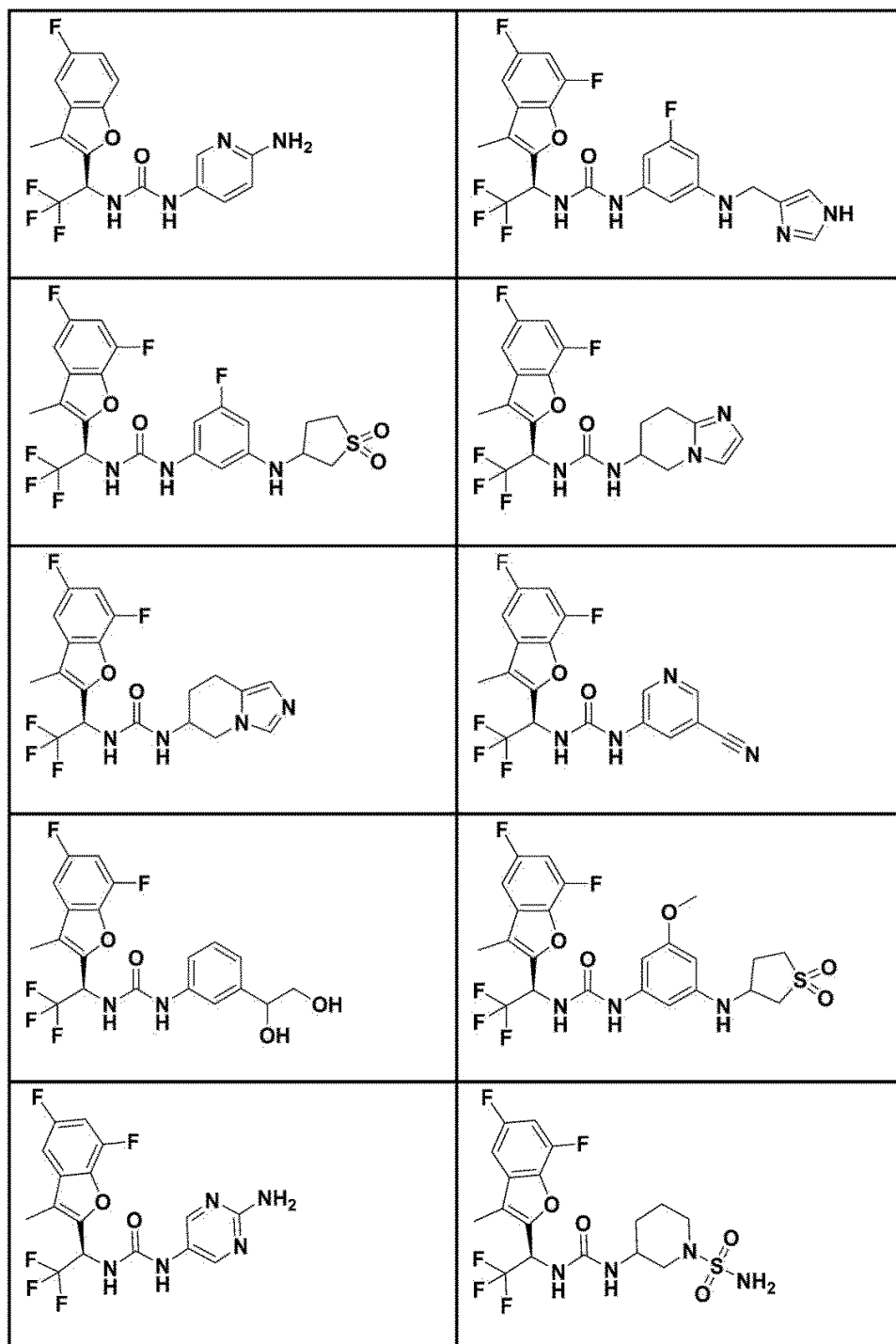
30

40

50



【表 4 - 1】



10

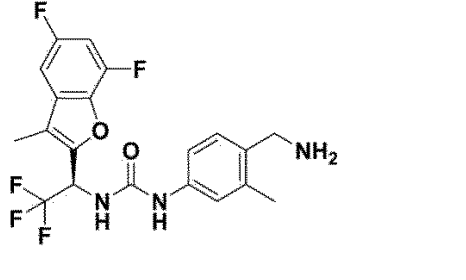
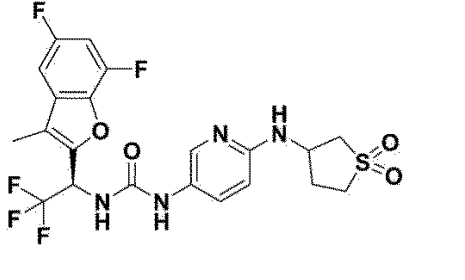
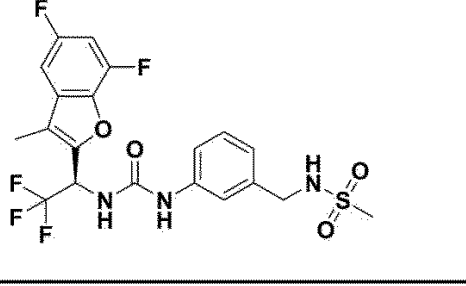
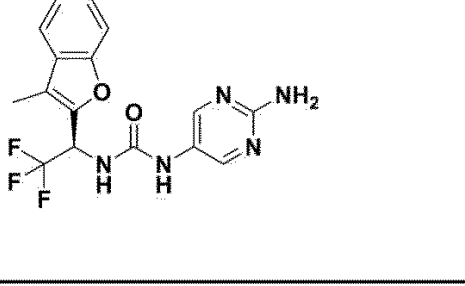
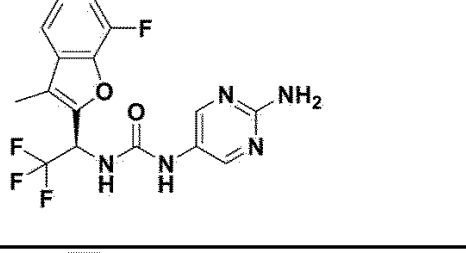
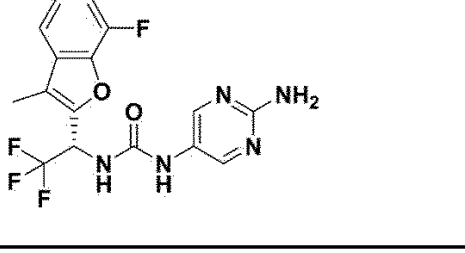
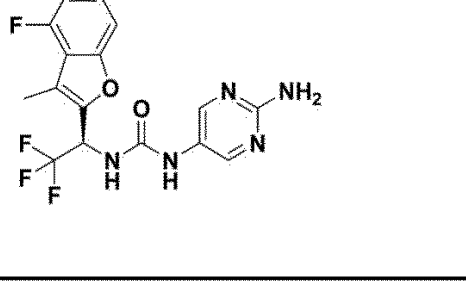
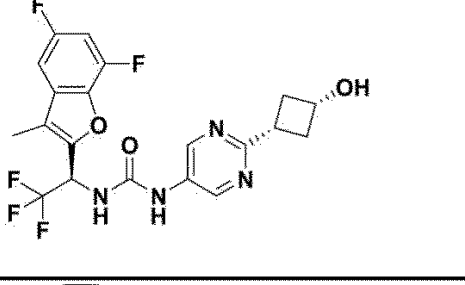
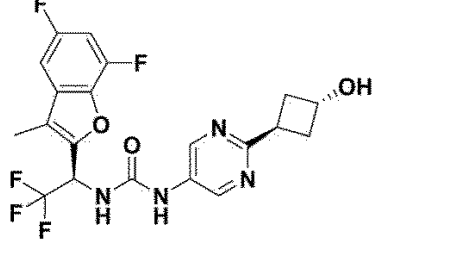
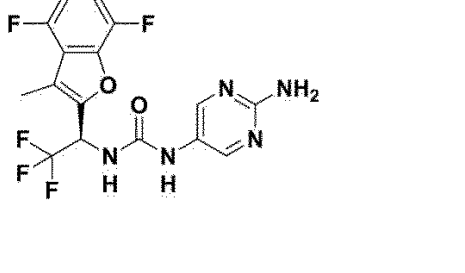
20

30

40

50

【表 4 - 2】

10

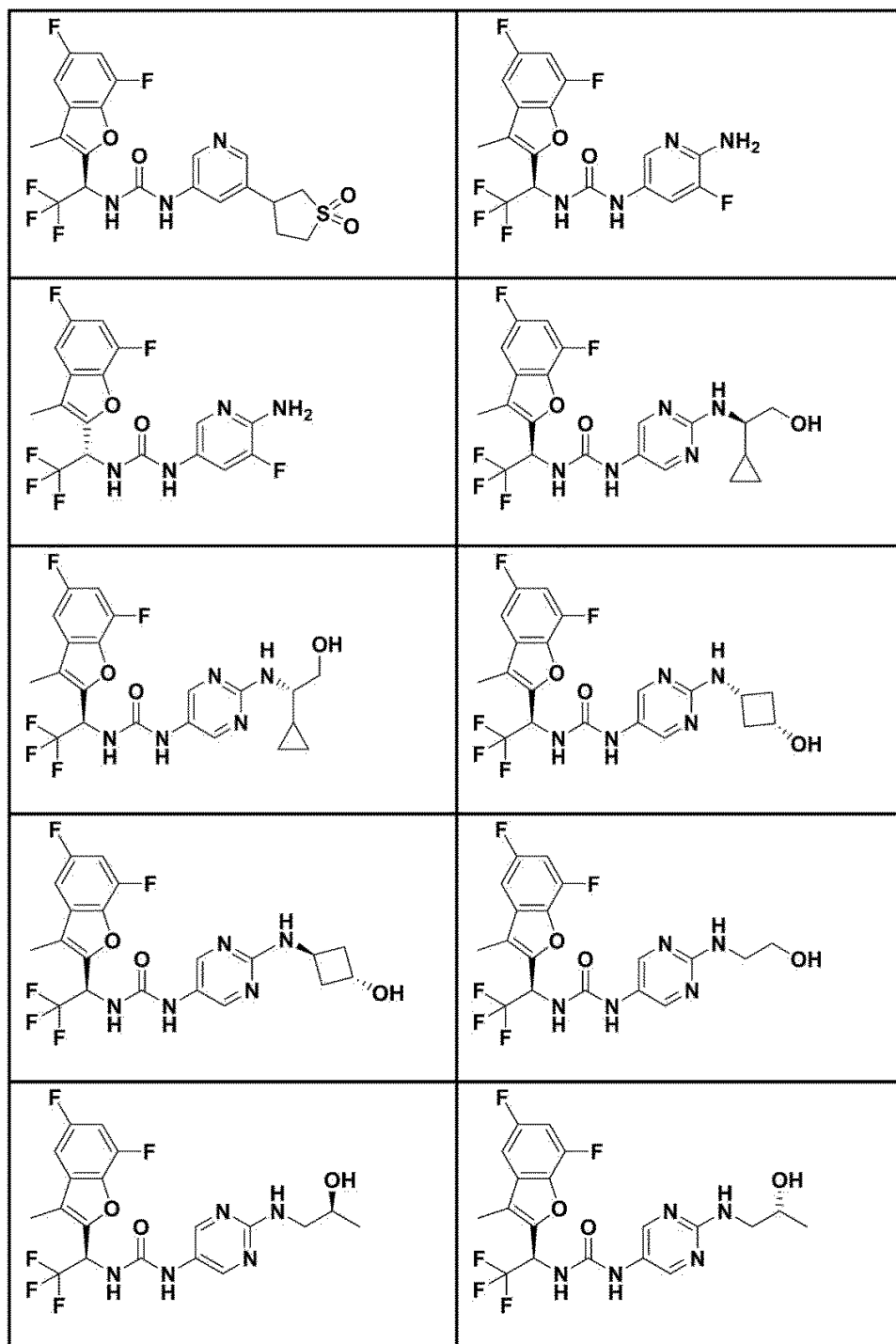
20

30

40

50

【表 4 - 3】



10

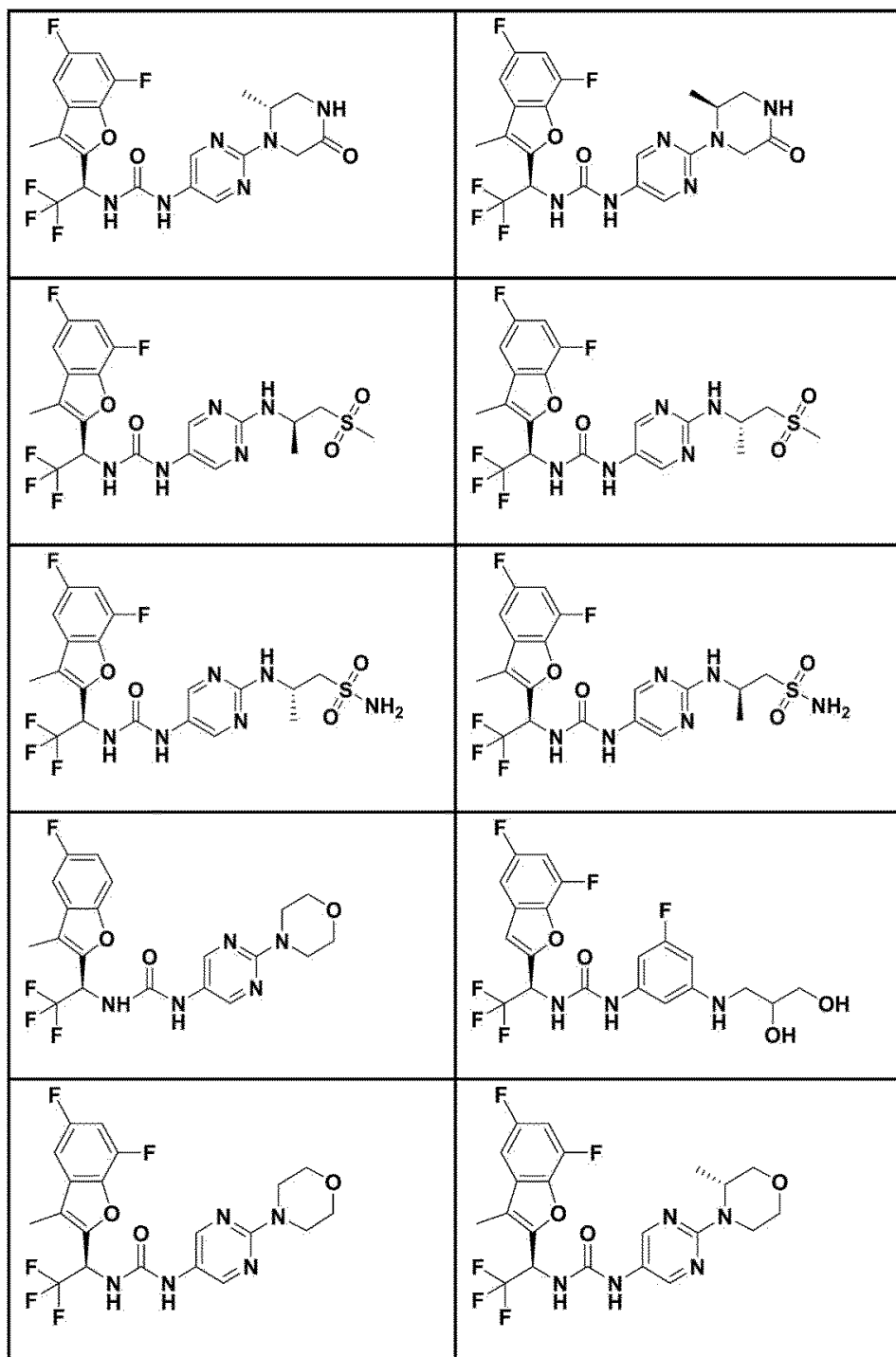
20

30

40

50

【表 4 - 4】



10

20

30

40

50

【表 4 - 5】


10

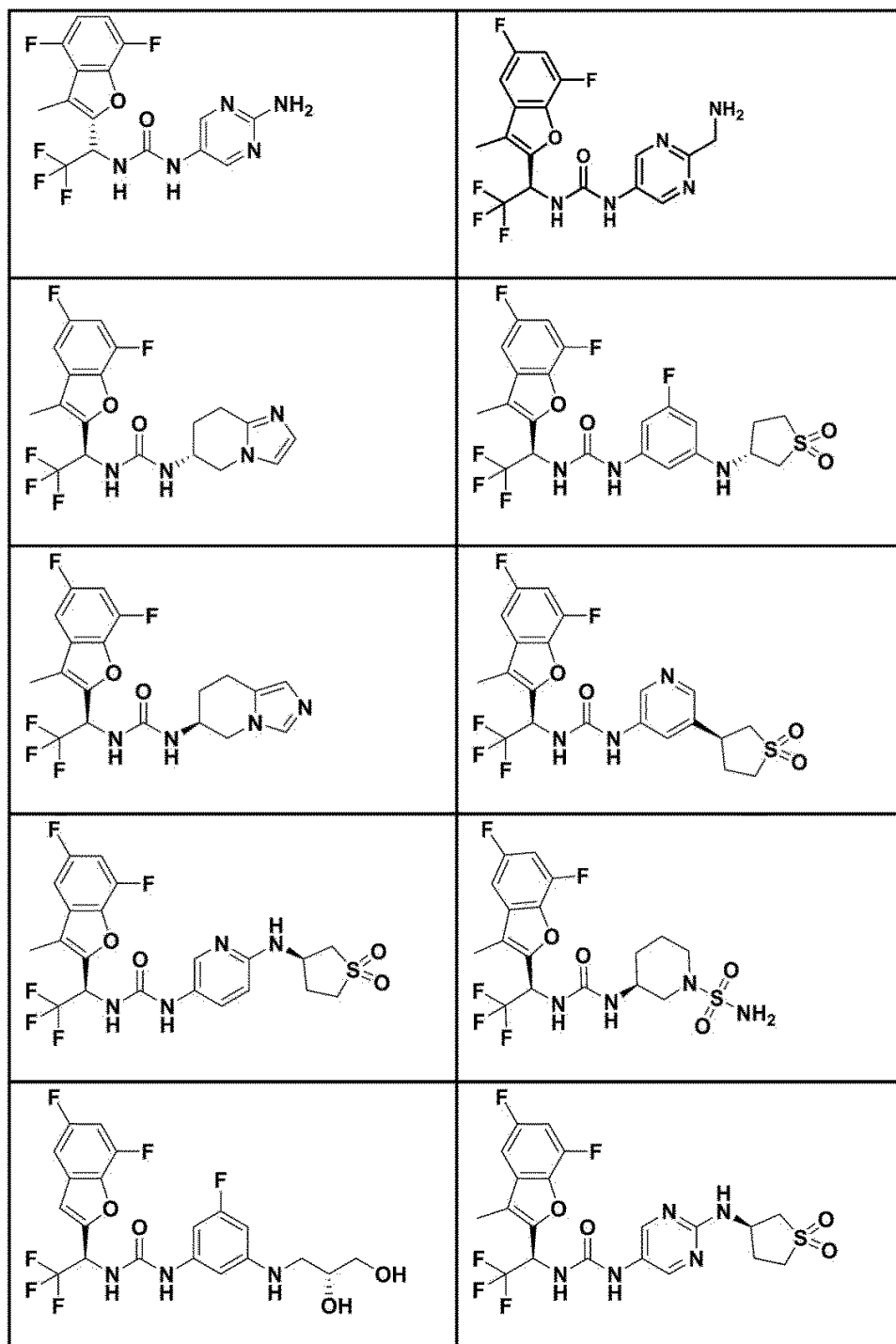
20

30

40

50

【表 4 - 6】



10

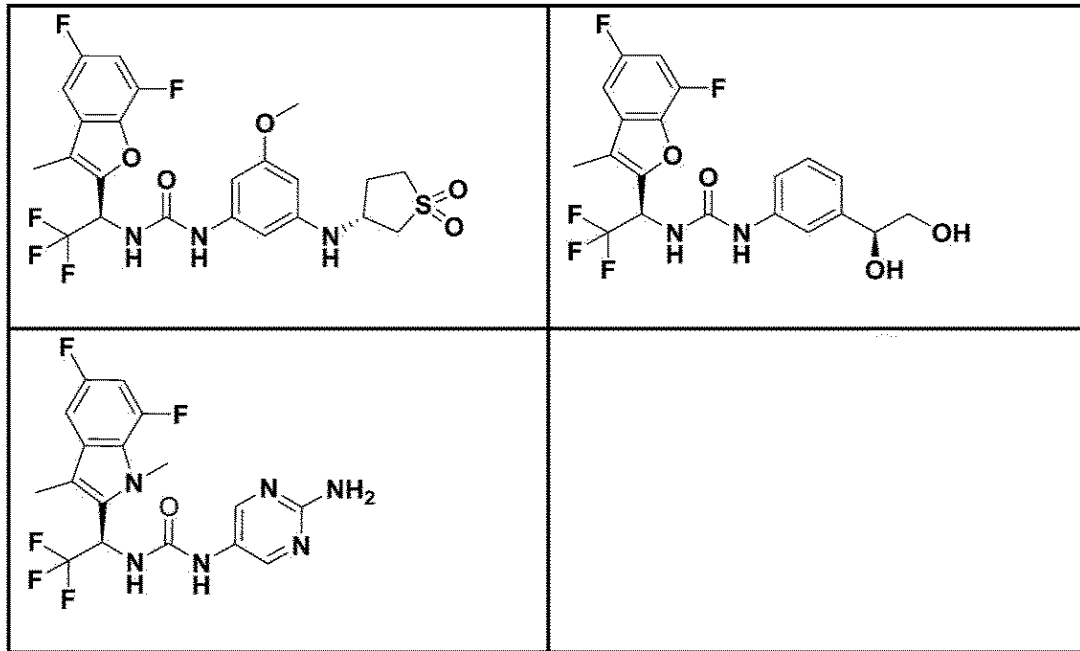
20

30

40

50

【表 4 - 7】



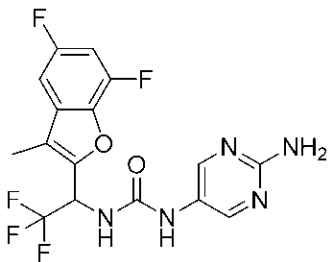
10

20

【請求項 2 4】

式の構造：

【化 6】



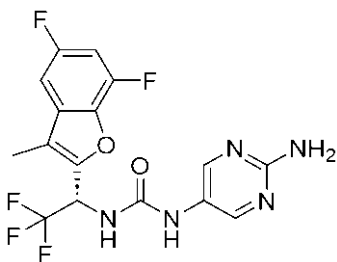
30

を有する 1-(2-アミノピリミジン-5-イル)-3-(1-(5,7-ジフルオロ-3-メチルベンゾフラン-2-イル)-2,2,2-トリフルオロエチル)尿素である化合物、またはその医薬として許容される塩。

【請求項 2 5】

式の構造：

【化 7】



40

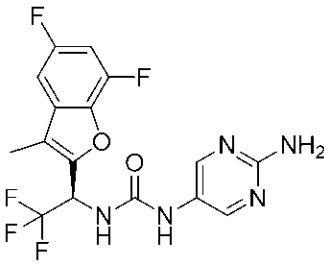
を有する (S)-1-(2-アミノピリミジン-5-イル)-3-(1-(5,7-ジフルオロ-3-メチルベンゾフラン-2-イル)-2,2,2-トリフルオロエチル)尿素である、請求項 2 4 に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩。

【請求項 2 6】

50

式の構造：

【化 8】



10

を有する(R)-1-(2-アミノピリミジン-5-イル)-3-(1-(5,7-ジフルオロ-3-メチルベンゾフラン-2-イル)-2,2,2-トリフルオロエチル)尿素である、請求項 2 4 に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩。

【請求項 2 7】

1-(2-アミノピリミジン-5-イル)-3-(1-(5,7-ジフルオロ-3-メチルベンゾフラン-2-イル)-2,2,2-トリフルオロエチル)尿素である化合物。

【請求項 2 8】

(S)-1-(2-アミノピリミジン-5-イル)-3-(1-(5,7-ジフルオロ-3-メチルベンゾフラン-2-イル)-2,2,2-トリフルオロエチル)尿素である、請求項 2 7 に記載の化合物。

【請求項 2 9】

(R)-1-(2-アミノピリミジン-5-イル)-3-(1-(5,7-ジフルオロ-3-メチルベンゾフラン-2-イル)-2,2,2-トリフルオロエチル)尿素である、請求項 2 7 に記載の化合物。

20

【請求項 3 0】

請求項 1 ~ 4、1 3、1 4、または 2 3 ~ 2 9 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩と、1 つまたは複数の医薬として許容される賦形剤とを含む、医薬組成物。

【請求項 3 1】

請求項 1 ~ 4、1 3、1 4、または 2 3 ~ 2 9 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬として許容される塩を含む、がんの治療剤。

【請求項 3 2】

請求項 1 ~ 4、1 3、1 4、または 2 3 ~ 2 9 のいずれか 1 項に記載の化合物またはその医薬として許容される塩を含む、P I 3 K 関連がんの治療剤。

30

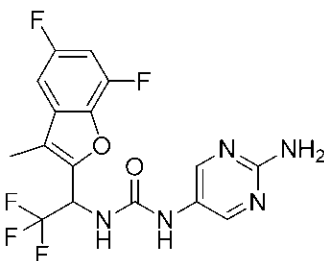
【請求項 3 3】

請求項 1 ~ 4、1 3、1 4、または 2 3 ~ 2 9 のいずれか 1 項に記載の化合物、またはその医薬として許容される塩を含む、哺乳類細胞において P I 3 K を調節するための剤。

【請求項 3 4】

式の構造：

【化 9】



40

を有する1-(2-アミノピリミジン-5-イル)-3-(1-(5,7-ジフルオロ-3-メチルベンゾフラン-2-イル)-2,2,2-トリフルオロエチル)尿素である化合物、またはその医薬として許容される塩を含む、固形腫瘍の治療剤であって、前記固形腫瘍が P I 3 K において 1 つ以

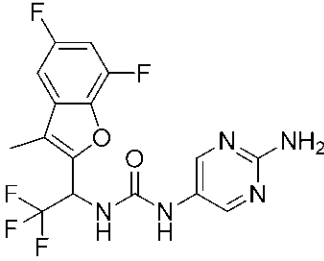
50

上の変異を有する、治療剤。

【請求項 35】

式の構造：

【化 10】



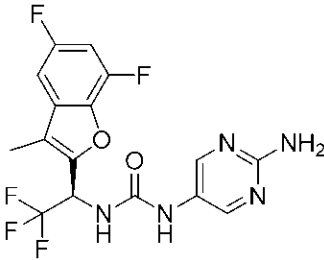
10

を有する1-(2-アミノピリミジン-5-イル)-3-(1-(5,7-ジフルオロ-3-メチルベンゾフラン-2-イル)-2,2,2-トリフルオロエチル)尿素である化合物、またはその医薬として許容される塩を含む、PI3K において1つ以上の変異を有するがんの治療剤であって、前記がんが乳癌、子宮内膜癌、膀胱癌、および頭頸部癌から選択される、治療剤。

【請求項 36】

化合物が式の構造：

【化 11】



20

を有する(R)-1-(2-アミノピリミジン-5-イル)-3-(1-(5,7-ジフルオロ-3-メチルベンゾフラン-2-イル)-2,2,2-トリフルオロエチル)尿素である、請求項 34 または 35 に記載の治療剤。

30

【請求項 37】

化合物、またはその医薬として許容される塩が1-(2-アミノピリミジン-5-イル)-3-(1-(5,7-ジフルオロ-3-メチルベンゾフラン-2-イル)-2,2,2-トリフルオロエチル)尿素である、請求項 34 または 35 に記載の治療剤。

【請求項 38】

化合物、またはその医薬として許容される塩が(R)-1-(2-アミノピリミジン-5-イル)-3-(1-(5,7-ジフルオロ-3-メチルベンゾフラン-2-イル)-2,2,2-トリフルオロエチル)尿素である、請求項 37 に記載の治療剤。

【請求項 39】

がんが乳癌である、請求項 38 に記載の治療剤。

40

【請求項 40】

PI3K における1つ以上の変異がE542A、E542G、E542K、E542Q、E542V、E545A、E545D、E545G、E545K、E545Q、M1043I、M1043L、M1043T、M1043V、H1047L、H1047Q、H1047R、H1047Y、G1049R、及びそれらの組み合わせからなる群から選択される、請求項 39 に記載の治療剤。

50